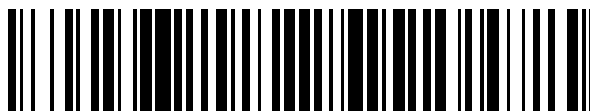


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 444 270**

51 Int. Cl.:

C07D 239/88 (2006.01)

C07D 401/04 (2006.01)

C07D 403/04 (2006.01)

A01N 43/54 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **03.03.2010** **E 10706254 (9)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **11.12.2013** **EP 2403837**

54 Título: **Compuestos de 3-arilquinazolin-3-ona para combatir plagas de invertebrados**

30 Prioridad:

04.03.2009 US 157375 P

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

24.02.2014

73 Titular/es:

**BASF SE (100.0%)
67056 Ludwigshafen, DE**

72 Inventor/es:

**GROSS, STEFFEN;
KÖRBER, KARSTEN;
VON DEYN, WOLFGANG;
KAISER, FLORIAN;
DESHMUKH, PRASHANT;
DICKHAUT, JOACHIM;
BANDUR, NINA, GERTRUD;
NARINE, ARUN;
POHLMAN, MATTHIAS;
PUHL, MICHAEL;
THOMPSON, SARAH;
EBUENGA, CECILLE;
ANSPAUGH, DOUGLAS, D. y
CULBERTSON, DEBORAH, L.**

74 Agente/Representante:

CARPINTERO LÓPEZ, Mario

ES 2 444 270 T3

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

DESCRIPCIÓN

Compuestos de 3-arylquinazolin-3-ona para combatir plagas de invertebrados

La presente invención se refiere a compuestos de 3-arylquinazolin-4-ona y a su uso para combatir o controlar plagas de invertebrados, en particular plagas de artrópodos y nematodos. La invención se refiere también a un procedimiento para controlar plagas de invertebrados usando dichos compuestos y a un material de propagación vegetal y a una composición agrícola que comprende dichos compuestos.

Antecedentes de la invención

Las plagas de invertebrados, y en particular artrópodos y nematodos, destruyen cultivos en crecimiento y recolectados y atacan viviendas de madera y estructuras comerciales, causando una gran pérdida económica al suministro de alimentos y a las propiedades. Aunque son conocidos un gran número de agentes plaguicidas, debido a la capacidad de las plagas diana de desarrollar resistencia ante dichos agentes, existe la necesidad continua de nuevos agentes para combatir plagas de invertebrados, en particular insectos, arácnidos y nematodos.

El documento DE 19547475 describe derivados de sulfuro de 3-(2,4-dioxopirimidin-3-il)-6-cianofenilo y sus aplicaciones para proteger a cultivos frente a insectos dañinos y malas hierbas.

El documento US 2006/0106042 describe 2-(4,4-difluorobut-3-enilsulfanil)pirimidinas que pueden portar grupos heterocíclicos y sus derivados sulfinilo y sulfonilo. Se describe también la actividad de estos compuestos contra insectos, arácnidos y nematodos.

El documento US 6.509.354 describe derivados de sulfuro de 3-(4-oxopirimidin-3-il)fenilo y sus actividades contra diversas plagas de insectos y ácaros.

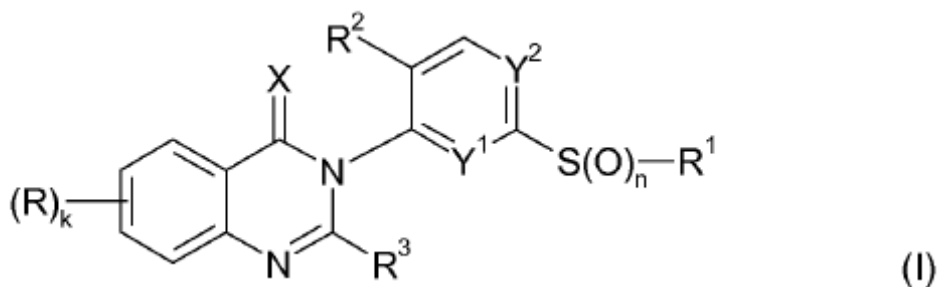
Las actividades plaguicidas de los compuestos de la técnica anterior, en particular sus actividades contra arácnidos tales como ácaros, no son siempre satisfactorias. Además, existe la necesidad continua de compuestos plaguicidas adicionales por las razones esbozadas anteriormente.

Por lo tanto, es un objeto de la presente invención proporcionar compuestos que tengan una buena actividad plaguicida, en particular actividad insecticida, y que muestren un amplio espectro de actividad contra un gran número de diferentes plagas de invertebrados, especialmente contra plagas de artrópodos y/o nematodos difíciles de controlar.

Sumario de la invención

Se ha encontrado que estos objetivos pueden conseguirse mediante compuestos de la fórmula I siguiente y mediante sus sales, en particular sus sales agrícola o veterinariamente aceptables.

Por lo tanto, en un primer aspecto, la invención se refiere a compuestos de 3-arylquinazolin-4-ona de fórmula I:



en la que

k es 0, 1, 2, 3 o 4;

n es 0, 1 o 2;

X es O, S o N-R⁴;

Y¹ es N o CH;

Y² es N o C-R⁵;

R se selecciona del grupo consistente en halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₄, halogenoalquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, halogenoalqueno C₁-C₄, alquino C₂-C₄, halogenoalquino C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alcoxi

C₁-C₄, halogenoalcoxilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio, halogenoalquil C₁-C₄-tio, alquil C₁-C₄-sulfinilo, halogenoalquil C₁-C₄-sulfinilo, alquil C₁-C₄-sulfonilo y halogenoalquil C₁-C₄-sulfonilo, siendo k 2, 3 o 4, siendo posible que R sea idéntico o diferente;

- 5 R¹ es alquilo C₁-C₁₀, halogenoalquilo C₁-C₁₀, alquenilo C₂-C₁₀, halogenoalquenilo C₂-C₁₀, alquinilo C₂-C₁₀, halogenoalquinilo C₂-C₁₀, cicloalquilo C₃-C₁₂, cicloalquenilo C₅-C₁₂, cicloalquil C₃-C₁₂-alquilo C₁-C₄, cicloalquenil C₅-C₁₂-alquilo C₁-C₄, en los que el radical cicloalquilo y el radical cicloalquenilo en los últimos cuatro radicales mencionados no están sustituidos, están parcial o totalmente halogenados y/o portan 1, 2, 3, 4, o 5 radicales alquilo C₁-C₄;
- 10 R² es hidrógeno, halógeno CN, C(Z)NH₂, alquilo C₁-C₄ o halogenoalquilo C₁-C₄, en el que Z es O, S o NR⁶;
- 10 R³ es hidrógeno, OH, halógeno, CN, alquilo C₁-C₄, halogenoalquilo C₁-C₄, alcoxilo C₁-C₄, halogenoalcoxilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio, halogenoalquil C₁-C₄-tio, alquil C₁-C₄-sulfinilo, halogenoalquil C₁-C₄-sulfinilo, alquil C₁-C₄-sulfonilo o halogenoalquil C₁-C₄-sulfonilo;
- 15 R⁴ se selecciona del grupo consistente en hidrógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, halogenoalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, halogenoalquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₄, alcoxilo C₁-C₆, halogenoalcoxilo C₁-C₆, alquilen C₂-C₆-oxilo, halogenoalquenil C₂-C₆-oxilo, alquinil C₂-C₆-oxilo, halogenoalquinil C₂-C₆-oxilo, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenilo C₅-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, cicloalquenil C₅-C₆-alquilo C₁-C₄, cicloalcoxilo C₃-C₆, cicloalquenoxilo C₅-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alcoxilo C₁-C₄, cicloalquenil C₅-C₆-alcoxilo C₁-C₄, en los que el radical cicloalquilo y el radical cicloalquenilo en los ocho últimos radicales mencionados están no sustituidos, parcial o totalmente halogenados y/o portan 1, 2, 3, 4, o 5 radicales alquilo C₁-C₄, fenilo, fenilalquilo C₁-C₄, feniloxilo y fenilalcoxilo C₁-C₄, en los que el anillo fenilo de fenilo, fenilalquilo C₁-C₄, fenilalcoxilo C₁-C₄ y fenoxilo está no sustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₄, halogenoalquilo C₁-C₄, alcoxilo C₁-C₄ y halogenoalcoxilo C₁-C₄; y
- 20 R⁵ es hidrógeno, halógeno, CN, C(Z)NH₂, alquilo C₁-C₄ o halogenoalquilo C₁-C₄, en el que Z es O, S o NR⁶;
- 25 R⁶ tiene uno de los significados dados para R⁴;

y las sales de los mismos, en particular las sales agrícolamente aceptables de los mismos.

La invención se refiere también al uso de compuestos de 3-arilquinazolin-4-ona de fórmula I como se define anteriormente y/o sales agrícolamente aceptables de los mismos para combatir plagas de invertebrados en particular insectos, ácaros y/o nematodos.

- 30 La presente invención proporciona también una composición agrícola que comprende al menos un compuesto de 3-arilquinazolin-4-ona de fórmula I como se define en la presente memoria y/o una sal agrícolamente aceptable del mismo y al menos un portador líquido o sólido.

- 35 La presente invención proporciona también un procedimiento para combatir plagas de invertebrados, comprendiendo dicho procedimiento tratar las plagas, su suministro de alimento, su hábitat o su terreno de cría o una planta cultivada, materiales de propagación vegetal (tales como semillas), suelo, zona, material o entorno en el que las plagas crecen o pueden crecer o los materiales, plantas cultivadas, materiales de propagación vegetal (tales como semillas), suelos, superficies o espacios para proteger del ataque o infestación de plagas con una cantidad plaguicida eficaz de un compuesto de 3-arilquinazolin-4-ona de fórmula I o una sal del mismo como se define en la presente memoria.

- 40 La presente invención se refiere también a material de propagación vegetal, en particular semillas, que comprende al menos un compuesto de fórmula I y/o una sal agrícolamente aceptable del mismo como se define en la presente memoria.

- 45 La presente invención se refiere adicionalmente a un procedimiento para tratar o proteger a un animal de la infestación o infección por parásitos que comprende poner en contacto el animal con una cantidad parasiticida eficaz de un compuesto de 3-arilquinazolin-4-ona de fórmula I o una sal veterinariamente aceptable del mismo como se define en la presente memoria. Poner en contacto el animal con el compuesto I, su sal o la composición veterinaria de la invención significa aplicarlos o administrarlos al animal.

Descripción detallada de la invención

- 50 Dependiendo del patrón de sustitución, los compuestos de fórmula I pueden tener uno o más centros quirales, en cuyo caso están presentes como mezclas de enantiómeros o diastereómeros. La invención proporciona tanto los enantiómeros o diastereómeros puros como sus mezclas y el uso según la invención de los enantiómeros o diastereómeros puros del compuesto I o sus mezclas. Los compuestos adecuados de fórmula I incluyen también todos los posibles estereoisómeros (isómeros cis/trans) y mezclas de los mismos.

Los compuestos de la presente invención pueden ser amorfos o pueden existir en uno o más estados cristalinos diferentes (polimorfos) que pueden tener propiedades macroscópicas diferentes tales como estabilidad o mostrar propiedades biológicas diferentes tales como actividades. La presente invención incluye tanto compuestos amorfos como cristalinos de fórmula I, mezclas de diferentes estados cristalinos del compuesto I respectivo, así como sales amorfas o cristalinas del mismo.

Las sales de los compuestos de fórmula I son preferiblemente sales agrícola y veterinariamente aceptables. Pueden formarse por un procedimiento habitual, por ejemplo haciendo reaccionar el compuesto con un ácido del anión en cuestión si el compuesto de fórmula I tiene una funcionalidad básica o haciendo reaccionar un compuesto ácido de fórmula I con una base adecuada.

Las sales agrícolamente aceptables son especialmente sales de aquellos cationes o sales de adición de ácido de aquellos ácidos cuyos cationes y aniones, respectivamente, no tienen efectos adversos sobre la acción de los compuestos según la presente invención. Son cationes adecuados en particular los iones de metales alcalinos, preferiblemente litio, sodio y potasio, de metales alcalinotérreos, preferiblemente calcio, magnesio y bario, y de metales de transición, preferiblemente manganeso, cobre, cinc y hierro, y también amonio (NH_4^+) y amonio sustituido en el que de uno a cuatro de los átomos de hidrógeno están reemplazados por alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, hidroxialquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcoxilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, hidroxialcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, fenilo o bencilo. Los ejemplos de iones de amonio sustituido comprenden metilamonio, isopropilamonio, dimetilamonio, diisopropilamonio, trimetilamonio, tetrametilamonio, tetraetilamonio, tetrabutilamonio, 2-hidroxietilamonio, 2-(2-hidroxietoxi)etilamonio, bis-(2-hidroxietil)amonio, benciltrimetilamonio y benciltriethylamonio, además iones de fosfonio iones de sulfonio, preferiblemente trialquil $\text{C}_1\text{-C}_4$ -sulfonio, e iones de sulfoxonio, preferiblemente trialquil $\text{C}_1\text{-C}_4$ -sulfoxonio.

Los aniones de sales de adición de ácido útiles son principalmente cloruro, bromuro, fluoruro, hidrogenosulfato, sulfato, dihidrogenofosfato, hidrogenofosfato, fosfato, nitrato, hidrogenocarbonato, carbonato, hexafluorosilicato, hexafluorofosfato, benzoato y los aniones de ácidos alcanicos $\text{C}_1\text{-C}_4$, preferiblemente formiato, acetato, propionato y butirato. Pueden formarse haciendo reaccionar un compuesto de fórmula I con un ácido del correspondiente anión, preferiblemente de ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico o ácido nítrico.

Se entiende por la expresión “sales veterinariamente aceptables” lassales de aquellos cationes o aniones que son conocidos y aceptados en la materia para la formación de sales para uso veterinario. Las sales de adición de ácido adecuadas, por ejemplo, formadas por compuestos de fórmula I que contienen un átomo de nitrógeno básico, por ejemplo un grupo amino, incluyen sales con ácidos inorgánicos, por ejemplo clorhidratos, sulfatos, fosfatos y nitratos de sales de ácidos orgánicos, por ejemplo ácido acético, ácido maleico, ácido dimaleico, ácido fumárico, ácido difumárico, ácido metanosulfónico, ácido metanosulfónico y ácido succínico.

El término “plaga de invertebrado” como se usa en la presente memoria abarca poblaciones animales, tales como insectos, arácnidos y nematodos, que pueden atacar plantas causando así un daño sustancial a las plantas atacadas, así como ectoparásitos que pueden infestar animales, en particular animales de sangre caliente tales como, por ejemplo, mamíferos o aves, u otros animales superiores tales como reptiles, anfibios o peces, causando así un daño sustancial a los animales infestados.

La expresión “material de propagación vegetal” como se usa en la presente memoria incluye todas las partes generativas de la planta tales como semillas y material vegetativo vegetal tal como esquejes y tubérculos (por ejemplo, patatas), que pueden usarse para la multiplicación de la planta. Esto incluye semillas, raíces, frutos, tubérculos, bulbos, rizomas, brotes, vástagos y otras partes de plantas. Pueden incluirse también plantones y plantas jóvenes, que han de transplantarse después de la germinación o después de la emergencia del suelo. Estos materiales de propagación vegetal pueden tratarse profilácticamente con un compuesto de protección vegetal al plantar o transplantar o antes.

El término “plantas” comprende cualquier tipo de plantas, incluyendo “plantas no cultivadas” y en particular “plantas cultivadas”.

El término “plantas no cultivadas” hace referencia a cualquier especie de tipo silvestre o especie relacionada o genero relacionado de una planta cultivada.

El término “plantas cultivadas” como se usa en la presente memoria incluye plantas que se han modificado por cultivo, mutagénesis o ingeniería genética. Las plantas modificadas genéticamente son plantas cuyo material genético se ha modificado mediante el uso de técnicas de ADN recombinante de tal modo que en circunstancias naturales no puedan obtenerse fácilmente por cultivo cruzado, mutaciones o recombinación natural. Típicamente, se han integrado uno o más genes en el material genético de una planta modificada genéticamente para mejorar ciertas propiedades de la planta. Dichas modificaciones genéticas incluyen también, pero sin limitación, modificación postraducciona dirigida de proteína o proteínas (oligopéptidos o polipéptidos), por ejemplo mediante glucosilación o adiciones de polímero tales como restos prenilados, acetilados o farnesilados o restos de PEG (por ejemplo, como se da a conocer en *Biotechnol Prog.* julio-agosto de 2001; 17(4): 720-8, *Protein Eng. Des Sel.* enero de 2004; 17(1): 57-66, *Nat. Protoc.* 2007; 2(5): 1225-35., *Curr. Opin. Chem. Biol.* octubre de 2006; 10(5): 487-91. Epub de 28 de

agosto de 2006, Biomaterials, marzo de 2001; 22(5): 405-17, Bioconjug. Chem. enero-febrero de 2005; 16(1): 113-21).

El término "plantas cultivadas" como se usa en la presente memoria incluye adicionalmente plantas que se han vuelto tolerantes a aplicaciones de clases específicas de herbicidas tales como inhibidores de hidroxifenilpiruvato dioxigenasa (HPPD); inhibidores de acetolactato sintasa (ALS) tales como sulfonilureas (véanse, por ejemplo, los documentos US 6.222.100, WO 01/82685, WO 00/26390, WO 97/41218, WO 98/02526, WO 98/02527, WO 04/106529, WO 05/20673, WO 03/14357, WO 03/13225, WO 03/14356, WO 04/16073) o imidazolinonas (véanse, por ejemplo, los documentos US 6.222.100, WO 01/82685, WO 00/26390, WO 97/41218, WO 98/02526, WO 98/02527, WO 04/106529, WO 05/20673, WO 03/14357, WO 03/13225, WO 03/14356, WO 04/16073); inhibidores de enolpiruvilshikimato-3-fosfato sintasa (EPSPS) tales como glifosato (véase, por ejemplo, el documento WO 92/00377); inhibidores de glutamina sintetasa (GS) tales como glufosinato (véanse, por ejemplo, los documentos EP-A-0242236, EP-A-242246) o herbicidas de oxinilo (véase, por ejemplo, el documento US 5.559.024) como resultado de procedimientos convencionales de cultivo o ingeniería genética. Varias plantas cultivadas se han vuelto tolerantes a herbicidas mediante procedimientos convencionales de cultivo (mutagénesis), por ejemplo, colza de verano Clearfield® (Canola) que es tolerante a imidazolinonas, por ejemplo, imazamox. Se han usado procedimientos de ingeniería genética para volver plantas cultivadas, tales como soja, algodón, maíz, remolachas y colza, tolerantes a herbicidas tales como glifosato y glufosinato, algunas de las cuales están comercialmente disponibles con los nombres comerciales RoundupReady® (glifosato) y LibertyLink® (glufosinato).

El término "plantas cultivadas" como se usa en la presente memoria incluye adicionalmente plantas que son capaces, mediante el uso de técnicas de ADN recombinante, de sintetizar una o más proteínas insecticidas, especialmente aquellas conocidas del género bacteriano *Bacillus*, particularmente de *Bacillus thuringiensis*, tales como endotoxinas δ , por ejemplo, CryIA(b), CryIA(c), CryIF, CryIF(a2), CryIIA (b), CryIIIA, CryIIIB(b1) o Cry9c; proteínas insecticidas vegetativas (VIP), por ejemplo VIP1, VIP2, VIP3 o VIP3A; proteínas insecticidas de bacterias que colonizan nematodos, por ejemplo, *Photorhabdus spp.* o *Xenorhabdus spp.*; toxinas producidas por animales, tales como toxinas de escorpión, toxinas de arácnido, toxinas de avispa u otras neurotoxinas específicas de insecto; toxinas producidas por hongos tales como toxinas de *Streptomyces*, lectinas vegetales tales como lectinas de guisante o cebada; aglutininas; inhibidores de proteinasa tales como inhibidores de tripsina, inhibidores de serinproteínasa, inhibidores de patatina, cistatina o papaína; proteínas inactivadoras de ribosoma (RIP) tales como ricina, RIP de maíz, abrina, lufina, saponina o briodina; enzimas del metabolismo esteroideo tales como 3-hidroxiesteroide oxidasa, ecdisteroide-IDP-glucosil transferasa, colesterol oxidasas, inhibidores de ecdisona o HMG-CoA reductasa; bloqueantes de canal iónico tales como bloqueantes de canales de sodio o calcio; esterasa de hormona juvenil; receptores de hormona diurética (receptores de helicoquinina); estilbeno sintasa, bibencilo sintasa, quitinasas o glucanasas. En el contexto de la presente invención, estas proteínas o toxinas insecticidas se entienden expresamente también como pretoxinas, proteínas híbridas, proteínas truncadas o modificadas de otro modo. Las proteínas híbridas se caracterizan por una nueva combinación de dominios proteicos (véase, por ejemplo, el documento WO 02/015701). Se dan a conocer ejemplos adicionales de dichas toxinas o plantas modificadas genéticamente capaces de sintetizar dichas toxinas, por ejemplo, en los documentos EP-A 374.753, WO 93/007278, WO 95/34656, EP-A 427529, EP-A 451878, WO 03/018810 y WO 03/052073. Los procedimientos para producir dichas plantas modificadas genéticamente son generalmente conocidos por el especialista en la materia y se describen, por ejemplo, en las publicaciones mencionadas anteriormente. Estas proteínas insecticidas contenidas en las plantas modificadas genéticamente confieren a las plantas productoras de estas proteínas protección ante plagas dañinas de ciertos grupos taxonómicos de insectos artrópodos, particularmente escarabajos (coleópteros), moscas (dípteros) y mariposas y polillas (lepidópteros) y ante nematodos parasitarios de plantas (nematodos).

