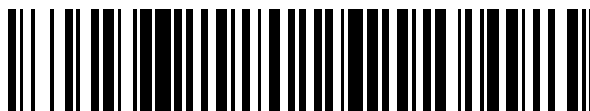


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 417 016**

51 Int. Cl.:

C07D 231/44 (2006.01)
A01N 43/56 (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01)
C07D 403/12 (2006.01)
C07D 409/12 (2006.01)
C07D 405/12 (2006.01)
C07D 417/12 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **12.11.2003 E 03779896 (4)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **24.04.2013 EP 1599451**

54 Título: **Derivados plaguicidas de 1-aril-3-amidoximpirazol**

30 Prioridad:

03.12.2002 EP 02027064

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

05.08.2013

73 Titular/es:

**MERIAL LIMITED (100.0%)
3239 SATELLITE BLVD
DULUTH, GA 30096-4640, US**

72 Inventor/es:

**DÖLLER, UWE;
HÖBALD, KLAUS, DIETER;
MAIER, MICHAEL;
KUHLMANN, ANKE y
SEEGER, KARL**

74 Agente/Representante:

PONTI SALES, Adelaida

ES 2 417 016 T3

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

DESCRIPCIÓN

Derivados plaguicidas de 1-aril-3-amidoximapirazol.

5 [0001] La invención se refiere a derivados de 1-arilpirazol 3-sustituídos con amidoxima, a procesos para su preparación, a composiciones de los mismos y a su uso para el control de plagas, tales como artrópodos dañinos (incluyendo insectos y arácnidos) y helmintos (incluyendo nematodos).

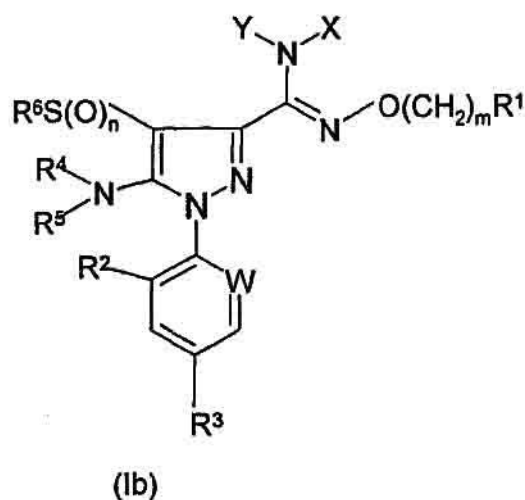
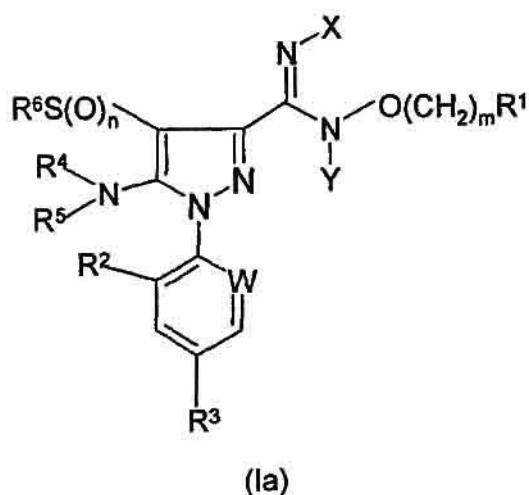
10 [0002] El control de insectos, arácnidos o helmintos con compuestos de 1-arilpirazol se ha descrito, por ejemplo, en las publicaciones de patente números WO 93/06089, WO 94/21606, WO 87/03781, EP 0295117, EP 659745, EP 679650, EP 201852 y U.S. 5.232.940. El control de parásitos en animales con compuestos de 1-arilpirazol se ha descrito también en las publicaciones de patente números WO 00/35884, EP 0846686, WO 98/24769 y WO 97/28126.

15 [0003] En particular, los documentos WO 98/28278 y WO 97/28126 describen ciertos derivados de 1-arilpirazol 3-sustituídos con amidoxima así como otros compuestos relacionados, sin embargo no se mencionan específicamente en los mismos compuestos de amidoxima sustituidos con bencilo y sustituidos con heterociclos, ni se sugiere que podrían ser también útiles como plaguicidas.

20 [0004] Sin embargo, el nivel de acción y/o la duración de la acción de estos compuestos de la técnica anterior no es enteramente satisfactorio en todos los campos de aplicación, en particular contra ciertos organismos o cuando se aplican bajas concentraciones.

25 [0005] Puesto que los plaguicidas modernos deben satisfacer un amplio intervalo de demandas, por ejemplo respecto al nivel, duración y espectro de la acción, espectro de uso, toxicidad, combinación con otras sustancias activas, combinación con auxiliares de formulación o síntesis, y puesto que es posible la aparición de resistencias, el desarrollo de dichas sustancias no puede considerarse nunca como concluido, y existe constantemente una alta demanda de compuestos novedosos que sean ventajosos frente a los compuestos conocidos, al menos en lo referente a algunos aspectos.

30 [0006] La presente invención proporciona un compuesto que es un derivado de 1-arilpirazol 3-sustituído con amidoxima de fórmulas (Ia) o (Ib):



35 en las que:

R^1 es arilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales R^{15} ;

40 X e Y son cada uno independientemente H, alqueno C_3-C_6 , halogenoalqueno C_3-C_6 , alquino C_3-C_6 , halogenoalquino C_3-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , -alquil C_1-C_4 -cicloalquilo C_3-C_7 , $-CO_2$ -alquilo C_1-C_6 , $CONR^7R^8$, $CONR^8R^9$, $-CO_2-(CH_2)_qR^7$, $-(CH_2)_qR^7$, $-(CH_2)_qR^{10}$, COR^8 , SO_2R^{13} o COR^{17} ; o alquilo C_1-C_6 no sustituido o sustituido con uno o más radicales R^{11} ;

45 W es N, C- CH_3 o C-halógeno;

R^2 es hidrógeno, CH_3 o halógeno;

R^3 es halógeno, alquilo C_1-C_3 , halogenoalquilo C_1-C_3 , halogenoalcóxilo C_1-C_3 , $S(O)_p$ -halogenoalquilo C_1-C_3 o SF_5 ;

R^4 es H, alqueno C_3-C_6 , halogenoalquilo C_3-C_6 , alquino C_3-C_6 , halogenoalquino C_3-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , $-CO_2$ -alquilo C_1-C_6 , $-CO_2$ -cicloalquilo C_3-C_7 ; $-CO_2$ -alquil C_1-C_4 -cicloalquilo C_3-C_7 , $-CO_2$ -alqueno C_3-C_6 , $-CO_2-(CH_2)_qR^7$,
5 $CONR^8R^9$, $-CO_2-(CH_2)_qR^{10}$, $-(CH_2)_qR^7$, $-(CH_2)_qR^{10}$, COR^8 o $COCH_2O$ -alquilo C_1-C_4 ; o alquilo C_1-C_6 no sustituido o sustituido con uno o más radicales R^{11} ;

R^5 es H, alquino C_2-C_6 , $-CO_2$ -alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 o $-SO_2R^{12}$; o alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 o CO -alquilo C_1-C_6 , estando dichos últimos tres grupos mencionados no sustituidos o sustituidos con uno o más radicales
10 R^{11} ;

R^6 y R^{13} son cada uno independientemente alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , halogenoalqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , halogenoalquino C_2-C_6 o cicloalquilo C_3-C_7 ;

15 R^7 es fenilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_6 , alcóxilo C_1-C_6 , halogenoalcóxilo C_1-C_6 , CN, NO_2 , $S(O)_pR^{13}$ y NR^9R^{14} ;

R^8 es H, alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , -alquil C_1-C_4 -cicloalquilo C_3-C_7 , $-(CH_2)_qR^7$ o $-(CH_2)_qR^{10}$;

20 R^9 y R^{14} son cada uno independientemente H, alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 o -alquil C_1-C_4 -cicloalquilo C_3-C_7 ; o

R^8 y R^9 , junto con el átomo de N unido, forman un anillo saturado de 5 o 6 miembros que opcionalmente contiene un
25 heteroátomo adicional en el anillo que se selecciona de O, S y N, estando el anillo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_6 y halógeno;

R^{11} es halógeno, alcóxilo C_1-C_6 , halogenoalcóxilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , $S(O)_pR^{13}$, $-CO_2$ -alquilo C_1-C_6 , $-O(C=O)$ -alquilo C_1-C_6 , CO -alquilo C_1-C_6 , CO -halogenoalquilo C_1-C_6 , NR^8R^9 , $CONR^8R^9$, $SO_2NR^8R^9$, OH, CN, NO_2 , OR⁷,
30 NR^8COR^{14} , $NR^8SO_2R^{13}$ u OR¹⁰; R^{12} es cicloalquilo C_3-C_7 , alqueno C_2-C_6 , haloalqueno C_2-C_6 o R^{10} ; o fenilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados de R^{15} ; o es alquilo C_1-C_6 no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alcóxilo C_1-C_6 , halogenoalcóxilo C_1-C_6 , alquilo C_3-C_6 -óxido, halogenoalqueno C_3-C_6 -óxido, alquino C_3-C_6 -óxido, halogenoalquino C_3-C_6 -óxido, cicloalquilo C_3-C_7 , $S(O)_pR^7$, $S(O)_pR^{10}$, $S(O)_pR^{13}$, CN, NO_2 , OH, COR^8 , NR^8COR^{14} , $NR^8SO_2R^{13}$, $CONR^8R^9$, NR^8R^9 , OR⁷, OR¹⁰, R^{16} ,
35 R^{10} y CO_2R^8 ;

R^{15} es halógeno, alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_6 , alcóxilo C_1-C_6 , halogenoalcóxilo C_1-C_6 , CN, NO_2 , $S(O)_pR^{13}$, NR^8R^9 , COR^{13} , COR^7 , $CONR^8R^9$, $SO_2NR^8R^9$, R^7 , SF_5 , OH, OR⁷, R^{18} , OR¹⁸, SO_3H o alquiliden C_1-C_6 -imino;

40 R^{16} es fenilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_6 , alcóxilo C_1-C_6 , halogenoalcóxilo C_1-C_6 , CN, NO_2 , $S(O)_pR^{13}$, NR^8R^9 , COR^{13} , COR^7 , $CONR^8R^9$, $SO_2NR^8R^9$, OH, SO_3H y alquiliden C_1-C_6 -imino;

45 R^{17} es alquilo C_1-C_5 que está sustituido con alcóxilo C_1-C_6 , $S(O)_p$ -alquilo C_1-C_6 o $S(O)_p$ -halogenoalquilo C_1-C_5 ;

R^{18} es un radical heteroaromático seleccionado del grupo consistente en piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tienilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, furilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo y triazolilo, estando dichos grupos no sustituidos o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en
50 halógeno, alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_6 y alcóxilo C_1-C_6 ;

m es 1 o 2;

n y p son cada uno independientemente 0, 1 o 2;

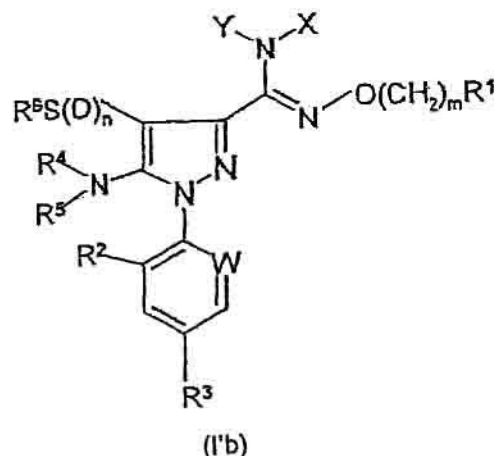
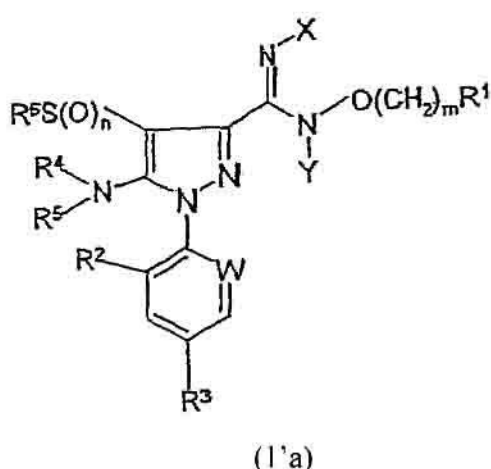
55 q es 0 o 1;

o una sal plaguicidamente aceptable de los mismos.

[0007] Estos compuestos poseen propiedades plaguicidas valiosas.

60

[0008] En un aspecto adicional, la presente invención proporciona un compuesto de fórmulas (I'a) o (I'b)



en las que:

5 R^1 es arilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales R^{15} ; o es R^{19} ;

X e Y son cada uno independientemente H, alqueno C_3-C_6 , halogenoalqueno C_3-C_6 , alquino C_3-C_6 , halogenoalquino C_3-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , -alquil C_1-C_4 -cicloalquilo C_3-C_7 , - CO_2 -alquilo C_1-C_6 , $CONR^7R^8$, $CONR^8R^9$,
 10 - $CO_2-(CH_2)_qR^7$, $-(CH_2)_qR^7$, $-(CH_2)_qR^{10}$, COR^8 , SO_2R^{13} o COR^{17} ; o alquilo C_1-C_6 no sustituido o sustituido con uno o más radicales R^{11} ;

W es N, C- CH_3 o C-halógeno;

R^2 es hidrógeno, CH_3 o halógeno;

15 R^3 es halógeno, alquilo C_1-C_3 , halogenoalquilo C_1-C_3 , halogenoalcóxido C_1-C_3 , $S(O)_p$ -halogenoalquilo C_1-C_3 o SF_5 ;

R^4 es H, alqueno C_3-C_5 , halogenoalqueno C_3-C_6 , alquino C_3-C_6 , halogenoalquino C_3-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , - CO_2 -alquilo C_1-C_6 , - CO_2 -cicloalquilo C_3-C_7 , - CO_2 -alquil C_1-C_4 -cicloalquilo C_3-C_7 , - CO_2 -alqueno C_3-C_6 , - $CO_2-(CH_2)_qR^7$,
 20 $CONR^8R^9$, - $CO_2-(CH_2)_qR^{10}$, $-(CH_2)_qR^7$, $-(CH_2)_qR^{10}$, COR^8 o $COCH_2O$ -alquilo C_1-C_4 ; o alquilo C_1-C_6 no sustituido o sustituido con uno o más radicales R^{11} ;

R^5 es H, alquino C_2-C_6 , - CO_2 -alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 o - SO_2R^{12} ; o alquilo C_1-C_5 , alqueno C_2-C_5 o CO -alquilo C_1-C_6 , estando dichos últimos tres grupos mencionados no sustituidos o sustituidos con uno o más radicales
 25 R^{11} ;

R^6 y R^{13} son cada uno independientemente alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , halogenoalquilo C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , halogenoalquino C_2-C_6 o cicloalquilo C_3-C_7 ;

30 R^7 es fenilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_6 , alcóxido C_1-C_6 , halogenoalcóxido C_1-C_6 , CN, NO_2 , $S(O)_pR^{13}$ y NR^9R^{14} ;

R^8 es H, alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , -alquil C_1-C_4 -cicloalquilo C_3-C_7 , $-(CH_2)_qR^7$ o $-(CH_2)_qR^{10}$;

35 R^9 y R^{14} son cada uno independientemente H, alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 o -alquilo C_1-C_4 -cicloalquilo C_3-C_7 ; o

R^8 y R^9 , junto con el átomo de N unido, forman un anillo saturado de 5 o 6 miembros que contiene opcionalmente un
 40 heteroátomo adicional en el anillo que se selecciona de O, S y N, estando el anillo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_6 y halógeno;

R^{11} es halógeno, alcóxido C_1-C_6 , halogenoalcóxido C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , $S(O)_pR^{13}$, - CO_2 -alquilo C_1-C_6 , - $O(C=O)$ -alquilo C_1-C_6 , CO -alquilo C_1-C_6 , CO -halogenoalquilo C_1-C_6 , NR^8R^9 , $CONR^8R^9$, $SO_2NR^8R^9$, OH, CN, NO_2 , OR^7 ,
 45 NR^8COR^{14} , $NR^8SO_2R^{13}$ u OR^{10} ; R^{12} es cicloalquilo C_3-C_7 , alqueno C_2-C_6 , halogenoalqueno C_2-C_6 o R^{10} ; o fenilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados de R^{15} ; o es alquilo C_1-C_6 no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alcóxido C_1-C_6 , halogenoalcóxido C_1-C_6 , alqueno C_3-C_6 -óxido, halogenoalqueno C_3-C_6 -óxido, alquino C_3-C_6 -óxido, halogenoalquino C_3-C_6 -óxido, cicloalquilo C_3-

C_7 , $S(O)_pR^7$, $S(O)_pR^{10}$, $S(O)_pR^{13}$, CN , NO_2 , OH , COR^8 , NR^8COR^{14} , $NR^8SO_2R^{13}$, $CONR^8R^9$, NR^8R^9 , OR^7 , OR^{10} , R^{16} , R^{10} y CO_2R^8 ;

R^{15} es halógeno, alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_6 , alcoxilo C_1-C_6 , halogenoalcoxilo C_1-C_6 , CN , NO_2 , $S(O)_pR^{13}$, NR^8R^9 , COR^{13} , COR^7 , $CONR^8R^9$, $SO_2NR^8R^9$, R^7 , SF_5 , OH , OR^7 , R^{18} , OR^{18} , SO_3H o alquiliden C_1-C_6 -imino;

R^{16} es fenilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_6 , alcoxilo C_1-C_6 , halogenoalcoxilo C_1-C_6 , CN , NO_2 , $S(O)_pR^{13}$, NR^8R^9 , COR^{13} , COR^7 , $CONR^8R^9$, $SO_2NR^8R^9$, OH , SO_3H y alquiliden C_1-C_6 -imino;

R^{17} es alquilo C_1-C_6 que está sustituido con alcoxilo C_1-C_6 , $S(O)_p$ -alquilo C_1-C_6 o $S(O)_p$ -halogenoalquilo C_1-C_6 ;

R^{18} es un radical heteroaromático seleccionado del grupo consistente en piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tienilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, furilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo y triazolilo, estando dichos grupos no sustituidos o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_6 y alcoxilo C_1-C_6 ;

R^{19} es un radical heteroaromático seleccionado del grupo consistente en piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tienilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, furilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, y triazolilo, que están no sustituidos o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_6 y alcoxilo C_1-C_6 , y estando sustituido dicho radical heteroaromático con R^7 , R^{18} u OR^7 ;

m es 1 o 2;

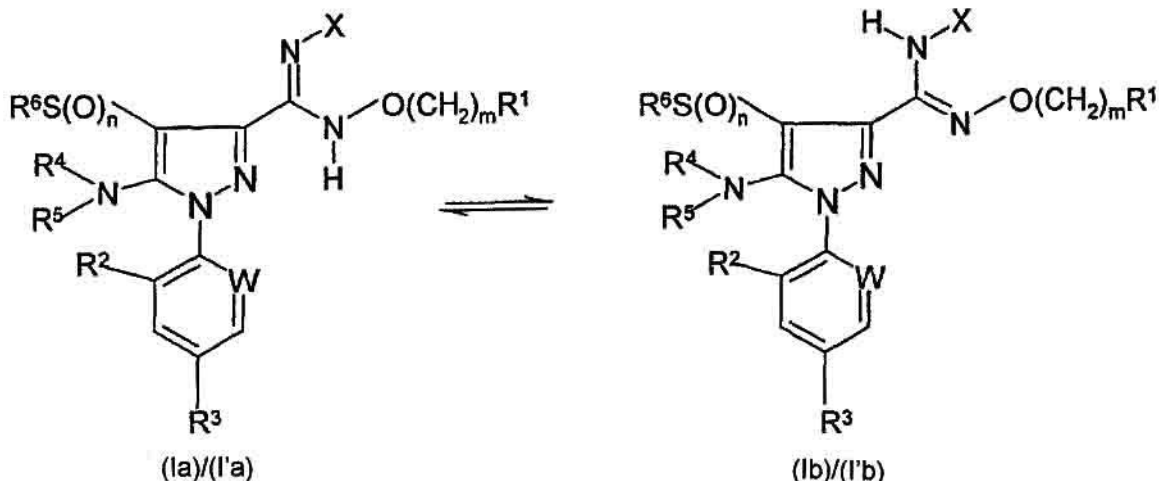
n y p son cada uno independientemente 0, 1 o 2;

q es 0 o 1; y

cada cicloalquilo en los radicales anteriormente mencionados está opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo; o una sal plaguicidamente aceptable de los mismos; para uso en el tratamiento de vertebrados de sangre caliente parasitados interna o externamente con artrópodos, en los que los artrópodos se seleccionan de *Rhipicephalus spp.* o *Ctenocephalides spp.*

[0009] La invención abarca también cualquier estereoisómero, enantiómero o isómero geométrico y mezclas de los mismos.

[0010] Los compuestos de fórmulas (Ia) y (Ib) en las que Y es H pueden existir en formas tautoméricas como se muestra a continuación:



[0011] Dicha tautomería es bien conocida y se describe en S. Patai ("The Chemistry of Functional Groups: Amidines and Imidates", vol 2, 1991, páginas 276-277). Se entenderá que todas dichas formas tautoméricas están englobadas en la presente invención. Se entiende por el término "sales plaguicidamente aceptables" sales cuyos aniones o cationes son conocidos y aceptados en la materia para la formación de sales de uso plaguicida. Las sales adecuadas con bases, por ejemplo formadas por compuestos de fórmula (I) que contienen un grupo ácido carboxílico, incluyen sales de metales alcalinos (por ejemplo, sodio y potasio), metales alcalinotérreos (por ejemplo, calcio y magnesio), amoniaco y amina (por ejemplo, dietanolamina, trietanolamina, octilamina, morfolina y

dioctilmetilamina). Las sales de adición de ácido adecuadas, por ejemplo formadas por compuestos de fórmula (I) que contienen un grupo amino, incluyen sales con ácidos inorgánicos, por ejemplo clorhidratos, sulfatos, fosfatos y nitratos y sales con ácidos orgánicos, por ejemplo ácido acético.

5 **[0012]** Ha de entenderse que las condiciones anteriormente mencionadas se incluyen solo por razones de inestabilidad química de los restos particulares excluidos, y no por razones de la técnica anterior.

[0013] En la presente memoria descriptiva de patente, incluyendo las reivindicaciones adjuntas, los sustituyentes anteriormente mencionados tienen los siguientes significados:

10

Átomo de halógeno significa flúor, cloro, bromo o yodo.

[0014] El término "halogeno" antes del nombre de un radical significa que ese radical está parcial o completamente halogenado, es decir, sustituido con F, Cl, Br o I, en cualquier combinación, preferiblemente con F o Cl.

15

[0015] Los grupos alquilo y porciones de los mismos (a menos que se definan de otro modo) pueden ser de cadena lineal o ramificada.