El término "plantas cultivadas" como se usa en la presente memoria incluye adicionalmente plantas que son capaces, mediante el uso de técnicas de ADN recombinante, de sintetizar una o más proteínas para aumentar la resistencia o tolerancia de estas plantas ante patógenos bacterianos, víricos o fúngicos. Son ejemplos de dichas proteínas las denominadas "proteínas relacionadas con la patogénesis" (proteínas PR véase, por ejemplo el documento EP-A 0.392.225), genes de resistencia a enfermedades vegetales (por ejemplo, variedades cultivadas de patata que expresan genes de resistencia que actúan contra *Phytophthora infestans* derivadas de la patata silvestre mexicana *Solanum bulbocastanum*) o lisozima T4 (por ejemplo, variedades cultivadas de patata capaces de sintetizar estas proteínas con resistencia aumentada ante bacterias tales como *Erwinia amylovora*). Los procedimientos para producir dichas plantas modificadas genéticamente son generalmente conocidos por el especialista en la materia y se describen, por ejemplo, en las publicaciones mencionadas anteriormente.

El término "plantas cultivadas" como se usa en la presente memoria incluye adicionalmente plantas que son capaces, mediante el uso de técnicas de ADN recombinante, de sintetizar una o más proteínas para aumentar la productividad (por ejemplo, la producción de biomasa, rendimiento de grano, contenido de almidón, contenido de aceite o contenido de proteína), la tolerancia a sequía, salinidad u otros factores ambientales limitantes del crecimiento o la tolerancia ante plagas y patógenos fúngicos, bacterianos o víricos de esas plantas.

El término "plantas cultivadas" como se usa en la presente memoria incluye adicionalmente plantas que contienen, mediante el uso de técnicas de ADN recombinante, una cantidad modificada de sustancias contenidas, o nuevas sustancias contenidas, específicamente para mejorar la nutrición humana o animal, por ejemplo, cultivos

oleaginosos que producen ácidos grasos omega 3 o ácidos grasos omega 9 de cadena larga promotores de la salud (por ejemplo, colza Nexera®).

El término "plantas cultivadas" como se usa en la presente memoria incluye adicionalmente plantas que contienen, mediante el uso de técnicas de ADN recombinante, una cantidad modificada de sustancias contenidas o nuevas sustancias contenidas, específicamente para mejorar la producción de material bruto, por ejemplo patatas que producen cantidades aumentadas de amilopectina (por ejemplo, patata Amflora®).

Los restos orgánicos mencionados en las definiciones anteriores de las variables son, como el término halógeno, términos colectivos para listados individuales de los miembros de grupo individuales. El prefijo C_n-C_m indica en cada caso el número posible de átomos de carbono en el grupo.

El término "halógeno" designa en cada caso flúor, bromo, cloro o yodo, en particular flúor, cloro o bromo.

El término "alquilo C_1-C_{10} " como se usa en la presente memoria y en los restos alquilo de alcoxilo, alcoxialquilo, alquiltio, alquilsulfonilo, alquilsulfonilo y similares, hace referencia a radicales hidrocarburo saturados de cadena lineal o ramificada que tienen de 1 a 2, de 1 a 4, de 1 a 6, de 1 a 8 o de 1 a 10 átomos de carbono. Alquilo C_1-C_2 es metilo o etilo. Alquilo C_1-C_4 es adicionalmente también, por ejemplo, propilo, isopropilo, butilo, 1-metilpropilo (*sec*-butilo), 2-metilpropilo (*isobut*ilo) o 1,1-dimetilbutilo (*terc*-butilo). Alquilo C_1-C_6 es adicionalmente también, por ejemplo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, hexilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo o 1-etil-2-metilpropilo. Alquilo C_1-C_8 es adicionalmente también, por ejemplo, heptilo, octilo, 2-etilhexilo e isómeros posicionales de los mismos. Alquilo C_1-C_{10} es adicionalmente también, por ejemplo, nonilo, decilo e isómeros posicionales de los mismos.

El término "halogenoalquilo C_1-C_{10} " como se usa en la presente memoria y en los restos halogenoalquilo de halogenoalcoxilo, halogenoalquiltio, halogenoalquilsulfonilo, halogenoalquilsulfonilo y similares hace referencia a grupos alquilo de cadena lineal o ramificada que tienen de 1 a 2, de 1 a 4, de 1 a 6, de 1 a 8 o de 1 a 10 átomos de carbono (como se menciona anteriormente), en los que todo o algunos de los átomos de hidrógeno en estos grupos pueden estar reemplazados por átomos de halógeno como se menciona anteriormente: en particular halogenoalquilo C_1-C_4 tal como clorometilo, bromometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorodifluorometilo, 1-cloroetilo, 1-bromoetilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-cloro-2-fluoroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, pentafluoroetilo, 2,2,3,3-tetrafluoropropilo, 3,3-difluoropropilo, 2,3,3-trifluoropropilo, 2,2,3,3,3-pentafluoropropilo, 4,4-difluorobutilo, 4,4,4-trifluorobutilo, 3,4,4-trifluorobutilo, 3,3,4,4-tetrafluorobutilo, 3,3,4,4,4-pentafluorobutilo o 1,1,1-trifluoroprop-2-ilo. El término "halogenoalquilo C_1-C_{10} " hace referencia en particular a "fluoroalquilo C_1-C_4 ".

El término "fluoroalquilo C_1-C_4 " o "alquilo C_1-C_4 fluorado" como se usa en la presente memoria hace referencia a grupos alquilo de cadena lineal o ramificada de 1 a 4 átomos de carbono (como se menciona anteriormente), en los que todos o algunos de los átomos de hidrógeno en estos grupos pueden estar reemplazados por átomos de flúor: los ejemplos incluyen fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, pentafluoroetilo, 2,2,3,3-tetrafluoropropilo, 3,3-difluoropropilo, 2,3,3-trifluoropropilo, 2,2,3,3,3-pentafluoropropilo, 4,4-difluorobutilo, 4,4,4-trifluorobutilo, 3,4,4-trifluorobutilo, 3,3,4,4-tetrafluorobutilo, 3,3,4,4,4-pentafluorobutilo y 1,1,1-trifluoroprop-2-ilo.

El término "alquenilo C_2-C_{10} " como se usa en la presente memoria y en el resto alquenilo de alqueniloxilo y similares hace referencia a radicales hidrocarburo monoinsaturados de cadena lineal o ramificada que tienen de 2 a 4, de 2 a 6, de 2 a 8, de 2 a 10 o de 3 a 10 átomos de carbono y un doble enlace en cualquier posición, por ejemplo, alquenilo C_2-C_6 tal como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metiletlenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-2-propenilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-metil-1-butenilo, 2-metil-1-butenilo, 3-metil-1-butenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1,2-dimetil-1-propenilo, 1,2-dimetil-2-propenilo, 1-etil-1-propenilo, 1-etil-2-propenilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1-metil-1-pentenilo, 2-metil-1-pentenilo, 3-metil-1-pentenilo, 4-metil-1-pentenilo, 1-metil-2-pentenilo, 2-metil-2-pentenilo, 3-metil-2-pentenilo, 4-metil-2-pentenilo, 1-metil-3-pentenilo, 2-metil-3-pentenilo, 3-metil-3-pentenilo, 4-metil-3-pentenilo, 1-metil-4-pentenilo, 2-metil-4-pentenilo, 3-metil-4-pentenilo, 4-metil-4-pentenilo, 1,1-dimetil-2-butenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, 1,2-dimetil-1-butenilo, 1,2-dimetil-2-butenilo, 1,2-dimetil-3-butenilo, 1,3-dimetil-1-butenilo, 1,3-dimetil-2-butenilo, 1,3-dimetil-3-butenilo, 2,2-dimetil-3-butenilo, 2,3-dimetil-1-butenilo, 2,3-dimetil-2-butenilo, 2,3-dimetil-3-butenilo, 3,3-dimetil-1-butenilo, 3,3-dimetil-2-butenilo, 1-etil-1-butenilo, 1-etil-2-butenilo, 1-etil-3-butenilo, 2-etil-1-butenilo, 2-etil-2-butenilo, 2-etil-3-butenilo, 1,1,2-trimetil-2-propenilo, 1-etil-1-metil-2-propenilo, 1-etil-2-metil-1-propenilo, 1-etil-2-metil-2-propenilo y similares.

El término "halogenoalquenilo C_2-C_{10} " como se usa en la presente memoria y los restos halogenoalquenilo en halogenoalqueniloxilo, halogenoalquenilcarbonilo y similares hace referencia a radicales hidrocarburo insaturados de cadena lineal o ramificada que tienen de 2 a 4, de 2 a 6, de 2 a 8 o de 2 a 10 átomos de carbono y un doble enlace

en cualquier posición (como se menciona anteriormente), en los que todos o algunos de los átomos de hidrógeno en estos grupos pueden estar reemplazados por átomos de halógeno como se menciona anteriormente, en particular flúor, cloro y bromo, por ejemplo, 2-clorovinilo, 2-cloroalilo (2-cloro-2-propen-1-ilo), 3-cloro-2-propen-1-ilo, 3,3-dicloro-2-propen-1-ilo, 2-fluorovinilo, 2,2-fluorovinilo, 3,3-difluoro-2-propen-1-ilo, 2,3,3-trifluoro-2-propen-1-ilo, 4,4-difluoro-3-buten-1-ilo, 3,4,4-trifluoro-3-buten-1-ilo y similares. El término "halogenoalquenilo C₂-C₁₀" hace referencia en particular a "fluoroalquenilo C₂-C₄".

El término "fluoroalquenilo C₂-C₄" o "alquenilo C₂-C₃ fluorado" como se usa en la presente memoria hace referencia a grupos alquenilo de cadena lineal o ramificada que tienen de 2 a 4 átomos de carbono (como se menciona anteriormente), en los que todos o algunos de los átomos de hidrógeno en estos grupos pueden estar reemplazados por átomos de flúor; los ejemplos incluyen 2-fluorovinilo, 2,2-fluorovinilo, 3,3-difluoro-2-propen-1-ilo, 2,3,3-trifluoro-2-propen-1-ilo, 4,4-difluoro-3-buten-1-ilo y 3,4,4-trifluoro-3-buten-1-ilo.

El término "alquinilo C₂-C₁₀" como se usa en la presente memoria y los restos alquinilo en alquinoxilo, alquilcarbonilo y similares hace referencia a grupos hidrocarburo de cadena lineal o ramificada que tienen de 2 a 4, de 2 a 6, de 2 a 8, de 2 a 10 o de 3 a 10 átomos de carbono y uno o dos triples enlaces en cualquier posición, por ejemplo, alquinilo C₂-C₆ tal como etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo, 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 1-metil-2-propinilo, 1-pentinilo, 2-pentinilo, 3-pentinilo, 4-pentinilo, 1-metil-2-butinilo, 1-metil-3-butinilo, 2-metil-3-butinilo, 3-metil-1-butinilo, 1,1-dimetil-2-propinilo, 1-etil-2-propinilo, 1-hexinilo, 2-hexinilo, 3-hexinilo, 4-hexinilo, 5-hexinilo, 1-metil-2-pentinilo, 1-metil-3-pentinilo, 1-metil-4-pentinilo, 2-metil-3-pentinilo, 2-metil-4-pentinilo, 3-metil-1-pentinilo, 3-metil-4-pentinilo, 4-metil-1-pentinilo, 4-metil-2-pentinilo, 1,1-dimetil-2-butinilo, 1,1-dimetil-3-butinilo, 1,2-dimetil-3-butinilo, 2,2-dimetil-3-butinilo, 3,3-dimetil-1-butinilo, 1-etil-2-butinilo, 1-etil-3-butinilo, 2-etil-3-butinilo, 1-etil-1-metil-2-propinilo y similares.

El término "halogenoalquinilo C₂-C₁₀" como se usa en la presente memoria y los restos halogenoalquinilo en halogenalquinoxilo, halogenalquilcarbonilo y similares hace referencia a radicales hidrocarburo insaturados de cadena lineal o ramificada que tienen de 3 a 4, de 3 a 6, de 3 a 8 o de 3 a 10 átomos de carbono y uno o dos triples enlaces en cualquier posición (como se menciona anteriormente), en los que todos o algunos de los átomos de hidrógeno en estos grupos pueden estar reemplazados por átomos de halógeno como se menciona anteriormente, en particular flúor, cloro y bromo.

El término "cicloalquilo C₃-C₁₂" como se usa en la presente memoria y en los restos cicloalquilo de cicloalquil C₃-C₁₂-alquilo C₁-C₄ y cicloalquil C₃-C₆-alcoxilo C₁-C₄ hace referencia a radicales hidrocarburo saturados monocíclicos, bicíclicos o policíclicos, en particular monocíclicos, que tienen de 3 a 12 (= cicloalquilo C₃-C₁₂) átomos de carbono, frecuentemente de 3 a 8 átomos de carbono (= cicloalquilo C₃-C₈), en particular de 3 a 6 átomos de carbono (= cicloalquilo C₃-C₆). Los ejemplos de radicales monocíclicos comprenden ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, ciclooctilo, ciclononilo y ciclodecilo. Los ejemplos de radicales bicíclicos comprenden biciclo[2.2.1]heptilo, biciclo[3.1.1]heptilo, biciclo[2.2.2]octilo y biciclo[3.2.1]octilo.

El término "cicloalquil C₃-C₁₂-alquilo C₁-C₄" como se usa en la presente memoria hace referencia a un radical alquilo C₁-C₄ lineal o ramificado como se define anteriormente que está sustituido con un radical cicloalquilo C₃-C₁₂, en particular cicloalquil C₃-C₁₂-CH₂, cicloalquil C₃-C₁₂-CH₂CH₂ y cicloalquil C₃-C₁₂-CH(CH₃), siendo ejemplos ciclopropilmetilo (ciclopropil-CH₂), ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo y ciclohexilmetilo.

El término "cicloalquenilo C₅-C₁₂" como se usa y en los restos cicloalquenilo de cicloalquenil C₅-C₁₂-alquilo C₁-C₄ hace referencia a radicales hidrocarburo insaturados monocíclicos, bicíclicos o policíclicos, en particular monocíclicos, que tienen de 5 a 12 (= cicloalquenilo C₅-C₁₂), en particular de 5 a 8 (= cicloalquenilo C₅-C₈) o de 5 a 6 (= cicloalquenilo C₅-C₆) miembros de anillo de carbono, tales como ciclopenten-1-ilo, ciclopenten-3-ilo, ciclohexen-1-ilo, ciclohexen-3-ilo, ciclohexen-4-ilo, cicloheptenilo, ciclooctenilo, biciclo[2.2.2]octenilo y similares.

El término "cicloalquenil C₅-C₁₂-alquilo C₁-C₄" como se usa en la presente memoria hace referencia a un radical alquilo C₁-C₄ lineal o ramificado como se define anteriormente, que está sustituido con un radical cicloalquenilo C₅-C₁₂, en particular a cicloalquenil C₅-C₁₂-CH₂, cicloalquenil C₅-C₁₂-CH₂CH₂ y cicloalquenil C₅-C₁₂-CH(CH₃).

El término "alcoxilo C₁-C₄" como se usa en la presente memoria y en los restos alcoxilo de alcoxialquilo hace referencia a radicales hidrocarburo saturados de cadena lineal o ramificada que tienen de 1 a 4 átomos de carbono que están unidos al resto de la molécula a través de un átomo de oxígeno. Alcoxilo C₁-C₂ es metoxilo o etoxilo. Alcoxilo C₁-C₄ es adicionalmente también, por ejemplo, propoxilo, isopropoxilo, butoxilo, 1-metilpropoxilo (sec-butoxilo), 2-metilpropoxilo (isobutoxilo) o 1,1-dimetiletóxilo (terc-butoxilo).

El término "cicloalquil C₃-C₆-alcoxilo C₁-C₄" como se usa en la presente memoria hace referencia a un radical alcoxilo C₁-C₄ lineal o ramificado como se define anteriormente que está sustituido con un radical cicloalquilo C₃-C₆, en particular a cicloalquil C₃-C₁₂-CH₂O, cicloalquil C₃-C₁₂-CH₂CH₂O y cicloalquil C₃-C₁₂-CH(CH₃)O, siendo ejemplos ciclopropilmetoxilo (ciclopropil-CH₂), ciclobutilmetoxilo, ciclopentilmetoxilo y ciclohexilmetoxilo.

El término "alquil C₁-C₄-tio" como se usa en la presente memoria hace referencia a radicales alquilo como se define anteriormente que tienen de 1 a 4 átomos de carbono y que están unidos al resto de la molécula a través de un átomo de azufre; siendo ejemplos metiltio, etiltio, n-propiltio, isopropiltio, n-butiltio y terc-butiltio.

El término “alquil C₁-C₄-sulfonilo” como se usa en la presente memoria hace referencia a radicales alquilo como se definen anteriormente que tienen de 1 a 4 átomos de carbono y que están unidos al resto de la molécula a través de un grupo S(O)₂; siendo ejemplos metilsulfonilo, etilsulfonilo, n-propilsulfonilo, isopropilsulfonilo, n-butilsulfonilo y *terc*-butilsulfonilo.

- 5 El término “alquil C₁-C₄-sulfonilo” como se usa en la presente memoria hace referencia a radicales alquilo como se definen anteriormente que tienen de 1 a 4 átomos de carbono y que están unidos al resto de la molécula a través de un grupo S(O); siendo ejemplos metilsulfonilo, etilsulfonilo, n-propilsulfonilo, isopropilsulfonilo, n-butilsulfonilo y *terc*-butilsulfonilo.

- 10 El término “halogenoalcoxilo C₁-C₄” como se usa en la presente memoria hace referencia a radicales halogenoalquilo como se definen anteriormente que tienen de 1 a 4 átomos de carbono y que están unidos al resto de la molécula a través de un átomo de oxígeno (como se menciona anteriormente), en los que todos o algunos de los átomos de hidrógeno en estos grupos pueden estar reemplazados por átomos de flúor: los ejemplos incluyen fluorometoxilo, difluorometoxilo, trifluorometoxilo, 1-fluoroetoxilo, 2-fluoroetoxilo, 2,2-difluoroetoxilo, 2,2,2-trifluoroetoxilo, 2-cloro-2-fluoroetoxilo, 2-cloro-2,2-difluoroetoxilo, pentafluoroetoxilo, 2,2,3,3-tetrafluoropropoxilo, 3,3-difluoropropoxilo, 2,3,3-trifluoropropoxilo, 2,2,3,3,3-pentafluoropropoxilo, 4,4-difluorobutoxilo, 4,4,4-trifluorobutoxilo, 3,4,4-trifluorobutoxilo, 3,3,4,4-tetrafluorobutoxilo, 3,3,4,4,4-pentafluorobutoxilo y 1,1,1-trifluoroprop-2-ilo.