20

[0016] La expresión "alquilo C₁-C₆" ha de entenderse que significa un radical hidrocarburo no ramificado o ramificado que tiene 1, 2, 3, 4, 5 o 6 átomos de carbono tal como, por ejemplo, un radical metilo, etilo, propilo, isopropilo, 1-butilo, 2-butilo, 2-metilpropilo o *terc*-butilo.

[0017]

Los radicales alquilo, y también en los grupos compuestos, a menos que se definan de otro modo, tienen preferiblemente de 1 a 4 átomos de carbono.

25

[0018] "Halogenoalquilo C₁-C₆" significa un grupo alquilo mencionado bajo la expresión "alquilo C₁-C₆" en que uno o más átomos de hidrógeno están reemplazados por el mismo número de átomos de halógeno idénticos o diferentes, tales como monohalogenoalquilo, perhalogenoalquilo, CF₃, CHF₂, CH₂F, CHFCH₃, CF₃CH₂, CF₃CF₂, CHF₂CF₂, CH₂FCHCl, CH₂Cl, CCl₃, CHCl₂ o CH₂CH₂Cl.

30

[0019] La expresión "alquilenilo C₁-C₁₂" ha de entenderse que significa una cadena carbonada saturada no ramificada o ramificada que tiene de 1 a 12 átomos de carbono.

35

[0020] La expresión "halogenoalquilenilo C₁-C₁₂" ha de entenderse que significa una cadena carbonada saturada no ramificada o ramificada que tiene de 1 a 12 átomos de carbono en que uno o más átomos de hidrógeno están reemplazados por el mismo número de átomos de halógeno idénticos o diferentes.

[0021] La expresión "alquenileno C₂-C₁₂" ha de entenderse que significa una cadena carbonada saturada no ramificada o ramificada que tiene de 2 a 12 átomos de carbono y que contiene al menos un doble enlace que puede estar localizado en cualquier posición del radical insaturado respectivo.

40

[0022] "Alcoxilo C₁-C₆" significa un grupo alcoxilo cuya cadena carbonada tiene el significado dado en la expresión "alquilo C₁-C₆". "Halogenoalcoxilo" es, por ejemplo, OCF₃, OCHF₂, OCH₂F, CF₃CF₂O, OCH₂CF₃ u OCH₂CH₂Cl.

45

[0023] "Alquenilo C₂-C₆" significa una cadena carbonada no cíclica no ramificada o ramificada que tiene un número de átomos de carbono que corresponde a este intervalo citado y que contiene al menos un doble enlace que puede estar localizado en cualquier posición del radical insaturado respectivo. "Alquenilo C₂-C₆" denota por consiguiente, por ejemplo, un grupo vinilo, alilo, 2-metil-2-propenilo, 2-butenilo, pentenilo, 2-metilpentenilo o hexenilo.

50

[0024] "Alquinilo C₂-C₆" significa una cadena carbonada no cíclica no ramificada o ramificada que tiene un número de átomos de carbono que corresponde a este intervalo citado y que contiene un triple enlace que puede estar localizado en cualquier posición del radical insaturado respectivo. "Alquinilo C₂-C₆" denota por consiguiente, por ejemplo, un grupo propargilo, 1-metil-2-propinilo, 2-butinilo o 3-butinilo.

55

[0025] Los grupos cicloalquilo tienen preferiblemente de 3 a 7 átomos de carbono en el anillo y están opcionalmente sustituidos con halógeno o alquilo.

60

[0026] En los compuestos de fórmula (I), se proporcionan los siguientes ejemplos de radicales:

Es un ejemplo de alquilo sustituido con cicloalquilo el ciclopropilmetilo;

65 es un ejemplo de alquilo sustituido con alcoxilo el metoximetilo (CH₃OCH₂-);

y es un ejemplo de alquilo sustituido con alquiltio el metiltiometilo (CH_3SCH_2-).

Arilo es un sistema aromático monocíclico o bicíclico, por ejemplo, fenilo, naftilo, tetrahidronaftilo, indenilo, indanilo y similares, preferiblemente fenilo.

5

[0027] El término plagas significa plagas de artrópodos (incluyendo insectos y arácnidos) y helmintos (incluyendo nematodos).

[0028] Se prefieren los compuestos de fórmulas (Ib)/(I'b).

10

[0029] Preferiblemente, R^1 es fenilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, halogenoalquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, alcoxilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, halogenoalcoxilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, CN , NO_2 , $\text{S(O)}_p\text{R}^{13}$, NR^8R^9 , COR^{13} y CONR^8R^9 ; (más preferiblemente, R^1 es fenilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_3$, halogenoalquilo $\text{C}_1\text{-C}_3$, alcoxilo $\text{C}_1\text{-C}_3$, halogenoalcoxilo $\text{C}_1\text{-C}_3$, CN , NO_2 , $\text{S(O)}_p\text{R}^{13}$ y NR^8R^9); y en que preferiblemente R^8 y R^9 son cada uno independientemente H o alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, o R^8 y R^9 , junto con el átomo de N unido, forman un anillo saturado de 5 o 6 miembros que contiene opcionalmente un heteroátomo adicional en el anillo que se selecciona de O, S y N, estando el anillo no sustituido o sustituido con uno o más radicales alquilo $\text{C}_1\text{-C}_3$;

15

20 y R^{13} es alquilo $\text{C}_1\text{-C}_3$ o halogenoalquilo $\text{C}_1\text{-C}_3$.

[0030] Preferiblemente, X e Y son cada uno independientemente H, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ o CO-alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$.

[0031] Preferiblemente, W es C-Cl.

25

[0032] Preferiblemente, R^2 es Cl.

[0033] Preferiblemente, R^3 es CF_3 u OCF_3 (más preferiblemente, R^3 es CF_3).

30

[0034] Preferiblemente, R^4 es H, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, alqueno $\text{C}_3\text{-C}_6$, alquino $\text{C}_3\text{-C}_6$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_7$, -CO_2 -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ -cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_7$, COCH_2O -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, -alquil $\text{C}_1\text{-C}_6$ - S(O)_p -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ o $\text{-CH}_2\text{R}^7$, en que R^7 es fenilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados de halógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_3$, halogenoalquilo $\text{C}_1\text{-C}_3$, alcoxilo $\text{C}_1\text{-C}_3$, halogenoalcoxilo $\text{C}_1\text{-C}_3$, CN , NO_2 y $\text{S(O)}_p\text{R}^{13}$, y R^{13} es alquilo $\text{C}_1\text{-C}_3$ o halogenoalquilo $\text{C}_1\text{-C}_3$.

35

[0035] Preferiblemente, R^5 es H, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, alqueno $\text{C}_3\text{-C}_6$, alquino $\text{C}_3\text{-C}_6$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_7$, -CO_2 -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ o -alquil $\text{C}_1\text{-C}_6$ -cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_7$.

[0036] Preferiblemente, R^6 es CF_3 .

40

[0037] Preferiblemente, m es 1.

[0038] Son una clase preferida de compuestos de fórmulas (Ib)/(I'b) aquellos en que:

45 R^1 es fenilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, halogenoalquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, alcoxilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, S(O)_p -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ o S(O)_p -halogenoalquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$; o es piridilo, pirimidinilo, tienilo, tiazolilo, furilo, tetrahydrofurilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, triazolilo, tetrahidrotienilo o tetrazolilo, estando dichos grupos no sustituidos o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_3$ o halogenoalquilo $\text{C}_1\text{-C}_3$;

50

X es H, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, alqueno $\text{C}_3\text{-C}_6$, alquino $\text{C}_3\text{-C}_6$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_7$, -alquil $\text{C}_1\text{-C}_4$ -cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_7$, -CO_2 -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, CO-alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, $\text{-CH}_2\text{O}$ -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ - S(O)_p -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ o -CH_2 -fenilo;

Y es H;

55

W es C-Cl;

R^2 es Cl;

60 R^3 y R^6 son cada uno CF_3 ;

R^4 es H, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, COCH_2O -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, -alquil $\text{C}_1\text{-C}_6$ - S(O)_p -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ o -CH_2 -fenilo;

R^5 es H, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, alqueno $\text{C}_3\text{-C}_6$, alquino $\text{C}_3\text{-C}_6$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_7$, -alquil $\text{C}_1\text{-C}_4$ -cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_7$, -CO_2 -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, CO-alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, $\text{-CH}_2\text{O}$ -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, -alquil $\text{C}_1\text{-C}_6$ - S(O)_p -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, SO_2 -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, SO_2 -halogenoalquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ o SO_2CH_2 -fenilo; y

65

m es 1 o 2.

[0039] Son una clase preferida de compuestos de fórmulas (Ia)/(I'a) aquellos en que:

5

R¹ es fenilo;

Y es H, alquilo C₁-C₆, alqueno C₃-C₆, alquino C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₇, -alquil C₁-C₄-cicloalquilo C₃-C₇, -CO₂-alquilo C₁-C₆, CO-alquilo C₁-C₆, -CH₂O-alquilo C₁-C₆, -alquil C₁-C₆-S(O)_p-alquilo C₁-C₆, SO₂-alquilo C₁-C₆, SO₂-halogenoalquilo C₁-C₆ o SO₂CH₂-fenilo;

10

X es H;

W es C-Cl;

15

R² es Cl;

R³ y R⁶ son cada uno CF₃;

20

R⁴ es H, alquilo C₁-C₆, -alquil C₁-C₆-S(O)_p-alquilo C₁-C₆ o -CH₂-fenilo;

R⁵ es H, alquilo C₁-C₆, alqueno C₃-C₆, alquino C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₇, -alquil C₁-C₄-cicloalquilo C₃-C₇, -CO₂-alquilo C₁-C₆, CO-alquilo C₁-C₆, -CH₂O-alquilo C₁-C₆, -alquil C₁-C₆-S(O)_p-alquilo C₁-C₆, SO₂-alquilo C₁-C₆, SO₂-halogenoalquilo C₁-C₆ o SO₂CH₂-fenilo; y

25

m es 1.

[0040] Son una clase preferida adicional de compuestos de fórmulas (Ia)/(I'a) aquellos en que:

30

R¹ es fenilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₆, alcoxilo C₁-C₆, S(O)_p-alquilo C₁-C₆ y S(O)_p-halogenoalquilo C₁-C₆;

35

X es H, alquilo C₁-C₆, alqueno C₃-C₆, alquino C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₇, -alquil C₁-C₄-cicloalquilo C₃-C₇, -CO₂-alquilo C₁-C₆, CO-alquilo C₁-C₆, CON[alquilo C₁-C₅]₂, -CH₂O-alquilo C₁-C₆, -alquil C₁-C₆-S(O)_p-alquilo C₁-C₆ o -CH₂-fenilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo C₁-C₃ o alcoxilo C₁-C₃;

Y es alquilo C₁-C₆;

W es C-Cl;

40

R² es Cl;

R³ y R⁶ son cada uno CF₃;

45

R⁴ es alquilo C₁-C₆ o -alquil C₂-C₄-S(O)_p-alquilo C₁-C₄;

R⁵ es H o CH₃; y

m es 1.

50

[0041] Son la clase más preferida de compuestos de fórmulas (Ia)/(I'a) o (Ib)/(I'b) aquellos en que:

R¹ es fenilo;

55

X e Y son cada uno independientemente H, metilo o acetilo;

W es C-Cl;

R² es Cl;

60

R³ y R⁶ son cada uno CF₃;

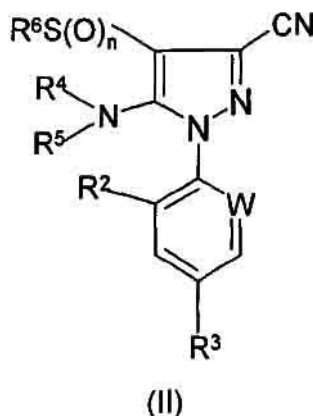
R⁴ y R⁵ son cada uno independientemente H, metilo, etilo, alilo, propargilo, ciclopropilo, bencilo, ciclopropilmetilo, metiltioetilo, etoxiacetilo o etoxicarbonilo; y m es 1.

65

[0042] Los compuestos de fórmulas generales (I)/(I') pueden prepararse mediante la aplicación o adaptación

de procedimientos conocidos (concretamente, procedimientos usados o descritos hasta el momento en la bibliografía química). Se entenderá que en ciertos casos pueda ser necesario el uso de agentes protectores bien conocidos en la materia para obtener rendimientos satisfactorios. En la siguiente descripción de procesos, cuando aparecen símbolos en fórmulas que no se definen específicamente, se entiende que son "como se define anteriormente" de acuerdo con la primera definición de cada símbolo en la memoria descriptiva.

[0043] Según un rasgo de la invención, los compuestos de fórmulas (Ia)/(I'a) en las que X es H, m y R^1 son como se definen anteriormente, Y es como se define anteriormente con la exclusión de H y los demás símbolos son como se definen anteriormente, pueden prepararse mediante la reacción de un compuesto de fórmula (II):

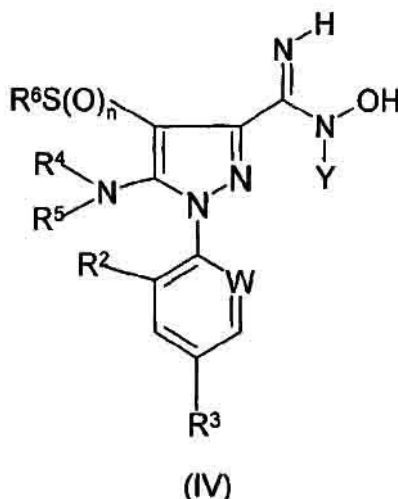


en la que R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , W y n son como se definen anteriormente, con un compuesto de fórmula (III):

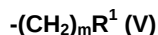


en la que R^1 y m son como se definen anteriormente e Y es como se define anteriormente con la exclusión de H. La reacción se efectúa generalmente en presencia de una base tal como una trietilamina, por ejemplo trietilamina, en un disolvente tal como metanol, a una temperatura de 0 a 100°C (preferiblemente de 0 a 50°C).

[0044] Según un rasgo adicional de la invención, los compuestos de fórmula (Ia) en la que X es H, m y R^1 son como se definen anteriormente, Y es como se define anteriormente con la exclusión de H y los demás símbolos son como se definen anteriormente, pueden prepararse también mediante la reacción de un compuesto de fórmula (IV):

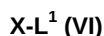


en la que los diversos símbolos son como se definen anteriormente, con un compuesto de fórmula (V):



en la que R^1 y m son como se definen anteriormente y L es un grupo saliente tal como halógeno, preferiblemente cloro, o sulfonyloxilo. La reacción se efectúa generalmente en presencia de una base tal como hidruro de sodio, en un disolvente tal como tetrahidrofurano o N,N-dimetilformamida, a una temperatura de 0 a 100°C (preferiblemente de 0 a 50°C).

[0045] Según un rasgo adicional de la invención, los compuestos de fórmula (Ia) en la que X es como se define anteriormente con la exclusión de H, y los demás símbolos son como se definen anteriormente, pueden prepararse mediante la alquilación, acilación o sulfonylación del correspondiente compuesto de fórmula (Ia), en la que X es H, usando un compuesto de fórmula (VI):

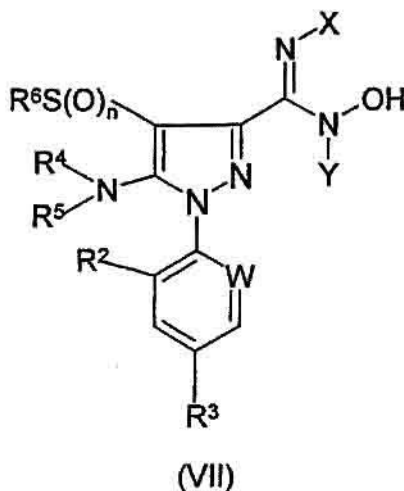


en la que X es como se define anteriormente con la exclusión de H y L^1 es un grupo saliente tal como halógeno, preferiblemente cloro, o sulfonyloxi.

[0046] La reacción de alquilación (cuando X es alqueno C_3-C_6 , halogenoalqueno C_3-C_6 , alqueno C_3-C_6 , halogenoalqueno C_3-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , -alquilo C_1-C_4 -cicloalquilo C_3-C_7 , o alquilo C_1-C_6 no sustituido o sustituido con uno o más radicales R^{11} , o cuando X es $-(CH_2)_qR^7$, $-(CH_2)_qR^{10}$ y q es 0) se efectúa generalmente en presencia de una base tal como hidruro de sodio, en un disolvente tal como tetrahidrofurano o *N,N*-dimetilformamida, a una temperatura de 0 a 100°C (preferiblemente de 0 a 50°C). Para alquilaciones en que X es $-(CH_2)_qR^7$, $-(CH_2)_qR^{10}$ y q es 1 (concretamente, arilaciones), L^1 es preferiblemente flúor.

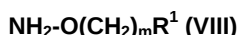
[0047] La reacción de sulfonylación (cuando X es SO_2R^{13}) se efectúa generalmente en presencia de una base tal como hidruro de sodio, en un disolvente tal como tetrahidrofurano o *N,N*-dimetilformamida, a una temperatura de 0 a 100°C (preferiblemente de 0 a 50°C). La reacción de acilación (cuando X es $-CO_2$ -alquilo C_1-C_6 , $CONR^7R^8$, $CONR^8R^9$, $-CO_2-(CH_2)_qR^7$, COR^8 o COR^{17}) se efectúa generalmente en presencia de una base tal como trietilamina, en un disolvente tal como tetrahidrofurano, a una temperatura de 0 a 100°C (preferiblemente de 0 a 50°C).

[0048] Según un rasgo adicional de la invención, los compuestos de fórmula (Ia), en la que X, Y y los demás símbolos son como se definen anteriormente, pueden prepararse mediante la reacción de un compuesto de fórmula (VII):



en la que los diversos símbolos son como se definen anteriormente, con un compuesto de fórmula (V) como se define anteriormente. La reacción se efectúa generalmente en presencia de una base tal como hidruro de sodio, en un disolvente tal como tetrahidrofurano o *N,N*-dimetilformamida, a una temperatura de 0 a 100°C (preferiblemente de 0 a 50°C).

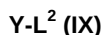
[0049] Según un rasgo adicional de la invención, los compuestos de fórmulas (Ib)/(I'b), en las que X e Y son cada uno H y m, R^1 y los demás símbolos son como se definen anteriormente, pueden prepararse mediante la reacción de un compuesto de fórmula (II) como se define anteriormente con un compuesto de fórmula (VIII):



en la que R^1 y m son como se definen anteriormente. La reacción se efectúa generalmente en presencia de una base tal como una trietilamina, por ejemplo trietilamina, en un disolvente tal como metanol, a una temperatura de 0 a 100°C (preferiblemente de 0 a 50°C).

[0050] Según un rasgo adicional de la invención, los compuestos de fórmulas (Ib)/(I'b), en las que X es H, Y es como se define anteriormente con la exclusión de H y los demás símbolos son como se definen anteriormente, pueden prepararse mediante la alquilación, acilación o sulfonylación del correspondiente compuesto de fórmulas

(Ib)/(I'b), en las que Y es H, usando un compuesto de fórmula (IX):



5 en la que Y es como se define anteriormente con la exclusión de H y L^2 es un grupo saliente tal como halógeno, preferiblemente cloruro, o sulfoniloxilo.

10 **[0051]** Las reacciones de alquilación, acilación y sulfonilación pueden efectuarse según los procedimientos descritos en el proceso anterior para la preparación de compuestos de fórmula (Ia) a partir de compuestos de fórmula (VI).

[0052] Según un rasgo adicional de la invención, los compuestos de fórmulas (Ib)/(I'b), en las que X e Y son como se definen anteriormente con la exclusión de H, y los demás símbolos son como se definen anteriormente, pueden prepararse mediante la alquilación, acilación o sulfonilación del correspondiente compuesto de fórmulas (Ib)/(I'b), en las que X es H, usando un compuesto de fórmula (VI) como se define anteriormente.

[0053] Las reacciones de alquilación, acilación y sulfonilación pueden efectuarse según los procedimientos descritos en el proceso anterior para la preparación de compuestos de fórmulas (Ia)/(I'a) a partir de compuestos de fórmula (VI).

25 **[0054]** Según un rasgo adicional de la invención, los compuestos de fórmulas (I)/(I'), en las que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , W, X, Y y m son como se definen anteriormente, y n es 1 o 2, pueden prepararse oxidando un correspondiente compuesto en que n es 0 o 1. La oxidación se efectúa generalmente usando un perácido tal como ácido 3-cloroperbenzoico en un disolvente tal como diclorometano o 1,2-dicloroetano, a una temperatura de 0°C a la temperatura de reflujo del disolvente.

30 **[0055]** Pueden prepararse también de manera paralela colecciones de compuestos de fórmulas (I)/(I'), que pueden sintetizarse mediante el proceso anteriormente mencionado, y esto puede efectuarse manualmente o de manera semiautomatizada o totalmente automatizada. En este caso, es posible, por ejemplo, automatizar el procedimiento de la reacción, procesamiento o purificación de los productos o intermedios. En total, esto ha de entenderse que significa un procedimiento como se describe, por ejemplo, por S.H. DeWitt en "Annual Reports in Combinatorial Chemistry and Molecular Diversity: Automated Synthesis", volumen 1, Verlag Escom 1997, páginas 69 a 77.

35 **[0056]** Pueden usarse una serie de aparatos comercialmente disponibles como se ofrecen, por ejemplo, por Stem Corporation, Woodrolfe Road, Tollesbury, Essex, CM9 8SE, Inglaterra o por H+P Labortechnik GmbH, Bruckmannring 28, 85764 Oberschleißheim, Alemania o por Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, Inglaterra, para el procedimiento paralelo de la reacción y procesamiento. Para la purificación paralela de compuestos de fórmula (I), o de intermedios obtenidos durante la preparación, puede hacerse uso, entre otras cosas, de aparatos cromatográficos, por ejemplo aquellos de ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, EE.UU.

45 **[0057]** Los aparatos mencionados conducen a un procedimiento modular en que las etapas de proceso individuales se automatizan, pero pueden efectuarse operaciones manuales entre las etapas de proceso. Esto puede evitarse empleando sistemas de automatización semiintegrados o totalmente integrados en que los módulos de automatización en cuestión se operan, por ejemplo, por robots. Dichos sistemas de automatización pueden obtenerse, por ejemplo, en Zymark Corporation, Zymark Center, Hopkinton, MA 01748, EE.UU.

50 **[0058]** Además de lo que se ha descrito aquí, los compuestos de fórmulas (I)/(I') pueden prepararse en parte o totalmente mediante procedimientos soportados en fase sólida. Con este fin, se unen a una resina sintética etapas intermedias individuales o todas las etapas intermedias de la síntesis adaptada para adecuarse al procedimiento en cuestión. Los procedimientos de síntesis soportados en fase sólida se describen extensamente en la bibliografía especializada, por ejemplo, Barry A. Bunin en "The Combinatorial Index", Academic Press, 1998.