- 15 El término “halogenoalquil C₁-C₄-tio” como se usa en la presente memoria hace referencia a radicales halogenoalquilo como se definen anteriormente que tienen de 1 a 4 átomos de carbono y que están unidos al resto de la molécula a través de un átomo de azufre: los ejemplos incluyen fluorometiltio, difluorometiltio, trifluorometiltio, 1-fluoroetiltio, 2-fluoroetiltio, 2,2-difluoroetiltio, 2,2,2-trifluoroetiltio, 2-cloro-2-fluoroetiltio, 2-cloro-2,2-difluoroetiltio, pentafluoroetiltio, 2,2,3,3-tetrafluoropropiltio, 3,3-difluoropropiltio, 2,3,3-trifluoropropiltio, 2,2,3,3,3-pentafluoropropiltio, 4,4-difluorobutiltio, 4,4,4-trifluorobutiltio, 3,4,4-trifluorobutiltio, 3,3,4,4-tetrafluorobutiltio, 3,3,4,4,4-pentafluorobutiltio y 1,1,1-trifluoroprop-2-iltio.

- 20 El término “halogenoalquil C₁-C₄-sulfonilo” como se usa en la presente memoria hace referencia a radicales halogenoalquilo como se definen anteriormente que tienen de 1 a 4 átomos de carbono y que están unidos al resto de la molécula a través de un grupo S(O)₂; los ejemplos incluyen fluorometilsulfonilo, difluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo, 1-fluoroetilsulfonilo, 2-fluoroetilsulfonilo, 2,2-difluoroetilsulfonilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfonilo, pentafluoroetilsulfonilo, 2,2,3,3-tetrafluoropropilsulfonilo, 3,3-difluoropropilsulfonilo, 2,3,3-trifluoropropilsulfonilo, 2,2,3,3,3-pentafluoropropilsulfonilo, 4,4-difluorobutilsulfonilo, 4,4,4-trifluorobutilsulfonilo, 3,4,4-trifluorobutilsulfonilo, 3,3,4,4-tetrafluorobutilsulfonilo, 3,3,4,4,4-pentafluorobutilsulfonilo y 1,1,1-trifluoroprop-2-ilsulfonilo.

- 25 El término “halogenoalquil C₁-C₄-sulfonilo” como se usa en la presente memoria hace referencia a radicales halogenoalquilo como se definen anteriormente que tienen de 1 a 4 átomos de carbono y que están unidos al resto de la molécula a través de un grupo S(O); los ejemplos incluyen fluorometilsulfonilo, difluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo, 1-fluoroetilsulfonilo, 2-fluoroetilsulfonilo, 2,2-difluoroetilsulfonilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfonilo, pentafluoroetilsulfonilo, 2,2,3,3-tetrafluoropropilsulfonilo, 3,3-difluoropropilsulfonilo, 2,3,3-trifluoropropilsulfonilo, 2,2,3,3,3-pentafluoropropilsulfonilo, 4,4-difluorobutilsulfonilo, 4,4,4-trifluorobutilsulfonilo, 3,4,4-trifluorobutilsulfonilo, 3,3,4,4-tetrafluorobutilsulfonilo, 3,3,4,4,4-pentafluorobutilsulfonilo y 1,1,1-trifluoroprop-2-ilsulfonilo.

- 30 El término “alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄” como se usa en la presente memoria hace referencia a un radical alquilo C₁-C₄ lineal o ramificado como se define anteriormente que está sustituido con un radical alcoxilo C₁-C₄, en particular a metoximetilo, etoximetilo, n-propoximetilo, n-butoxietilo, 2-metoxietilo, 2-etoxietilo, 2-(n-propoxi)etilo, 2-(n-butoxi)etilo, 2-metoxipropilo, 2-etoxipropilo, 2-(n-propoxi)propilo, 2-(n-butoxi)propilo, 3-metoxipropilo, 3-etoxipropilo, 3-(n-propoxi)propilo, 3-(n-butoxi)propilo, 4-metoxibutilo y 4-etoxibutilo.

- 35 El término “fenilalquilo C₁-C₄” como se usa en la presente memoria hace referencia a un radical alquilo C₁-C₄ lineal o ramificado como se define anteriormente que está sustituido con un radical fenilo; los ejemplos incluyen bencilo, 1-feniletilo y 2-feniletilo.

- 40 El término “fenilalcoxilo C₁-C₄” como se usa en la presente memoria hace referencia a un radical alcoxilo C₁-C₄ lineal o ramificado como se define anteriormente que está sustituido con un radical fenilo; los ejemplos incluyen benciloxilo, 1-feniletiloxilo y 2-feniletiloxilo.

- 45 Las observaciones realizadas a continuación respecto a realizaciones preferidas de las variables de los compuestos de fórmula I, o los rasgos del uso y procedimiento según la invención y de la composición de la invención son válidas por sí mismas así como preferiblemente en combinación entre sí.

- 50 Se prefieren compuestos de 3-arilquinazolin-4-ona de fórmula I en la que R¹ se selecciona del grupo consistente en alquilo C₁-C₄, alquilo C₁-C₄ fluorado, alqueno C₂-C₄, alqueno C₂-C₄ fluorado, ciclopropilo y ciclopropilmetilo. Se prefieren particularmente compuestos de fórmula I en la que R¹ es alquilo C₁-C₄ fluorado o alqueno C₂-C₄ fluorado.
- 55 En una realización especialmente preferida, R¹ es 2,2,2-trifluoroetilo. En otra realización especialmente preferida, R¹ es 3,4,4-trifluoro-3-buten-1-ilo.

Se da preferencia adicionalmente a compuestos de 3-arylquinazolin-4-ona de fórmula I en la que R^2 es hidrógeno, flúor, cloro o metilo. Se da particular preferencia a compuestos de fórmula I en la que R^2 es hidrógeno o flúor.

Se prefieren también compuestos de 3-arylquinazolin-4-ona de fórmula I en la que R^3 es hidrógeno.

Se da preferencia adicionalmente a compuestos de 3-arylquinazolin-4-ona de fórmula I en la que k es 0.

- 5 Igualmente, se da preferencia a compuestos de 3-arylquinazolin-4-ona de fórmula I en la que k es 1, 2 o 3, en particular 1, y en la que cada R se selecciona independientemente de flúor, cloro, CN, NO_2 , metilo y metoxilo.

Una realización particularmente preferida de la invención hace referencia a compuestos de fórmula I en la que la variable X es O.

Otra realización de la invención se refiere a compuestos de fórmula I en la que la variable X es S.

- 10 Una realización adicional de la invención se refiere a compuestos de fórmula I en la que la variable X es N-R^4 . En esta realización, R^4 se selecciona preferiblemente del grupo consistente en alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcoxilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alquenilo $\text{C}_2\text{-C}_4$ y alquenil $\text{C}_2\text{-C}_4$ -oxilo.

- 15 Se da también preferencia a compuestos de fórmula I en la que la variable Y^1 es CH y la variable Y^2 es C-R^5 . Son significados preferidos de R^5 hidrógeno, cloro, metilo, difluorometilo, trifluorometilo o ciano, en particular hidrógeno o metilo.

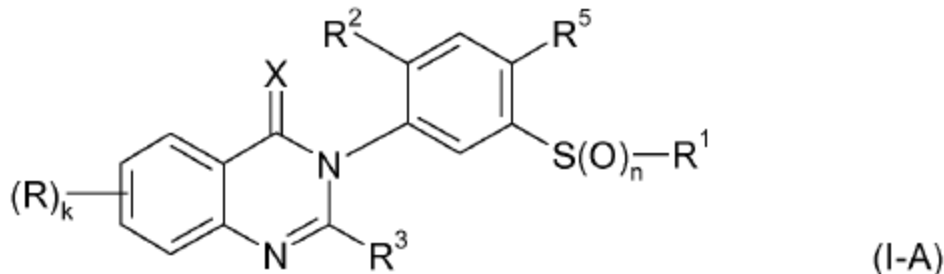
Igualmente, se da preferencia a compuestos de fórmula I en la que Y^1 y Y^2 son ambos N.

En una realización preferida de la invención, la variable n es 0.

En otra realización preferida de la invención, la variable n es 1.

En una realización preferida adicional de la invención, la variable n es 2.

- 20 Una realización preferida de la invención se refiere a los compuestos I de fórmula I-A:

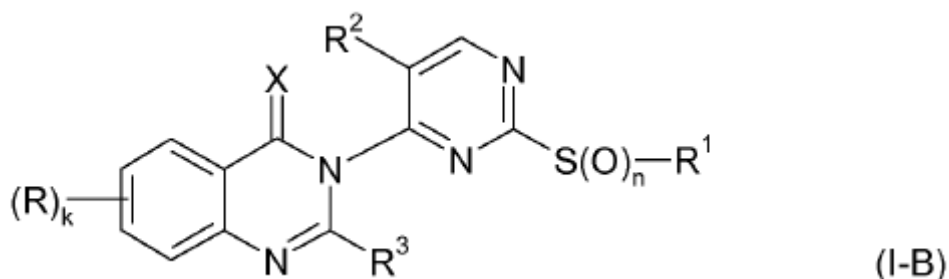


en la que R, R^1 , R^2 , R^3 , R^5 , X, n y k tienen uno de los significados dados anteriormente, especialmente uno de los significados preferidos.

Se prefieren especialmente compuestos de fórmula I-A que tienen los significados siguientes:

- 25 k es 0, 1, 2 o 3, en particular 0 o 1;
n es 0, 1 o 2;
X es O;
R si está presente, es idéntico o diferente y se selecciona de flúor, cloro, CN, NO_2 , metilo y metoxilo;
30 R^1 es alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$ fluorado, alquenilo $\text{C}_2\text{-C}_4$, alquenilo $\text{C}_2\text{-C}_4$ fluorado, alquinilo $\text{C}_2\text{-C}_{10}$, ciclopropilo o ciclopropilmetilo, más preferiblemente alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$ fluorado o alquenilo $\text{C}_2\text{-C}_4$ fluorado, en particular 2,2,2-trifluoroetilo o 3,4,4-trifluoro-3-buten-1-ilo;
 R^2 es hidrógeno, flúor, cloro o metilo, en particular flúor o cloro;
 R^3 es hidrógeno; y
 R^5 es hidrógeno, cloro, metilo, difluorometilo, trifluorometilo o CN, en particular hidrógeno o metilo.

- 35 Una realización preferida adicional de la invención se refiere a compuestos I de fórmula I-B:

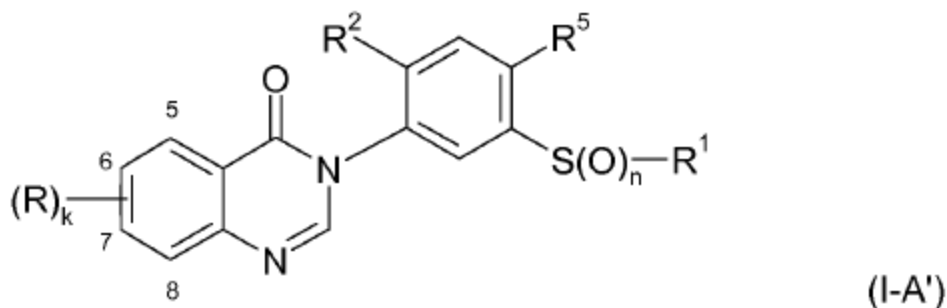


en la que R, R¹, R², R³, X, n y k tienen uno de los significados dados anteriormente, especialmente uno de los significados preferidos.

Se prefieren especialmente compuestos de fórmula I-B que tienen los significados siguientes:

- 5 k es 0, 1, 2 o 3, en particular 0 o 1;
- n es 0, 1 o 2;
- X es O;
- R si está presente, es idéntico o diferente y se selecciona de flúor, cloro, CN, NO₂, metilo y metoxilo;
- 10 R¹ es alquilo C₁-C₄, alquilo C₁-C₄ fluorado, alqueno C₂-C₄, alqueno C₂-C₄ fluorado, alquino C₂-C₁₀,
 ciclopropilo o ciclopropilmetilo, más preferiblemente alquilo C₁-C₄ fluorado o alqueno C₂-C₄ fluorado, en
 particular 2,2,2-trifluoroetilo o 3,4,4-trifluoro-3-buten-1-ilo;
- R² es hidrógeno, flúor, cloro o metilo, en particular flúor o cloro, especialmente hidrógeno; y
- R³ es hidrógeno.

- 15 En particular, con vistas a su uso para combatir plagas de invertebrados, se da preferencia a compuestos
 individuales de fórmula I-A' (compuestos de fórmula I-A en que X es O, R³ es H) y las variables n, k, R, R¹, R² y R⁵
 tienen cada una los significados dados anteriormente, en particular los significados preferidos.



Los ejemplos de compuestos I-A' recopilan en las tablas 1 a 29 siguientes, en las que las variables n, R¹, R² y R⁵ tienen cada una los significados dados en la fila de la tabla A.

20

Tabla A:

	R ¹	R ²	R ⁵	n
A-1	Metilo	H	Cl	0
A-2	Etilo	H	Cl	0
A-3	Trifluorometilo	H	Cl	0
A-4	n-Propilo	H	Cl	0
A-5	Ciclopropilo	H	Cl	0
A-6	Metilciclopropilo	H	Cl	0

	R ¹	R ²	R ⁵	n
A-7	Ciclopropilmetilo	H	Cl	0
A-8	2,2,2-Trifluoroetilo	H	Cl	0
A-9	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	H	Cl	0
A-10	Metilo	H	CH ₃	0
A-11	Etilo	H	CH ₃	0
A-12	Trifluorometilo	H	CH ₃	0
A-13	n-Propilo	H	CH ₃	0
A-14	Ciclopropilo	H	CH ₃	0
A-15	Metilciclopropilo	H	CH ₃	0
A-16	Ciclopropilmetilo	H	CH ₃	0
A-17	2,2,2-Trifluoroetilo	H	CH ₃	0
A-18	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	H	CH ₃	0
A-19	Metilo	H	CHF ₂	0
A-20	Etilo	H	CHF ₂	0
A-21	Trifluorometilo	H	CHF ₂	0
A-22	n-Propilo	H	CHF ₂	0
A-23	Ciclopropilo	H	CHF ₂	0
A-24	Metilciclopropilo	H	CHF ₂	0
A-25	Ciclopropilmetilo	H	CHF ₂	0
A-26	2,2,2-Trifluoroetilo	H	CHF ₂	0
A-27	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	H	CHF ₂	0
A-28	Metilo	H	CF ₃	0
A-29	Etilo	H	CF ₃	0
A-30	Trifluorometilo	H	CF ₃	0
A-31	n-Propilo	H	CF ₃	0
A-32	Ciclopropilo	H	CF ₃	0
A-33	Metilciclopropilo	H	CF ₃	0
A-34	Ciclopropilmetilo	H	CF ₃	0
A-35	2,2,2-Trifluoroetilo	H	CF ₃	0
A-36	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	H	CF ₃	0
A-37	Metilo	H	CN	0
A-38	Etilo	H	CN	0
A-39	Trifluorometilo	H	CN	0
A-40	n-Propilo	H	CN	0

	R ¹	R ²	R ⁵	n
A-41	Ciclopropilo	H	CN	0
A-42	Metilciclopropilo	H	CN	0
A-43	Ciclopropilmetilo	H	CN	0
A-44	2,2,2-Trifluoroetilo	H	CN	0
A-45	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	H	CN	0
A-46	Metilo	F	Cl	0
A-47	Etilo	F	Cl	0
A-48	Trifluorometilo	F	Cl	0
A-49	n-Propilo	F	Cl	0
A-50	Ciclopropilo	F	Cl	0
A-51	Metilciclopropilo	F	Cl	0
A-52	Ciclopropilmetilo	F	Cl	0
A-53	2,2,2-Trifluoroetilo	F	Cl	0
A-54	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	F	Cl	0
A-55	Metilo	F	CH ₃	0
A-56	Etilo	F	CH ₃	0
A-57	Trifluorometilo	F	CH ₃	0
A-58	n-Propilo	F	CH ₃	0
A-59	Ciclopropilo	F	CH ₃	0
A-60	Metilciclopropilo	F	CH ₃	0
A-61	Ciclopropilmetilo	F	CH ₃	0
A-62	2,2,2-Trifluoroetilo	F	CH ₃	0
A-63	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	F	CH ₃	0
A-64	Metilo	F	CHF ₂	0
A-65	Etilo	F	CHF ₂	0
A-66	Trifluorometilo	F	CHF ₂	0
A-67	n-Propilo	F	CHF ₂	0
A-68	Ciclopropilo	F	CHF ₂	0
A-69	Metilciclopropilo	F	CHF ₂	0
A-70	Ciclopropilmetilo	F	CHF ₂	0
A-71	2,2,2-Trifluoroetilo	F	CHF ₂	0
A-72	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	F	CHF ₂	0
A-73	Metilo	F	CF ₃	0
A-74	Etilo	F	CF ₃	0

	R ¹	R ²	R ⁵	n
A-75	Trifluorometilo	F	CF ₃	0
A-76	n-Propilo	F	CF ₃	0
A-77	Ciclopropilo	F	CF ₃	0
A-78	Metilciclopropilo	F	CF ₃	0
a-79	Ciclopropilmetilo	F	CF ₃	0
A-80	2,2,2-Trifluoroetilo	F	CF ₃	0
A-81	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	F	CF ₃	0
A-82	Metilo	F	CN	0
A-83	Etilo	F	CN	0
A-84	Trifluorometilo	F	CN	0
A-85	n-Propilo	F	CN	0
A-86	Ciclopropilo	F	CN	0
A-87	Metilciclopropilo	F	CN	0
A-88	Ciclopropilmetilo	F	CN	0
A-89	2,2,2-Trifluoroetilo	F	CN	0
A-90	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	F	CN	0
A-91	Metilo	H	Cl	1
A-92	Etilo	H	Cl	1
A-93	Trifluorometilo	H	Cl	1
A-94	n-Propilo	H	Cl	1
A-95	Ciclopropilo	H	Cl	1
A-96	Metilciclopropilo	H	Cl	1
A-97	Ciclopropilmetilo	H	Cl	1
A-98	2,2,2-Trifluoroetilo	H	Cl	1
A-99	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	H	Cl	1
A-100	Metilo	H	CH ₃	1
A-101	Etilo	H	CH ₃	1
A-102	Trifluorometilo	H	CH ₃	1
A-103	n-Propilo	H	CH ₃	1
A-104	Ciclopropilo	H	CH ₃	1
A-105	Metilciclopropilo	H	CH ₃	1
A-106	Ciclopropilmetilo	H	CH ₃	1
A-107	2,2,2-Trifluoroetilo	H	CH ₃	1
A-108	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	H	CH ₃	1

	R ¹	R ²	R ⁵	n
A-109	Metilo	H	CHF ₂	1
A-110	Etilo	H	CHF ₂	1
A-111	Trifluorometilo	H	CHF ₂	1
A-112	n-Propilo	H	CHF ₂	1
A-113	Ciclopropilo	H	CHF ₂	1
A-114	Metilciclopropilo	H	CHF ₂	1
A-115	Ciclopropilmetilo	H	CHF ₂	1
A-116	2,2,2-Trifluoroetilo	H	CHF ₂	1
A-117	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	H	CHF ₂	1
A-118	Metilo	H	CF ₃	1
A-119	Etilo	H	CF ₃	1
A-120	Trifluorometilo	H	CF ₃	1
A-121	n-Propilo	H	CF ₃	1
A-122	Ciclopropilo	H	CF ₃	1
A-123	Metilciclopropilo	H	CF ₃	1
A-124	Ciclopropilmetilo	H	CF ₃	1
A-125	2,2,2-Trifluoroetilo	H	CF ₃	1
A-126	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	H	CF ₃	1
A-127	Metilo	H	CN	1
A-128	Etilo	H	CN	1
A-129	Trifluorometilo	H	CN	1
A-130	n-Propilo	H	CN	1
A-131	Ciclopropilo	H	CN	1
A-132	Metilciclopropilo	H	CN	1
A-133	Ciclopropilmetilo	H	CN	1
A-134	2,2,2-Trifluoroetilo	H	CN	1
A-135	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	H	CN	1
A-136	Metilo	F	Cl	1
A-137	Etilo	F	Cl	1
A-138	Trifluorometilo	F	Cl	1
A-139	n-Propilo	F	Cl	1
A-140	Ciclopropilo	F	Cl	1
A-141	Metilciclopropilo	F	Cl	1
A-142	Ciclopropilmetilo	F	Cl	1

ES 2 444 270 T3

	R ¹	R ²	R ⁵	n
A-143	2,2,2-Trifluoroetilo	F	Cl	1
A-144	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	F	Cl	1
A-145	Metilo	F	CH ₃	1
A-146	Etilo	F	CH ₃	1
A-147	Trifluorometilo	F	CH ₃	1
A-148	n-Propilo	F	CH ₃	1
A-149	Ciclopropilo	F	CH ₃	1
A-150	Metilciclopropilo	F	CH ₃	1
A-151	Ciclopropilmetilo	F	CH ₃	1
A-152	2,2,2-Trifluoroetilo	F	CH ₃	1
A-153	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	F	CH ₃	1
A-154	Metilo	F	CHF ₂	1
A-155	Etilo	F	CHF ₂	1
A-156	Trifluorometilo	F	CHF ₂	1
A-157	n-Propilo	F	CHF ₂	1
A-158	Ciclopropilo	F	CHF ₂	1
A-159	Metilciclopropilo	F	CHF ₂	1
A-160	Ciclopropilmetilo	F	CHF ₂	1
A-161	2,2,2-Trifluoroetilo	F	CHF ₂	1
A-162	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	F	CHF ₂	1
A-163	Metilo	F	CF ₃	1
A-164	Etilo	F	CF ₃	1
A-165	Trifluorometilo	F	CF ₃	1
A-166	n-Propilo	F	CF ₃	1
A-167	Ciclopropilo	F	CF ₃	1
A-168	Metilciclopropilo	F	CF ₃	1
A-169	Ciclopropilmetilo	F	CF ₃	1
A-170	2,2,2-Trifluoroetilo	F	CF ₃	1
A-171	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	F	CF ₃	1
A-172	Metilo	F	CN	1
A-173	Etilo	F	CN	1
A-174	Trifluorometilo	F	CN	1
A-175	n-Propilo	F	CN	1
A-176	Ciclopropilo	F	CN	1

	R ¹	R ²	R ⁵	n
A-177	Metilciclopropilo	F	CN	1
A-178	Ciclopropilmetilo	F	CN	1
A-179	2,2,2-Trifluoroetilo	F	CN	1
A-180	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	F	CN	1
A-181	Metilo	H	Cl	2
A-182	Etilo	H	Cl	2
A-183	Trifluorometilo	H	Cl	2
A-184	n-Propilo	H	Cl	2
A-185	Ciclopropilo	H	Cl	2
A-186	Metilciclopropilo	H	Cl	2
A-187	Ciclopropilmetilo	H	Cl	2
A-188	2,2,2-Trifluoroetilo	H	Cl	2
A-189	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	H	Cl	2
A-190	Metilo	H	CH ₃	2
A-191	Etilo	H	CH ₃	2
A-192	Trifluorometilo	H	CH ₃	2
A-193	n-Propilo	H	CH ₃	2
A-194	Ciclopropilo	H	CH ₃	2
A-195	Metilciclopropilo	H	CH ₃	2
A-196	Ciclopropilmetilo	H	CH ₃	2
A-197	2,2,2-Trifluoroetilo	H	CH ₃	2
A-198	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	H	CH ₃	2
A-199	Metilo	H	CHF ₂	2
A-200	Etilo	H	CHF ₂	2
A-201	Trifluorometilo	H	CHF ₂	2
A-202	n-Propilo	H	CHF ₂	2
A-203	Ciclopropilo	H	CHF ₂	2
A-204	Metilciclopropilo	H	CHF ₂	2
A-205	Ciclopropilmetilo	H	CHF ₂	2
A-206	2,2,2-Trifluoroetilo	H	CHF ₂	2
A-207	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	H	CHF ₂	2
A-208	Metilo	H	CF ₃	2
A-209	Etilo	H	CF ₃	2
A-210	Trifluorometilo	H	CF ₃	2

ES 2 444 270 T3

	R ¹	R ²	R ⁵	n
A-211	n-Propilo	H	CF ₃	2
A-212	Ciclopropilo	H	CF ₃	2
A-213	Metilciclopropilo	H	CF ₃	2
A-214	Ciclopropilmetilo	H	CF ₃	2
A-215	2,2,2-Trifluoroetilo	H	CF ₃	2
A-216	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	H	CF ₃	2
A-217	Metilo	H	CN	2
A-218	Etilo	H	CN	2
A-219	Trifluorometilo	H	CN	2
A-220	n-Propilo	H	CN	2
A-221	Ciclopropilo	H	CN	2
A-222	Metilciclopropilo	H	CN	2
A-223	Ciclopropilmetilo	H	CN	2
A-224	2,2,2-Trifluoroetilo	H	CN	2
A-225	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	H	CN	2
A-226	Metilo	F	Cl	2
A-227	Etilo	F	Cl	2
A-228	Trifluorometilo	F	Cl	2
A-229	n-Propilo	F	Cl	2
A-230	Ciclopropilo	F	Cl	2
A-231	Metilciclopropilo	F	Cl	2
A-232	Ciclopropilmetilo	F	Cl	2
A-233	2,2,2-Trifluoroetilo	F	Cl	2
A-234	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	F	Cl	2
A-235	Metilo	F	CH ₃	2
A-236	Etilo	F	CH ₃	2
A-237	Trifluorometilo	F	CH ₃	2
A-238	n-Propilo	F	CH ₃	2
A-239	Ciclopropilo	F	CH ₃	2
A-240	Metilciclopropilo	F	CH ₃	2
A-241	Ciclopropilmetilo	F	CH ₃	2
A-242	2,2,2-Trifluoroetilo	F	CH ₃	2
A-243	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	F	CH ₃	2
A-244	Metilo	F	CHF ₂	2

ES 2 444 270 T3

	R ¹	R ²	R ⁵	n
A-245	Etilo	F	CHF ₂	2
A-246	Trifluorometilo	F	CHF ₂	2
A-247	n-Propilo	F	CHF ₂	2
A-248	Ciclopropilo	F	CHF ₂	2
A-249	Metilciclopropilo	F	CHF ₂	2
A-250	Ciclopropilmetilo	F	CHF ₂	2
A-251	2,2,2-Trifluoroetilo	F	CHF ₂	2
A-252	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	F	CHF ₂	2
A-253	Metilo	F	CF ₃	2
A-254	Etilo	F	CF ₃	2
A-255	Trifluorometilo	F	CF ₃	2
A-256	n-Propilo	F	CF ₃	2
A-257	Ciclopropilo	F	CF ₃	2
A-258	Metilciclopropilo	F	CF ₃	2
A-259	Ciclopropilmetilo	F	CF ₃	2
A-260	2,2,2-Trifluoroetilo	F	CF ₃	2
A-261	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	F	CF ₃	2
A-262	Metilo	F	CN	2
A-263	Etilo	F	CN	2
A-264	Trifluorometilo	F	CN	2
A-265	n-Propilo	F	CN	2
A-266	Ciclopropilo	F	CN	2
A-267	Metilciclopropilo	F	CN	2
A-268	Ciclopropilmetilo	F	CN	2
A-269	2,2,2-Trifluoroetilo	F	CN	2
A-270	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	F	CN	2
A-271	Trifluorometilo	CH ₃	CH ₃	0
A-272	Trifluorometilo	CH ₃	CH ₃	1
A-273	Trifluorometilo	CH ₃	CH ₃	2
A-274	Trifluorometilo	CH ₃	CN	0
A-275	Trifluorometilo	CH ₃	CN	1
A-276	Trifluorometilo	CH ₃	CN	2
A-277	2,2,2-Trifluoroetilo	CH ₃	CH ₃	0
A-278	2,2,2-Trifluoroetilo	CH ₃	CH ₃	1

	R ¹	R ²	R ⁵	n
A-279	2,2,2-Trifluoroetilo	CH ₃	CH ₃	2
A-280	2,2,2-Trifluoroetilo	CH ₃	CN	0
A-281	2,2,2-Trifluoroetilo	CH ₃	CN	1
A-282	2,2,2-Trifluoroetilo	CH ₃	CN	2
A-283	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	CH ₃	CH ₃	0
A-284	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	CH ₃	CH ₃	1
A-285	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	CH ₃	CH ₃	2
A-286	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	CH ₃	CN	0
A-287	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	CH ₃	CN	1
A-288	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	CH ₃	CN	2

Tabla 1:

Compuestos de fórmula I-A' en la que k es 0 y la combinación de n, R¹, R² y R⁵ para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 2:

- 5 Compuestos de fórmula I-A' en la que k es 1, (R)_k es 5-NO₂ y la combinación de n, R¹, R² y R⁵ para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 3:

Compuestos de fórmula I-A' en la que k es 1, (R)_k es 6-NO₂ y la combinación de n, R¹, R² y R⁵ para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

10 Tabla 4:

Compuestos de fórmula I-A' en la que k es 1, (R)_k es 7-NO₂ y la combinación de n, R¹, R² y R⁵ para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 5:

- 15 Compuestos de fórmula I-A' en la que k es 1, (R)_k es 8-NO₂ y la combinación de n, R¹, R² y R⁵ para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 6:

Compuestos de fórmula I-A' en la que k es 1, (R)_k es 5-CN y la combinación de n, R¹, R² y R⁵ para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 7:

- 20 Compuestos de fórmula I-A' en la que k es 1, (R)_k es 6-CN y la combinación de n, R¹, R² y R⁵ para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 8:

Compuestos de fórmula I-A' en la que k es 1, (R)_k es 7-CN y la combinación de n, R¹, R² y R⁵ para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

25 Tabla 9:

Compuestos de fórmula I-A' en la que k es 1, (R)_k es 8-CN y la combinación de n, R¹, R² y R⁵ para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 10:

- 30 Compuestos de fórmula I-A' en la que k es 1, (R)_k es 5-CH₃ y la combinación de n, R¹, R² y R⁵ para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 11:

Compuestos de fórmula I-A' en la que k es 1, (R)_k es 6-CH₃ y la combinación de n, R¹, R² y R⁵ para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 12:

- 5 Compuestos de fórmula I-A' en la que k es 1, (R)_k es 7-CH₃ y la combinación de n, R¹, R² y R⁵ para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 13:

Compuestos de fórmula I-A' en la que k es 1, (R)_k es 8-CH₃ y la combinación de n, R¹, R² y R⁵ para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

- 10 Tabla 14:

Compuestos de fórmula I-A' en la que k es 1, (R)_k es 5-CF₃ y la combinación de n, R¹, R² y R⁵ para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 15:

- 15 Compuestos de fórmula I-A' en la que k es 1, (R)_k es 6-CF₃ y la combinación de n, R¹, R² y R⁵ para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 16:

Compuestos de fórmula I-A' en la que k es 1, (R)_k es 7-CF₃ y la combinación de n, R¹, R² y R⁵ para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 17:

- 20 Compuestos de fórmula I-A' en la que k es 1, (R)_k es 8-CF₃ y la combinación de n, R¹, R² y R⁵ para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 18:

Compuestos de fórmula I-A' en la que k es 1, (R)_k es 5-Cl y la combinación de n, R¹, R² y R⁵ para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

- 25 Tabla 19:

Compuestos de fórmula I-A' en la que k es 1, (R)_k es 6-Cl y la combinación de n, R¹, R² y R⁵ para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 20:

- 30 Compuestos de fórmula I-A' en la que k es 1, (R)_k es 7-Cl y la combinación de n, R¹, R² y R⁵ para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 21:

Compuestos de fórmula I-A' en la que k es 1, (R)_k es 8-Cl y la combinación de n, R¹, R² y R⁵ para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 22:

- 35 Compuestos de fórmula I-A' en la que k es 1, (R)_k es 5-OCH₃ y la combinación de n, R¹, R² y R⁵ para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 23:

Compuestos de fórmula I-A' en la que k es 1, (R)_k es 6-OCH₃ y la combinación de n, R¹, R² y R⁵ para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

- 40 Tabla 24:

Compuestos de fórmula I-A' en la que k es 1, (R)_k es 7-OCH₃ y la combinación de n, R¹, R² y R⁵ para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 25:

Compuestos de fórmula I-A' en la que k es 1, (R)_k es 8-OCH₃ y la combinación de n, R¹, R² y R⁵ para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 26:

- 5 Compuestos de fórmula I-A' en la que k es 1, (R)_k es 5-F y la combinación de n, R¹, R² y R⁵ para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 27:

Compuestos de fórmula I-A' en la que k es 1, (R)_k es 6-F y la combinación de n, R¹, R² y R⁵ para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

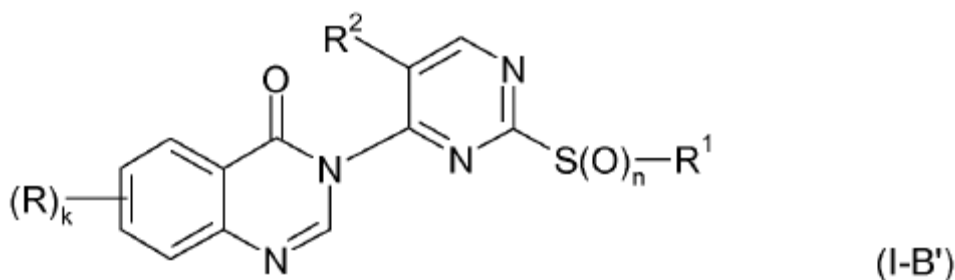
Tabla 28:

- 10 Compuestos de fórmula I-A' en la que k es 1, (R)_k es 7-F y la combinación de n, R¹, R² y R⁵ para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 29:

Compuestos de fórmula I-A' en la que k es 1, (R)_k es 8-F y la combinación de n, R¹, R² y R⁵ para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

- 15 En particular, con vistas a su uso para combatir plagas de invertebrados, se da preferencia a los compuestos individuales de fórmula I-B' (compuestos de fórmula I-B en la que X es O, R³ es H) y las variables n, k, R, R¹ y R² tienen cada una los significados dados anteriormente, en particular los significados preferidos.



- 20 Los ejemplos de los compuestos I-B' se recopilan en las tablas 30 a 58 siguientes, en las que las variables n, R¹ y R² tienen cada una los significados dados en una fila de la tabla B.

Tabla B:

	R ¹	R ²	n
B-1	Metilo	H	0
B-2	Etilo	H	0
B-3	Trifluorometilo	H	0
B-4	n-Propilo	H	0
B-5	Ciclopropilo	H	0
B-6	Metilciclopropilo	H	0
B-7	Ciclopropilmetilo	H	0
B-8	2,2,2-Trifluoroetilo	H	0
B-9	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	H	0
B-10	Metilo	H	1
B-11	Etilo	H	1
B-12	Trifluorometilo	H	1

	R ¹	R ²	n
B-13	n-Propilo	H	1
B-14	Ciclopropilo	H	1
B-15	Metilciclopropilo	H	1
B-16	Ciclopropilmetilo	H	1
B-17	2,2,2-Trifluoroetilo	H	1
B-18	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	H	1
B-19	Metilo	H	2
B-20	Etilo	H	2
B-21	Trifluorometilo	H	2
B-22	n-Propilo	H	2
B-23	Ciclopropilo	H	2
B-24	Metilciclopropilo	H	2
B-25	Ciclopropilmetilo	H	2
B-26	2,2,2-Trifluoroetilo	H	2
B-27	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	H	2
B-28	Metilo	F	0
B-29	Etilo	F	0
B-30	Trifluorometilo	F	0
B-31	n-Propilo	F	0
B-32	Ciclopropilo	F	0
B-33	Metilciclopropilo	F	0
B-34	Ciclopropilmetilo	F	0
B-35	2,2,2-Trifluoroetilo	F	0
B-36	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	F	0
B-37	Metilo	F	1
B-38	Etilo	F	1
B-39	Trifluorometilo	F	1
B-40	n-Propilo	F	1
B-41	Ciclopropilo	F	1
B-42	Metilciclopropilo	F	1
B-43	Ciclopropilmetilo	F	1
B-44	2,2,2-Trifluoroetilo	F	1
B-45	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	F	1
B-46	Metilo	F	2

	R ¹	R ²	n
B-47	Etilo	F	2
B-48	Trifluorometilo	F	2
B-49	n-Propilo	F	2
B-50	Ciclopropilo	F	2
B-51	Metilciclopropilo	F	2
B-52	Ciclopropilmetilo	F	2
B-53	2,2,2-Trifluoroetilo	F	2
B-54	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	F	2
B-55	Trifluorometilo	CH ₃	0
B-56	2,2,2-Trifluoroetilo	CH ₃	0
B-57	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	CH ₃	0
B-58	Trifluorometilo	CH ₃	1
B-59	2,2,2-Trifluoroetilo	CH ₃	1
B-60	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	CH ₃	1
B-61	Trifluorometilo	CH ₃	2
B-62	2,2,2-Trifluoroetilo	CH ₃	2
B-63	3,4,4-Trifluoro-3-buten-1-ilo	CH ₃	2

Tabla 30:

Compuestos de fórmula I-B' en la que k es 0 y la combinación de n, R¹ y R² para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla B.

Tabla 31:

- 5 Compuestos de fórmula I-B' en la que k es 1, (R)_k es 5-NO₂ y la combinación de n, R¹ y R² para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla B.

Tabla 32:

Compuestos de fórmula I-B' en la que k es 1, (R)_k es 6-NO₂ y la combinación de n, R¹ y R² para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla B.

10 Tabla 33:

Compuestos de fórmula I-B' en la que k es 1, (R)_k es 7-NO₂ y la combinación de n, R¹ y R² para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla B.

Tabla 34:

- 15 Compuestos de fórmula I-B' en la que k es 1, (R)_k es 8-NO₂ y la combinación de n, R¹ y R² para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla B.

Tabla 35:

Compuestos de fórmula I-B' en la que k es 1, (R)_k es 5-CN y la combinación de n, R¹ y R² para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla B.

Tabla 36:

- 20 Compuestos de fórmula I-B' en la que k es 1, (R)_k es 6-CN y la combinación de n, R¹ y R² para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla B.

Tabla 37:

Compuestos de fórmula I-B' en la que k es 1, $(R)_k$ es 7-CN y la combinación de n, R^1 y R^2 para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla B.

Tabla 38:

- 5 Compuestos de fórmula I-B' en la que k es 1, $(R)_k$ es 8-CN y la combinación de n, R^1 y R^2 para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla B.

Tabla 39:

Compuestos de fórmula I-B' en la que k es 1, $(R)_k$ es 5-CH₃ y la combinación de n, R^1 y R^2 para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla B.

- 10 Tabla 40:

Compuestos de fórmula I-B' en que k es 1, $(R)_k$ es 6-CH₃ y la combinación de n, R^1 y R^2 para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla B.

Tabla 41:

- 15 Compuestos de fórmula I-B' en la que k es 1, $(R)_k$ es 7-CH₃ y la combinación de n, R^1 y R^2 para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla B.

Tabla 42:

Compuestos de fórmula I-B' en la que k es 1, $(R)_k$ es 8-CH₃ y la combinación de n, R^1 y R^2 para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla B.

Tabla 43:

- 20 Compuestos de fórmula I-B' en la que k es 1, $(R)_k$ es 5-CF₃ y la combinación de n, R^1 y R^2 para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla B.

Tabla 44:

Compuestos de fórmula I-B' en la que k es 1, $(R)_k$ es 6-CF₃ y la combinación de n, R^1 y R^2 para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla B.

- 25 Tabla 45:

Compuestos de fórmula I-B' en la que k es 1, $(R)_k$ es 7-CF₃ y la combinación de n, R^1 y R^2 para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla B.

Tabla 46:

- 30 Compuestos de fórmula I-B' en la que k es 1, $(R)_k$ es 8-CF₃ y la combinación de n, R^1 y R^2 para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla B.

Tabla 47:

Compuestos de fórmula I-B' en la que k es 1, $(R)_k$ es 5-Cl y la combinación de n, R^1 y R^2 para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla B.

Tabla 48:

- 35 Compuestos de fórmula I-B' en la que k es 1, $(R)_k$ es 6-Cl y la combinación de n, R^1 y R^2 para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla B.

Tabla 49:

Compuestos de fórmula I-B' en que k es 1, $(R)_k$ es 7-Cl y la combinación de n, R^1 y R^2 para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla B.