55 **[0059]** El uso de procedimientos de síntesis soportados en fase sólida permite una serie de protocolos que son conocidos en la bibliografía y que, a su vez, pueden efectuarse manualmente o de manera automatizada. Por ejemplo, el "procedimiento de la bolsa de té" (Houghten, US 4.631.211; Houghten y col, *Proc. Natl. Acad. Sci.*, 1985, 82, 5131-5135), en que se emplean productos de IRORI, 11149 North Torrey Pines Road, La Jolla, CA 92037, EE.UU., puede semiautomatizarse. La automatización de síntesis paralelas soportadas en fase sólida se efectúa mediante aparatos de Argonaut Technologies, Inc., 887 Industrial Road, San Carlos, CA 94070, EE.UU. o MultiSynTech GmbH, Wullener Feld 4, 58454 Witten, Alemania.

65 **[0060]** La preparación de los procesos descritos en la presente memoria proporciona compuestos de fórmula (I) en forma de colecciones de sustancias que se denominan bancos. La presente invención se refiere también a bancos que comprenden al menos dos compuestos de fórmulas (I)/(I').

[0061] Los intermedios de fórmula (IV) como se define anteriormente pueden prepararse mediante la reacción

de un compuesto de fórmula (II) como se define anteriormente con un compuesto de fórmula (X):

Y-NHOH (X)

- 5 en la que Y es como se define anteriormente. La reacción puede llevarse a cabo usando el procedimiento anterior para la preparación de un compuesto de fórmulas (Ia)/(I'a) a partir de compuestos de fórmulas (III) y (II).

10 **[0062]** Los intermedios de fórmula (VII) como se define anteriormente pueden prepararse mediante la reacción de un compuesto de fórmula (IV) como se define anteriormente con un compuesto de fórmula (VI) como se define anteriormente. La reacción puede llevarse a cabo usando el procedimiento anterior para la preparación del compuesto de fórmulas (Ia)/(I'a) mediante la alquilación, acilación y sulfonilación de los correspondientes compuestos de fórmulas (Ia)/(I'a), en las que X es H, usando compuestos de fórmula (VI).

15 **[0063]** Ciertos compuestos de fórmulas (IV) y (VII) son novedosos, y como tales forman un rasgo adicional de la invención.

[0064] Los compuestos de fórmulas (II), (III), (V), (VI), (VIII), (IX) y (X) son conocidos o pueden prepararse mediante procedimientos conocidos.

20 **[0065]** Los siguientes ejemplos no limitantes ilustran la preparación de los compuestos de fórmulas (I)/(I').

Ejemplos químicos

25 **[0066]** En los ejemplos siguientes, las cantidades (también porcentajes) están basadas en el peso, a menos que se indique otra cosa.

Ejemplo 1:

30 1-(2,6-Dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-(N-benciloxi-2-amidino)-5-metilamino-4-trifluorometilsulfonilpirazol (Compuesto 1-49)

[0067] Se añadieron clorhidrato de O-bencilhidroxilamina (0,214 g, 1,34 mmol) y trietilamina (0,33 g, 3,3 mmol) a una disolución de 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-5-metilamino-4-trifluorometilsulfonilpirazol (0,5 g, 1,1 mmol) en metanol. Se agitó la mezcla a 20°C hasta que se obtuvo una disolución transparente, y se evaporó entonces. Después de añadir agua y acetato de etilo y su procesamiento extractivo, se obtuvo el producto del título (0,387 g) en forma de un sólido blanco.

Ejemplo 2:

40 1-(2,6-Dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-[N-(2,6-diclorobenciloxi)-N-metil-2-amidino]-5-metilamino-4-trifluorometilsulfonilpirazol (Compuesto 4-82)

[0068] Se añadió hidruro de sodio (al 90%, 0,029 g, 1,1 mmol) a una disolución de 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-(N-hidroxi-N-metil-2-amidino)-5-metilamino-4-trifluorometilsulfonilpirazol (0,5 g, 1,0 mmol) en N,N-dimetilformamida. Después de agitar durante 0,5 h a 20°C, se añadió gota a gota bromuro de 2,6-diclorobencilo (0,252 g, 1,05 mmol). Se agitó la mezcla durante 7 horas adicionales a 20°C. Después de añadir cloruro de amonio acuoso y su procesamiento extractivo, se aisló el producto del título mediante cromatografía (0,31 g) en forma de un sólido.

Ejemplo 3:

50 1-(2,6-Dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-[N-metil-N-(4-trifluorometilbenciloxi)-2-amidino]-5-metilamino-4-trifluorometilsulfonilpirazol (Compuesto 4-128)

55 **[0069]** Al proceder según el ejemplo 2, pero usando 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-(N-hidroxi-N-metil-2-amidino)-5-metilamino-4-trifluorometilsulfonilpirazol (0,5 g, 1,0 mmol), hidruro de sodio (al 90%, 0,029 g, 1,1 mmol) y bromuro de 4-trifluorometilbencilo, se obtuvo el compuesto del título (0,57 g) en forma de un sólido.

Ejemplo 4:

60 1-(2,6-Dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-[N-metil-N-(4-trifluorometoxibenciloxi)-2-amidino]-5-metilamino-4-trifluorometiltio-
pirazol (Compuesto 4-165)

[0070] Al proceder según el ejemplo 2, pero usando 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-(N-hidroxi-N-metil-2-amidino)-5-metilamino-4-trifluorometiltio-
pirazol (0,5 g, 1,0 mmol), hidruro de sodio (al 90%, 0,029 g, 1,1 mmol) y bromuro de 4-trifluorometoxibencilo (0,290 g, 1,05 mmol), se obtuvo el compuesto del título (0,093 g) en forma de un

sólido.

Ejemplo 5:

- 5 1-(2,6-Dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-[*N*-metil-*N*-(4-trifluorometilbenciloxi)-2-amidino]-5-metilamino-4-trifluorometilsulfinilpirazol (Compuesto 4-93)

10 **[0071]** Al proceder según el ejemplo 2, pero usando 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-(*N*-hidroxi-*N*-metil-2-amidino)-5-metilamino-4-trifluorometilsulfinilpirazol (0,5 g, 1,0 mmol), hidruro de sodio al 90% (0,029 g, 1,1 mmol) y bromuro de 4-trifluorometilbencilo (0,251 g, 1,05 mmol), y la posterior purificación por cromatografía, se obtuvo 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-[*N*-metil-*N*-(4-trifluorometilbenciloxi)-2-amidino]-5-metilamino-4-trifluorometilsulfinilpirazol (0,018 g) en forma de un sólido.

Ejemplo 6:

- 15 1-(2,6-Dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-[*N*-(4-fluorobenciloxi-*N*-metil)-*N'*-(4-fluorobencil)-2-amidino]-5-metilamino-4-trifluorometilsulfinilpirazol (Compuesto 4-159)

20 **[0072]** Al proceder según el ejemplo 2, pero usando 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-(*N*-metil-*N*-hidroxi-2-amidino)-5-metilamino-4-trifluorometilsulfinilpirazol (0,5 g, 1,0 mmol), hidruro de sodio (al 90%, 0,029 g, 1,1 mmol) y bromuro de 4-fluorobencilo (0,202 g, 1,05 mmol), se obtuvo el compuesto del título (0,309 g) en forma de un sólido.

25 **[0073]** Los siguientes ejemplos de referencia ilustran la preparación de intermedios usados en la síntesis de los ejemplos anteriores.

Ejemplo intermedio 1:

1-(2,6-Dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-(*N*-hidroxi-*N*-metil-2-amidino)-5-metilamino-4-trifluorometilsulfinilpirazol

- 30 **[0074]** Se añadieron clorhidrato de *N*-metilhidroxilamina (3,45 g, 41,55 mmol) y trietilamina (10,05 g, 13,9 ml, 99,0 mmol) a una disolución de 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-5-metilamino-4-trifluorometilsulfinilpirazol (2,0 g, 4,0 mmol) en metanol. Se agitó la mezcla durante 8 horas a 20°C, se evaporó y se lavó el sólido resultante con agua, se filtró y se secó, proporcionando el producto del título (14,73 g) en forma de un sólido blanco pálido.

Ejemplo intermedio 2:

1-(2,6-Dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-(*N*-bencil-*N*-hidroxi-2-amidino)-5-metilamino-4-trifluorometilsulfinilpirazol

- 40 **[0075]** Al proceder según el ejemplo intermedio 1, pero usando 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-5-metilamino-4-trifluorometilsulfinilpirazol (0,5 g, 1,1 mmol) y clorhidrato de *N*-bencilhidroxilamina (0,22 g, 1,34 mmol), se obtuvo el compuesto del título (0,450 g) en forma de un sólido blanco.

Ejemplo intermedio 3:

- 45 3-(*N*-Bencil-*N*-hidroxi-2-amidino)-1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-5-metilamino-4-trifluorometiltiopirazol

50 **[0076]** Al proceder según el ejemplo intermedio 1, pero usando 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-5-metilamino-4-trifluorometiltiopirazol (0,5 g, 1,1 mmol) y clorhidrato de *N*-bencilhidroxilamina (0,22 g, 1,34 mmol), se obtuvo el compuesto del título (0,435 g) en forma de un sólido blanco.

Ejemplo intermedio 4:

3-(*N*-Bencil-*N*-hidroxi-2-amidino)-1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-5-metilamino-4-trifluorometilsulfinilpirazol

- 55 **[0077]** Al proceder según el ejemplo intermedio 1, pero usando 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-5-metilamino-4-trifluorometilsulfinilpirazol (0,5 g, 1,1 mmol) y clorhidrato de *N*-bencilhidroxilamina (0,22 g, 1,34 mmol), se obtuvo el compuesto del título (0,61 g) en forma de un sólido blanco.

60 **[0078]** Los siguientes compuestos preferidos mostrados en las Tablas 1 a 7 forman parte también de la presente invención y se prepararon o se pueden preparar de acuerdo con, o análogamente a, los ejemplos 1 a 6 anteriormente mencionados o los procedimientos generales anteriormente mencionados. En las Tablas, cPr significa ciclopropilo y Ph significa fenilo. Cuando se omiten los subíndices después de los átomos, se entenderá que están sobreentendidos, por ejemplo, CH₃ significa CH₃.

- 65 **[0079]** Los números de compuesto se dan solo con fines de referencia.

[0080] En las siguientes tablas, aquellos compuestos marcados con un asterisco (*) se incluyen solo como ejemplos de referencia.

Tabla 1: Compuestos de fórmulas (Ib)/(I'b) en que $R^2 = Cl$; $W = C-Cl$; $R^3 = R^6 = CF_3$; $m = 1$; $R^1 = \text{fenilo}$; $X = Y = H$

Número de compuesto	R^5	R^4	n	p.f. (°C)
1-1	H	CH ₃	0	
1-2	CH ₃	CH ₃	0	
1-3	CH ₂ CH ₃	CH ₃	0	
1-4	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	0	
1-5	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	0	
1-6	CH ₂ CHCH ₂	CH ₃	0	

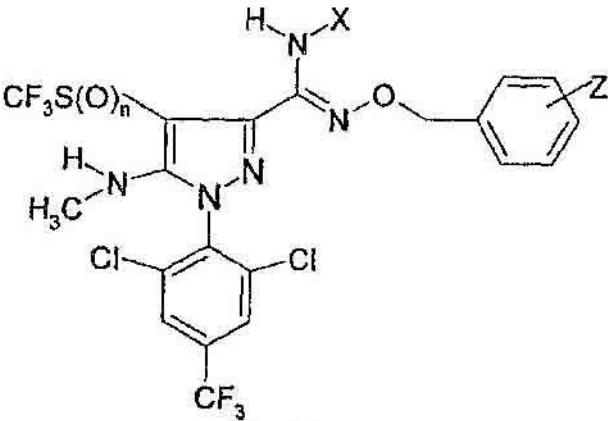
5

Número de compuesto	R ⁵	R ⁴	n	p.f. (°C)
1-7	CH ₂ CCH	CH ₃	0	
1-8	C(O)OCH ₃	CH ₃	0	
1-9	C(O)OCH ₂ CH ₃	CH ₃	0	
1-10	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	0	
1-11	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	0	
1-12	CH ₂ cPr	CH ₃	0	
1-13	cPr	CH ₃	0	
1-14	CH ₃	CH ₂ Ph	0	
1-15	H	H	0	
1-16	H	CH ₂ CH ₃	0	
1-17	H	iPr	0	
1-18	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	0	
1-19	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	0	
1-20	S ₀₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	0	
1-21	S ₀₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	CH ₃	0	
1-22	S ₀₂ CH ₂ Ph	CH ₃	0	
1-23	COCH ₃	CH ₃	0	
1-24	COCH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	0	
1-25	H	CH ₃	1	
1-26	CH ₃	CH ₃	1	
1-27	CH ₂ CH ₃	CH ₃	1	
1-28	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	1	
1-29	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	1	
1-30	CH ₂ CHCH ₂	CH ₃	1	
1-31	CH ₂ CCH	CH ₃	1	
1-32	C(O)OCH ₃	CH ₃	1	
1-33	C(O)OCH ₂ CH ₃	CH ₃	1	
1-34	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	1	
1-35	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	1	
1-36	CH ₂ cPr	CH ₃	1	
1-37	cPr	CH ₃	1	
1-38	CH ₃	CH ₂ Ph	1	
1-39	H	H	1	
1-40	H	CH ₂ CH ₃	1	
1-41	H	iPr	1	
1-42	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	1	
1-43	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	1	
1-44	S ₀₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	1	

ES 2 417 016 T3

Número de compuesto	R ⁵	R ⁴	n	p.f. (°C)
1-45	SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	CH ₃	1	
1-46	SO ₂ CH ₂ Ph	CH ₃	1	
1-47	COCH ₃	CH ₃	1	
1-48	COCH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	1	
1-49	H	CH ₃	2	174
1-50	CH ₃	CH ₃	2	
1-51	CH ₂ CH ₃	CH ₃	2	
1-52	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	2	
1-53	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	2	
1-54	CH ₂ CHCH ₂	CH ₃	2	
1-55	CH ₂ CCH	CH ₃	2	
1-56	C(O)OCH ₃	CH ₃	2	
1-57	C(O)OCH ₂ CH ₃	CH ₃	2	
1-58	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	2	
1-59	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	2	
1-60	CH ₂ cPr	CH ₃	2	
1-61	cPr	CH ₃	2	
1-62	CH ₃	CH ₂ Ph	2	
1-63	H	H	2	
1-64	H	CH ₂ CH ₃	2	
1-65	H	iPr	2	
1-66	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	2	
1-67	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	2	
1-68	SO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	2	
1-69	SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	CH ₃	2	
1-70	SO ₂ CH ₂ Ph	CH ₃	2	
1-71	COCH ₃	CH ₃	2	
1-72	COCH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	2	

Tabla 2: Compuestos de fórmulas (Ib-1)/(I'b-1)

 (Ib1)/(I'b-1)				
Número de compuesto	X	Z	n	p.f. (°C)
2-1	H	H	0	
2-2	CH3	H	0	
2-3	CH2CH3	H	0	
2-4	CH2CH2CH3	H	0	
2-5	CH2CH2CH2CH3	H	0	
2-6	CH2CHCH2	H	0	
2-7	CH2CCH	H	0	
2-8	C(O)OCH3	H	0	
2-9	C(O)CH3	H	0	
2-10	CH2OCH3	H	0	
2-11	CH2OCH2CH3	H	0	
2-12	CH2cPr	H	0	
2-13	cPr	H	0	
2-14	CH2Ph	H	0	
2-15	H	H	1	
2-16	CH3	H	1	
2-17	CH2CH3	H	1	
2-18	CH2CH2CH3	H	1	
2-19	CH2CH2CH2CH3	H	1	
2-20	CH2CHCH2	H	1	
2-21	CH2CCH	H	1	
2-22	C(O)OCH3	H	1	
2-23	C(O)OCH2CH3	H	1	
2-24	CH2OCH3	H	1	
2-25	CH2OCH2CH3	H	1	
2-26	CH2cPr	H	1	

Número de compuesto	X	Z	n	p.f. (°C)
2-27	cPr	H	1	
2-28	CH ₂ Ph	H	1	
2-29	H	H	2	
2-30	CH ₃	H	2	
2-31	CH ₂ CH ₃	H	2	
2-32	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	2	
2-33	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	2	
2-34	CH ₂ CHCH ₂	H	2	
2-35	CH ₂ CCH	H	2	
2-36	C(O)OCH ₃	H	2	
2-37	C(O)CH ₃	H	2	
2-38	CH ₂ OCH ₃	H	2	
2-39	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	2	
2-40	CH ₂ cPr	H	2	
2-41	cPr	H	2	
2-42	CH ₂ Ph	H	2	
2-43	H	2-Cl	0	
2-44	H	3-Cl	0	
2-45	H	4-Cl	0	
2-46	H	2,5-Cl ₂	0	
2-47	H	2,6-Cl ₂	0	
2-48	H	3,4-Cl ₂	0	
2-49	H	2-F	0	
2-50	H	3-F	0	
2-51	H	4-F	0	
2-52	H	3,4-F ₂	0	
2-53	H	2,6-F ₂	0	
2-54	H	4-Br	0	
2-55	H	4-I	0	
2-56	H	2-CF ₃	0	
2-57	H	3-CF ₃	0	
2-58	H	4-CF ₃	0	
2-59	H	3,5-(CF ₃) ₂	0	
2-60	H	4-CF ₃ , 2-Cl	0	
2-61	H	3-CF ₃ , 4-Cl	0	
2-62	H	2-OCH ₃	0	
2-63	H	3-OCH ₃	0	
2-64	H	4-OCH ₃	0	

ES 2 417 016 T3

Número de compuesto	X	Z	n	p.f. (°C)
2-65	H	4-SCH3	0	
2-66	H	4-SCF3	0	
2-67	H	4-SF5	0	
2-68	H	3,4-(OCH3)2	0	
2-69	H	4-Ph	0	
2-70	H	4-I	0	
2-71	H	2-CH3	0	
2-72	H	3-CH3	0	
2-73	H	2,3-(CH3)2	0	
2-74	H	4-CH3	0	
2-75	H	2,5-(CH3)2	0	
2-76	H	2,6-(CH3)2	0	
2-77	H	3,4-(CH3)2	0	
2-78	H	2-Cl	1	
2-79	H	3-Cl	1	
2-80	H	4-Cl	1	
2-81	H	2,5-Cl2	1	
2-82	H	2,6-Cl2	1	
2-83	H	3,4-Cl2	1	
2-84	H	2-F	1	
2-85	H	3-F	1	
2-86	H	4-F	1	
2-87	H	3,4-F2	1	
2-88	H	2,6-F2	1	
2-89	H	4-Br	1	
2-90	H	4-I	1	
2-91	H	2-CF3	1	
2-92	H	3-CF3	1	
2-93	H	4-CF3	1	
2-94	H	3,5-(CF3)2	1	
2-95	H	4-CF3, 2-Cl	1	
2-96	H	3-CF3, 4-Cl	1	
2-97	H	2-OCH3	1	
2-98	H	3-OCH3	1	
2-99	H	4-OCH3	1	
2-100	H	4-SCH3	1	
2-101	H	4-SCF3	1	
2-102	H	4-SF5	1	

ES 2 417 016 T3

Número de compuesto	X	Z	n	p.f. (°C)
2-103	H	3,4-(OCH ₃) ₂	1	
2-104	H	4-Ph	1	
2-105	H	4-I	1	
2-106	H	2-CH ₃	1	
2-107	H	3-CH ₃	1	
2-108	H	2,3-(CH ₃) ₂	1	
2-109	H	4-CH ₃	1	
2-110	H	2,5-(CH ₃) ₂	1	
2-111	H	2,6-(CH ₃) ₂	1	
2-112	H	3,4-(CH ₃) ₂	1	
2-113	H	2-Cl	2	
2-114	H	3-Cl	2	
2-115	H	4-Cl	2	
2-116	H	2,5-Cl ₂	2	
2-117	H	2,6-Cl ₂	2	
2-118	H	3,4-Cl ₂	2	
2-119	H	2-F	2	
2-120	H	3-F	2	
2-121	H	4-F	2	
2-122	H	3,4-F ₂	2	
2-123	H	2,6-F ₂	2	
2-124	H	4-Br	2	
2-125	H	4-I	2	
2-126	H	2-CF ₃	2	
2-127	H	3-CF ₃	2	
2-128	H	4-CF ₃	2	
2-129	H	3,5-(CF ₃) ₂	2	
2-130	H	4-CF ₃ , 2-Cl	2	
2-131	H	3-CF ₃ , 4-Cl	2	
2-132	H	2-OCH ₃	2	
2-133	H	3-OCH ₃	2	
2-134	H	4-OCH ₃	2	
2-135	H	4-SCH ₃	2	
2-136	H	4-SCF ₃	2	
2-137	H	4-SF ₅	2	
2-138	H	3,4-(OCH ₃) ₂	2	
2-139	H	4-Ph	2	
2-140	H	4-I	2	

Número de compuesto	X	Z	n	p.f. (°C)
2-141	H	2-CH ₃	2	
2-142	H	3-CH ₃	2	
2-143	H	2,3-(CH ₃) ₂	2	
2-144	H	4-CH ₃	2	
2-145	H	2,5-(CH ₃) ₂	2	
2-146	H	2,6-(CH ₃) ₂	2	
2-147	H	3,4-(CH ₃) ₂	2	
2-148	H	4-C ₅ H ₁₁	0	
2-149	H	3,5-Cl ₂	0	
2-150	H	3,5-Cl ₂	1	
2-151	H	3,5-Cl ₂	2	

Tabla 3: Compuestos de fórmulas (Ia)/(I'a) en que R² = Cl; W = C-Cl; R³ = R⁶ = CF₃; m = 1; R¹ = fenilo; X = H

Nº de comp.	R ⁵	R ⁴	Y	n	p.f. (°C)/RMN ¹ H
3-1	H	CH ₃	CH ₃	0	
3-2	CH ₃	CH ₃	CH ₃	0	
3-3	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	0	
3-4	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	0	
3-5	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	0	
3-6	CH ₂ CHCH ₂	CH ₃	CH ₃	0	
3-7	CH ₂ CCH	CH ₃	CH ₃	0	
3-8	C(O)OCH ₃	CH ₃	CH ₃	0	
3-9	C(O)OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	0	
3-10	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃	0	
3-11	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	0	
3-12	CH ₂ cPr	CH ₃	CH ₃	0	
3-13	cPr	CH ₃	CH ₃	0	
3-14	CH ₃	CH ₂ Ph	CH ₃	0	
3-15	H	H	CH ₃	0	
3-16	H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	0	
3-17	H	iPr	CH ₃	0	
3-18	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃	0	
3-19	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CH ₃	0	
3-20	SO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	0	
3-21	SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	CH ₃	CH ₃	0	
3-22	SO ₂ CH ₂ Ph	CH ₃	CH ₃	0	
3-23	COCH ₃	CH ₃	CH ₃	0	

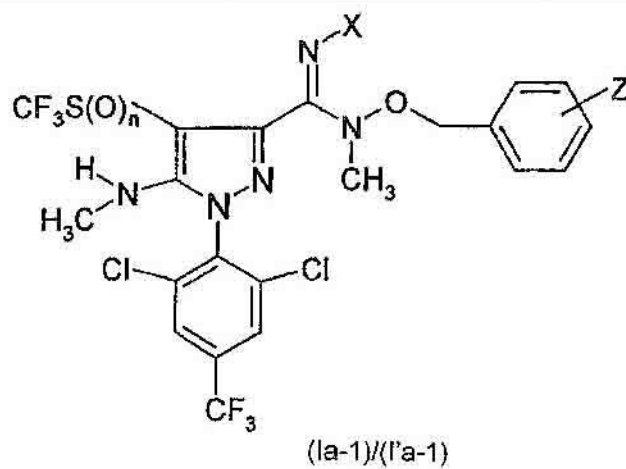
N° de comp.	R ⁵	R ⁴	Y	n	p.f. (°C)/RMN ¹ H
3-24	COCH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	0	
3-25	H	CH ₃	CH ₃	1	2,50 d, 3H, N-CH ₃
3-26	CH ₃	CH ₃	CH ₃	1	
3-27	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	1	
3-28	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	1	
3-29	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	1	
3-30	CH ₂ CHCH ₂	CH ₃	CH ₃	1	
3-31	CH ₂ CCH	CH ₃	CH ₃	1	
3-32	C(O)OCH ₃	CH ₃	CH ₃	1	
3-33	C(O)OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	1	
3-34	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃	1	
3-35	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	1	
3-36	CH ₂ cPr	CH ₃	CH ₃	1	
3-37	cPr	CH ₃	CH ₃	1	
3-38	CH ₃	CH ₂ Ph	CH ₃	1	
3-39	H	H	CH ₃	1	
3-40	H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	1	
3-41	H	iPr	CH ₃	1	
3-42	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃	1	
3-43	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CH ₃	1	
3-44	SO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	1	
3-45	SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	CH ₃	CH ₃	1	
3-46	SO ₂ CH ₂ Ph	CH ₃	CH ₃	1	
3-47	COCH ₃	CH ₃	CH ₃	1	
3-48	COCH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	1	
3-49	H	CH ₃	CH ₃	2	
3-50	CH ₃	CH ₃	CH ₃	2	
3-51	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	2	
3-52	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	2	
3-53	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	2	
3-54	CH ₂ CHCH ₂	CH ₃	CH ₃	2	
3-55	CH ₂ CCH	CH ₃	CH ₃	2	
3-56	C(O)OCH ₃	CH ₃	CH ₃	2	
3-57	C(O)OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	2	
3-58	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃	2	
3-59	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	2	
3-60	CH ₂ cPr	CH ₃	CH ₃	2	
3-61	cPr	CH ₃	CH ₃	2	

N° de comp.	R ⁵	R ⁴	Y	n	p.f. (°C)/RMN ¹ H
3-62	CH ₃	CH ₂ Ph	CH ₃	2	
3-63	H	H	CH ₃	2	
3-64	H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	2	
3-65	H	iPr	CH ₃	2	
3-66	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃	2	
3-67	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CH ₃	2	
3-68	SO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	2	
3-69	SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	CH ₃	CH ₃	2	
3-70	SO ₂ CH ₂ Ph	CH ₃	CH ₃	2	
3-71	COCH ₃	CH ₃	CH ₃	2	
3-72	COCH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	2	
3-73	H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	0	
3-74	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	0	
3-75	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	0	
3-76	H	CH ₃	CH ₂ CHCH ₂	0	
3-77	H	CH ₃	CH ₂ CCH	0	
3-78	H	CH ₃	C(O)OCH ₃	0	
3-79	H	CH ₃	C(O)OCH ₂ CH ₃	0	
3-80	H	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	0	
3-81	H	CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	0	
3-82	H	CH ₃	CH ₂ cPr	0	
3-83	H	CH ₃	cPr	0	
3-84	H	CH ₃	CH ₂ Ph	0	
3-85	H	CH ₃	H	0	
3-86	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	0	
3-87	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	0	
3-88	H	CH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₃	0	
3-89	H	CH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	0	
3-90	H	CH ₃	SO ₂ CH ₂ Ph	0	
3-91	H	CH ₃	COCH ₃	0	
3-92	H	CH ₃	COCH ₂ OCH ₂ CH ₃	0	
3-93	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ CH ₃	1	
3-94	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	1	
3-95	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	1	
3-96	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ CHCH ₂	1	
3-97	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ CCH	1	
3-98	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	C(O)OCH ₃	1	
3-99	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	C(O)OCH ₂ CH ₃	1	

ES 2 417 016 T3

N° de comp.	R ⁵	R ⁴	Y	n	p.f. (°C)/RMN ¹ H
3-100	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ OCH ₃	1	
3-101	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	1	
3-102	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ cPr	1	
3-103	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	cPr	1	
3-104	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ Ph	1	
3-105	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	1	
3-106	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	1	
3-107	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	1	
3-108	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₃	1	
3-109	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	1	
3-110	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CH ₂ Ph	1	
3-111	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	COCH ₃	1	
3-112	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	COCH ₂ OCH ₂ CH ₃	1	
3-113	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	2	
3-114	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	2	
3-115	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	2	
3-116	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₂ CHCH ₂	2	
3-117	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₂ CCH	2	
3-118	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	C(O)OCH ₃	2	
3-119	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	C(O)OCH ₂ CH ₃	2	
3-120	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₂ OCH ₃	2	
3-121	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	2	
3-122	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₂ cPr	2	
3-123	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	cPr	2	
3-124	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₂ Ph	2	
3-125	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	H	2	
3-126	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	2	
3-127	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	2	
3-128	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₃	2	
3-129	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	2	
3-130	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₂ Ph	2	
3-131	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	COCH ₃	2	
3-132	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	COCH ₂ OCH ₂ CH ₃	2	

Tabla 4: Compuestos de fórmulas (Ia-1)/(I'a-1)



Nº de comp.	X	Z	n	p.f. (°C)/RMN ¹ H
4-1	CON(CH ₃) ₂	H	0	
4-2	CH ₃	H	0	
4-3	CH ₂ CH ₃	H	0	
4-4	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	0	
4-5	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	0	
4-6	CH ₂ CHCH ₃	H	0	
4-7	CH ₂ CCH ₃	H	0	
4-8	C(O)OCH ₃	H	0	
4-9	C(O)CH ₃	H	0	
4-10	CH ₂ OCH ₃	H	0	
4-11	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	0	
4-12	CH ₂ cPr	H	0	
4-13	cPr	H	0	
4-14	CH ₂ Ph	H	0	
4-15	H	H	1	
4-16	CH ₃	H	1	
4-17	CH ₂ CH ₃	H	1	
4-18	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	1	
4-19	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	1	
4-20	CH ₂ CHCH ₃	H	1	
4-21	CH ₂ CCH ₃	H	1	
4-22	C(O)OCH ₃	H	1	
4-23	C(O)OCH ₂ CH ₃	H	1	
4-24	CH ₂ OCH ₃	H	1	
4-25	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	1	
4-26	CH ₂ cPr	H	1	

N° de comp.	X	Z	n	p.f. (°C)/RMN ¹ H
4-27	cPr	H	1	
4-28	CH ₂ Ph	H	1	
4-29	H	H	2	
4-30	CH ₃	H	2	
4-31	CH ₂ CH ₃	H	2	
4-32	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	2	
4-33	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	2	
4-34	CH ₂ CHCH ₂	H	2	
4-35	CH ₂ CCH	H	2	
4-36	C(O)OCH ₃	H	2	
4-37	C(O)CH ₃	H	2	
4-38	CH ₂ OCH ₃	H	2	
4-39	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	2	
4-40	CH ₂ cPr	H	2	
4-41	cPr	H	2	
4-42	CH ₂ Ph	H	2	
4-43	H	2-Cl	0	
4-44	H	3-Cl	0	
4-45	H	4-Cl	0	
4-46	H	2,5-Cl ₂	0	
4-47	H	2,6-Cl ₂	0	
4-48	H	3,4-Cl ₂	0	
4-49	H	2-F	0	
4-50	H	3-F	0	
4-51	H	4-F	0	
4-52	H	3,4-F ₂	0	
4-53	H	2,6-F ₂	0	
4-54	H	4-Br	0	
4-55	H	4-I	0	
4-56	H	2-CF ₃	0	
4-57	H	3-CF ₃	0	
4-58	H	4-CF ₃	0	
4-59	H	3,5-(CF ₃) ₂	0	
4-60	H	4-CF ₃ , 2-Cl	0	
4-61	H	3-CF ₃ , 4-Cl	0	
4-62	H	2-OCH ₃	0	
4-63	H	3-OCH ₃	0	
4-64	H	4-OCH ₃	0	

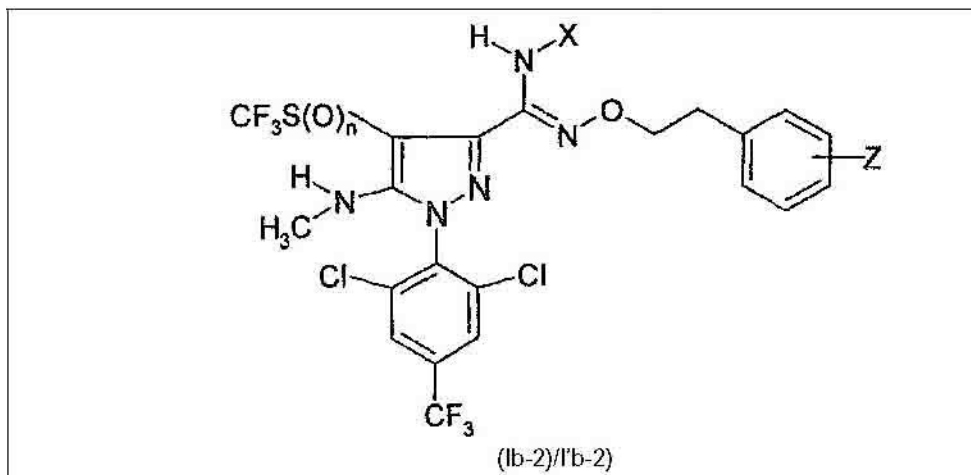
ES 2 417 016 T3

Nº de comp.	X	Z	n	p.f. (°C)/RMN ¹ H
4-65	H	4-SCH ₃	0	
4-66	H	4-SCF ₃	0	
4-67	H	4-SF ₅	0	
4-68	H	3,4-(OCH ₃) ₂	0	
4-69	H	4-Ph	0	
4-70	H	4-I	0	
4-71	H	2-CH ₃	0	
4-72	H	3-CH ₃	0	
4-73	H	2,3-(CH ₃) ₂	0	
4-74	H	4-CH ₃	0	
4-75	H	2,5-(CH ₃) ₂	0	
4-76	H	2,6-(CH ₃) ₂	0	
4-77	H	3,4-(CH ₃) ₂	0	
4-78	H	2-Cl	1	
4-79	H	3-Cl	1	
4-80	H	4-Cl	1	
4-81	H	2,5-Cl ₂	1	
4-82	H	2,6-Cl ₂	1	79
4-83	H	3,4-Cl ₂	1	
4-84	H	2-F	1	
4-85	H	3-F	1	
4-86	H	4-F	1	
4-87	H	3,4-F ₂	1	
4-88	H	2,6-F ₂	1	
4-89	H	4-Br	1	
4-90	H	4-I	1	
4-91	H	2-CF ₃	1	
4-92	H	3-CF ₃	1	
4-93	H	4-CF ₃	1	2,50, d,3H, N-CH ₃
4-94	H	3,5-(CF ₃) ₂	1	
4-95	H	4-CF ₃ , 2-Cl	1	
4-96	H	3-CF ₃ , 4-Cl	1	
4-97	H	2-OCH ₃	1	
4-98	H	3-OCH ₃	1	
4-99	H	4-OCH ₃	1	
4-100	H	4-SCH ₃	1	
4-101	H	4-SCF ₃	1	2,51, d,3H, N-CH ₃
4-102	H	4-SF ₅	1	

N° de comp.	X	Z	n	p.f. (°C)/RMN- ¹ H
4-103	H	3,4-(OCH ₃) ₂	1	
4-104	H	4-Ph	1	
4-105	H	4-I	1	
4-106	H	2-CH ₃	1	
4-107	H	3-CH ₃	1	
4-108	H	2,3-(CH ₃) ₂	1	
4-109	H	4-CH ₃	1	
4-110	H	2,5-(CH ₃) ₂	1	
4-111	H	2,6-(CH ₃) ₂	1	
4-112	H	3,4-(CH ₃) ₂	1	
4-113	H	2-Cl	2	
4-114	H	3-Cl	2	2,57, d,3H, N-CH ₃
4-115	H	4-Cl	2	175
4-116	H	2,5-Cl ₂	2	
4-117	H	2,6-Cl ₂	2	80
4-118	H	3,4-Cl ₂	2	
4-119	H	2-F	2	
4-120	H	3-F	2	
4-121	H	4-F	2	2,60, d,3H, N-CH ₃
4-122	H	3,4-F ₂	2	
4-123	H	2,6-F ₂	2	
4-124	H	4-Br	2	
4-125	H	4-I	2	
4-126	H	2-CF ₃	2	
4-127	H	3-CF ₃	2	
4-128	H	4-CF ₃	2	93
4-129	H	3,5-(CF ₃) ₂	2	
4-130	H	4-CF ₃ , 2-Cl	2	
4-131	H	3-CF ₃ , 4-Cl	2	
4-132	H	2-OCH ₃	2	
4-133	H	3-OCH ₃	2	
4-134	H	4-OCH ₃	2	
4-135	H	4-SCH ₃	2	
4-136	H	4-SCF ₃	2	62
4-137	H	4-SF ₅	2	
4-138	H	3,4-(OCH ₃) ₂	2	
4-139	H	4-Ph	2	
4-140	H	4-I	2	

Nº de comp.	X	Z	n	p.f. (°C)/RMN- ¹ H
4-141	H	2-CH ₃	2	
4-142	H	3-CH ₃	2	
4-143	H	2,3-(CH ₃) ₂	2	
4-144	H	4-CH ₃	2	81
4-145	H	2,5-(CH ₃) ₂	2	
4-146	H	2,6-(CH ₃) ₂	2	
4-147	H	3,4-(CH ₃) ₂	2	
4-148	H	4-C ₅ H ₁₁	0	
4-149	H	3,5-Cl ₂	0	
4-150	H	3,5-Cl ₂	1	
4-151	H	3,5-Cl ₂	2	
4-152	H	3,5-(CH ₃) ₂	2	64
4-153	H	2-CN	2	54
4-154	H	4-terc-C ₄ H ₉	1	2,50, d,3H, N-CH ₃
4-155	H	4-terc-C ₄ H ₉	2	2,60, d,3H, N-CH ₃
4-156	3-F-bencilo	3-F	2	2,60, d,3H, N-CH ₃
4-157	2-F-bencilo	2-F	2	2,61, d,3H, N-CH ₃
4-158	2-Cl-bencilo	2-Cl	2	2,57, d,3H, N-CH ₃
4-159	4-F-bencilo	4-F	2	2,60, d,3H, N-CH ₃
4-160	3-Cl-bencilo	3-Cl	2	2,68, d,3H, N-CH ₃
4-161	3-CH ₃ -bencilo	3-CH ₃	2	2,60, d,3H, N-CH ₃
4-162	3-OCH ₃ -bencilo	3-OCH ₃	2	2,62, d,3H, N-CH ₃
4-163	2-CH ₃ -bencilo	2-CH ₃	2	2,60, d,3H, N-CH ₃
4-164	4-terc-C ₄ H ₉ -bencilo	4-terc-C ₄ H ₉	2	2,60, d,3H, N-CH ₃
4-165	H	4-OCF ₃	0	

Tabla 5: Compuestos de fórmulas (Ib-2)/(I'b-2)



Nº de comp.	X	Z	n	p.f. (°C)/RMN ¹ H
5-1	H	H	0	Aceite
5-2	CH ₃	H	0	
5-3	CH ₂ CH ₃	H	0	
5-4	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	0	
5-5	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	0	
5-6	CH ₂ CHCH ₂	H	0	
5-7	CH ₂ CCH	H	0	
5-8	C(O)OCH ₃	H	0	
5-9	C(O)CH ₃	H	0	
5-10	CH ₂ OCH ₃	H	0	
5-11	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	0	
5-12	CH ₂ cPr	H	0	
5-13	cPr	H	0	
5-14	CH ₂ Ph	H	0	
5-15	H	H	1	
5-16	CH ₃	H	1	
5-17	CH ₂ CH ₃	H	1	
5-18	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	1	
5-19	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	1	
5-20	CH ₂ CHCH ₂	H	1	
5-21	CH ₂ CCH	H	1	
5-22	C(O)OCH ₃	H	1	
5-23	C(O)OCH ₂ CH ₃	H	1	
5-24	CH ₂ OCH ₃	H	1	
5-25	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	1	
5-26	CH ₂ cPr	H	1	
5-27	cPr	H	1	
5-28	CH ₂ Ph	H	1	
5-29	H	H	2	
5-30	CH ₃	H	2	
5-31	CH ₂ CH ₃	H	2	
5-32	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	2	
5-33	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	2	
5-34	CH ₂ CHCH ₂	H	2	
5-35	CH ₂ CCH	H	2	
5-36	C(O)OCH ₃	H	2	
5-37	C(O)CH ₃	H	2	
5-38	CH ₂ OCH ₃	H	2	

N° de comp.	X	Z	n	p.f. (°C)/RMN ¹ H
5-39	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	2	
5-40	CH ₂ cPr	H	2	
5-41	cPr	H	2	
5-42	CH ₂ Ph	H	2	
5-43	H	2-Cl	0	
5-44	H	3-Cl	0	
5-45	H	4-Cl	0	
5-46	H	2,5-Cl ₂	0	
5-47	H	2,6-Cl ₂	0	
5-48	H	3,4-Cl ₂	0	
5-49	H	2-F	0	
5-50	H	3-F	0	
5-51	H	4-F	0	
5-52	H	3,4-F ₂	0	
5-53	H	2,6-F ₂	0	
5-54	H	4-Br	0	
5-55	H	4-I	0	
5-56	H	2-CF ₃	0	
5-57	H	3-CF ₃	0	
5-58	H	4-CF ₃	0	
5-59	H	3,5-(CF ₃) ₂	0	
5-60	H	4-CF ₃ , 2-Cl	0	
5-61	H	3-CF ₃ , 4-Cl	0	
5-62	H	2-OCH ₃	0	
5-63	H	3-OCH ₃	0	
5-64	H	4-OCH ₃	0	
5-65	H	4-SCH ₃	0	
5-66	H	4-SCF ₃	0	
5-67	H	4-SF ₅	0	
5-68	H	3,4-(OCH ₃) ₂	0	
5-69	H	4-Ph	0	
5-70	H	4-I	0	
5-71	H	2-CH ₃	0	
5-72	H	3-CH ₃	0	
5-73	H	2,3-(CH ₃) ₂	0	
5-74	H	4-CH ₃	0	
5-75	H	2,5-(CH ₃) ₂	0	
5-76	H	2,6-(CH ₃) ₂	0	

N° de comp.	X	Z	n	p.f. (°C)/RMN ¹ H
5-77	H	3,4-(CH ₃) ₂	0	
5-78	H	2-Cl	1	
5-79	H	3-Cl	1	
5-80	H	4-Cl	1	
5-81	H	2,5-Cl ₂	1	
5-82	H	2,6-Cl ₂	1	
5-83	H	3,4-Cl ₂	1	
5-84	H	2-F	1	
5-85	H	3-F	1	
5-86	H	4-F	1	
5-87	H	3,4-F ₂	1	
5-88	H	2,6-F ₂	1	
5-89	H	4-Br	1	
5-90	H	4-I	1	
5-91	H	2-CF ₃	1	
5-92	H	3-CF ₃	1	
5-93	H	4-CF ₃	1	
5-94	H	3,5-(CF ₃) ₂	1	
5-95	H	4-CF ₃ , 2-Cl	1	
5-96	H	3-CF ₃ , 4-Cl	1	
5-97	H	2-OCH ₃	1	
5-98	H	3-OCH ₃	1	
5-99	H	4-OCH ₃	1	
5-100	H	4-SCH ₃	1	
5-101	H	4-SCF ₃	1	
5-102	H	4-SF ₅	1	
5-103	H	3,4-(OCH ₃) ₂	1	
5-104	H	4-Ph	1	
5-105	H	4-I	1	
5-106	H	2-CH ₃	1	
5-107	H	3-CH ₃	1	
2-108	H	2,3-(CH ₃) ₂	1	
5-109	H	4-CH ₃	1	
5-110	H	2,5-(CH ₃) ₂	1	
5-111	H	2,6-(CH ₃) ₂	1	
5-112	H	3,4-(CH ₃) ₂	1	
5-113	H	2-Cl	2	
5-114	H	3-Cl	2	

Nº de comp.	X	Z	n	p.f. (°C)/RMN ¹ H
5-115	H	4-Cl	2	
5-116	H	2,5-Cl ₂	2	
5-117	H	2,6-Cl ₂	2	
5-118	H	3,4-Cl ₂	2	
5-119	H	2-F	2	
5-120	H	3-F	2	
5-121	H	4-F	2	
5-122	H	3,4-F ₂	2	
5-123	H	2,6-F ₂	2	
5-124	H	4-Br	2	
5-125	H	4-I	2	
5-126	H	2-CF ₃	2	
5-127	H	3-CF ₃	2	
5-128	H	4-CF ₃	2	
5-129	H	3,5-(CF ₃) ₂	2	
5-130	H	4-CF ₃ , 2-Cl	2	
5-131	H	3-CF ₃ , 4-Cl	2	
5-132	H	2-OCH ₃	2	
5-133	H	3-OCH ₃	2	
5-134	H	4-OCH ₃	2	
5-135	H	4-SCH ₃	2	
5-136	H	4-SCF ₃	2	
5-137	H	4-SF ₅	2	
5-138	H	3,4-(OCH ₃) ₂	2	
5-139	H	4-Ph	2	
5-140	H	4-I	2	
5-141	H	2-CH ₃	2	
5-142	H	3-CH ₃	2	
5-143	H	2,3-(CH ₃) ₂	2	
5-144	H	4-CH ₃	2	
5-145	H	2,5-(CH ₃) ₂	2	
5-146	H	2,6-(CH ₃) ₂	2	
5-147	H	3,4-(CH ₃) ₂	2	
5-148	H	4-C ₅ H ₁₁	0	
5-149	H	3,5-Cl ₂	0	
5-150	H	3,5-Cl ₂	1	
5-151	H	3,5-Cl ₂	2	