- 40 Tabla 50:

Compuestos de fórmula I-B' en la que k es 1, $(R)_k$ es 8-Cl y la combinación de n, R^1 y R^2 para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla B.

Tabla 51:

Compuestos de fórmula I-B' en la que k es 1, $(R)_k$ es 5-OCH₃ y la combinación de n, R¹ y R² para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla B.

Tabla 52:

5 Compuestos de fórmula I-B' en la que k es 1, $(R)_k$ es 6-OCH₃ y la combinación de n, R¹ y R² para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla B.

Tabla 53:

Compuestos de fórmula I-B' en la que k es 1, $(R)_k$ es 7-OCH₃ y la combinación de n, R¹ y R² para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla B.

Tabla 54:

10 Compuestos de fórmula I-B' en la que k es 1, $(R)_k$ es 8-OCH₃ y la combinación de n, R¹ y R² para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla B.

Tabla 55:

Compuestos de fórmula I-B' en la que k es 1, $(R)_k$ es 5-F y la combinación de n, R¹ y R² para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla B.

15 Tabla 56:

Compuestos de fórmula I-B' en la que k es 1, $(R)_k$ es 6-F y la combinación de n, R¹ y R² para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla B.

Tabla 57:

20 Compuestos de fórmula I-B' en la que k es 1, $(R)_k$ es 7-F y la combinación de n, R¹ y R² para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla B.

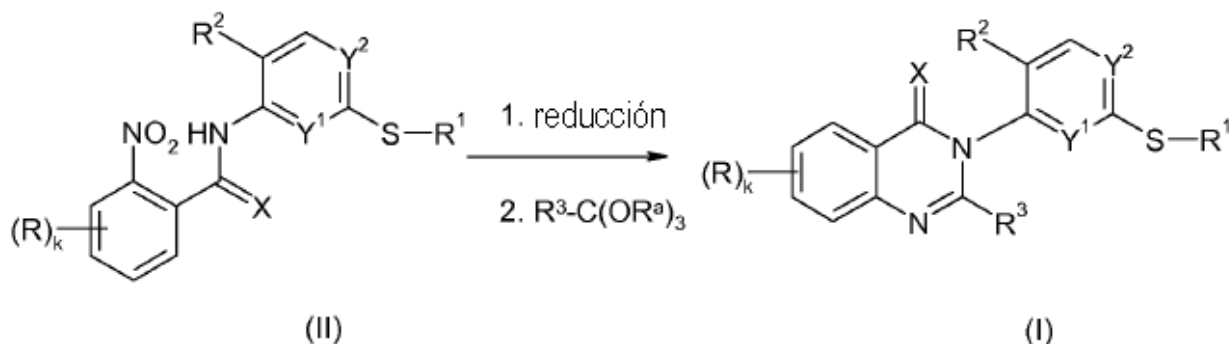
Tabla 58:

Compuestos de fórmula I-B' en la que k es 1, $(R)_k$ es 8-F y la combinación de n, R¹ y R² para cada compuesto individual corresponde en cada caso a una fila de la tabla B.

25 La preparación de los compuestos de fórmula I puede lograrse según procedimientos estándares de química orgánica, por ejemplo, mediante los procedimientos descritos de aquí en adelante o en los ejemplos de trabajo, pero no está limitada a las vías dadas a continuación.

Los compuestos de fórmula I en la que n es igual a 0 pueden prepararse, por ejemplo, según el procedimiento representado en el esquema 1 mediante una reducción del compuesto de nitro de fórmula II seguida de una reacción de condensación del compuesto de amina obtenido con un ortoéster R³-C(O-R^a)₃.

30 Esquema 1



En el esquema 1, k, R, R¹, R², R³, Y¹, Y² y X tienen uno de los significados dados anteriormente y R^a designa preferiblemente un grupo alquilo C₁-C₄, tal como metilo o etilo. X es preferiblemente O.

35 Según el esquema 1, el grupo nitro de un compuesto II se reduce en primer lugar hasta un grupo amino mediante procedimientos bien conocidos en la materia, tales como hidrogenación en presencia de níquel de Raney. Según la segunda etapa representada en el esquema 1, se introduce un grupo metino sustituido en R³ conectando el átomo de nitrógeno secundario del grupo amida y el átomo de nitrógeno del grupo amino recién formado, proporcionando el

compuesto I. Esta conversión puede lograrse, por ejemplo, haciendo reaccionar con un ortoéster tal como trietoximetano o 1,1,1-trietoxietano.

Los compuestos de fórmula I en la que n es igual a 1 pueden prepararse, por ejemplo, mediante oxidación del correspondiente compuesto I en la que n es igual a 0 usando un reactivo de oxidación tal como ácido nítrico diluido, peróxido de hidrógeno o un peroxiácido, por ejemplo ácido metacloroperoxibenzoico.

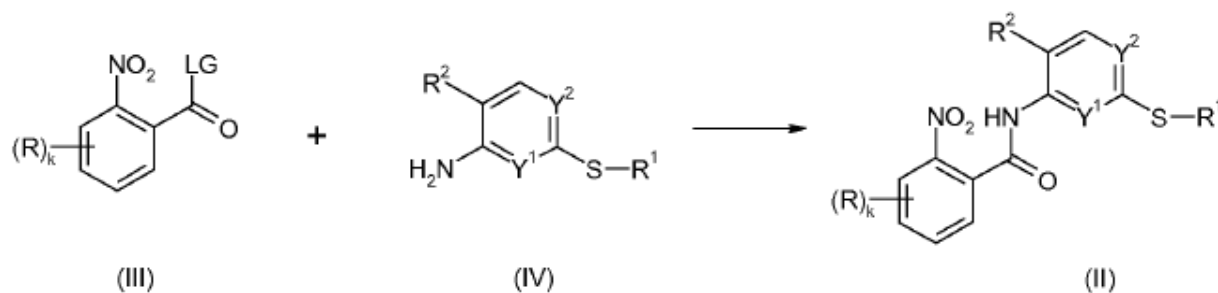
Los compuestos de fórmula I en la que n es igual a 2 pueden prepararse, por ejemplo, mediante oxidación del correspondiente compuesto I en el que n es igual a 0 o 1 usando ácido nítrico concentrado, permanganato de potasio o un exceso de peróxido de hidrógeno o peroxiácido.

Los compuestos de fórmula I en la que X es S pueden prepararse, por ejemplo, mediante tionación del correspondiente compuesto I en el que X es O usando pentasulfuro de fósforo o reactivo de Lawesson. Como alternativa, puede introducirse S en posición X mediante dicha reacción de tionación en una etapa más temprana o más tardía de la síntesis, por ejemplo, mediante tionación del compuesto 11.

Los compuestos de fórmula I en la que X es N-R⁴ pueden prepararse, por ejemplo, haciendo reaccionar un compuesto de fórmula I en la que X es S con la correspondiente amina R⁴-NH₂ de acuerdo con el procedimiento descrito por V. Glushkov *et al.* en *Pharmaceutical Chemistry Journal* 2005, 39(10), 533-536.

Los compuestos de fórmula II en la que X es O pueden prepararse, por ejemplo, según el procedimiento representado en el esquema 2 mediante una reacción de acilación.

Esquema 2

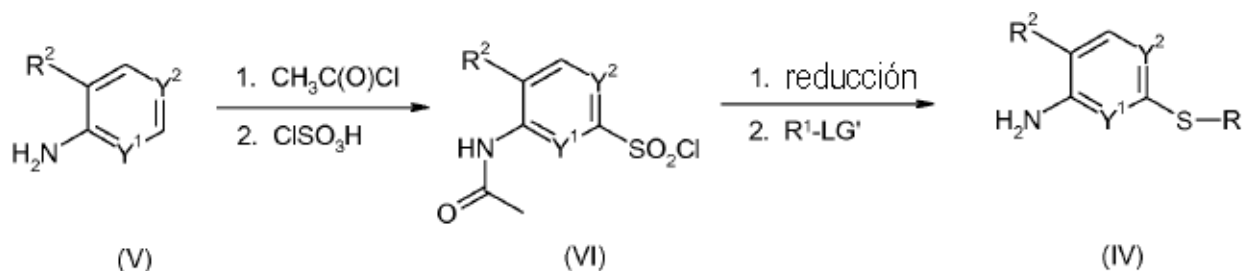


En el esquema 2, k, R, R¹, R², Y¹, Y² y X tienen uno de los significados dados anteriormente y LG designa un grupo saliente tal como halógeno, alcoxilo C₁-C₆ o hidroxilo.

Según el esquema 2, el compuesto IV se hace reaccionar con un ácido carboxílico de fórmula III, o un éster del mismo o un halogenuro de ácido carboxílico del mismo, especialmente cloruro, mediante procedimientos familiares para un químico orgánico y bien conocidos en la materia, dando un compuesto de fórmula 11.

Los compuestos de fórmula IV son conocidos, por ejemplo, por el documento JP 2007284356, o pueden prepararse análogamente a los procedimientos descritos allí. Pueden prepararse, por ejemplo, a partir de compuestos VI como se esboza en el esquema 3 siguiente.

Esquema 3



En el esquema 3, R¹, R², Y¹ e Y² tienen uno de los significados dados anteriormente y LG' designa un grupo saliente tal como halógeno, por ejemplo bromo o yodo.

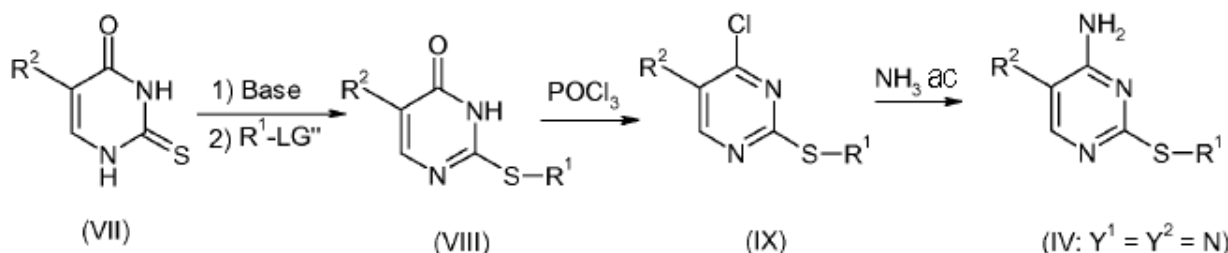
Según el procedimiento esbozado en el esquema 3, se reduce en primer lugar el cloruro de (het)arilsulfonilo VI hasta el correspondiente tiol por medios convencionales, por ejemplo, haciéndolo reaccionar con ácido yodhídrico o LiAlH₄. Como se esboza en el esquema 3, se convierte entonces el tiol en el tioéster IV por medios convencionales, por

ejemplo, haciéndolo reaccionar con un yoduro de halogenoalquilo, en el caso de pretender un halogenoalquilo como radical R^1 . Típicamente, la última etapa se lleva a cabo en presencia de un agente reductor tal como hidroximetisulfonato de sodio (Rongalite®, BASF) para convertir el ditiol que pueda haberse formado a partir de dos moléculas de compuesto VI durante la etapa de reducción precedente hasta el correspondiente tiol.

- 5 Los cloruros de (het)arilsulfonilo VI pueden prepararse, por ejemplo, según el procedimiento esbozado en el esquema 3, haciendo reaccionar una arilamina V, posteriormente a la introducción de un grupo protector de amino, con ácido clorosulfónico.

Los compuestos de fórmula IV en la que Y^1 e Y^2 son N pueden prepararse según el siguiente esquema 4:

Esquema 4



En el esquema 4, R^1 y R^2 tienen uno de los significados dados anteriormente y LG'' designa un grupo saliente tal como halógeno, por ejemplo bromo o yodo.

Según el esquema 4, se convierte en primer lugar un compuesto VII 2-tio-2,3-dihidropirimidin-4(1H)-ona en el correspondiente compuesto VIII de sulfanilo por medios convencionales, por ejemplo, haciéndolo reaccionar con un haluro de halogenoalquilo tal como yoduro de halogenoalquilo, en el caso de pretender un radical halogenoalquilo como radical R^1 . Típicamente, esta etapa se efectúa en presencia de una base tal como un hidruro de metal alcalinotérreo o hidruro de metal alcalino, por ejemplo, hidruro de sodio. Se convierte entonces el compuesto VIII en un compuesto IX de 4-cloropirimidina haciéndolo reaccionar con oxiclورو de fósforo. Finalmente, se hace reaccionar el compuesto IX con amoníaco acuoso, dando el compuesto IV.

Las (het)arilaminas de fórmula V son conocidas en la materia (por ejemplo, 4-metilnilina, número CAS [106-49-0] y 4-aminopirimidina, número CAS [591-54-8]) o pueden prepararse mediante procedimientos familiares para un químico orgánico y bien conocidos en la materia. Los procedimientos adecuados para preparar compuestos V comprenden, entre otros, la reducción catalítica de los correspondientes compuestos de arilnitro (véase, por ejemplo, *Chemistry Letters* 1975, 4, 259-260).

Varios de los compuestos III y III', tales como ácido 2-nitrobenzoico y 2-nitrobenzonitrilo, están comercialmente disponibles.

Como norma, los compuestos de fórmula I pueden prepararse mediante los procedimientos descritos anteriormente. Si compuestos individuales no pueden prepararse las rutas anteriormente descritas, pueden prepararse mediante derivatización de otros compuestos de fórmula I o mediante modificaciones habituales de las rutas sintéticas descritas. Por ejemplo, en casos individuales, ciertos compuestos de fórmula I pueden prepararse ventajosamente a partir de otros compuestos de fórmula I mediante hidrólisis de éster, amidación, esterificación, escisión de éter, olefinación, reducción, reacciones de acoplamiento catalizado por metal, oxidación y similares.

Las mezclas de reacción se procesan de manera habitual, por ejemplo mezclando con agua, separando las fases y, si es apropiado, purificando los productos brutos mediante cromatografía, por ejemplo sobre gel de alúmina o sílice. Algunos de los intermedios y productos finales pueden obtenerse en forma de aceites viscosos incoloros o marrones pálidos que se liberan o purifican de componentes volátiles a presión reducida y una temperatura moderadamente elevada. Si los intermedios y productos finales se obtienen en forma de sólidos, pueden purificarse mediante recristalización.

Debido a su excelente actividad, los compuestos de fórmula I pueden usarse para controlar plagas de invertebrados.

Por consiguiente, los compuestos de fórmula I pueden usarse para controlar plagas de invertebrados, comprendiendo dicho procedimiento tratar las plagas, su suministro de alimento, su hábitat o su terreno de cría o una planta cultivada, materiales de propagación vegetal (tales como semillas), suelo, zona, material o entorno en el que las plagas crecen o pueden crecer o los materiales, plantas cultivadas, materiales de propagación vegetal (tales como semillas), suelos, superficies o espacios para proteger del ataque o infestación de plagas con una cantidad plaguicida eficaz de un compuesto de fórmula I o una sal del mismo o una composición como se define anteriormente.

Preferiblemente, la presente invención proporciona un procedimiento para proteger material de propagación vegetal (tal como semillas) y a la planta que crece a partir del mismo ante el ataque o infestación de plagas, y comprende tratar el material de propagación vegetal (tal como semillas) con una cantidad plaguicida eficaz de un compuesto de fórmula I o una sal agrícolamente aceptable del mismo como se define anteriormente o con una cantidad plaguicida eficaz de una composición agrícola como se define anteriormente y a continuación. El procedimiento de la invención no está limitado a la protección del "sustrato" (planta, materiales de propagación vegetal, material de suelo, etc.) que se ha tratado según la invención, sino que también tiene un efecto preventivo, por tanto por ejemplo según la protección a una planta que crece a partir de materiales de propagación vegetal (tales como semillas), no habiendo sido tratada la planta misma.

- 10 En el sentido de la presente invención, las "plagas de invertebrados" se seleccionan preferiblemente de artrópodos y nematodos, más preferiblemente de insectos dañinos, arácnidos y nematodos, y aún más preferiblemente de insectos, ácaros y nematodos.

- 15 La invención proporciona adicionalmente una composición agrícola para combatir dichas plagas de invertebrados que comprende dicha cantidad de al menos un compuesto de fórmula I o al menos una sal agrícolamente útil del mismo y al menos un portador líquido y/o sólido inerte agronómicamente aceptable que tiene acción plaguicida y, si se desea, al menos un tensioactivo.

- 20 Dicha composición puede contener un compuesto activo único de fórmula I o una sal del mismo o una mezcla de varios compuestos activos de fórmula I o sus sales según la presente invención. La composición según la presente invención puede comprender un isómero individual o mezclas de isómeros, así como tautómeros individuales o mezclas de tautómeros.

Los compuestos de fórmula I y las composiciones plaguicidas que los comprenden son agentes eficaces para controlar plagas de artrópodos y nematodos. Las plagas de invertebrados controladas por los compuestos de fórmula I incluyen, por ejemplo:

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

- 40 escarabajos (*Coleoptera*), por ejemplo *Agrilus sinuatus*, *Agriotes lineatus*, *Agriotes obscurus*, *Amphimallus solstitialis*, *Anisandrus dispar*, *Anthonomus grandis*, *Anthonomus pomorum*, *Atomaria linearis*, *Blastophagus piniperda*, *Blitophaga undata*, *Bruchus rufimanus*, *Bruchus pisorum*, *Bruchus lentis*, *Byctiscus betulae*, *Cassida nebulosa*, *Ceratomya trifurcata*, *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Ceuthorrhynchus napi*, *Chaetocnema tibialis*, *Conoderus vespertinus*, *Crioceris asparagi*, *Diabrotica longicornis*, *Diabrotica 12 punctata*, *Diabrotica virgifera*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix hirtipennis*, *Eutinobothrus brasiliensis*, *Hylobius abietis*, *Hypera brunneipennis*, *Hypera postica*, *Ips typographus*, *Lema bilineata*, *Lema melanopus*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Limonius californicus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Melanotus communis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha hippocastani*, *Melolontha melolontha*, *Oulema oryzae*, *Ortiorrhynchus sulcatus*, *Otiorrhynchus ovatus*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllotreta chrysocephala*, *Phyllophaga sp.*, *Phyllopertha horticola*, *Phyllotreta nemorum*, *Phyllotreta striolata*, *Popillia japonica*, *Sitona lineatus* y *Sitophilus granaria*;