Tabla 6: Compuestos de fórmula (I'b) en que R² = Cl; W = C-Cl; R³ = R⁶ = CF₃; m = 1; R⁴=Y = H; R⁵ = CH₃

Nº de compuesto	X	R ¹	n	P.f. (°C)/RMN- ¹ H
6-1	H	2-piridilo	0	
6-2	H	3-piridilo	0	2,56, d, 3H, N-CH ₃
6-3	H	3-piridilo	0	
6-4	H	4-piridilo	0	
6-5	H	1-pirimidilo	0	
6-6	H	3-pirimidilo	0	
6-7	H	4-pirimidilo	0	
6-8	H	2-tienilo	0	
6-9	H	3-tienilo	0	
6-10	H	2-furilo	0	
6-11	H	3-furilo	0	
6-12	H	2-tetrahidrofurilo	0	
6-13	H	3-tetrahidrofurilo	0	
6-14	H	3-pirazolilo	0	
6-15	H	4-pirazolilo	0	
6-16	H	5-pirazolilo	0	
6-17	H	2-imidazolilo	0	
6-18	H	4-imidazolilo	0	
6-19	H	5-imidazolilo	0	
6-20	H	2-tiazolilo	0	
6-21	H	4-tiazolilo	0	
6-22	H	5-tiazolilo	0	
6-23	H	2-tetrahidrotienilo	0	
6-24	H	2-pirrolilo	0	
6-25	H	3-pirrolilo	0	
6-26	H	4-pirrolilo	0	
6-27	H	1-tetrazolilo	0	
6-28	H	5-tetrazolilo	0	
6-29	H	3-(1,2,4)-triazolilo	0	
6-30	H	5-(1,2,4)-triazolilo	0	
6-31	CH ₃	2-tienilo	0	
6-32	CH ₂ CH ₃	2-tienilo	0	
6-33	CH ₂ CH ₂ CH ₃	2-tienilo	0	
6-34	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	2-tienilo	0	
6-35	CH ₂ CHCH ₂	1-metil-4-imidazolilo	0	
6-36	CH ₂ CCH	1-metil-4-imidazolilo	0	
6-37	C(O)OCH ₃	1,3-dimetil-5-Cl-pirazolilo	0	
6-38	C(O)CH ₃	2,4-dimetil-5-tiazolilo	0	
6-39	CH ₂ OCH ₃	5-(2-piridil)-2-tienilo	0	
6-40	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	2-metil-5-CF ₃ -4-furilo	0	
6-41	CH ₂ cPr	2,5-dimetil-3-tienilo	0	
6-42	H	2-Cl-5-piridilo	0	2,59, d, 3H, N-CH ₃
6-43	H	2-piridilo	1	
6-44	H	3-piridilo	1	
6-45	H	3-piridilo	1	
6-46	H	4-piridilo	1	
6-47	H	1-pirimidilo	1	
6-48	H	3-pirimidilo	1	
6-49	H	4-pirimidilo	1	
6-50	H	2-tienilo	1	
6-51	H	3-tienilo	1	
6-52	H	2-furilo	1	
6-53	H	3-furilo	1	
6-54	H	2-tetrahidrofurilo	1	
6-55	H	3-tetrahidrofurilo	1	
6-56	H	3-pirazolilo	1	
6-57	H	4-pirazolilo	1	
6-58	H	5-pirazolilo	1	
6-59	H	5-pirazolilo	1	
6-60	H	4-imidazolilo	1	
6-61	H	5-imidazolilo	1	
6-62	H	2-tiazolilo	1	

Nº de compuesto	X	R ¹	n	P.f. (°C)/RMN- ¹ H
6-63	H	4-tiazolilo	1	
6-64	H	5-tiazolilo	1	
6-65	H	2-tetrahidrotienilo	1	
6-66	H	2-pirrolilo	1	
6-67	H	3-pirrolilo	1	
6-68	H	4-pirrolilo	1	
6-69	H	1-tetrazolilo	1	
6-70	H	5-tetrazolilo	1	
6-71	H	3-(1,2,4)-triazolilo	1	
6-72	H	5-(1,2,4)-triazolilo	1	
6-73	CH ₃	2-tienilo	1	
6-74	CH ₂ CH ₃	2-tienilo	1	
6-75	CH ₂ CH ₂ CH ₃	2-tienilo	1	
6-76	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	2-tienilo	1	
6-77	CH ₂ CHCH ₂	1-metil-4-imidazolilo	1	
6-78	CH ₂ CCH	1-metil-4-imidazolilo	1	
6-79	C(O)OCH ₃	1,3-dimetil-5-Cl-pirazolilo	1	
6-80	C(O)CH ₃	2,4-dimetil-5-tiazolilo	1	
6-81	CH ₂ OCH ₃	5-(2-piridil)-2-tienilo	1	
6-82	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	2-metil-5-CF ₃ -4-furilo	1	
6-83	CH ₂ cPr	2,5-dimetil-3-tienilo	1	
6-84	H	2-Cl-5-piridilo	1	2,64, d, 3H, N-CH ₃
6-85	H	2-piridilo	2	
6-86	H	3-piridilo	2	
6-87	H	3-piridilo	2	
6-88	H	4-piridilo	2	
6-89	H	1-pirimidilo	2	
6-90	H	3-pirimidilo	2	
6-91	H	4-pirimidilo	2	
6-92	H	2-tienilo	2	
6-93	H	3-tienilo	2	
6-94	H	2-furilo	2	
6-95	H	3-furilo	2	
6-96	H	2-tetrahidrofurilo	2	
6-97	H	3-tetrahidrofurilo	2	
6-98	H	3-pirazolilo	2	
6-99	H	4-pirazolilo	2	
6-100	H	5-pirazolilo	2	
6-101	H	5-pirazolilo	2	
6-102	H	4-imidazolilo	2	
6-103	H	5-imidazolilo	2	
6-104	H	2-tiazolilo	2	
6-105	H	4-tiazolilo	2	
6-106	H	5-tiazolilo	2	
6-107	H	2-tetrahidrotienilo	2	
6-108	H	2-pirrolilo	2	
6-109	H	3-pirrolilo	2	
6-110	H	4-pirrolilo	2	
6-111	H	1-tetrazolilo	2	
6-112	H	5-tetrazolilo	2	
6-113	H	3-(1,2,4)-triazolilo	2	
6-114	H	5-(1,2,4)-triazolilo	2	
6-115	CH ₃	2-tienilo	2	
6-116	CH ₂ CH ₃	2-tienilo	2	
6-117	CH ₂ CH ₂ CH ₃	2-tienilo	2	
6-118	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	2-tienilo	2	
6-119	CH ₂ CHCH ₂	1-metil-4-imidazolilo	2	
6-120	CH ₂ CCH	1-metil-4-imidazolilo	2	
6-121	C(O)OCH ₃	1,3-dimetil-5-Cl-pirazolilo	2	
6-122	C(O)CH ₃	2,4-dimetil-5-tiazolilo	2	
6-123	CH ₂ OCH ₃	5-(2-piridil)-2-tienilo	2	
6-124	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	2-metil-5-CF ₃ -4-furilo	2	

Nº de compuesto	X	R ¹	n	P.f. (°C)/RMN- ¹ H
6-125	CH ₂ cPr	2,5-dimetil-3-tienilo	2	
6-126	H	2-Cl-5-piridilo	2	2,65, d, 3H, N-CH ₃

Tabla 7: Compuestos de fórmula (I'b) en que R² = Cl; W = C-Cl; R³ = R⁶ = CF₃; m = 2; R⁴ = Y = H; R⁵ = CH₃

Nº de compuesto	X	R ¹	n	P.f. (°C)/RMN- ¹ H
7-1	H	2-piridilo	0	Aceite
7-2	H	3-piridilo	0	
7-3	H	3-piridilo	0	
7-4	H	4-piridilo	0	
7-5	H	1-pirimidilo	0	
7-6	H	3-pirimidilo	0	
7-7	H	4-pirimidilo	0	
7-8	H	2-tienilo	0	
7-9	H	3-tienilo	0	
7-10	H	2-furilo	0	
7-11	H	3-furilo	0	
7-12	H	2-tetrahidrofurilo	0	
7-13	H	3-tetrahidrofurilo	0	
7-14	H	3-pirazolilo	0	
7-15	H	4-pirazolilo	0	
7-16	H	5-pirazolilo	0	
7-17	H	2-imidazolilo	0	
7-18	H	4-imidazolilo	0	
7-19	H	5-imidazolilo	0	
7-20	H	2-tiazolilo	0	
7-21	H	4-tiazolilo	0	
7-22	H	5-tiazolilo	0	
7-23	H	2-tetrahidrotienilo	0	
7-24	H	2-pirrolilo	0	
7-25	H	3-pirrolilo	0	
7-26	H	4-pirrolilo	0	
7-27	H	1-tetrazolilo	0	
7-28	H	5-tetrazolilo	0	
7-29	H	3-(1,2,4)-triazolilo	0	
7-30	H	5-(1,2,4)-triazolilo	0	
7-31	H	2-tienilo	0	
7-32	H	2-tienilo	0	
7-33	H	2-tienilo	0	
7-34	H	2-tienilo	0	
7-35	H	1-metil-4-imidazolilo	0	
7-36	H	1-metil-4-imidazolilo	0	
7-37	H	1,3-dimetil-5-Cl-pirazolilo	0	
7-38	H	2,4-dimetil-5-tiazolilo	0	
7-39	H	5-(2-piridil)-2-tienilo	0	
7-40	H	2-metil-5-CF ₃ -4-furilo	0	
7-41	H	2,5-dimetil-3-tienilo	0	
7-42	H	2-Cl-5-piridilo	0	
7-43	H	2-piridilo	1	
7-44	H	3-piridilo	1	
7-45	H	3-piridilo	1	
7-46	H	4-piridilo	1	
7-47	H	1-pirimidilo	1	
7-48	H	3-pirimidilo	1	
7-49	H	4-pirimidilo	1	
7-50	H	2-tienilo	1	
7-51	H	3-tienilo	1	
7-52	H	2-furilo	1	
7-53	H	3-furilo	1	
7-54	H	2-tetrahidrofurilo	1	
7-55	H	3-tetrahidrofurilo	1	
7-56	H	3-pirazolilo	1	

Nº de compuesto	X	R ¹	n	P.f. (°C)/RMN- ¹ H
7-57	H	4-pirazolilo	1	
7-58	H	5-pirazolilo	1	
7-59	H	5-pirazolilo	1	
7-60	H	4-imidazolilo	1	
7-61	H	5-imidazolilo	1	
7-62	H	2-tiazolilo	1	
7-63	H	4-tiazolilo	1	
7-64	H	5-tiazolilo	1	
7-65	H	2-tetrahidrotienilo	1	
7-66	H	2-pirrolilo	1	
7-67	H	3-pirrolilo	1	
7-68	H	4-pirrolilo	1	
7-69	H	1-tetrazolilo	1	
7-70	H	5-tetrazolilo	1	
7-71	H	3-(1,2,4)-triazolilo	1	
7-72	H	5-(1,2,4)-triazolilo	1	
7-73	H	2-tienilo	1	
7-74	H	2-tienilo	1	
7-75	H	2-tienilo	1	
7-76	H	2-tienilo	1	
7-77	H	1-metil-4-imidazolilo	1	
7-78	H	1-metil-4-imidazolilo	1	
7-79	H	1,3-dimetil-5-Cl-pirazolilo	1	
7-80	H	2,4-dimetil-5-tiazolilo	1	
7-81	H	5-(2-piridil)-2-tienilo	1	
7-82	H	2-metil-5-CF ₃ -4-furilo	1	
7-83	H	2,5-dimetil-3-tienilo	1	
7-84	H	2-Cl-5-piridilo	1	
7-85	H	2-piridilo	2	
7-86	H	3-piridilo	2	
7-87	H	3-piridilo	2	
7-88	H	4-piridilo	2	
7-89	H	1-pirimidilo	2	
7-90	H	3-pirimidilo	2	
7-91	H	4-pirimidilo	2	
7-92	H	2-tienilo	2	
7-93	H	3-tienilo	2	
7-94	H	2-furilo	2	
7-95	H	3-furilo	2	
7-96	H	2-tetrahidrofurilo	2	
7-97	H	3-tetrahidrofurilo	2	
7-98	H	3-pirazolilo	2	
7-99	H	4-pirazolilo	2	
7-100	H	5-pirazolilo	2	
7-101	H	5-pirazolilo	2	
7-102	H	4-imidazolilo	2	
7-103	H	5-imidazolilo	2	
7-104	H	2-tiazolilo	2	
7-105	H	4-tiazolilo	2	
7-106	H	5-tiazolilo	2	
7-107	H	2-tetrahidrotienilo	2	
7-108	H	2-pirrolilo	2	
7-109	H	3-pirrolilo	2	
7-110	H	4-pirrolilo	2	
*7-111	H	1-tetrazolilo	2	
*7-112	H	5-tetrazolilo	2	
7-113	H	3-(1,2,4)-triazolilo	2	
7-114	H	5-(1,2,4)-triazolilo	2	
7-115	H	2-tienilo	2	
7-116	H	2-tienilo	2	
7-117	H	2-tienilo	2	
7-118	H	2-tienilo	2	

Nº de compuesto	X	R ¹	n	P.f. (°C)/RMN- ¹ H
7-119	H	1-metil-4-imidazolilo	2	
7-120	H	1-metil-4-imidazolilo	2	
7-121	H	1,3-dimetil-5-Cl-pirazolilo	2	
7-122	H	2,4-dimetil-5-tiazolilo	2	
7-123	H	5-(2-piridil)-2-tienilo	2	
7-124	H	2-metil-5-CF ₃ -4-furilo	2	
7-125	H	2,5-dimetil-3-tienilo	2	
7-126	H	2-Cl-5-piridilo	2	
7-127	CH ₃	2-piridilo	1	Aceite
7-128	CH ₃	3-piridilo	0	
7-129	CH ₃	3-piridilo	0	
7-70	CH ₃	4-piridilo	0	

[0081] Según un rasgo adicional de la presente invención, se proporciona un procedimiento para el control de plagas en un lugar que comprende la aplicación de una cantidad eficaz de un compuesto de fórmulas (I)/(I') o una sal del mismo. Con este fin, dicho compuesto se usa normalmente en forma de una composición plaguicida (concretamente, en asociación con diluyentes o portadores y/o agentes tensioactivos compatibles adecuados para uso en composiciones plaguicidas), por ejemplo, como se describe a continuación en la presente memoria.

[0082] El término "compuesto de la invención" como se usa a continuación en la presente memoria engloba un alquilaminopirazol 5-sustituido de fórmulas (I)/(I') como se define anteriormente y una sal plaguicidamente aceptable del mismo.

[0083] Un aspecto de la presente invención como se define anteriormente es un procedimiento no terapéutico para el control de plagas en un lugar. El lugar incluye, por ejemplo, la plaga misma, el sitio (planta, campo, bosque, huerto, vía fluvial, suelo, producto de planta o similar) en que la plaga reside o se alimenta, o un sitio susceptible de futura infestación por la plaga. El compuesto de la invención puede aplicarse por lo tanto directamente a la plaga, al sitio donde la plaga reside o se alimenta o a un sitio susceptible de futura infestación por la plaga. Como es evidente por los usos plaguicidas anteriores, la presente invención proporciona compuestos plaguicidamente activos y procedimientos de uso de dichos compuestos para el control de una serie de especies de plagas que incluyen: artrópodos, especialmente insectos o arácnidos, tales como ácaros, o helmintos tales como nematodos de plantas. El compuesto de la invención puede emplearse por tanto ventajosamente en usos prácticos, por ejemplo, en cultivos agrícolas u hortícolas, en silvicultura, en medicina veterinaria o la cría de ganado o en salud pública.

[0084] Los compuestos de la invención pueden usarse, por ejemplo, en las siguientes aplicaciones y en las siguientes plagas:

[0085] Para el control de insectos del suelo, tales como gusano de la raíz del maíz, termitas (especialmente para la protección de estructuras), larvas de la raíz, larvas de elatérico, gorgojos de la raíz, barrenadores del tallo, gusanos cortadores, áfidos de la raíz o larvas de escarabajos. Pueden usarse también para proporcionar actividad contra nematodos patógenos de plantas tales como de nódulos de raíz, quísticos, de daga, de lesión o nematodos de tallo o bulbo, o contra ácaros. Para el control de plagas del suelo, por ejemplo gusano de la raíz del maíz, los compuestos se aplican ventajosamente o se incorporan a una tasa eficaz al suelo en que se plantan los cultivos o se van a plantar o a las semillas o raíces de planta en crecimiento.

[0086] En el sector de la salud pública, los compuestos son especialmente útiles en el control de muchos insectos, especialmente moscas de la basura u otras plagas de dípteros tales como moscas domésticas, moscas de los establos, moscas soldado, moscas de los cuernos, moscas del venado, moscas de caballos, jejenes, beatillas, moscas negras o mosquitos.

[0087] En la protección de productos almacenados, por ejemplo cereales incluyendo grano o harina, cacahuets, piensos animales, madera o artículos domésticos, por ejemplo alfombras y productos textiles, los compuestos de la invención son útiles contra el ataque por artrópodos, más especialmente escarabajos, incluyendo gorgojos, polillas o ácaros, por ejemplo *Ephesia spp.* (polillas de la harina), *Anthrenus spp.* (escarabajos de las alfombras), *Tribolium spp.* (escarabajos de la harina), *Sitophilus spp.* (gorgojos de los cereales) o *Acarus spp.* (ácaros).

[0088] En el control de cucarachas, hormigas o termitas o plagas de artrópodos similares en locales domésticos o industriales o en el control de larvas de mosquito en vías fluviales, pozos, depósitos u otras aguas corrientes o estancadas.

[0089] Para el tratamiento de cimientos, estructuras o suelo en prevención del ataque al edificio por termitas, por ejemplo *Reticulitermes spp.*, *Heterotermes spp.*, *Coptotermes spp.*.

[0090] En agricultura, contra adultos, larvas y huevos de lepidópteros (mariposas y polillas), por ejemplo, *Heliothis* spp. tales como *Heliothis virescens* (cogollero del tabaco), *Heliothis armigera* y *Heliothis zea*. Contra adultos y larvas de coleópteros (escarabajos), por ejemplo, *Anthonomus* spp. por ejemplo *grandis* (picudo del algodón), *Leptinotarsa decemlineata* (escarabajo de la patata), *Diabrotica* spp. (gusanos de la raíz del maíz).
 5 Contra heterópteros (hemípteros y homópteros), por ejemplo, *Psylla* spp., *Bemisia* spp., *Trialeurodes* spp., *Aphis* spp., *Myzus* spp., *Megoura viciae*, *Phylloxera* spp., *Nephotettix* spp. (saltamontes del arroz), *Nilaparvata* spp..

[0091] Contra dípteros, por ejemplo, *Musca* spp.. Contra tisanópteros tales como *Thrips tabaci*. Contra ortópteros tales como *Locusta* y *Schistocerca* spp., (langostas y grillos) por ejemplo *Gryllus* spp., y *Acheta* spp. por
 10 ejemplo *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blatella germanica*, *Locusta migratoria migratorioides*, y *Schistocerca gregaria*. Contra colémbolos por ejemplo *Periplaneta* spp. y *Blatella* spp. (cucarachas). Contra artrópodos de importancia agrícola tales como *Acari* (ácaros) por ejemplo *Tetranychus* spp. y *Panonychus* spp..

[0092] Contra nematodos que atacan plantas o árboles de importancia para agricultura, silvicultura u
 15 horticultura directamente o extendiendo enfermedades bacterianas, víricas, micoplásmicas o fúngicas de las plantas. Por ejemplo, nematodos de nódulos de raíz tales como *Meloidogyne* spp. (por ejemplo *M. incognita*).

[0093] En el campo de la medicina veterinaria o la cría de ganado o en el mantenimiento de la salud pública
 20 contra artrópodos que son parásitos internos o externos de vertebrados, particularmente vertebrados de sangre caliente, por ejemplo animales domésticos, por ejemplo vacas, ovejas, cabras, caballos, cerdos, aves de corral, perros o gatos, por ejemplo *Acarina*, incluyendo garrapatas (por ejemplo garrapatas blandas incluyendo *Argasidae* spp. por ejemplo *Argas* spp. y *Ornithodoros* spp. (por ejemplo *Ornithodoros moubata*); garrapatas duras incluyendo *Ixodidae* spp., por ejemplo *Boophilus* spp. por ejemplo *Boophilus microplus*, *Rhipicephalus* spp. por ejemplo. *Rhipicephalus appendiculatus* y *Rhipicephalus sanguineus*; ácaros (por ejemplo *Damalinia* spp.); pulgas (por
 25 ejemplo, *Ctenocephalides* spp. por ejemplo *Ctenocephalides felis* (pulga de gato) y *Ctenocephalides canis* (pulga de perro)); piojos, por ejemplo *Menopon* spp.; dípteros (por ejemplo *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Musca* spp., *Hypoderma* spp.); hemípteros; dictiópteros (por ejemplo, *Periplaneta* spp., *Blatella* spp.); himenópteros; por ejemplo contra infecciones del tracto gastrointestinal causadas por gusanos nematodos parasitarios, por ejemplo miembros de la familia *Trichostrongylidae*.

30 **[0094]** En un aspecto preferido de la invención, se usan los compuestos de fórmulas (I)/(I') para el control de parásitos de animales. Preferiblemente, el animal para tratar es un animal de compañía doméstico tal como un perro o gato.

35 **[0095]** En un aspecto adicional de la invención, los compuestos de fórmulas (I)/(I') o sales o composiciones de los mismos se usan para la preparación de un medicamento veterinario.

[0096] En el uso práctico para el control de artrópodos, especialmente insectos o arácnidos tales como ácaros, o helmintos tales como plagas de nematodos de plantas, un procedimiento comprende, por ejemplo, aplicar
 40 a las plantas o al medio en que crecen una cantidad eficaz de un compuesto de la invención. Para dicho procedimiento, el compuesto de la invención se aplica generalmente al lugar en que la infestación de artrópodo o nematodo se va a controlar a una tasa eficaz en el intervalo de aproximadamente 2 g a aproximadamente 1 kg de compuesto activo por hectárea del lugar tratado. En condiciones ideales, dependiendo de la plaga para controlar, una tasa inferior puede ofrecer una protección adecuada. Por otro lado, condiciones meteorológicas adversas,
 45 resistencia de la plaga u otros factores pueden requerir usar el ingrediente activo a tasas mayores. La tasa óptima depende habitualmente de una serie de factores, por ejemplo, el tipo de plaga que se esté controlando, el tipo de etapa de crecimiento de la planta infestada, el espaciado de fila o también el procedimiento de aplicación. Preferiblemente, un intervalo de tasa eficaz de compuesto activo es de aproximadamente 10 g/ha a aproximadamente 400 g/ha, más preferiblemente de aproximadamente 50 g/ha a aproximadamente 200 g/ha.

50 **[0097]** Cuando una plaga se transmite por el suelo, el compuesto activo, generalmente en una composición formulada, se distribuye uniformemente sobre la zona para tratar (por ejemplo, tratamiento de difusión o bandas) de cualquier manera conveniente y se aplica a tasas de aproximadamente 10 g/ha a aproximadamente 400 g de ia/ha, preferiblemente de aproximadamente 50 g/ha a aproximadamente 200 g de ia/ha. Cuando se aplica como baño de
 55 raíces a plántulas o como irrigación de baño a plantas, la solución o suspensión líquida contiene de aproximadamente 0,075 a aproximadamente 1000 mg de ia/l, preferiblemente de aproximadamente 25 a aproximadamente 200 mg de ia/l. La aplicación puede hacerse, si se desea, generalmente en el campo o zona de crecimiento del cultivo en las cercanías de la semilla o planta para proteger del ataque. El compuesto de la invención puede lavarse del suelo pulverizando con agua sobre la zona o puede dejarse a la acción natural de la lluvia.
 60 Durante o después de la aplicación, el compuesto formulado puede distribuirse mecánicamente en el suelo si se desea, por ejemplo, por arado, rastrado de discos o el uso de cadenas de arrastre. La aplicación puede ser antes de plantar, al plantar, después de plantar pero antes de que tenga lugar el brote o después del brote.

[0098] El compuesto de la invención y los procedimientos de control de plagas del mismo son particularmente
 65 valiosos para la protección de cultivos de campo, forraje, plantación, invernadero, huerto o viñedo, de plantas ornamentales o de árboles de plantación o silvicultura, por ejemplo, cereales (tales como trigo o arroz), algodón,

hortalizas (tales como pimientos), cultivos de campo (tales como remolacha azucarera, soja o colza de semilla oleaginosa), cultivos de hierba o forraje (tales como maíz o sorgo), huertos o arboledas (tales como de frutas con hueso o frutas con pepita o cítricos), plantas ornamentales, flores u hortalizas o arbustos de interior o en jardines o parques o árboles de bosque (tanto caducos como perennes) en bosques, plantaciones o viveros.

5

[0099] Son también valiosos en la protección de madera (en pie, caída, convertida, almacenada o estructural) del ataque de, por ejemplo, moscas de sierra o escarabajos o termitas.

[0100] Tienen aplicaciones en la protección de productos almacenados tales como granos, frutos, nueces, especias o tabaco, tanto enteros o molidos como combinados en productos ante el ataque de polillas, escarabajos, ácaros o gorgojos de cereales. También se protegen productos animales almacenados tales como piel, pelo, lana o plumas en forma natural o convertida (por ejemplo, como alfombras o productos textiles) del ataque de polillas o escarabajos, así como carne, pescado o granos almacenados del ataque de escarabajos, ácaros o moscas.

[0101] Adicionalmente, el compuesto de la invención y los procedimientos de uso del mismo son particularmente valiosos en el control de artrópodos o helmintos que sean dañinos, o que dispersen o actúen como vectores de enfermedades de animales domésticos, por ejemplo los mencionados anteriormente en la presente memoria, y más especialmente en el control de garrapatas, ácaros, piojos, pulgas, jejenes o moscas mordedoras, molestas o miáticas. Los compuestos de la invención son particularmente útiles en el control de artrópodos o helmintos que están presentes dentro de animales hospedadores domésticos o que se alimentan en o sobre la piel o chupan la sangre del animal, con cuyo fin pueden administrarse por vía oral, parenteral, percutánea o tópica.

[0102] Las composiciones descritas a continuación en la presente memoria para aplicación a cultivos en crecimiento o lugares de crecimiento de cultivos o como desinfección de semilla pueden emplearse, en general, en la protección de productos almacenados, artículos domésticos, propiedades o zonas del medio ambiente. Los medios adecuados de aplicación de los compuestos de la invención incluyen: a cultivos en crecimiento como pulverizadores foliares (por ejemplo, como en pulverizador de surco), polvos para espolvorear, gránulos, nieblas o espumas o también como suspensiones de composiciones finamente divididas o encapsuladas como tratamientos de suelo o raíz por pociones líquidas, polvos para espolvorear, gránulos, humos o espumas; a semillas de cultivo mediante aplicación como desinfección de semillas por suspensiones líquidas o polvos para espolvorear; a animales infestados o expuestos a infestación por artrópodos o helmintos, mediante la aplicación parenteral, oral o tópica de composiciones en que el ingrediente activo exhibe una acción inmediata y/o prolongada durante un periodo de tiempo contra artrópodos o helmintos, por ejemplo, mediante la incorporación a pienso o formulaciones farmacéuticas oralmente ingeribles, cebos comestibles, bloques de sal, suplementos dietéticos, formulaciones de vertido dorsal, pulverizadores, baños, inmersiones, duchas, chorros, polvos, grasas, champús, cremas, láminas de cera o sistemas de autotratamiento del ganado; al ambiente en general o a localizaciones específicas donde las plagas pueden acechar, incluyendo productos almacenados, madera, artículos domésticos o locales domésticos o industriales, como pulverizadores, nieblas, polvos para espolvorear, humos, láminas de cera, lacas, gránulos o cebos, o en alimentación continua a vías fluviales, pozos, depósitos u otras aguas corrientes o estancadas.

40

[0103] Los compuestos de fórmulas (I)/(I') son particularmente útiles para el control de parásitos de animales cuando se aplican por vía oral, y en un aspecto preferido adicional de la invención, los compuestos de fórmulas (I)/(I') se usan para el control de parásitos de animales mediante aplicación oral. Los compuestos de fórmulas (I)/(I') o sales de los mismos pueden administrarse antes, durante o después de las comidas. Los compuestos de fórmulas (I)/(I') o sales de los mismos pueden mezclarse con un portador y/o alimento.

45

[0104] El compuesto de fórmulas (I)/(I') o sal del mismo se administra por vía oral en una dosis al animal en el intervalo de dosis generalmente de 0,1 a 500 mg/kg del compuesto de fórmulas (I)/(I') o sal del mismo por kg de peso corporal animal (mg/kg).

50

[0105] La frecuencia de tratamiento del animal, preferiblemente el animal doméstico para tratar mediante el compuesto de fórmulas (I)/(I') o sal del mismo, es generalmente de aproximadamente una vez por semana a aproximadamente una vez al año, preferiblemente de aproximadamente una vez cada dos semanas a una vez cada tres meses.

55

[0106] Los compuestos de la invención pueden administrarse lo más ventajosamente con otro material parasiticida eficaz, tal como un endoparasiticida y/o un ectoparasiticida y/o un endectoparasiticida. Por ejemplo, dichos compuestos incluyen lactonas macrocíclicas tales como avermectinas o milbemicinas, por ejemplo, ivermectina, piratel o un regulador del crecimiento de insectos tal como lufenurón o metopreno.

60

[0107] Los compuestos de fórmulas (I)/(I') pueden emplearse también para controlar plagas en cultivos de plantas genéticamente genomanipuladas conocidas o plantas genéticamente manipuladas aún por desarrollar. Como norma, las plantas transgénicas se distinguen por propiedades especialmente ventajosas, por ejemplo, por resistencias a agentes de protección de cultivos particulares, resistencias a enfermedades de plantas o patógenos de enfermedades de plantas, tales como insectos o microorganismos particulares tales como hongos, bacterias o virus. Otras propiedades particulares hacen referencia, por ejemplo, al material cosechado con respecto a la

65

cantidad, calidad, propiedades de almacenamiento, composición y constituyentes específicos. Por tanto, son conocidas plantas transgénicas en que el contenido de almidón aumenta, o la calidad del almidón se altera, o en que el material cosechado tiene una composición de ácidos grasos diferente.

5 **[0108]** Se prefiere el uso en cultivos transgénicos económicamente importantes de plantas útiles y ornamentales, por ejemplo, de cereales tales como trigo, cebada, centeno, avena, mijo, arroz, mandioca y maíz o también cultivos de remolacha azucarera, algodón, soja, colza de semilla oleaginosa, patatas, tomates, guisantes y otros tipos de hortalizas.

10 **[0109]** Cuando se usan en cultivos transgénicos, en particular aquellos que tienen resistencias a insectos, se observan frecuentemente efectos, además de los efectos contra plagas que se observan en otros cultivos, que son específicos de la aplicación al cultivo transgénico en cuestión, por ejemplo, un espectro de plagas que pueden controlarse alterado o específicamente ampliado o tasas de aplicación que pueden emplearse para aplicación alteradas.

15 **[0110]** Por lo tanto, la invención se refiere también al uso de compuestos de fórmulas (I)/(I') para controlar plagas en plantas de cultivo transgénicas.

[0111] Según un rasgo adicional de la presente invención, se proporciona una composición plaguicida que comprende uno o más compuestos de la invención como se definen anteriormente, en asociación con, y preferiblemente dispersada homogéneamente en, uno o más diluyentes o portadores y/o agentes tensioactivos compatibles y plaguicidamente aceptables [concretamente, diluyentes o portadores y/o agentes tensioactivos del tipo aceptado generalmente en la materia como adecuado para uso en composiciones plaguicidas y que son compatibles con los compuestos de la invención].

25 **[0112]** En la práctica, los compuestos de la invención forman lo más frecuentemente parte de composiciones. Estas composiciones pueden emplearse para controlar artrópodos, especialmente insectos y arácnidos, tales como ácaros o helmintos, tales como nematodos de plantas. Las composiciones pueden ser de cualquier tipo conocido en la materia adecuado para aplicación a la plaga deseada en cualquier local o zona interior o exterior. Estas composiciones contienen al menos un compuesto de la invención como ingrediente activo en combinación o asociación con uno o más de otros componentes compatibles que son, por ejemplo, portadores o diluyentes sólidos o líquidos, coadyuvantes, agentes tensioactivos o similares apropiados para el uso pretendido y que son agronómica o médicamente aceptables. Estas composiciones, que pueden prepararse de cualquier manera conocida en la materia, forman parte igualmente de esta invención.

35 **[0113]** Los compuestos de la invención, en sus formulaciones comercialmente disponibles y en las formas para uso preparadas a partir de estas formulaciones, pueden estar presentes en mezclas con otras sustancias activas tales como insecticidas, atractores, esterilizadores, acaricidas, nematocidas, funguicidas, sustancias reguladoras del crecimiento o herbicidas.

40 **[0114]** Los plaguicidas incluyen, por ejemplo, ésteres fosfóricos, carbamatos, ésteres carboxílicos, formamidinas, compuestos de estaño y materiales producidos por microorganismos.

[0115] Son componentes preferidos en las mezclas:

45 1. Del grupo de los compuestos de fósforo:

acefato, azametifos, azinfos-etilo, azinfos-metilo, bromofos, bromofosetilo, cadusafos (F-67825), cloretoxifos, clorfenvinfos, clormefos, clorprifos, clorpirifos-metilo, demetón, demetón-S-metilo, demetón-S-metilsulfona, dialfos, 50 diazinón, diclorvos, dicrotofos, dimetoato, disulfotón, EPN, etión, etoprofos, etrimfos, famfur, fenamifos, fenitrotión, fensulfotión, fentión, flupirazofos, fonofos, formotión, fostiazato, heptenofos, isazofos, isotioato, isoxatión, malatión, metacrifos, metamidofos, metidatión, salitión, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemetón-metilo, paratión, paratión-metilo, fentoato, forato, fosadona, fosfolano, fosfocarb (BAS-301), fosmet, fosfamidón, foxim, pirimifos, pirimifos-etilo, pirimifos-metilo, profenofos, propafos, proetamfos, protiofos, piraclorfos, piridapentión, quinalfos, 55 sulprofos, temefos, terbufos, tebupirimfos, tetraclorvinfos, tiometón, triazofos, triclorfón, vamidotión;

2. del grupo de los carbamatos:

alanicarb (OK-135), aldicarb, carbamato de 2-sec-butilfenilmetilo (BPMC), carbarilo, carbofurano, carbosulfano, 60 cloetocarb, benfuracarb, etiofencarb, furatiocarb, HCN-801, isoprocarb, metomilo, (metil)carbamato de 5-metil-m-cumenilbutirilo, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, N-metil-N-(morfolintio)carbamato de 1-metiltio(etilidenamino) (UC 51717), triazamato;

3. del grupo de los ésteres carboxílicos:

65 acrinatrina, aletrina, alfametrina, (E)-(1R)-cis-2,2-dimetil-3-(2-oxotiolan-3-ilidenmetil)ciclopropanocarboxilato de 5-

bencil-3-furilmetilo, β -ciflutrina, α -cipermetrina, β -cipermetrina, bioaletrina, bioaletrina (isómero de (S)-ciclopentilo), bioresmetrina, bifentrina, (1RS)-trans-3-(4-*terc*-butilfenil)-2,2-dimetilciclopropanocarboxilato de (RS)-1-ciano-1-(6-fenoxi-2-piridil)metilo (NCI 85193), cicloprotrina, ciflutrina, cihalotrina, cititrina, cipermetina, cifenotrina, deltametrina, empentrina, esfenvalerato, fenflutrina, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flumetrina, fluvalinato (isómero D), imiprotrina (S-41311), λ -cihalotrina, permetrina, fenotrina (isómero R), praletrina, piretrinas (productos naturales), resmetrina, teflutrina, tetrametrina, θ -cipermetrina, tralometrina, transflutrina, ζ -cipermetrina (F-56701);

4. del grupo de las amidinas:

10 amitraz, clordimeformo;

5. del grupo de los compuestos de estaño:

cihexatina, óxido de fenbutatina;

15 6. otros

abamectina, ABG-9008, acetamiprid, acequinocilo, *Anagrapha falcitera*, AKD-1022, AKD-3059, ANS-118, azadiractina, *Bacillus thuringiensis*, *Beauveria bassiana*, bensultap, bifenazato, binapacril, BJI-932, bromopropilato, BTG-504, BTG-505, buprofezina, canfeclor, cartap, clorobencilato, clorfenapir, clorfluazurón, 2-(4-clorofenil)-4,5-difeniltiofeno (UBI-T930), clorfentezina, clorproxifeno, cromafenozida, clotianidina, ciclopropanocarboxilato de 2-naftilmetilo (Ro12-0470), ciromazina, diaclodén (tiامتtoxam), diafentiurón, DBI-3204, 2-cloro-N-(3,5-dicloro-4-(1,1,2,3,3,3-hexafluoro-1-propilo)fenil)carbamoil)-2-carboximidato de etilo, DDT, dicofol, diflubenzurona, N-(2,3-dihidro-3-metil-1,3-tiazol-2-iliden)-2,4-xilidina, dihidroximetildihidroxipirrolidina, dinobutón, dinocap, diofenolano, benzoato de emamectina, endosulfán, etiprol (sulfetiprol), etofenprox, etoxazol, fenazaquina, fenoxicarb, fipronil, fluazurón, flumite (flufenzina, SZI-121), 2-fluoro-5-(4-(4-etoxifenil)-4-metil-1-pentil)difeniléter (MTI 800), virus de granulosis y poliedrosis nuclear, fenpiroximato, fentocarb, fluacripirim, flubenzimina, flubrocitrinato, flucicloxurón, flufenoxurón, flufenzina, flufenprox, fluproxifeno, γ -HCH, halfenozida, halofenprox, hexaflumurón (DE_473), hexitiazox, HOI-9004, hidrametilnón (AC 217300), IKI-220, indoxacarb, ivermectina, L-14165, imidacloprid, indoxacarb (DPX-MP062), Kanemite (AKD-2023), lufenurón, M-020, M-020, metoxifenozida, milbemectina, NC-196, Neemgard, nidinoterfurano, nitenpiram, 2-nitrometil-4,5-dihidro-6H-tiazina (DS 52618), 2-nitrometil-3,4-dihidrotiazol (SD 35651), 2-nitrometilen-1,2-tiazinan-3-ilcarbamalaldehído (WL 108477), novalurón, piridarilo, propargita, protrifenbute, pimetrozina, piridabeno, porimidifeno, piriproxifeno, NC-196, NC-1111, NNI-9768, novalurón (MCW-275), OK-9701, OK-9601, OK-9602, OK-9802, R-195, RH-0345, RH-2485, RYI-210, S-1283, S-1833, SI-8601, silafluofeno, silomadina (CG-177), espinosad, espirodiclofeno, SU-9118, tebufenozida, tebufenpirad, teflubenzurón, tetradifón, tetrasul, tiacloprid, tiociclam, tiامتtoxam, tolfenpirad, triazamato, trietoxiespinosina A, triflumurón, verbutina, Vertalec (micotal), YI-5301.

[0116] Los componentes anteriormente mencionados para combinaciones son sustancias activas conocidas, muchas de las cuales se describen en Ch.R Worthing, S.B. Walker, "The Pesticide Manual", 12ª edición, British Crop Protection Council, Farnham 2000.

[0117] Las dosis de uso eficaz de los compuestos empleados en la invención pueden variar dentro de amplios límites, particularmente dependiendo de la naturaleza de la plaga para eliminar o del grado de infestación, por ejemplo, de los cultivos con estas plagas. En general, las composiciones según la invención contienen habitualmente de aproximadamente 0,05 a aproximadamente 95% (en peso) de uno o más ingredientes activos según la invención, de aproximadamente 1 a aproximadamente 95% de uno o más portadores sólidos o líquidos y, opcionalmente, de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 50% de uno o más componentes compatibles, tales como agentes tensioactivos o similares. En la presente explicación, el término "portador" denota un ingrediente orgánico o inorgánico, natural o sintético, con que se combina el ingrediente activo para facilitar su aplicación, por ejemplo, a la planta, semillas o suelo. Por lo tanto, este portador es generalmente inerte y debe ser aceptable (por ejemplo, agronómicamente aceptable, particularmente para la planta tratada).

[0118] El portador puede ser un sólido, por ejemplo arcillas, silicatos naturales o sintéticos, sílice, resinas, ceras, fertilizantes sólidos (por ejemplo, sales de amonio), minerales naturales molidos tales como caolines, arcillas, talco, tiza, cuarzo, atapulgita, montmorillonita, bentonita o tierra de diatomeas, o minerales sintéticos molidos tales como sílice, alúmina o silicatos, especialmente silicatos de aluminio o magnesio. Como portadores sólidos para gránulos, son adecuados los siguientes: rocas naturales trituradas o fraccionadas tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita y dolomita; gránulos sintéticos de harinas inorgánicas u orgánicas; gránulos de material orgánico tales como serrín, cáscaras de coco, mazorcas de maíz, cáscaras de maíz o tallos de tabaco; tierra, tierra de diatomeas, fosfato tricálcico, corcho en polvo o negro de carbón absorbente; polímeros hidrosolubles, resinas, ceras o fertilizantes sólidos. Dichas composiciones sólidas pueden contener, si se desea, uno o más agentes humectantes, dispersantes, emulsionantes o colorantes compatibles que, cuando son sólidos, pueden servir también como diluyentes.

[0119] El portador puede ser también líquido, por ejemplo, agua; alcoholes, particularmente butanol o glicol,

así como sus éteres o ésteres, particularmente acetato de metilglicol; cetonas, particularmente acetona, ciclohexanona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o isoforona; fracciones de petróleo tales como hidrocarburos parafínicos o aromáticos, particularmente xilenos o alquilnaftalenos; aceites minerales o vegetales; hidrocarburos clorados alifáticos, particularmente tricloroetano o cloruro de metileno; hidrocarburos clorados aromáticos, particularmente clorobencenos; disolventes hidrosolubles o fuertemente polares tales como dimetilformamida, dimetilsulfóxido o *N*-metilpirrolidona; gases licuados o similares o una mezcla de los mismos.

[0120] El agente tensioactivo puede ser un agente emulsionante, agente dispersante o agente humectante de tipo iónico o no iónico o una mezcla de dichos agentes tensioactivos. Entre estos están, por ejemplo, las sales de poli(ácidos acrílicos), sales de ácidos lignosulfónicos, sales de ácidos fenolsulfónicos o naftalenosulfónicos, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o ácidos grasos o ésteres grasos o aminas grasas, fenoles sustituidos (particularmente alquilfenoles o arilfenoles), sales de ésteres de ácido sulfosuccínico, derivados de taurina (particularmente tauratos de alquilo), ésteres fosfóricos de alcoholes o de policondensados de óxido de etileno con fenoles, ésteres de ácidos grasos con polioles, o derivados funcionales de sulfato, sulfonato o fosfato de los compuestos anteriores. La presencia de al menos un agente tensioactivo es generalmente esencial cuando el ingrediente activo y/o el portador inerte son solo ligeramente hidrosolubles o no son hidrosolubles y el agente portador de la composición para aplicación es agua. Las composiciones de la invención pueden contener además otros aditivos tales como adhesivos o colorantes. Pueden usarse en las formulaciones adhesivos tales como carboximetilcelulosa o polímeros naturales o sintéticos en forma de polvos, gránulos o látex, tales como goma arábica, poli(alcohol vinílico) o poli(acetato de vinilo), fosfolípidos naturales tales como cefalinas o lecitinas o fosfolípidos sintéticos. Es posible usar colorantes tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo; óxidos de hierro, óxidos de titanio o azul de Prusia; tintes orgánicos tales como tintes de alizarina, tintes azoicos o tintes de ftalocianina metálica u oligonutrientes tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno o cinc.

[0121] Para su aplicación agrícola, los compuestos de la invención están por lo tanto generalmente en forma de composiciones en diversas formas sólidas o líquidas. Las formas sólidas de composiciones que pueden usarse son polvos para espolvorear (con un contenido del compuesto de la invención en el intervalo hasta 80%), polvos o gránulos humectables (incluyendo gránulos dispersables en agua), particularmente aquellos obtenidos por extrusión, compactación o impregnación de un portador granular, o granulación a partir de un polvo (estando el contenido del compuesto de la invención, en estos polvos o gránulos humectables entre aproximadamente 0,5 y aproximadamente 80%). Las composiciones sólidas homogéneas o heterogéneas que contienen uno o más compuestos de la invención, por ejemplo gránulos, aglomerados, briquetas o cápsulas, pueden usarse para tratar agua estancada o corriente durante un periodo de tiempo. Puede conseguirse un efecto similar usando alimentaciones continuas o intermitentes de concentrados dispersables en agua como se describe en la presente memoria.

[0122] Las composiciones líquidas incluyen, por ejemplo, disoluciones o suspensiones acuosas o no acuosas (tales como concentrados emulsionables, emulsiones, fluidos, dispersiones o disoluciones) o aerosoles. Las composiciones líquidas incluyen también, en particular, concentrados emulsionables, dispersiones, emulsiones, fluidos, aerosoles, polvos humectables (o polvo para pulverizar), fluidos secos o pastas como formas de composiciones que son líquidas o con que se pretende formar composiciones líquidas cuando se aplican, por ejemplo, como pulverizadores acuosos (incluyendo de volumen bajo y ultrabajo) o como nieblas o aerosoles.