- 50 dípteros (*Diptera*), por ejemplo *Aedes aegypti*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Contarinia sorghicola*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culex pipiens*, *Dacus cucurbitae*, *Dacus oleae*, *Dasineura brassicae*, *Fannia canicularis*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hylemyia platura*, *Hypoderma lineata*, *Liriomyza sativae*, *Liriomyza trifolii*, *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Lycoria pectoralis*, *Mayetiola destructor*, *Musca domestica*, *Muscina stabulans*, *Oestrus ovis*, *Oscinella frit*, *Pegomya hysocyami*, *Phorbia antiqua*, *Phorbia brassicae*, *Phorbia coarctata*, *Rhagoletis cerasi*, *Rhagoletis pomonella*, *Tabanus bovinus*, *Tipula oleracea* y *Tipula paludosa*;

trips (*Thysanoptera*), por ejemplo *Dichromothrips corbeti*, *Frankliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella tritici*, *Scirtothrips citri*, *Thrips oryzae*, *Thrips palmi* and *Thrips tabaci*;

himenópteros (*Hymenoptera*), por ejemplo *Athalia rosae*, *Atta cephalotes*, *Atta sexdens*, *Atta texana*, *Hoplocampa minuta*, *Hoplocampa testudinea*, *Monomorium pharaonis*, *Solenopsis geminata* y *Solenopsis invicta*;

heterópteros (*Heteroptera*), por ejemplo *Acrosternum hilare*, *Blissus leucopterus*, *Cyrtopeltis notatus*, *Dysdercus cingulatus*, *Dysdercus intermedius*, *Eurygaster integriceps*, *Euschistus impictiventris*, *Leptoglossus phyllopus*, *Lygus lineolaris*, *Lygus pratensis*, *Nezara viridula*, *Piesma quadrata*, *Solubea insularis* y *Thyanta perditor*;

homópteros (*Homoptera*), por ejemplo *Acyrtosiphon onobrychis*, *Adelges laricis*, *Aphidula nasturtii*, *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis pomi*, *Aphis gossypii*, *Aphis grossulariae*, *Aphis schneideri*, *Aphis spiraeola*, *Aphis sambuci*, *Acyrtosiphon pisum*, *Aulacorthum solani*, *Bemisia argentifolii*, *Brachycaudus cardui*, *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycaudus persicae*, *Brachycaudus prunicola*, *Brevicoryne brassicae*, *Capitophorus horni*, *Cerosipha gossypii*, *Chaetosiphon fragaefolii*, *Cryptomyzus ribis*, *Dreyfusia nordmannianae*, *Dreyfusia piceae*, *Dysaphis radicola*, *Dysaulacorthum pseudosolani*, *Dysaphis plantaginea*, *Dysaphis pyri*, *Empoasca fabae*, *Hyalopterus pruni*, *Hyperomyzus lactucae*, *Macrosiphum avenae*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphum rosae*, *Megoura viciae*, *Melanaphis pyraus*, *Metopolophium dirhodum*, *Myzodes persicae*, *Myzus ascalonicus*, *Myzus cerasi*, *Myzus persicae*, *Myzus varians*, *Nasonovia ribis-nigri*, *Nilaparvata lugens*, *Pemphigus bursarius*, *Perkinsiella saccharicida*, *Phorodon humuli*, *Psylla mali*, *Psylla piri*, *Rhopalomyzus ascalonicus*, *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum padi*, *Rhopalosiphum insertum*, *Sappaphis mala*, *Sappaphis mali*, *Schizaphis graminum*, *Schizoneura lanuginosa*, *Sitobion avenae*, *Sogatella furcifera*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Toxoptera aurantiand*, y *Viteus vitifolii*;

termitas (*Isoptera*), por ejemplo *Calotermes flavicollis*, *Leucotermes flavipes*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes lucifugus* y *Termes natalensis*;

ortópteros (*Orthoptera*), por ejemplo *Acheta domestica*, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Forficula auricularia*, *Grylotalpa grylotalpa*, *Locusta migratoria*, *Melanoplus bivittatus*, *Melanoplus femur-rubrum*, *Melanoplus mexicanus*, *Melanoplus sanguinipes*, *Melanoplus spretus*, *Nomadacris septemfasciata*, *Periplaneta americana*, *Schistocerca americana*, *Schistocerca peregrina*, *Stauronotus maroccanus* y *Tachycines asynamorus*;

Arachnoidea, tales como arácnidos (*Acarina*), por ejemplo de las familias *Argasidae*, *Ixodidae* y *Sarcoptidae*, tales como *Amblyomma americanum*, *Amblyomma variegatum*, *Argas persicus*, *Boophilus annulatus*, *Boophilus decoloratus*, *Boophilus microplus*, *Dermacentor silvarum*, *Hyalomma truncatum*, *Ixodes ricinus*, *Ixodes rubicundus*, *Ornithodoros moubata*, *Otobius megnini*, *Dermanyssus gallinae*, *Psoroptes ovis*, *Rhipicephalus appendiculatus*, *Rhipicephalus evertsi*, *Sarcoptes scabiei* y *Eriophyidae* spp. tales como *Aculus schlechtendali*, *Phyllocoptrata oleivora* y *Eriophyes sheldoni*; *Tarsonemidae* spp. tales como *Phytonemus pallidus* y *Polyphagotarsonemus latus*; *Tenuipalpidae* spp. tales como *Brevipalpus phoenicis*; *Tetranychidae* spp. tales como *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus kanzawai*, *Tetranychus pacificus*, *Tetranychus telarius* y *Tetranychus urticae*, *Panonychus ulmi*, *Panonychus citri* y *Oligonychus pratensis*;

Siphonatera, por ejemplo *Xenopsylla cheopsis*, *Ceratophyllus* spp.

Las composiciones y compuestos de fórmula I son útiles para el control de nematodos, especialmente nematodos parasitarios vegetales tales como nematodos inductores de agallas, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica*, y otras especies de *Meloidogyne* species; nematodos formadores de quistes, *Globodera rostochiensis* y otras especies de *Globodera*; *Heterodera avenae*, *Heterodera glycines*, *Heterodera schachtii*, *Heterodera trifolii* y otras especies de *Heterodera*; nematodos de agalla de semilla, especies de *Anguina*; nematodos de tallo y foliares, especies de *Aphelenchoides*; nematodos de aguijón, *Belonolaimus longicaudatus* y otras especies de *Belonolaimus*; nematodos de pino, *Bursaphelenchus xylophilus* y otras especies de *Bursaphelenchus*; nematodos anulares, especies de *Criconema*, especies de *Criconemella*, especies de *Criconemoides*, especies de *Mesocriconema*; nematodos de tallo y bulbo, *Ditylenchus destructor*, *Ditylenchus dipsaci* y otras especies de *Ditylenchus*; nematodos de punzón, especies de *Dolichodorus*; nematodos espirales, *Helicotylenchus multicinctus* y otras especies de *Helicotylenchus*; nematodos de vaina y vainoides, especies de *Hemicycliophora* y especies de *Hemicriconemoides*; especies de *Hirshmanniella*; nematodos de lanza, especies de *Hoploaimus*; falsos nematodos inductores de agallas, especies de *Nacobbus*; nematodos de aguja, *Longidorus elongatus* y otras especies de *Longidorus*; nematodos de alfiler, especies de *Pratylenchus*; nematodos de lesión, *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus curvatus*, *Pratylenchus goodeyi* y otras especies de *Pratylenchus*; nematodos excavadores, *Radopholus similis* y otras especies de *Radopholus*; nematodos reniformes, *Rotylenchus robustus* y otras especies de *Rotylenchus*; especies de *Scutellonema*; nematodos de raíz gruesa, *Trichodorus primitivus* y otras especies de *Trichodorus*, especies de *Paratrachodorus*; nematodos del raquitismo, *Tylenchorhynchus claytoni*, *Tylenchorhynchus dubius* y otras especies de *Tylenchorhynchus*; nematodos de cítricos, especies de *Tylenchulus*; nematodos de daga, especies de *Xiphinema* y otras especies de nematodos parasitarias de plantas.

En una realización preferida de la invención, los compuestos de fórmula I se usan para controlar insectos o arácnidos, en particular insectos de los órdenes *Lepidoptera*, *Coleoptera*, *Thysanoptera* y *Homoptera* y arácnidos del orden *Acarina*. Los compuestos de fórmula I según la presente invención son particularmente útiles para controlar insectos de los órdenes *Thysanoptera* y *Homoptera*.

Los compuestos de fórmula I o las composiciones plaguicidas que los comprenden pueden usarse para proteger a plantas y cultivos en crecimiento del ataque o infestación por plagas de invertebrados, especialmente insectos, ácaros o arácnidos, mediante la puesta en contacto de la planta/cultivo con una cantidad plaguicida eficaz de compuestos de fórmula I. El término "cultivo" hace referencia tanto a cultivos en crecimiento como recolectados.

- 5 Los compuestos de fórmula I pueden convertirse en formulaciones habituales, por ejemplo soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos finos, polvos, pastas y gránulos. La forma de uso depende del fin particular pretendido; en cada caso, debería asegurar una distribución fina y uniforme del compuesto según la invención.

Las formulaciones se preparan de manera conocida (véanse, por ejemplo, para revisión los documentos US 3.060.084, EP-A 707.445 (para concentrados líquidos), Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, 4 de diciembre de 1967, 147-48, "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 4ª Ed., McGraw-Hill, Nueva York, 1963, páginas 8-57 y los siguientes WO 91/13546, US 472714, US 4.144.050, US 3.920.442, US 5.180.587, US 5.232.701, US 5.208.030, GB 2.095.558, US 3.299.566, Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley and Sons, Inc., Nueva York, 1961, Hance *et al.*, "Weed Control Handbook", 8ª Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989 y Mollet, H., Grubemann, A., "Formulation Technology", Wiley VCH Verlag GmbH, Weinheim (Alemania), 2001, 2. D. A. Knowles, "Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations", Kluwer Academia Publishers, Dordrecht, 1998 (ISBN 0-7514-0443-8), por ejemplo extendiendo el compuesto activo con auxiliares adecuados para la formulación de productos agroquímicos, tales como disolventes y/o portadores, si se desea emulsionantes, tensioactivos y dispersantes, conservantes, agentes antiespumantes, agentes anticongelantes, y para formulación de tratamiento de semilla, también opcionalmente colorantes y/o aglutinantes y/o agentes gelificantes.

20 Son ejemplos de disolventes adecuados agua, disolventes aromáticos (por ejemplo, productos de Solvesso, xileno), parafinas (por ejemplo, fracciones de aceite mineral), alcoholes (por ejemplo metanol, butanol, pentanol, alcohol bencílico), cetonas (por ejemplo, ciclohexanona, γ -butirolactona), pirrolidonas (*N*-metilpirrolidona [NMP], *N*-octilpirrolidona [NOP]), acetatos (diacetato de glicol), glicoles, dimetilamidas de ácido graso, ácidos grasos y ésteres de ácido graso. En principio, pueden usarse también mezclas de disolventes.

25 Son emulsionantes adecuados los emulsionantes no iónicos y aniónicos (por ejemplo éteres de alcohol graso de polioxietileno, alquilsulfonatos y arilsulfonatos).

Son ejemplos de dispersantes aguas residuales de lignina-sulfito y metilcelulosa.

30 Son tensioactivos adecuados usados las sales de metal alcalino, metal alcalinotérreo y amonio de ácido lignosulfónico, ácido naftalenosulfónico, ácido fenolsulfónico, ácido dibutilnaftalenosulfónico, alquilarilsulfonatos, alquilsulfatos, alquilsulfonatos, sulfatos de alcohol graso, ácidos grasos y glicoléteres de alcohol graso sulfatados, además condensados de naftaleno sulfonado y derivados de naftaleno con formaldehído, condensados de naftaleno o ácido naftalenosulfónico con fenol y formaldehído, polioxietilenoctilfenoléter, isooctilfenol etoxilado, octilfenol, nonilfenol, alquilfenolpoliglicoléteres, tributilfenilpoliglicoléter, triestearilfenilpoliglicoléter, alquilaripolieteralcoholes, condensados de alcohol y alcohol graso con óxido de etileno, aceite de ricino etoxilado, polioxietilenoalquiléteres, polioxipropileno etoxilado, poliglicoleteracetato de alcohol láurico, ésteres de sorbitol, aguas de desecho de lignosulfito y metilcelulosa.

40 Son sustancias que son adecuadas para la preparación de soluciones, emulsiones, pastas o dispersiones oleosas directamente pulverizables las fracciones de aceite mineral de punto de ebullición medio a alto, tales como queroseno o gasolina diésel, además aceites de alquitrán de hulla y aceites de origen vegetal o animal, hidrocarburos alifáticos, cíclicos y aromáticos, por ejemplo tolueno, xileno, parafina, tetrahidronaftaleno, naftalenos alquilados o sus derivados, metanol, etanol, propanol, butanol, ciclohexanol, ciclohexanona, isoforona, disolventes altamente polares, por ejemplo, dimetilsulfóxido, *N*-metilpirrolidona o agua.

Pueden añadirse también a la formulación agentes anticongelantes tales como glicerina, etilenglicol, propilenglicol y bactericidas.

45 Son agentes antiespumantes adecuados, por ejemplo, agentes antiespumantes basados en estearato de silicio o magnesio.

Es un conservante adecuado, por ejemplo, el diclorofeno.

Las formulaciones de tratamiento de semilla pueden comprender adicionalmente aglutinantes y opcionalmente colorantes.

50 Los aglutinantes pueden añadirse para mejorar la adhesión de los materiales activos sobre las semillas después del tratamiento. Son aglutinantes adecuados copolímeros en bloque de tensioactivos de OE/OP, pero también polivinilalcoholes, polivinilpirrolidonas, poliácridatos, polimetacrilatos, polibutenos, poliisobutenos, poliestireno, polietilenaminas, polietilenamidas, polietileniminas, (Lupasol®, Polymin®), poliéteres, poliuretanos, polivinilacetatos, tilosa y copolímeros derivados de estos polímeros.

- Pueden incluirse también opcionalmente colorantes en la formulación. Son colorantes o tintes adecuados para el tratamiento de semillas rodamina B, pigmento rojo C.I. 112, disolvente rojo C.I. 1, pigmento azul 15:4, pigmento azul 15:3, pigmento azul 15:2, pigmento azul 15:1, pigmento azul 80, pigmento amarillo 1, pigmento amarillo 13, pigmento rojo 112, pigmento rojo 48: 2, pigmento rojo 48:1, pigmento rojo 57:1, pigmento rojo 53:1, pigmento naranja 43, pigmento naranja 34, pigmento naranja 5, pigmento verde 36, pigmento verde 7, pigmento blanco 6, pigmento marrón 25, violeta básico 10, violeta básico 49, rojo ácido 51, rojo ácido 52, rojo ácido 14, azul ácido 9, amarillo ácido 23, rojo básico 10 y rojo básico 108.
- 5 Son ejemplos de agente gelificante el carragenano (Satiagel®).
- Los polvos, materiales para dispersión y productos espolvoreables pueden prepararse mezclando o moliendo conjuntamente las sustancias activas con un portador sólido.
- 10 Los gránulos, por ejemplo gránulos recubiertos, gránulos impregnados y gránulos homogéneos, pueden prepararse uniendo los compuestos activos con portadores sólidos.
- 15 Son ejemplos de portadores sólidos tierras minerales tales como geles de sílice, silicatos, talco, caolín, atapulgita activada, caliza, cal, creta, arcilla calcareoferruginosa, loess, arcilla, dolomita, tierra de diatomeas, sulfato de calcio, sulfato de magnesio, óxido de magnesio, materiales sintéticos molidos, fertilizantes tales como, por ejemplo, sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, ureas y productos de origen vegetal tales como harina de cereal, harina de corteza de árbol, polvo de madera y harina de cáscara de nuez, celulosa en polvo y otros portadores sólidos.
- 20 En general, las formulaciones comprenden de 0,01 a 95% en peso, preferiblemente de 0,1 a 90% en peso, del compuesto o compuestos activos. En este caso, el compuesto o compuestos activos se emplean con una pureza de 90 a 100% en peso, preferiblemente de 95 a 100% en peso (según el espectro de RMN).
- Con fines de tratamiento de semillas, las formulaciones respectivas pueden diluirse 2-10 veces, conduciendo a concentraciones en las preparaciones listas para usar de 0,01 a 60% en peso de compuesto activo, preferiblemente de 0,1 a 40% en peso.
- 25 Los compuestos de fórmula I pueden usarse como tales, en forma de sus formulaciones o las formas de uso preparadas a partir de las mismas, por ejemplo en forma de soluciones, polvos, suspensiones o dispersiones directamente pulverizables, emulsiones, dispersiones oleosas, pastas, productos espolvoreables, materiales para dispersar o gránulos, mediante pulverización, atomización, espolvoreo, dispersión o vertido. Las formas de uso dependen enteramente de los fines pretendidos; se pretende asegurar en cada caso la distribución más fina posible del compuesto o compuestos activos según la invención.
- 30 Las formas acuosas pueden prepararse a partir de concentrados en emulsión, pastas o polvos humectables (polvos pulverizables, dispersiones oleosas) añadiendo agua. Para preparar emulsiones, pastas o dispersiones oleosas, las sustancias como tales o disueltas en un aceite o disolvente pueden homogeneizarse en agua mediante un humectante, adhesivo, dispersante o emulsionante. Sin embargo, también es posible preparar concentrados compuestos por sustancia activa, humectante, adhesivo, dispersante o emulsionante y, si es apropiado, disolvente o aceite, y dichos concentrados son útiles para dilución con agua.
- 35 Las concentraciones de compuesto activo en las preparaciones listas para usar pueden variar dentro de intervalos relativamente amplios. En general, son de 0,0001 a 10% en peso, preferiblemente de 0,01 a 1% en peso.
- El compuesto o compuestos activos pueden usarse también exitosamente en el proceso de volumen ultrabajo (ULV), siendo posible aplicar formulaciones que comprenden más de 95% en peso de compuesto activo, o incluso aplicar el compuesto activo sin aditivos.
- 40 Los siguientes son ejemplos de formulaciones:
1. Productos para dilución con agua para aplicaciones foliares. Con fines de tratamiento de semillas, dichos productos pueden aplicarse a semillas diluidos o no diluidos.
- 45 A) Concentrados hidrosolubles (SL, LS)
- Se disuelven 10 partes en peso del compuesto o compuestos activos en 90 partes en peso de agua o disolvente hidrosoluble. Como alternativa, se añaden humectantes u otros auxiliares. El compuesto o compuestos activos se disuelven tras dilución con agua, con lo que se obtiene una formulación con 10% (p/p) de compuesto o compuestos activos.
- 50 B) Concentrados dispersables (DC)
- Se disuelven 20 partes en peso de compuesto o compuestos activos en 70 partes en peso de ciclohexanona con adición de 10 partes en peso de un dispersante, por ejemplo, polivinilpirrolidona. La dilución con agua da una dispersión, con lo que se obtiene una formulación con 20% (p/p) de compuesto o compuestos activos.

C) Concentrados emulsionables (EC)

Se disuelven 15 partes en peso del compuesto o compuestos activos en 7 partes en peso de xileno con adición de dodecibencenosulfonato de calcio y aceite de ricino etoxilado (en cada caso, 5 partes en peso). La dilución con agua da una emulsión, con lo que se obtiene una formulación con 15% (p/p) de compuesto o compuestos activos.

5 D) Emulsiones (EW, EO, ES)

Se disuelven 25 partes en peso del compuesto o compuestos activos en 35 partes en peso de xileno con adición de dodecibencenosulfonato de calcio y aceite de ricino etoxilado (en cada caso, 5 partes en peso). Se introduce esta mezcla en 30 partes en peso de agua mediante un aparato emulsionante (por ejemplo, Ultraturax) y se forma una emulsión homogénea. La dilución con agua da una emulsión, con lo que se obtiene una formulación con 25% (p/p) de compuesto o compuestos activos.

10

E) Suspensiones (SC, OD, FS)

En un molino de bolas agitado, se trituran 20 partes en peso del compuesto o compuestos activos con adición de 10 partes en peso de dispersantes y humectantes y 70 partes en peso de agua o un disolvente orgánico, dando una suspensión fina de compuesto o compuestos activos. La dilución con agua da una suspensión estable de compuesto o compuestos activos, con lo que se obtiene una formulación con 20% (p/p) de compuesto o compuestos activos.

15

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

Se muelen finamente 50 partes en peso del compuesto o compuestos activos con adición de 50 partes en peso de dispersantes y humectantes y se forman gránulos dispersables en agua o hidrosolubles mediante aparatos técnicos (por ejemplo, extrusión, torre de pulverización, lecho fluidificado). La dilución con agua da una dispersión o solución estable del compuesto o compuestos activos, con lo que se obtiene una formulación con 50% (p/p) de compuesto o compuestos activos.

20

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

Se muelen 75 partes en peso del compuesto o compuestos activos en un molino rotor-estator con adición de 25 partes en peso de dispersantes, humectantes y gel de sílice. La dilución con agua da una dispersión o solución estable del compuesto o compuestos activos, con lo que se obtiene una formulación con 75% (p/p) de compuesto o compuestos activos.

25

H) Formulación de gel (GF)

En un molino de bolas agitado, se trituran 20 partes en peso de compuesto o compuestos activos con adición de 10 partes en peso de dispersantes, 1 parte en peso de un agente gelificante y humectantes y 70 partes en peso de agua o un disolvente orgánico, dando una suspensión fina de compuesto o compuestos activos. La dilución con agua da una suspensión estable del compuesto o compuestos activos, con lo que se obtiene una formulación con 20% (p/p) de compuesto o compuestos activos.

30

2. Productos para aplicar sin dilución para aplicaciones foliares. Con fines de tratamiento de semillas, pueden aplicarse dichos productos a las semillas diluidos o no diluidos.

35 I) Polvos espolvoreables (DP, DS)

Se muelen finamente 5 partes en peso del compuesto o compuestos activos y se mezclan íntimamente con 95 partes en peso de caolín finamente dividido. Esto da un producto espolvoreable que tiene 5% (p/p) de compuesto o compuestos activos.

J) Gránulos (GR, FG, GG, MG)

Se muelen finamente 0,5 partes en peso del compuesto o compuestos activos y se asocian con 95,5 partes en peso de portadores, con lo que se obtiene una formulación con 0,5% (p/p) del compuesto o compuestos activos. Los procedimientos actuales son extrusión, secado por pulverización o lecho fluidificado. Esto da gránulos para aplicar sin dilución para uso foliar.

40

K) Soluciones de ULV (UL)

Se disuelven 10 partes en peso del compuesto o compuestos activos en 90 partes en peso de un disolvente orgánico, por ejemplo xileno. Esto da un producto que tiene un 10% (p/p) de compuesto o compuestos activos, que se aplica sin dilución para uso foliar.

45

Los compuestos de fórmula I son también adecuados para el tratamiento de materiales de propagación vegetal (tales como semillas). Las formulaciones de tratamiento de semillas convencionales incluyen, por ejemplo, concentrados fluidos FS, soluciones LS, polvos para tratamiento en seco DS, polvos dispersables en agua para

50

tratamiento en suspensión densa WS, polvos hidrosolubles SS y formulaciones en emulsión ES y EC y en gel GF. Estas formulaciones pueden aplicarse a las semillas diluidas o sin diluir. La aplicación a las semillas se lleva a cabo antes de sembrar, directamente sobre las semillas o después de pregerminar estas últimas.

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

- 10 Otras formulaciones de FS preferidas de compuestos de fórmula I para tratamiento de semillas comprenden de 0,5 a 80% en peso del ingrediente activo, de 0,05 a 5% en peso de humectante, de 0,5 a 15% en peso de agente dispersante, de 0,1 a 5% en peso de espesante, de 5 a 20% en peso de agente anticongelante, de 0,1 a 2% en peso de agente antiespumante, de 1 a 20% en peso de pigmento y/o tinte, de 0 a 15% en peso de adhesivo/agente de adhesión, de 0 a 75% en peso de carga/vehículo y de 0,01 a 1% en peso de conservante.

- 15 Pueden añadirse a los ingredientes activos diversos tipos de aceites, humectantes, coadyuvantes, herbicidas, fungicidas, otros plaguicidas o bactericidas, si es apropiado inmediatamente antes del uso (mezcla en tanque). Estos agentes se mezclan habitualmente con los agentes según la invención en una relación en peso de 1:10 a 10:1.

Los compuestos de fórmula I son eficaces tanto por contacto (a través de suelo, vidrio, pared, mosquitera, alfombra, partes de planta o partes de animal) como por ingestión (cebo o parte de planta).

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

- 20 El cebo puede ser una preparación líquida, sólida o semisólida (por ejemplo, un gel). Los cebos sólidos pueden conformarse en diversas conformaciones y formas adecuadas para la aplicación respectiva, por ejemplo, gránulos, bloques, barras, discos. Los cebos líquidos pueden rellenar diversos dispositivos para asegurar una aplicación apropiada, por ejemplo envases abiertos, dispositivos de pulverización, fuentes de goteo o fuentes de evaporación. Los geles pueden estar basados en matrices acuosas u oleosas y pueden formularse según necesidades
25 particulares en términos de pegajosidad, retención de humedad o características de envejecimiento.

- El cebo empleado en la composición es un producto que es suficientemente atractivo para incitar a insectos tales como hormigas, avispas, moscas, mosquitos, grillos, etc. o cucarachas a comerlo. El atractivo puede manipularse usando estimulantes alimentarios o feromonas sexuales. Los estimulantes alimentarios se eligen, por ejemplo pero no exclusivamente, de proteínas animales y/o vegetales (harina de carne, pescado o sangre, partes de insecto, yema de huevo), de grasas y aceites de origen animal y/o vegetal o mono-, oligo- o poliorganosacáridos, especialmente sacarosa, lactosa, fructosa, dextrosa, glucosa, almidón, pectina o incluso melazas o miel. Partes frescas o descompuestas de frutos, cultivos, plantas, animales, insectos o partes específicas de los mismos pueden servir también como estimulante alimentario. Las feromonas sexuales son conocidas por ser más específicas de insectos. Se describen feromonas específicas en la bibliografía y son conocidas por los especialistas en la materia.

- 35 Las formulaciones de compuestos de fórmula I en forma de aerosoles (por ejemplo, en botes pulverizadores), pulverizadores de aceite o pulverizadores de bomba son altamente deseables para el usuario no profesional para controlar plagas tales como moscas, pulgas, garrapatas, mosquitos o cucarachas. Las composiciones de aerosol están preferiblemente compuestas por compuesto activo, disolventes tales como alcoholes inferiores (por ejemplo, metanol, etanol, propanol, butanol), cetonas (por ejemplo, acetona, metiletilcetona), hidrocarburos parafinados (por ejemplo, querosenos) que tienen intervalos de ebullición de aproximadamente 50 a 250°C, dimetilformamida, *N*-metilpirrolidona, dimetilsulfóxido, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, xileno, agua y además auxiliares
40 tales como emulsionantes tales como monooleato de sorbitol, etoxilato de oleilo que tiene 3-7 mol de óxido de etileno, etoxilato de alcohol graso, aceites perfumados tales como aceites de éter, ésteres de ácidos grasos medios con alcoholes inferiores, compuestos carbonílicos aromáticos, si es apropiado estabilizantes tales como benzoato de sodio, tensioactivos anfotéricos, epóxidos inferiores, ortoformiato de trietilo y, si es necesario, propelentes tales como propano, butano, nitrógeno, aire comprimido, dimetiléter, dióxido de carbono, óxido nitroso o mezclas de estos gases.

Las formulaciones de pulverización de aceite difieren de las composiciones de aerosol en que no se usan propelentes.

- 50 Los compuestos de fórmula I y sus composiciones respectivas pueden usarse también en espirales antimosquitos y de fumigación, cartuchos de humo, placas vaporizadoras o vaporizadores a largo plazo y también en papeles antipolillas, pastillas antipolillas u otros sistemas vaporizadores independientes del calor.

- Los procedimientos para controlar enfermedades infecciosas transmitidas por insectos (por ejemplo, malaria, dengue y fiebre amarilla, filariasis linfática y leishmaniosis) con compuestos de fórmula I y sus composiciones respectivas
55 comprenden también el tratamiento de superficies de cabañas y casas, la pulverización del aire e impregnación de cortinas, tiendas, artículos de vestir, mosquiteras, trampas para mosca tsé tsé o similares. Las composiciones insecticidas para aplicación a fibras, tela, artículos tejidos, no tejidos, material o láminas de malla y toldos

comprenden preferiblemente una mezcla que incluye el insecticida, opcionalmente un repelente y al menos un aglutinante. Son repelentes adecuados, por ejemplo, *N,N*-dietil-meta-toluamida (DEET), *N,N*-dietilfenilacetamida (DEPA), 1-(3-ciclohexan-1-ilcarbonyl)-2-metilpiperina, lactona del ácido (2-hidroximetilciclohexil)acético, 2-etil-1,3-hexanodiol, indalona, metilneodecanamida (MNDA), un piretroide no usado para control de insectos tal como (+)-trans-crisantemato de (+/-)-3-alil-2-metil-4-oxociclopent-2-(+)-enilo (esbiotrina), un repelente derivado de o idéntico a extractos vegetales como limoneno, eugenol, (+)-eucamalol (1), (-)-1-epi-eucamalol o extractos vegetales brutos de plantas como *Eucalyptus maculata*, *Vitex rotundifolia*, *Cymbopogon martinii*, *Cymbopogon citratus* (hierba de limón), *Cymbopogon nardus* (citronela). Los aglutinantes adecuados se seleccionan, por ejemplo, de polímeros y copolímeros de ésteres vinílicos de ácidos alifáticos (tales como acetato de vinilo y versatato de vinilo), ésteres acrílicos y metacrílicos de alcoholes tales como acrilato de butilo, acrilato de 2-etilhexilo y acrilato de metilo, hidrocarburos mono- y dietilénicamente insaturados tales como estireno y dienos alifáticos tales como butadieno.

La impregnación de cortinas y mosquiteras se realiza en general sumergiendo el material textil en emulsiones o dispersiones de los compuestos activos de fórmula I o pulverizándolos sobre las mallas.

Los procedimientos que pueden emplearse para tratar semillas son, en principio, todas las técnicas de tratamiento de semillas y especialmente de desinfección de semillas adecuadas conocidas en la materia, tales como recubrimiento de semillas (por ejemplo, peletización de semillas), espolvoreo de semillas e imbibición de semillas (por ejemplo, empapado de semillas). Aquí, "tratamiento de semillas" hace referencia a todos los procedimientos que ponen en contacto semillas y compuestos de fórmula I entre sí, y "desinfección de semillas" a procedimientos de tratamiento de semillas que proporcionan a las semillas una cantidad de los compuestos de fórmula I, concretamente que generan una semilla que comprende el compuesto de fórmula I. En principio, el tratamiento puede aplicarse a la semilla en cualquier momento desde la recolección de la semilla hasta la siembra de la semilla. La semilla puede tratarse inmediatamente antes, o durante la plantación de la semilla, por ejemplo usando el procedimiento de "maceta". Sin embargo, el tratamiento puede llevarse a cabo también durante varias semanas o meses, por ejemplo hasta 12 meses, antes de plantar la semilla, por ejemplo en forma de un tratamiento de desinfección de semillas, sin que se observe una eficacia sustancialmente reducida.

Convenientemente, el tratamiento se aplica a semilla no sembrada. Como se usa en la presente memoria, el término "semilla no sembrada" pretende incluir semilla en cualquier periodo desde la recolección de la semilla a la siembra de la semilla en el terreno con fines de germinación y crecimiento de la planta.

Específicamente, se sigue un procedimiento en el tratamiento en que se mezcla la semilla en un dispositivo adecuado, por ejemplo un dispositivo de mezclado para partículas de mezcla sólidos o sólidos/líquidos, con la cantidad deseada de formulaciones de tratamiento de semillas, como tales o después de dilución previa con agua, hasta que la composición se distribuye uniformemente sobre la semilla. Si es apropiado, esto es seguido por una etapa de secado.

Los compuestos de fórmula I o los enantiómeros o sales veterinariamente aceptables de los mismos son en particular adecuados también para uso para combatir parásitos en y sobre animales.

Es un objeto de la invención proporcionar plaguicidas más seguros para animales. Es otro objeto de la invención proporcionar adicionalmente plaguicidas para animales que puedan usarse a dosis menores que los plaguicidas existentes. Y es otro objeto de la invención proporcionar plaguicidas para animales que proporcionen un largo control residual de los parásitos.

La invención se refiere también a composiciones que contienen una cantidad parasitocida eficaz de compuestos de fórmula I o a enantiómeros o sales veterinariamente aceptables de los mismos y un portador aceptable para combatir parásitos en y sobre animales.

Los compuestos de fórmula I pueden usarse también para tratar, controlar, prevenir y proteger a animales contra la infestación e infección por parásitos, que comprende administrar o aplicar por vía oral, tópica o parenteral a los animales una cantidad parasitocida eficaz de un compuesto de fórmula I o los enantiómeros o sales veterinariamente aceptables de los mismos o una composición que los comprenda.

La presente invención proporciona también un procedimiento no terapéutico para tratar, controlar, prevenir y proteger a animales contra la infestación e infección por parásitos, que comprende aplicar a un lugar una cantidad parasitocida eficaz de un compuesto de fórmula I o los enantiómeros o sales veterinariamente aceptables de los mismos o una composición que los comprenda.

La invención proporciona también un proceso para la preparación de una composición para tratar, controlar, prevenir o proteger a animales contra la infestación o infección por parásitos, que comprende incluir una cantidad parasitocida eficaz de un compuesto de fórmula I o los enantiómeros o sales veterinariamente aceptables de los mismos en una composición que los comprenda.

La invención se refiere adicionalmente a compuestos de fórmula I para uso en el tratamiento, control, prevención o protección de animales contra la infestación o infección por parásitos.

La invención se refiere también al uso de un compuesto de fórmula I, o una composición que lo comprenda, para la fabricación de un medicamento para el tratamiento terapéutico de animales contra infecciones o infestaciones por parásitos.

- 5 La actividad de compuestos contra plagas agrícolas no sugiere su idoneidad para el control de endoparásitos y ectoparásitos en o sobre animales que requieran, por ejemplo, dosificaciones bajas no eméticas en el caso de aplicación oral, compatibilidad metabólica con el animal, baja toxicidad y un manejo seguro.

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

- 10 Los compuestos de fórmula I o los enantiómeros o sales veterinariamente aceptables de los mismos y composiciones que los comprenden se usan preferiblemente para controlar y prevenir infestaciones e infecciones en animales que incluyen animales de sangre caliente (incluyendo seres humanos) y peces. Son adecuados, por ejemplo, para controlar y prevenir infestaciones e infecciones en mamíferos tales como ganado bovino, ovejas, porcinos, camellos, ciervos, caballos, cerdos, aves de corral, conejos, cabras, perros y gatos, búfalos de agua, monos, gamos y renos, y también en animales de peletería tales como visón, chinchilla y mapache, aves tales como gallinas, gansos, pavos y patos y peces tales como peces de agua dulce y agua salada tales como trucha, carpa y anguilas.

Los compuestos de fórmula I o los enantiómeros o sales veterinariamente aceptables de los mismos y composiciones que los comprenden se usan preferiblemente para controlar y prevenir infestaciones e infecciones en animales domésticos tales como perros o gatos.

- 20 Las infestaciones en animales de sangre caliente y peces incluyen, pero sin limitación, piojos, piojos mordedores, garrapatas, estros nasales, moscas malófagas, moscas mordedoras, moscas muscoides, moscas, larvas de mosca miasítica, chinches, jejenos, mosquitos y pulgas.

- 25 Los compuestos de fórmula I o los enantiómeros o sales veterinariamente aceptables de los mismos y composiciones que los comprenden son adecuados para el control sistémico y/o no sistémico de ectoparásitos y/o endoparásitos. Son activos contra todas o algunas etapas de desarrollo.

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

Los compuestos de fórmula I son especialmente útiles para combatir endoparásitos.

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

- 30 pulgas (*Siphonaptera*), por ejemplo *Ctenocephalides felis*, *Ctenocephalides canis*, *Xenopsylla cheopis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans* y *Nosopsyllus fasciatus*,

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

- 35 moscas y mosquitos (*Diptera*), por ejemplo *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Anopheles crucians*, *Anopheles albimanus*, *Anopheles gambiae*, *Anopheles freeborni*, *Anopheles leucosphyrus*, *Anopheles minimus*, *Anopheles quadrimaculatus*, *Calliphora vicina*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Chrysops discalis*, *Chrysops silacea*, *Chrysops atlanticus*, *Cochliomyia hominivorax*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culicoides furens*, *Culex pipiens*, *Culex nigripalpus*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex tarsalis*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Dermatobia hominis*, *Fannia canicularis*,
40 *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Glossina palpalis*, *Glossina fuscipes*, *Glossina tachinoides*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hippelates* spp., *Hypoderma lineata*, *Leptoconops torrens*, *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Lycoria pectoralis*, *Mansonina* spp., *Musca domestica*, *Muscina stabulans*, *Oestrus ovis*, *Phlebotomus argentipes*, *Psorophora columbiae*, *Psorophora discolor*, *Prosimulium mixtum*, *Sarcophaga haemorrhoidalis*, *Sarcophaga* sp., *Simulium vittatum*, *Stomoxys calcitrans*, *Tabanus bovinus*, *Tabanus atratus*, *Tabanus lineola* y *Tabanus similis*;

piojos (*Phthiraptera*), por ejemplo *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pthirus pubis*, *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus suis*, *Linognathus vituli*, *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*, *Menacanthus s tramineus* y *Solenopotes capillatus*;

- 50 garrapatas y ácaros parásitos (*Parasitiformes*): garrapatas (*Ixodida*), por ejemplo *Ixodes scapularis*, *Ixodes holocyclus*, *Ixodes pacificus*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor variabilis*, *Amblyomma americanum*, *Amblyomma maculatum*, *Ornithodoros hermsi*, *Ornithodoros turicata* y ácaros parásitos (*Mesostigmata*), por ejemplo *Ornithonyssus bacoti* y *Dermanyssus gallinae*,

actínidos (*Prostigmata*) y acarídidos (*Astigmata*) por ejemplo *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Ornithocheyletiella* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Listrophorus* spp., *Acarus* spp., *Tyrophagus*

spp., *Caloglyphus spp.*, *Hypodectes spp.*, *Pterolichus spp.*, *Psoroptes spp.*, *Chorioptes spp.*, *Otodectes spp.*, *Sarcoptes spp.*, *Notoedres spp.*, *Knemidocoptes spp.*, *Cytodites spp.*, and *Laminosioptes spp.*,

chinchas (*Heteroptera*): *Cimex lectularius*, *Cimex hemipterus*, *Reduvius senilis*, *Triatoma spp.*, *Rhodnius spp.*, *Panstrongylus spp.* y *Arlus critatus*,

5 anoplúridos, por ejemplo *Haematopinus spp.*, *Linognathus spp.*, *Pediculus spp.*, *Phthirus spp.* y *Solenopotes spp.*,

malófagos (subórdenes *Amblycerina* e *Ischnocerina*), por ejemplo *Trimenopon spp.*, *Menopon spp.*, *Trinoton spp.*, *Bovicola spp.*, *Werneckiella spp.*, *Lepikentron spp.*, *Trichodectes spp.*, y *Felicola spp.*,

nematodos gusanos redondos:

10 gusanos látigo y de triquinosis (*Trichosyringida*), por ejemplo triquinélidos (*Trichinella spp.*), (*Trichuridae*) *Trichuris spp.*, *Capillaria spp.*,

rabditidos, por ejemplo *Rhabditis spp.*, *Strongyloides spp.*, *Helicephalobus spp.*,

15 estrogilidos, por ejemplo *Strongylus spp.*, *Ancylostoma spp.*, *Necator americanus*, *Bunostomum spp.* (anquilostoma), *Trichostrongylus spp.*, *Haemonchus contortus*, *Ostertagia spp.*, *Cooperia spp.*, *Nematodirus spp.*, *Dictyocaulus spp.*, *Cyathostoma spp.*, *Oesophagostomum spp.*, *Stephanurus dentatus*, *Ollulanus spp.*, *Chabertia spp.*, *Stephanurus dentatus*, *Syngamus trachea*, *Ancylostoma spp.*, *Uncinaria spp.*, *Globocephalus spp.*, *Necator spp.*, *Metastrongylus spp.*, *Muellerius capillaris*, *Protostrongylus spp.*, *Angiostrongylus spp.*, *Parelaphostrongylus spp.*, *Aleurostrongylus abstrusus*, y *Diocetophyma renale*,

20 gusanos redondos intestinales (*Ascaridida*), por ejemplo *Ascaris lumbricoides*, *Ascaris suum*, *Ascaridia galli*, *Parascaris equorum*, *Enterobius vermicularis* (oxiuro), *Toxocara canis*, *Toxascaris leonine*, *Skrjabinema spp.* y *Oxyuris equi*;

camalánidos, por ejemplo *Dracunculus medinensis* (gusano de Guinea);

espirúridos, por ejemplo *Thelazia spp.*, *Wuchereria spp.*, *Brugia spp.*, *Onchocerca spp.*, *Dirofilaria spp.*, *Dipetalonema spp.*, *Setaria spp.*, *Elaeophora spp.*, *Spirocerca lupi* y *Habronema spp.*;

25 gusanos de cabeza espinosa (*Acanthocephala*), por ejemplo *Acanthocephalus spp.*, *Macracanthorhynchus hirudinaceus* y *Oncicola spp.*;

planarios (platelmintos):

trematodos (*Trematoda*), por ejemplo *Faciola spp.*, *Fascioloides magna*, *Paragonimus spp.*, *Dicrocoelium spp.*, *Fasciolopsis buski*, *Clonorchis sinensis*, *Schistosoma spp.*, *Trichobilharzia spp.*, *Alaria alata*, *Paragonimus spp.* y *Nanocyetes spp.*,

30 cercomeromorfos, en particular cestodos (gusanos planos), por ejemplo *Diphylobothrium spp.*, *Tenia spp.*, *Echinococcus spp.*, *Dipilidium caninum*, *Multiceps spp.*, *Hymenolepis spp.*, *Mesocostoides spp.*, *Vampirolepis spp.*, *Moniezia spp.*, *Anoplocephala spp.*, *Sirometra spp.*, *Anoplocephala spp.* e *Hymenolepis spp.*

Los compuestos de fórmula I y composiciones que los contienen son particularmente útiles para el control de plagas de los órdenes *Diptera*, *Siphonaptera* e *Ixodida*.