[0123] Las composiciones líquidas, por ejemplo en forma de concentrados emulsionables o solubles, comprenden lo más frecuentemente de aproximadamente 5 a aproximadamente 80% en peso del ingrediente activo, mientras que las emulsiones o disoluciones que están listas para aplicación contienen, en su caso, de aproximadamente 0,01 a aproximadamente 20% del ingrediente activo. Además del disolvente, los concentrados emulsionables o solubles pueden contener, cuando sea necesario, de aproximadamente 2 a aproximadamente 50% de aditivos adecuados, tales como estabilizantes, agentes tensioactivos, agentes de penetración, inhibidores de la corrosión, colorantes o adhesivos. Las emulsiones de cualquier concentración requerida, que son particularmente adecuadas para aplicación, por ejemplo, a plantas, pueden obtenerse a partir de estos concentrados mediante dilución con agua. Estas composiciones se incluyen dentro del alcance de las composiciones que pueden emplearse en la presente invención. Las emulsiones pueden estar en forma de tipo agua en aceite o aceite en agua y pueden tener una consistencia densa.

[0124] Las composiciones líquidas de esta invención pueden usarse, además de para aplicaciones de uso agrícola normales, por ejemplo para tratar sustratos o sitios infestados o susceptibles de infestación con artrópodos (u otras plagas controladas por los compuestos de esta invención) incluyendo locales, almacenamiento exterior o interior o zonas de procesamiento, depósitos o equipos o agua estancada o corriente.

[0125] Todas estas dispersiones o emulsiones o mezclas de pulverización acuosas pueden aplicarse, por ejemplo, a cultivos mediante cualquier medio adecuado, principalmente por pulverización, a tasas que son generalmente del orden de aproximadamente 100 a aproximadamente 1.200 l de mezcla de pulverización por hectárea, pero pueden ser mayores o menores (por ejemplo, de volumen bajo o ultrabajo), dependiendo de la necesidad o de la técnica de aplicación. El compuesto o composiciones según la invención se aplican convenientemente a la vegetación y en particular a las raíces u hojas que tengan plagas para eliminar. Otro

procedimiento de aplicación de los compuestos o composiciones según la invención es mediante quimigación, es decir, la adición de una formulación que contiene el ingrediente activo al agua de irrigación. Esta irrigación puede ser irrigación por aspersión para plaguicidas foliares o puede ser irrigación de suelo o irrigación subterránea para plaguicidas de suelo o sistémicos.

5

[0126] Las suspensiones concentradas, que pueden aplicarse por pulverización, se preparan para producir un producto fluido estable que no sedimente (molido fino) y contienen habitualmente de aproximadamente 10 a aproximadamente 75% en peso de ingrediente activo, de aproximadamente 0,5 a aproximadamente 30% de agentes tensioactivos, de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 10% de agentes tixotrópicos, de aproximadamente 0 a aproximadamente 30% de aditivos adecuados, tales como agentes antiespumantes, inhibidores de la corrosión, estabilizantes, agentes de penetración, adhesivos y, como portador, agua o un líquido orgánico en que el ingrediente activo sea poco soluble o insoluble. Algunos sólidos orgánicos o sales inorgánicas pueden disolverse en el portador para ayudar a evitar la sedimentación o como anticongelante para el agua.

10

[0127] Los polvos humectables (o polvo para pulverizar) se preparan habitualmente de modo que contengan de aproximadamente 10 a aproximadamente 80% en peso de ingrediente activo, de aproximadamente 20 a aproximadamente 90% de un portador sólido, de aproximadamente 0 a aproximadamente 5% de un agente humectante, de aproximadamente 3 a aproximadamente 10% de un agente dispersante y, cuando sea necesario, de aproximadamente 0 a aproximadamente 80% de uno o más estabilizantes y/u otros aditivos, tales como agentes de penetración, adhesivos, agentes antiaglomerantes, colorantes o similares. Para obtener estos polvos humectables, el ingrediente activo se mezcla concienzudamente en un mezclador adecuado con sustancias adicionales que pueden estar impregnadas en la carga porosa y se muele usando un molino u otro triturador adecuado. Esto produce polvos humectables cuya humectabilidad y suspendibilidad son ventajosas. Pueden suspenderse en agua dando cualquier concentración deseada, y esta suspensión puede emplearse muy ventajosamente en particular para aplicación al follaje de planta.

25

[0128] Los "gránulos dispersables en agua (WG)" (gránulos que son fácilmente dispersables en agua) tienen composiciones que son sustancialmente parecidas a las de los polvos humectables. Pueden prepararse mediante la granulación de formulaciones descritas para polvos humectables, por vía húmeda (poniendo en contacto el ingrediente activo finamente dividido con una carga inerte y un poco de agua, por ejemplo 1 a 20% en peso, o con una disolución acuosa de agente dispersante o ligante, seguido de secado y cribado), o por vía seca (compactación seguida de molido y cribado).

30

[0129] Las tasas y concentraciones de las composiciones formuladas pueden variar según el procedimiento de aplicación o la naturaleza de las composiciones o el uso de las mismas. Hablando en general, las composiciones para aplicación para controlar plagas de artrópodos o nematodos de plantas contienen habitualmente de aproximadamente 0,00001% a aproximadamente 95%, más particularmente de aproximadamente 0,0005% a aproximadamente 50% en peso de uno o más compuestos de la invención, o de los ingredientes activos totales (es decir, los compuestos de la invención junto con las demás sustancias tóxicas para artrópodos o nematodos de plantas, sinergistas, oligoelementos o estabilizantes). Las composiciones reales empleadas y su tasa de aplicación se seleccionarán para conseguir el efecto o efectos deseados por el granjero, productor de ganado, facultativo médico o veterinario, operario de control de plagas u otra persona experta en la materia.

40

[0130] Las composiciones sólidas o líquidas para aplicación por vía tópica a animales, madera, productos almacenados o artículos domésticos contienen habitualmente de aproximadamente 0,00005% a aproximadamente 90%, más particularmente de aproximadamente 0,001% a aproximadamente 10%, en peso de uno o más compuestos de la invención. Para administración a animales por vía oral o parenteral, incluyendo composiciones sólidas o líquidas percutáneas, estas contienen normalmente de aproximadamente 0,1% a aproximadamente 90% en peso de uno o más compuestos de la invención.

50

[0131] Los alimentos medicados contienen normalmente de aproximadamente 0,001% a aproximadamente 3% del peso de uno o más compuestos de la invención. Los concentrados o suplementos para mezclar con alimentos contienen normalmente de aproximadamente 5 a aproximadamente 90%, preferiblemente de aproximadamente 5 a aproximadamente 50% en peso, de uno o más compuestos de la invención. Los bloques de sal mineral contienen normalmente de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 10% en peso de uno o más compuestos de fórmula (I) o sales plaguicidamente aceptables de los mismos.

55

[0132] Los polvos para espolvorear o composiciones líquidas para aplicación a ganado, productos, locales o zonas exteriores pueden contener de aproximadamente 0,0001% a aproximadamente 15%, más especialmente de aproximadamente 0,005% a aproximadamente 2,0% en peso, de uno o más compuestos de la invención. Las concentraciones adecuadas en aguas tratadas son de entre aproximadamente 0,0001 ppm y aproximadamente 20 ppm, más particularmente de aproximadamente 0,001 ppm a aproximadamente 5,0 ppm, de uno o más compuestos de la invención, y pueden usarse terapéuticamente en piscicultura con tiempos de exposición apropiados. Los cebos comestibles pueden contener de aproximadamente 0,01 a aproximadamente 5%, preferiblemente de aproximadamente 0,01 a aproximadamente 1,0% en peso de uno o más compuestos de la invención.

65

[0133] Cuando se administran a vertebrados por vía parenteral, oral o percutánea u otros medios, la dosificación de los compuestos de la invención dependerá de la especie, edad o salud del vertebrado y de la naturaleza y grado de su infestación actual o potencial por plagas de artrópodos o helmintos. Es generalmente adecuada para administración oral o parenteral una sola dosis de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 100 mg, preferiblemente de aproximadamente 2,0 a aproximadamente 20,0 mg, por kg de peso corporal del animal, o dosis de aproximadamente 0,01 a aproximadamente 20,0 mg, preferiblemente de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 5,0 mg por kg de peso corporal del animal al día, para medicación mantenida. Mediante el uso de formulaciones o dispositivos de liberación mantenida, las dosis diarias requeridas durante un periodo de meses pueden combinarse y administrarse a animales de una sola vez.

[0134] Las siguientes composiciones de los EJEMPLOS 2A - 2M ilustran composiciones para uso contra artrópodos, especialmente ácaros o insectos o nematodos de plantas, que comprenden, como ingrediente activo, compuestos de la invención tales como los descritos en los ejemplos preparativos. Las composiciones descritas en los EJEMPLOS 2A - 2M pueden diluirse cada uno, dando una composición pulverizable a las concentraciones adecuadas para uso en el campo. Las descripciones químicas genéricas de los ingredientes (para los que todos los siguientes porcentajes son porcentajes en peso) usados en la composición de los EJEMPLOS 2A - 2M ejemplificados a continuación, son como siguen:

Nombre comercial	Descripción química
Ethylan BCP	Condensado de nonilfenol-óxido de etileno
Soprophor BSU	Condensado de triestirilfenol-óxido de etileno
Arylan CA	Una disolución al 70% p/v de dodecibencenosulfonato de sodio
Solvesso 150	Disolvente aromático C ₁₀ ligero
Arylan S	Dodecibencenosulfonato de sodio
Darvan NO ₂	Lignosulfonato de sodio
Celite PF	Portador de silicato de magnesio sintético
Sopropion T36	Sales de sodio de poli(ácidos carboxílicos)
Rhodigel 23	Goma de xantana polisacárida
Bentone 38	Derivado orgánico de montmorillonita de magnesio
Aerosil	Dióxido de silicio microfino

20 EJEMPLO 2A

[0135] Se prepara una disolución hidrosoluble con la composición siguiente:

Ingrediente activo	7%
Ethylan BCP	10%
N-metilpirrolidona	83%

[0136] Se añade el ingrediente activo a una disolución de Ethylan BCP disuelto en una parte de N-metilpirrolidona con calentamiento y agitación hasta disolverse. Se completa el volumen de la disolución resultante con el resto del disolvente.

EJEMPLO 2B

[0137] Se prepara un concentrado emulsionable (EC) con la composición siguiente:

Ingrediente activo	25% (máx)
Soprophor BSU	10%
Arylan CA	5%
N-metilpirrolidona	50
Solvesso 150	10%

[0138] Los tres primeros componentes se disuelven en N-metilpirrolidona y se añade a esta entonces Solvesso 150, dando el volumen final.

EJEMPLO 2C

[0139] Se prepara un polvo humectable (WP) con la composición siguiente:

Ingrediente activo	40%
Arylan S	2%
Darvan NO ₂	5%
Celite PF	53%

[0140] Se mezclan los ingredientes y se muelen en un molino de martillos hasta un polvo con un tamaño de

partícula de menos de 50 µm.

EJEMPLO 2D

- 5 [0141] Se prepara una formulación acuosa fluida con la composición siguiente:

Ingrediente activo	40,00%
Ethylan BCP	1,00%
Sopropon T360	0,20%
Etilenglicol	5,00%
Rhodigel 230	0,15%
Agua	53,65%

[0142] Se mezclan íntimamente los ingredientes y se muelen en un molino de bolas hasta obtener un tamaño medio de partícula menor de 3 µm.

10

EJEMPLO 2E

- [0143] Se prepara un concentrado de suspensión emulsionable con la composición siguiente:

Ingrediente activo	30,0%
Ethylan BCP	10,0%
Bentone 38	0,5%
Solvesso 150	59,5%

15

[0144] Se mezclan íntimamente los ingredientes y se muelen en un molino de bolas hasta obtener un tamaño medio de partícula de menos de 3 µm.

EJEMPLO 2F

20

- [0145] Se prepara un gránulo dispersable en agua con la composición siguiente:

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

- [0146] Se mezclan los ingredientes, se micronizan en molino de energía fluida y se granulan entonces en una peletizadora giratoria pulverizando con agua (hasta 10%). Se secan los gránulos resultantes en un secador de lecho fluido para retirar el exceso de agua.

25

EJEMPLO 2G

- 30 [0147] Se prepara un polvo para espolvorear con la composición siguiente:

Ingrediente activo	1 a 10%
Talco en polvo superfino	99 a 90%

- [0148] Se mezclan íntimamente los ingredientes y se muelen adicionalmente según sea necesario para conseguir un polvo fino. Este polvo puede aplicarse a un lugar de infestación de artrópodos, por ejemplo vertederos de residuos, productos almacenados o artículos domésticos, o a animales infestados, o con riesgo de infestación, por artrópodos para controlar los artrópodos mediante ingestión oral. Los medios adecuados para distribuir el polvo para espolvorear en el lugar de infestación de artrópodos incluyen sopladores mecánicos, agitadores manuales o dispositivos de autotratamiento de ganado.

35

EJEMPLO 2H

- [0149] Se prepara un cebo comestible con la composición siguiente:

Ingrediente activo	0,1 a 10%
Harina de trigo	80%
Melazas	19,9 a 19%

- 45 [0150] Se mezclan íntimamente los ingredientes y se conforman según se requiera en forma de cebo. Este cebo comestible puede distribuirse en un lugar, por ejemplo locales domésticos o industriales, por ejemplo cocinas, hospitales o almacenes, o zonas exteriores, infestados por artrópodos, por ejemplo hormigas, langostas, cucarachas

o moscas, para controlar los artrópodos por ingestión oral.

EJEMPLO 2I

- 5 [0151] Se prepara una formulación de disolución con la composición siguiente:

Ingrediente activo	15%
Dimetilsulfóxido	85%

- [0152] Se disuelve el ingrediente activo en dimetilsulfóxido con mezclado o calentamiento según sea necesario. Esta disolución puede aplicarse por vía percutánea como una aplicación de vertido dorsal a animales domésticos infestados por artrópodos o, después de esterilización mediante filtración a través de una membrana de politetrafluoroetileno (0,22 µm de tamaño de poro), por inyección parenteral a una tasa de aplicación de 1,2 a 12 ml de disolución por 100 kg de peso corporal animal.

EJEMPLO 2J

- 15 [0153] Se prepara un polvo humectable con la composición siguiente:

Ingrediente activo	50%
Ethylan BCP	5%
Aerosil	5%
Celite PF	40%

- [0154] Se absorbe el Ethylan BCP sobre el Aerosil, que se mezcla entonces con los demás ingredientes y se muele en un molino de martillos hasta un polvo humectable, que puede diluirse con agua hasta una concentración de 0,001% a 2% en peso del compuesto activo y aplicarse a un lugar de infestación por artrópodos, por ejemplo larvas de dípteros o nematodos de plantas, mediante pulverización, o a animales domésticos infestados o con riesgo de infección por artrópodos, por pulverización o inmersión, o por administración oral en el agua de bebida, para controlar los artrópodos.

EJEMPLO 2K

- [0155] Se forma una composición de bolo de liberación lenta a partir de gránulos que contienen los siguientes componentes en porcentajes variables (similares a los descritos para las composiciones anteriores) dependiendo de la necesidad:

Ingrediente activo
Agente densificante
Agente de liberación lenta
35 Aglutinante

- [0156] Se conforman los ingredientes mezclados íntimamente en gránulos que se comprimen en un bolo con una densidad relativa de 2 o más. Este puede administrarse por vía oral a animales domésticos rumiantes para retención en el retículo-rumen, dando una liberación lenta continua del compuesto activo durante un periodo extenso de tiempo para controlar la infestación de los animales domésticos rumiantes por artrópodos.

EJEMPLO 2L

- [0157] Puede prepararse una composición de liberación lenta en forma de gránulos, aglomerados, briquetas o similares con las composiciones siguientes:

Ingrediente activo	0,5 a 25%
Poli(cloruro de vinilo)	75 a 99,5%
Ftalato de dioctilo (plastificante)	

- [0158] Se combinan los componentes y se conforman entonces en formas adecuadas por extrusión en estado fundido o moldeo. Estas composiciones son útiles, por ejemplo, para adición a agua estancada o para fabricación en collares o crotales para poner a animales domésticos para controlar las plagas por liberación lenta.

EJEMPLO 2M

- [0159] Se prepara un gránulo dispersable en agua con la composición siguiente:

Ingrediente activo	85% (max)
Polivinilpirrolidona	5%

Arcilla de atapulgita	6%
Laurilsulfato de sodio	2%
Glicerina	2%

[0160] Se mezclan los ingredientes en una suspensión al 45% con agua y se muelen en húmedo hasta un tamaño de partícula de 4 µm, entonces se secan por pulverización para retirar el agua.

5 PROCEDIMIENTOS DE USO PLAGUICIDA

[0161] Se realizaron los siguientes procedimientos de ensayo representativos, usando compuestos de la invención, para determinar la actividad parasitocida y plaguicida de los compuestos de la invención.

10 **PROCEDIMIENTO A:** Procedimiento de cribado para ensayar la sistemicidad de los compuestos contra *Ctenocephalides felis* (pulga de gato)

[0162] Se rellenó un recipiente de ensayo con 10 adultos de *Ctenocephalides felis*. Se cerró un cilindro de vidrio por un extremo con Parafilm y se dispuso encima del recipiente de ensayo. Se pipeteó entonces la disolución de compuesto de ensayo en sangre bovina y se añadió al cilindro de vidrio. Se mantuvieron las *Ctenocephalides felis* tratadas en este ensayo de perro artificial (sangre a 37°C, 40-60% de humedad relativa; *Ctenocephalides felis* a 20-22°C, 40-60% de humedad relativa) y se efectuó la valoración a las 24 y 48 horas después de la aplicación.

[0163] Los compuestos activos dieron un control de al menos un 90% de las *Ctenocephalides felis* a una concentración de ensayo de 5 ppm o menos.

PROCEDIMIENTO B: Cribado de *Diabrotica undecimpunctata* (gusano de la raíz del maíz meridional)

[0164] Dos días antes de la aplicación, se empaparon semillas de maíz en agua en condiciones templadas para desencadenar una germinación rápida. Un día antes de la aplicación, se transfirieron huevos de *Diabrotica undecimpunctata* a la mitad de un papel de filtro japonés dispuesto en una placa Petri de plástico. Después de ello, se dispuso una semilla de maíz brotada en una almohadilla humedecida al lado del papel de filtro. Se pipetearon cuidadosamente sobre el huevo 3 gotas de 200 µl de disolución de compuesto de ensayo. Se dispuso el resto de la disolución sobre el maíz y se cerró entonces la placa Petri. Se mantuvieron los huevos tratados en las placas Petri en una cámara climatizada durante 6 días. Se valoró la eficacia del compuesto (porcentaje de huevos y/o larvas muertos en comparación con el control no tratado) 6 días después de la aplicación usando un microscopio binocular.

[0165] Los compuestos activos dieron un control de al menos un 90% de *Diabrotica undecimpunctata* a una concentración de ensayo de 10 ppm.

PROCEDIMIENTO C: Cribado de *Nephotettix cincticeps* (saltahojas del arroz)

[0166] Se sumergieron las hojas de 12 plantas de arroz que tienen una longitud de tallo de 8 cm durante 5 segundos en una disolución acuosa del compuesto de ensayo formulado. Después de escurrir la disolución, se dispusieron las plantas de arroz tratadas de esta manera en una placa Petri y se poblaron con aproximadamente 20 larvas (etapa L3) de *Nephotettix cincticeps*. Se cerró la placa Petri y se almacenó entonces en una cámara climatizada (16 horas de luz/día, 25°C, 40-60% de humedad relativa). Después de 6 días de almacenamiento, se determinó la mortalidad porcentual de las larvas de saltahojas.

[0167] Los compuestos activos dieron al menos un 98% de mortalidad de larvas de *Nephotettix cincticeps* a una concentración de ensayo de 100 ppm.

PROCEDIMIENTO D: Procedimiento de cribado para ensayar la actividad de contacto contra *Ctenocephalides felis* (pulga de gato)

[0168] Se añadieron gota a gota disoluciones de los compuestos de ensayo sobre papel de filtro, se secaron, se dispuso el papel de filtro en tubos de ensayo y se infestaron con 10 adultos de *Ctenocephalides felis*. Se mantuvieron las *Ctenocephalides felis* tratadas en una cámara climatizada (26°C, 80% de HR) y se valoró la eficacia porcentual a las 24 y 48 horas después de la aplicación en comparación con el control no tratado.

[0169] Los compuestos activos dieron un control de contacto de al menos un 70% de *Ctenocephalides felis* a una concentración de ensayo de 1000 ppm.

PROCEDIMIENTO E: Procedimiento de cribado para ensayar la actividad de contacto contra *Rhipicephalus sanguineus* (garrapata marrón del perro)

[0170] Se añadieron gota a gota disoluciones de los compuestos de ensayo sobre papel de filtro, se secaron, se dispuso el papel de filtro en tubos de ensayo, se infestó con 20-30 larvas (L1) de *Rhipicephalus sanguineus* y se

cerraron los tubos con una abrazadera. Se mantuvieron las *Rhipicephalus sanguineus* tratadas en una cámara climatizada (25°C, 90% de HR) y se valoró la eficacia porcentual a las 24 horas después de la aplicación en comparación con el control no tratado.

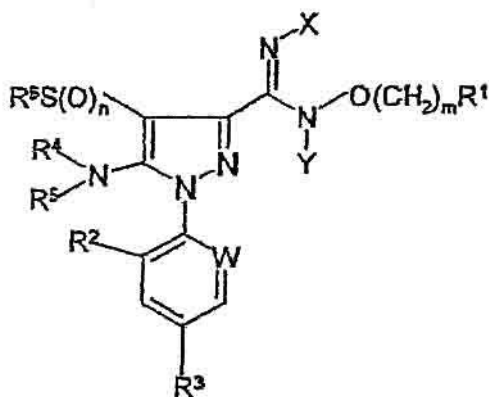
5 [0171] Los compuestos activos dieron un control de contacto de al menos un 70% de *Rhipicephalus sanguineus* a una concentración de ensayo de 100 ppm.

[0172] Los siguientes números de compuesto eran activos en uno o más de los ensayos anteriores: 1-49, 3-25, 4-82, 4-93, 4-101, 4-114, 4-115, 4-117, 4-121, 4-128, 4-136, 4-144, 4-152, 4-153, 5-1, 6-2, 6-42, 7-1, 7-127.

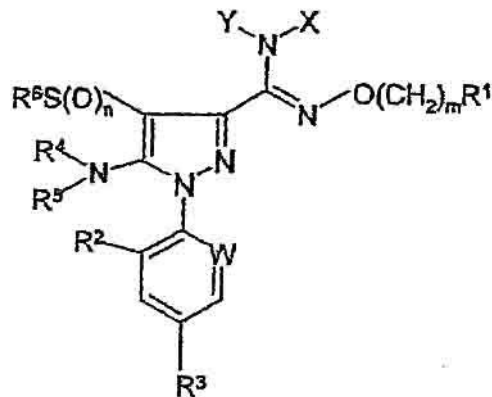
10

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmulas (Ia) o (Ib):



(Ia)



(Ib)

5

en las que:

R^1 es arilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales R^{15} ;

10

X e Y son cada uno independientemente H, alqueno C_3-C_6 , halogenoalqueno C_3-C_6 , alquino C_3-C_6 , halogenoalquino C_3-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , -alquil C_1-C_4 -cicloalquilo C_3-C_7 , $-CO_2$ -alquilo C_1-C_6 , $CONR^7R^8$, $CONR^8R^9$, $-CO_2-(CH_2)_qR^7$, $-(CH_2)_qR^7$, $-(CH_2)_qR^{10}$, COR^8 , SO_2R^{13} o COR^{17} ; o alquilo C_1-C_6 no sustituido o sustituido con uno o más radicales R^{11} ;

15

W es N, C- CH_3 o C-halógeno;

R^2 es hidrógeno, CH_3 o halógeno;

20

R^3 es halógeno, alquilo C_1-C_3 , halogenoalquilo C_1-C_3 , halogenoalcoxilo C_1-C_3 , $S(O)_p$ -halogenoalquilo C_1-C_3 o SF_5 ;

R^4 es H, alqueno C_3-C_6 , halogenoalquilo C_3-C_6 , alquino C_3-C_6 , halogenoalquino C_3-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , $-CO_2$ -alquilo C_1-C_6 , $-CO_2$ -cicloalquilo C_3-C_7 ; $-CO_2$ -alquil C_1-C_4 -cicloalquilo C_3-C_7 , $-CO_2$ -alqueno C_3-C_6 , $-CO_2-(CH_2)_qR^7$, $CONR^8R^9$, $-CO_2-(CH_2)_qR^{10}$, $-(CH_2)_qR^7$, $-(CH_2)_qR^{10}$, COR^8 o $COCH_2O$ -alquilo C_1-C_4 ; o alquilo C_1-C_6 no sustituido o sustituido con uno o más radicales R^{11} ;

25

R^5 es H, alquino C_2-C_6 , $-CO_2$ -alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 o $-SO_2R^{12}$; o alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 o CO -alquilo C_1-C_6 , estando dichos últimos tres grupos mencionados no sustituidos o sustituidos con uno o más radicales R^{11} ;

30

R^6 y R^{13} son cada uno independientemente alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , halogenoalqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , halogenoalquino C_2-C_6 o cicloalquilo C_3-C_7 ;

R^7 es fenilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_6 , alcoxilo C_1-C_6 , halogenoalcoxilo C_1-C_6 , CN, NO_2 , $S(O)_pR^{13}$ y NR^9R^{14} ;

35

R^8 es H, alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , -alquil C_1-C_4 -cicloalquilo C_3-C_7 , $-(CH_2)_qR^7$ o $-(CH_2)_qR^{10}$;

40

R^9 y R^{14} son cada uno independientemente H, alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 o -alquil C_1-C_4 -cicloalquilo C_3-C_7 ; o

R^8 y R^9 , junto con el átomo de N unido, forman un anillo saturado de 5 o 6 miembros que opcionalmente contiene un heteroátomo adicional en el anillo que se selecciona de O, S y N, estando el anillo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_6 y halógeno;

45

R^{11} es halógeno, alcoxilo C_1-C_6 , halogenoalcoxilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , $S(O)_pR^{13}$, $-CO_2$ -alquilo C_1-C_6 , $-O(C=O)$ -alquilo C_1-C_6 , CO -alquilo C_1-C_6 , CO -halogenoalquilo C_1-C_6 , NR^8R^9 , $CONR^8R^9$, $SO_2NR^8R^9$, OH, CN, NO_2 , OR^7 , NR^8COR^{14} , $NR^8SO_2R^{13}$ u OR^{10} ; R^{12} es cicloalquilo C_3-C_7 , alqueno C_2-C_6 , haloalqueno C_2-C_6 o R^{10} ; o fenilo no

sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados de R^{15} ; o es alquilo C_1-C_6 no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alcoxilo C_1-C_6 , halogenoalcoxilo C_1-C_6 , alquilen C_3-C_6 -oxilo, halogenoalquilen C_3-C_6 -oxilo, alquini C_3-C_6 -oxilo, halogenoalquini C_3-C_6 -oxilo, cicloalquilo C_3-C_7 , $S(O)_pR^{10}$, $S(O)_pR^{13}$, $S(O)_pR^{13}$, CN, NO_2 , OH, COR^8 , NR^8COR^{14} , $NR^8SO_2R^{13}$, $CONR^8R^9$, NR^8R^9 , OR^7 , OR^{10} , R^{16} , R^{10} y CO_2R^8 ;

R^{15} es halógeno, alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_6 , alcoxilo C_1-C_6 , halogenoalcoxilo C_1-C_6 , CN, NO_2 , $S(O)_pR^{13}$, NR^8R^9 , COR^{13} , COR^7 , $CONR^8R^9$, $SO_2NR^8R^9$, R^7 , SF_5 , OH, OR^7 , R^{18} , OR^{18} , SO_3H o alquiliden C_1-C_6 -imino;

10 R^{16} es fenilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_6 , alcoxilo C_1-C_6 , halogenoalcoxilo C_1-C_6 , CN, NO_2 , $S(O)_pR^{13}$, NR^8R^9 , COR^{13} , COR^7 , $CONR^8R^9$, $SO_2NR^8R^9$, OH, SO_3H y alquiliden C_1-C_6 -imino;

R^{17} es alquilo C_1-C_5 que está sustituido con alcoxilo C_1-C_6 , $S(O)_p$ -alquilo C_1-C_6 o $S(O)_p$ -halogenoalquilo C_1-C_5 ;

15 R^{18} es un radical heteroaromático seleccionado del grupo consistente en piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tienilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, furilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo y triazolilo, estando dichos grupos no sustituidos o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_6 y alcoxilo C_1-C_6 ;

20 m es 1 o 2;

n y p son cada uno independientemente 0, 1 o 2;

25 q es 0 o 1;

o una sal plaguicidamente aceptable de los mismos.

2. Un compuesto o sal del mismo según la reivindicación 1, en el que R^1 es fenilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_6 , alcoxilo C_1-C_6 , halogenoalcoxilo C_1-C_6 , CN, NO_2 , $S(O)_pR^{13}$, NR^8R^9 , COR^{13} y $CONR^8R^9$; y en que R^8 y R^9 son cada uno independientemente H o alquilo C_1-C_6 , o R^8 y R^9 , junto con el átomo de N unido, forman un anillo saturado de 5 o 6 miembros que contiene opcionalmente un heteroátomo adicional en el anillo que se selecciona de O, S y N, estando el anillo no sustituido o sustituido con uno o más radicales alquilo C_1-C_3 ; y R^{13} es alquilo C_1-C_3 o halogenoalquilo C_1-C_3 .

3. Un compuesto o sal del mismo según la reivindicación 1 o 2, en el que X e Y son cada uno independientemente H, alquilo C_1-C_6 o CO-alquilo C_1-C_6 .

40 4. Un compuesto o sal del mismo según la reivindicación 1, 2 o 3, en el que W es C-Cl.

5. Un compuesto o sal del mismo según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en el que R^2 es Cl.

6. Un compuesto o sal del mismo según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, en el que R^3 es CF_3 .

7. Un compuesto o sal del mismo según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en el que R^4 es H, alquilo C_1-C_6 , alqueni C_3-C_6 , alquini C_3-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , $-CO_2$ -alquilo C_1-C_6 , -alquilo C_1-C_6 -cicloalquilo C_3-C_7 , $COCH_2O$ -alquilo C_1-C_4 , -alquil $C_1-C_6-S(O)_p$ -alquilo C_1-C_6 o $-CH_2R^7$, en que R^7 es fenilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados de halógeno, alquilo C_1-C_3 , halogenoalquilo C_1-C_3 , alcoxilo C_1-C_3 , halogenoalcoxilo C_1-C_3 , CN, NO_2 y $S(O)_pR^{13}$, y R^{13} es alquilo C_1-C_3 o halogenoalquilo C_1-C_3 .

8. Un compuesto o sal del mismo según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, en el que R^5 es H, alquilo C_1-C_6 , alqueni C_3-C_6 , alquini C_3-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , $-CO_2$ -alquilo C_1-C_6 o -alquil C_1-C_6 -cicloalquilo C_3-C_7 .

9. Un compuesto o sal del mismo según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, en el que R^6 es CF_3 .

60 10. Un compuesto o sal del mismo según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, en el que m es 1.

11. Un compuesto o sal del mismo según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, en el que R^1 es fenilo;

X e Y son cada uno independientemente H, metilo o acetilo;

65 W es C-Cl;

R^2 es Cl;

R^3 y R^6 son cada uno CF_3 ;

5

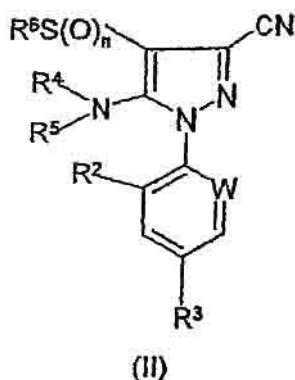
R^4 y R^5 son cada uno independientemente H, metilo, etilo, alilo, propargilo, ciclopropilo, bencilo, ciclopropimetilo, metiltioetilo, etoxiacetilo o etoxicarbonilo; y m es 1.

12. Un proceso para la preparación de un compuesto de fórmula (I) o una sal del mismo como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11, comprendiendo dicho proceso:

10

a) cuando (I) es una fórmula (Ia), X es H, m y R^1 son como se definen en la reivindicación 1, Y es como se define en la reivindicación 1 con la exclusión de H y los demás símbolos son como se definen en la reivindicación 1, hacer reaccionar un compuesto de fórmula (II):

15



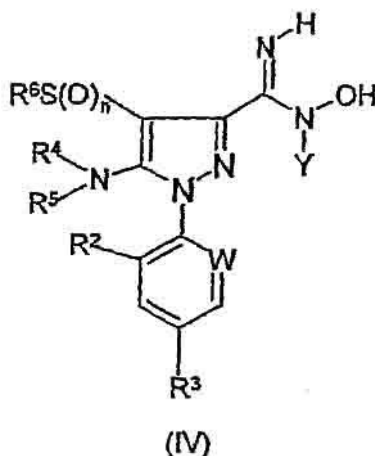
en la que R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , W y n son como se definen en la reivindicación 1, con un compuesto de fórmula (III):

20



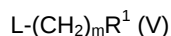
en la que R^1 y m son como se definen en la reivindicación 1 e Y es como se define en la reivindicación 1 con la exclusión de H; o

25 b) cuando (I) es una fórmula (Ia), X es H, m y R^1 son como se definen en la reivindicación 1, Y es como se define en la reivindicación 1 con la exclusión de H y los demás símbolos son como se definen en la reivindicación 1, hacer reaccionar un compuesto de fórmula (IV):



30

en la que los diversos símbolos son como se definen en la reivindicación 1, con un compuesto de fórmula (V):



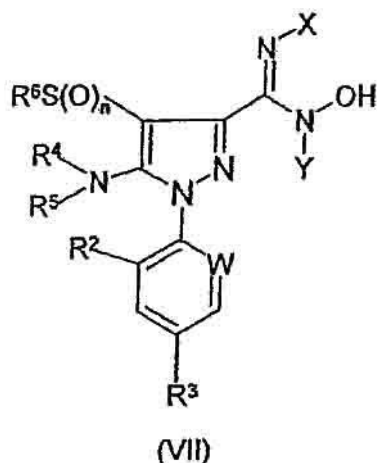
35 en la que R^1 y m son como se definen en la reivindicación 1 y L es un grupo saliente; o

c) cuando (I) es una fórmula (Ia), X es como se define en la reivindicación 1 con la exclusión de H y los demás símbolos son como se definen en la reivindicación 1, la alquilación, acilación o sulfonilación del correspondiente compuesto de fórmula (Ia) en la que X es H, usando un compuesto de fórmula (VI):

5 $X-L^1$ (VI)

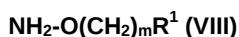
en la que X es como se define en la reivindicación 1 con la exclusión de H y L^1 es un grupo saliente; o

d) cuando (I) es una fórmula (Ia), X, Y y los demás símbolos son como se definen en la reivindicación 1, la reacción
10 de un compuesto de fórmula (VII):



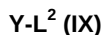
en la que los diversos símbolos son como se definen en la reivindicación 1, con un compuesto de fórmula (V) como
15 se define anteriormente; o

e) cuando (I) es una fórmula (Ib), X e Y son cada uno H, y m, R^1 y los demás símbolos son como se definen en la reivindicación 1, la reacción de un compuesto de fórmula (II) como se define en la reivindicación 1 con un compuesto
20 de fórmula (VIII):



en la que R^1 y m son como se definen en la reivindicación 1; o

25 f) cuando (I) es una fórmula (Ib), X es H, Y es como se define en la reivindicación 1 con la exclusión de H, y los demás símbolos son como se definen en la reivindicación 1, la alquilación, acilación o sulfonilación del correspondiente compuesto de fórmula (Ib) en la que Y es H, usando un compuesto de fórmula (IX),



30 en la que Y es como se define en la reivindicación 1 con la exclusión de H y L^2 es un grupo saliente; o

g) cuando (I) es una fórmula (Ib), X e Y son como se definen en la reivindicación 1 con la exclusión de H y los demás
35 símbolos son como se definen en la reivindicación 1, la alquilación, acilación o sulfonilación del correspondiente compuesto de fórmula (Ib), en la que X es H, usando un compuesto de fórmula (VI) como se define en la reivindicación 1; o

h) cuando R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , W, X, Y y m son como se definen en la reivindicación 1, y n es 1 o 2, oxidar un
40 correspondiente compuesto en que n es 0 o 1; y

i) si se desea, convertir el compuesto resultante de fórmula (I) en una sal plaguicidamente aceptable del mismo.

13. Una composición plaguicida que comprende un compuesto de fórmula (I) o una sal plaguicidamente
45 diluyente o portador y/o agente tensioactivo plaguicidamente aceptable.

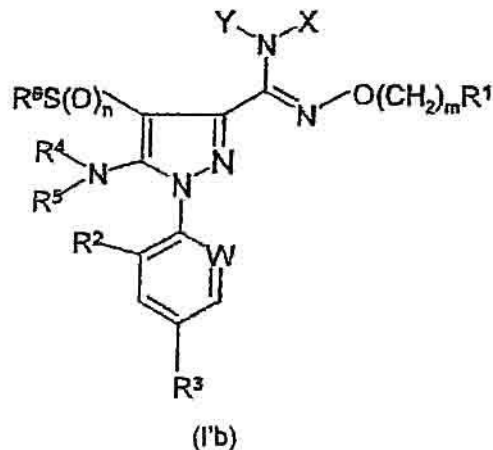
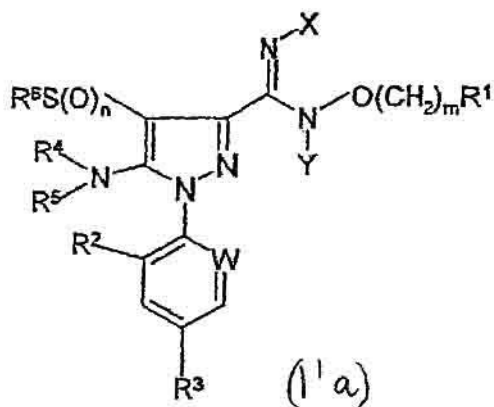
14. El uso de un compuesto de fórmula (I) o una sal del mismo según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11 o de una composición según la reivindicación 13 para la preparación de un medicamento veterinario.

15. El uso de un compuesto de fórmula (I) o una sal del mismo según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11 o de una composición según la reivindicación 13 para la preparación de un medicamento veterinario para controlar plagas.

5

16. Un procedimiento no terapéutico para el control de plagas en un lugar que comprende la aplicación de una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula (I) o una sal del mismo según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11 o de una composición según la reivindicación 13.

10 17. Un compuesto de fórmulas (I'a) o (I'b)



en las que:

15

R^1 es arilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales R^{15} , o es R^{19} ;

X e Y son cada uno independientemente H, alquenilo C_3-C_6 , haloalquenilo C_3-C_6 , alquinilo C_3-C_6 , haloalquinilo C_3-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , -alquil C_1-C_4 -cicloalquilo C_3-C_7 , - CO_2 -alquilo C_1-C_6 , $CONR^7R^8$, $CONR^8R^9$, - CO_2 -(CH_2) $_qR^7$, - $(CH_2)_qR^7$, - $(CH_2)_qR^{10}$, COR^8 , SO_2R^{13} o COR^{17} , o alquilo C_1-C_6 no sustituido o sustituido con uno o más radicales R^{11} ;

20

W es N, C- CH_3 o C-halógeno;

R^2 es hidrógeno, CH_3 o halógeno;

25

R^3 es halógeno, alquilo C_1-C_3 , halogenoalquilo C_1-C_3 , halogenoalcoxilo C_1-C_3 , $S(O)_p$ -halogenoalquilo C_1-C_3 o SF_5 ;

R^4 es H, alquenilo C_3-C_5 , halogenoalquenilo C_3-C_6 , alquinilo C_3-C_6 , halogenoalquinilo C_3-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , - CO_2 -alquilo C_1-C_6 , - CO_2 -cicloalquilo C_3-C_7 , - CO_2 -alquil C_1-C_4 -cicloalquilo C_3-C_7 , - CO_2 -alquenilo C_3-C_6 , - CO_2 -(CH_2) $_qR^7$, $CONR^8R^9$, - CO_2 -(CH_2) $_qR^{10}$, - $(CH_2)_qR^7$, - $(CH_2)_qR^{10}$, COR^8 o $COCH_2O$ -alquilo C_1-C_4 ; o alquilo C_1-C_6 no sustituido o sustituido con uno o más radicales R^{11} ;

30

R^5 es H, alquinilo C_2-C_6 , - CO_2 -alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 o - SO_2R^{12} ; o alquilo C_1-C_5 , alquenilo C_2-C_5 o CO -alquilo C_1-C_6 , estando dichos últimos tres grupos mencionados no sustituidos o sustituidos con uno o más radicales R^{11} ;

35

R^6 y R^{13} son cada uno independientemente alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , halogenoalquilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , halogenoalquinilo C_2-C_6 o cicloalquilo C_3-C_7 ;

40

R^7 es fenilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_6 , alcoxilo C_1-C_6 , halogenoalcoxilo C_1-C_6 , CN , NO_2 , $S(O)_pR^{13}$ y NR^9R^{14} ;

R^8 es H, alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , -alquil C_1-C_4 -cicloalquilo C_3-C_7 , - $(CH_2)_qR^7$ o - $(CH_2)_qR^{10}$;

45

R^9 y R^{14} son cada uno independientemente H, alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 o -alquilo C_1-C_4 -cicloalquilo C_3-C_7 ; o

R^8 y R^9 , junto con el átomo de N unido, forman un anillo saturado de 5 o 6 miembros que contiene opcionalmente un heteroátomo adicional en el anillo que se selecciona de O, S y N, estando el anillo no sustituido o sustituido con uno

50

o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₆ y halógeno;

5 R¹¹ es halógeno, alcoxilo C₁-C₆, halogenoalcoxilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₇, S(O)_pR¹³, -CO₂-alquilo C₁-C₆, -O(C=O)-alquilo C₁-C₆, CO-alquilo C₁-C₆, CO-halogenoalquilo C₁-C₆, NR⁸R⁹, CONR⁸R⁹, SO₂NR⁸R⁹, OH, CN, NO₂, OR⁷, NR⁸COR¹⁴, NR⁸SO₂R¹³ u OR¹⁰; R¹² es cicloalquilo C₃-C₇, alquenilo C₂-C₆, halogenoalquenilo C₂-C₆ o R¹⁰; o fenilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados de R¹⁵; o es alquilo C₁-C₆ no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alcoxilo C₁-C₆, halogenoalcoxilo C₁-C₆, alquenil C₃-C₆-oxilo, halogenoalquenil C₃-C₆-oxilo, alquinil C₃-C₆-oxilo, halogenoalquinil C₃-C₆-oxilo, cicloalquilo C₃-C₇, S(O)_pR⁷, S(O)_pR¹⁰, S(O)_pR¹³, CN, NO₂, OH, COR⁸, NR⁸COR¹⁴, NR⁸SO₂R¹³, CONR⁸R⁹, NR⁸R⁹, OR⁷, OR¹⁰, R¹⁶,
10 R¹⁰ y CO₂R⁸;

R¹⁵ es halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₆, alcoxilo C₁-C₆, halogenoalcoxilo C₁-C₆, CN, NO₂, S(O)_pR¹³, NR⁸R⁹, COR¹³, COR⁷, CONR⁶R⁹, SO₂NR⁸R⁹, R⁷, SF₅, OH, OR⁷, R¹⁸, OR¹⁸, SO₃H o alquiliden C₁-C₆-imino;

15 R¹⁶ es fenilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₆, alcoxilo C₁-C₆, halogenoalcoxilo C₁-C₆, CN, NO₂, S(O)_pR¹³, NR⁸R⁹, COR¹³, COR⁷, CONR⁶R⁹, SO₂NR⁸R⁹, OH, SO₃H y alquiliden C₁-C₆-imino;

20 R¹⁷ es alquilo C₁-C₆ que está sustituido con alcoxilo C₁-C₆, S(O)_p-alquilo C₁-C₆ o S(O)_p-halogenoalquilo C₁-C₆;

R¹⁸ es un radical heteroaromático seleccionado del grupo consistente en piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tienilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, furilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo y triazolilo, estando dichos grupos no sustituidos o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₆ y alcoxilo C₁-C₆;

25 R¹⁹ es un radical heteroaromático seleccionado del grupo consistente en piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tienilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, furilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, y triazolilo, que están no sustituidos o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₆ y alcoxilo C₁-C₆, y estando sustituido dicho radical heteroaromático con R⁷, R¹⁸ u OR⁷;

30 m es 1 o 2;

n y p son cada uno independientemente 0, 1 o 2;

35 q es 0 o 1; y

40 cada cicloalquilo en los radicales anteriormente mencionados está opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo; o una sal plaguicidamente aceptable de los mismos; para uso en el tratamiento de vertebrados de sangre caliente parasitados interna o externamente con artrópodos, en los que los artrópodos se seleccionan de *Rhipicephalus spp.* o *Ctenocephalides spp.*

18. Un compuesto para uso según la reivindicación 17, en el que el vertebrado de sangre caliente es un animal doméstico.

45 19. Un compuesto para uso según la reivindicación 18, en el que los animales domésticos se seleccionan de vacas, ovejas, cabras, caballos, cerdos, aves de corral, perros o gatos.