35 Además, es especialmente preferido el uso de los compuestos de fórmula I y composiciones que los contienen para combatir mosquitos.

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

40 Además, se prefiere especialmente el uso de los compuestos de fórmula I y composiciones que los contienen para combatir pulgas.

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

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

45 Los compuestos de fórmula I pueden ser eficaces mediante contacto (a través de suelo, vidrio, pared, mosquitera, alfombra, mantas o partes de animal) e ingestión (por ejemplo cebos).

La presente invención se refiere al uso terapéutico y no terapéutico de compuestos de fórmula I para controlar y/o combatir parásitos en y/o sobre animales.

Los compuestos de fórmula I pueden usarse para proteger a animales del ataque o infestación por parásitos poniéndolos en contacto con una cantidad parasitaria eficaz de compuestos de fórmula I. Como tal, "poner en contacto" incluye tanto contacto directo (aplicar los compuestos/composiciones directamente sobre el parásito, por ejemplo también en su lugar y opcionalmente también administrar los compuestos/composiciones directamente sobre el animal) como contacto indirecto (aplicar los compuestos/composiciones en el lugar del parásito). El contacto con el parásito mediante aplicación a su lugar es un ejemplo de uso no terapéutico de compuestos de fórmula I.

"Lugar" como se define anteriormente significa el hábitat, suministro de alimento, terreno de cría, zona, material o entorno en que un parásito crece o puede crecer fuera del animal. Los compuestos de la invención pueden aplicarse también preventivamente a sitios en que se espera la aparición de plagas o parásitos.

La administración al animal puede llevarse a cabo tanto profiláctica como terapéuticamente.

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

Para administración oral a animales de sangre caliente, los compuestos de fórmula I pueden formularse como piensos animales, premezclas de piensos animales, concentrados de alimentos animales, píldoras, soluciones, pastas, suspensiones, pócimas, geles, comprimidos, bolos y cápsulas. Además, los compuestos de fórmula I pueden administrarse a los animales con su agua potable. Para administración oral, la forma de dosificación elegida debería proporcionar al animal de 0,01 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal animal al día de compuesto de fórmula I, preferiblemente de 0,5 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal animal al día.

Como alternativa, los compuestos de fórmula I pueden administrarse a animales por vía parenteral, por ejemplo, por inyección intrarruminal, intramuscular, intravenosa o subcutánea. Los compuestos de fórmula I pueden dispersarse o disolverse en un portador fisiológicamente aceptable para inyección subcutánea. Como alternativa, los compuestos de fórmula I pueden formularse en un implante para administración subcutánea. Además, el compuesto de fórmula I puede administrarse por vía transdérmica a animales. Para administración parenteral, la forma de dosificación elegida debería proporcionar al animal de 0,01 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal animal al día de compuesto de fórmula I.

Los compuestos de fórmula I pueden aplicarse también por vía tópica a los animales en forma de baños, polvos finos, polvos, collares, medallones, pulverizadores, champús, formulaciones de tratamiento por aplicación puntual y lavado y en pomadas o emulsiones de aceite en agua o agua en aceite. Para aplicación tópica, los baños y pulverizadores contienen habitualmente de 0,5 ppm a 5.000 ppm y preferiblemente de 1 ppm a 3.000 ppm de compuesto de fórmula I. Además, los compuestos de fórmula I pueden formularse como crotales para animales, particularmente cuadrúpedos tales como ganado bovino y ovejas.

Son preparaciones adecuadas:

- soluciones tales como soluciones orales, concentrados para administración oral después de dilución, soluciones para uso sobre la piel o en cavidades corporales, formulaciones de tratamiento por lavado, geles;
- emulsiones y suspensiones para administración oral o dérmica; preparaciones semisólidas;
- formulaciones en que el compuesto activo se procesa en una base de pomada o en una base de emulsión de aceite en agua o agua en aceite;
- preparaciones sólidas tales como polvos, premezclas o concentrados, gránulos, aglomerados, comprimidos, bolos, cápsulas, aerosoles e inhaladores y artículos conformados que contienen el compuesto activo.

Las composiciones adecuadas para inyección se preparan disolviendo el ingrediente activo en un disolvente adecuado y añadiendo opcionalmente ingredientes adicionales tales como ácidos, bases, sales de tamponación, conservantes y solubilizantes. Las soluciones se filtran y son rellenadas estériles.

Son disolventes adecuados los disolventes fisiológicamente tolerables tales como agua, alcanos tales como etanol, butanol, alcohol bencílico, glicerol, propilenglicol, polietilenglicoles, *N*-metilpirrolidona, 2-pirrolidona y mezclas de los mismos.

Los compuestos activos pueden disolverse opcionalmente en aceites vegetales o sintéticos fisiológicamente tolerables que sean adecuados para inyección.

Son solubilizantes adecuados disolventes que promueven la disolución del compuesto activo en el disolvente principal o previenen su precipitación. Son ejemplos polivinilpirrolidona, polivinilalcohol, aceite de ricino polioxietilado y éster de sorbitán polioxietilado.

Son conservantes adecuados alcohol bencílico, triclorobutanol, ésteres de ácido p-hidroxibenzoico y n-butanol.

Las soluciones orales se administran directamente. Los concentrados se administran por vía oral después de dilución previa hasta la concentración de uso. Las soluciones orales y concentrados se preparan según el estado de la técnica y como se describe anteriormente para soluciones de inyección, no siendo necesarios procedimientos estériles.

- 5 Las soluciones para uso sobre la piel se gotean, extienden, frotan, rocían o pulverizan.

Las soluciones para uso sobre la piel se preparan según el estado de la técnica y según lo que se describe anteriormente para soluciones de inyección, no siendo necesarios procedimientos estériles.

- 10 Son disolventes adecuados adicionales polipropilenglicol, feniletanol, fenoxietanol, ésteres tales como acetato de etilo o butilo, benzoato de bencilo, éteres tales como alquilenglicolalquiléter, por ejemplo dipropilenglicolmonometiléter, cetonas tales como acetona, metiletilcetona, hidrocarburos aromáticos, aceites vegetales y sintéticos, dimetilformamida, dimetilacetamida, Transcutol, Solketal, carbonato de propileno y mezclas de los mismos.

- 15 Puede ser ventajoso añadir espesantes durante la preparación. Son espesantes adecuados espesantes inorgánicos tales como bentonitas, ácido silícico coloidal, monoestearato de aluminio, espesantes orgánicos tales como derivados de celulosa, polivinilalcoholes y sus copolímeros, acrilatos y metacrilatos.

Los geles se aplican o extienden sobre la piel o se introducen en cavidades corporales. Los geles se preparan tratando soluciones que se han preparado como se describe en el caso de soluciones de inyección con espesante suficiente para dar como resultado un material transparente con consistencia de tipo pomada. Los espesantes empleados son los espesantes dados anteriormente.

- 20 Las formulaciones de tratamiento por lavado se vierten o pulverizan sobre zonas limitadas de la piel, penetrando el compuesto activo en la piel y actuando sistémicamente.

- 25 Las formulaciones de tratamiento por lavado se preparan disolviendo, suspendiendo o emulsionando el compuesto activo en disolventes dermocompatibles adecuados o mezclas de disolventes. Si es apropiado, se añaden otros auxiliares tales como colorantes, sustancias promotoras de la bioabsorción, antioxidantes, fotoestabilizantes y adhesivos.

- 30 Son disolventes adecuados: agua, alcanoles, glicoles, polietilenglicoles, polipropilenglicoles, glicerol, alcoholes aromáticos tales como alcohol bencílico, feniletanol, fenoxietanol, ésteres tales como acetato de etilo, acetato de butilo, benzoato de bencilo, éteres tales como alquilenglicolalquiléteres tales como dipropilenglicolmonometiléter, dietilenglicolmonobutyléter, cetonas tales como acetona, metiletilcetona, carbonatos cíclicos tales como carbonato de propileno, carbonato de etileno, hidrocarburos aromáticos y/o alifáticos, aceites vegetales o sintéticos, DMF, dimetilacetamida, *N*-alquilpirrolidonas tales como metilpirrolidona, *n*-butilpirrolidona o *n*-octilpirrolidona, *N*-metilpirrolidona, 2-pirrolidona, 2,2-dimetil-4-oximetilen-1,3-dioxolano y glicerolformal.

Son colorantes adecuados todos los colorantes permitidos para uso en animales y que puedan disolverse o suspenderse.

- 35 Son sustancias promotoras de la absorción adecuadas, por ejemplo, DMSO, aceites formadores de película tales como miristato de isopropilo, pelargonato de dipropilenglicol, aceites de silicona y copolímeros de los mismos con poliéteres, ésteres de ácido graso, triglicéridos y alcoholes grasos.

Son antioxidantes adecuados sulfitos o metabisulfitos tales como metabisulfito de potasio, ácido ascórbico, butilhidroxitolueno, butilhidroxianisol y tocoferol.

- 40 Son fotoestabilizantes adecuados, por ejemplo, ácido novantisólico.

Son adhesivos adecuados, por ejemplo, derivados de celulosa, derivados de almidón, poliacrilatos, polímeros naturales tales como alginatos y gelatina.

Las emulsiones pueden administrarse por vía oral, dérmica o como inyecciones.

Las emulsiones son de tipo agua en aceite o de tipo aceite en agua.

- 45 Se preparan disolviendo el compuesto activo en la fase hidrófoba o hidrófila y homogeneizando esta con el disolvente de la otra fase con la ayuda de emulsionantes adecuados y, si es apropiado, otros auxiliares tales como colorantes, sustancias promotoras de la absorción, conservantes, antioxidantes, fotoestabilizantes y agentes potenciadores de la viscosidad.

Son fases hidrófobas (aceites) adecuadas:

- 50 parafinas líquidas, aceites de silicona, aceites vegetales naturales tales como aceite de sésamo, aceite de almendra, aceite de ricino, triglicéridos sintéticos tales como diglicérido caprílico/cáprico, mezcla de triglicéridos con ácidos

5 grasos vegetales de longitud de cadena C₈-C₁₂ u otros ácidos grasos naturales especialmente seleccionados, mezclas de glicéridos parciales de ácidos grasos saturados o insaturados que contienen posiblemente también grupos hidroxilo, mono- y diglicéridos de ácidos grasos C₈-C₁₀, ésteres de ácido graso tales como estearato de etilo, adipato de di-n-butilo, laurato de hexilo, pelargonato de dipropilenglicol, ésteres de un ácido graso ramificado de longitud de cadena media con alcoholes grasos saturados de longitud de cadena C₁₆-C₁₈, miristato de isopropilo, palmitato de isopropilo, ésteres de ácido caprílico/cáprico de alcoholes grasos saturados de longitud de cadena C₁₂-C₁₈, estearato de isopropilo, oleato de oleilo, oleato de decilo, oleato de etilo, lactato de etilo, ésteres de ácido graso céreos tales como grasa de gándula uropígea de pato sintética, ftalato de dibutilo, adipato de diisopropilo y mezclas de ésteres relacionados con los últimos, alcoholes grasos tales como alcohol isotridecílico, 2-octildodecanol, alcohol cetilestearílico, alcohol oleico y ácidos grasos tales como ácido oleico y mezclas de los mismos.

Son fases hidrófilas adecuadas: agua, alcoholes tales como propilenglicol, glicerol, sorbitol y mezclas de los mismos.

Son emulsionantes adecuados:

15 tensioactivos no iónicos, por ejemplo, aceite de ricino polietoxilado, monooleato de sorbitán polietoxilado, monoestearato de sorbitán, monoestearato de glicerol, estearato de polioxietilo, alquilfenolpoliglicoléter; tensioactivos anfólicos tales como *N*-lauril-p-iminodipropionato de disodio o lecitina; tensioactivos aniónicos tales como laurilsulfato de sodio, etersulfatos de alcohol graso, mono/dialquilpoliglicoléter, sal de monoetanolamina de éster del ácido ortofosfórico y tensioactivos catiónicos tales como cloruro de cetiltrimetilamonio.

20 Son auxiliares adicionales adecuados: sustancias que potencian la viscosidad y estabilizan la emulsión tales como carboximetilcelulosa, metilcelulosa y otros derivados de celulosa y almidón, poliacrilatos, alginatos, gelatina, goma arábiga, polivinilpirrolidona, polivinilalcohol, copolímeros de metilviniléter y anhídrido maleico, polietilenglicoles, ceras, ácido silícico coloidal o mezclas de las sustancias mencionadas.

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

25 Los agentes de suspensión líquidos son todos los disolventes y mezclas de disolventes homogéneos.

Son agentes humectantes adecuados (dispersantes) los emulsionantes dados anteriormente.

Son otros auxiliares que pueden mencionarse los dados anteriormente.

Las preparaciones semisólidas pueden administrarse por vía oral o tópica/dérmica. Difieren de las suspensiones y emulsiones descritas anteriormente solo en su mayor viscosidad.

30 Para la producción de preparaciones sólidas, el compuesto activo se mezcla con excipientes adecuados, si es apropiado con adición de auxiliares, y se lleva a la forma deseada. Los excipientes adecuados son todas sustancias inertes sólidas fisiológicamente tolerables. Aquellos usados son sustancias inorgánicas y orgánicas. Las sustancias inorgánicas son, por ejemplo, cloruro de sodio, carbonatos tales como carbonato de calcio, hidrogenocarbonatos, óxidos de aluminio, óxido de titanio, ácidos silícicos, tierras arcillosas, sílice precipitada o coloidal o fosfatos. Las sustancias orgánicas son, por ejemplo, azúcar, celulosa, comestibles y alimentos tales como leche en polvo, harina animal, harinas de grano y grano triturado y almidones.

Son auxiliares adecuados conservantes, antioxidantes, y/o colorantes que se han mencionado anteriormente.

40 Son otros auxiliares adecuados lubricantes y deslizantes tales como estearato de magnesio, ácido esteárico, talco, bentonitas, sustancias promotoras de la disgregación tales como almidón o polivinilpirrolidona reticulada, aglutinantes tales como almidón, gelatina o polivinilpirrolidona lineal y aglutinantes secos tales como celulosa microcristalina.

45 En general, "cantidad parasitocida eficaz" significa la cantidad de ingrediente activo necesaria para conseguir un efecto observable sobre el crecimiento, incluyendo los efectos de necrosis, muerte, retraso, prevención y eliminación, destrucción o disminución de otro modo de la aparición y actividad del organismo diana. La cantidad parasitocida eficaz puede variar para los diversos compuestos/composiciones usados en la invención. La cantidad parasitocida eficaz de las composiciones variará también según las condiciones reinantes tales como el efecto parasitocida deseado y la duración, la especie diana, el modo de aplicación y similares.

Las composiciones que pueden usarse en la invención pueden comprender generalmente de aproximadamente 0,001 a 95% del compuesto de fórmula I.

50 En general, es favorable aplicar los compuestos de fórmula I en cantidades totales de 0,5 mg/kg a 100 mg/kg, preferiblemente de 1 mg/kg a 50 mg/kg de peso corporal del animal tratado al día.

Las preparaciones listas para usar contienen los compuestos que actúan contra parásitos, preferiblemente ectoparásitos, a concentraciones de 10 ppm a 80% en peso, preferiblemente de 0,1 a 65% en peso, más preferiblemente de 1 a 50% en peso, lo más preferiblemente de 5 a 40% en peso.

- 5 Las preparaciones que se diluyen antes del uso contienen los compuestos que actúan contra ectoparásitos a concentraciones de 0,5 a 90% en peso, preferiblemente de 1 a 50% en peso.

Además, las preparaciones comprenden los compuestos de fórmula I contra endoparásitos a concentraciones de 10 ppm a 2% en peso, preferiblemente de 0,05 a 0,95 en peso, con muy particular preferencia de 0,005 a 0,25% en peso.

- 10 En una realización preferida de la presente invención, las composiciones que comprenden los compuestos de fórmula I se aplican por vía dérmica/tópica.

En una realización preferida adicional, la aplicación tópica se realiza en forma de artículos conformados que contienen compuesto tales como collares, medallones, crotales, bandas para fijar en partes corporales y tiras y láminas adhesivas.

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

- 20 Para la preparación de artículos conformados, se usan termoplásticos y plásticos flexibles así como elastómeros y elastómeros termoplásticos. Son plásticos y elastómeros adecuados resinas de polivinilo, poliuretano, poliácido, resinas epoxídicas, celulosa, derivados de celulosa, poliamidas y poliésteres que sean suficientemente compatibles con los compuestos de fórmula I. Se da una lista detallada de plásticos y elastómeros, así como de procedimientos de preparación para artículos conformados, por ejemplo en el documento WO 03/086075.

- 25 Las composiciones para usar según esta invención pueden contener también otros ingredientes activos, por ejemplo, otros plaguicidas, insecticidas, herbicidas, fungicidas, otros plaguicidas o bactericidas, fertilizantes tales como nitrato de amonio, urea, potasa y superfosfato, fitotóxicos y reguladores del crecimiento vegetal, protectores y nematicidas. Estos ingredientes adicionales pueden usarse secuencialmente o en combinación con las composiciones anteriormente descritas, si es apropiado se añaden también solo inmediatamente antes del uso (mezcla de tanque). Por ejemplo, la planta o plantas pueden pulverizarse con una composición de esta invención antes o después de tratarse con otros ingredientes activos.

- 30 Estos agentes pueden mezclarse con los agentes usados según la invención en una relación en peso de 1:10 a 10:1. Mezclar los compuestos de fórmula I o las composiciones que los comprenden en la forma de uso como plaguicidas con otros plaguicidas da frecuentemente como resultado un espectro de acción plaguicida más amplio.

La siguiente lista M de plaguicidas junto con los cuales pueden usarse los compuestos según la invención y con los cuales podrían producirse efectos sinérgicos potenciales pretende ilustrar las posibles combinaciones, pero no imponer ninguna limitación:

- 35 M.1. organo(tio)fosfatos: acefato, azametifos, azinfos-etilo, azinfos-metilo, cloretoxifos, clorfeninfos, clormefos, clorpirifos, clorpirifos-metilo, cumafos, cianofos, demeton-S-metilo, diazinón, diclorvos/ DDVP, dicrotofos, dimetoato, dimetilvininfos, disulfoton, EPN, etión, etoprofos, famfur, fenamifos, fenitrotión, fentión, flupirazofos, fostiazato, heptenofos, isoxatión, malatión, mecarbam, metamidofos, metidatión, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemetón-metilo, paratión, paratión-metilo, fentoato, forato, fosadona, fosmet, fosfamidona, foxim, pirimifos-metilo, profenofos, propetafos, protiofos, piraclofos, piridafentión, quinalfos, sulfotep, tebupirimfos, temefos, terbufos, tetraclorvinfos, tiometón, triazofos, triclorfon, vamidotión;

- 40 M.2. carbamatos: aldicarb, alanicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbarilo, carbofurano, carbosulfano, etiofencarb, fenobucarb, formetanata, furatiocarb, isoprocarb, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, trimetacarb, XMC, xililcarb, triazamato;

- 45 M.3. piretroides: acrinatrina, aletrina, d-cis-trans aletrina, d-trans aletrina, bifentrina, bioaletrina, bioaletrina S-ciclopentenilo, biorresmetrina, cicloprotrina, ciflutrina, betaciflutrina, cihalotrina, λ-cihalotrina, γ-cihalotrina, cipermetrina, α-cipermetrina, β-cipermetrina, θ-cipermetrina, ζ-cipermetrina, cifenotrina, deltametrina, empenetrina, esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flumetrina, τ-fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, metoflutrina, permetrina, fenotrina, praletrina, proflutrina, piretrina (piretro), resmetrina, silafluofeno, teflutrina, tetrametrina, talometrina, transflutrina;

- 50 M.4. miméticos de hormona juvenil: hidropreno, cinopreno, metopreno, fenoxicarb, piriproxifeno;

M.5. compuestos agonistas/antagonistas de receptor nicotínico: acetamiprid, bensultap, clorhidrato de cartap, clotianidina, dinotefurán, imidacloprid, tiametoxam, nitenpiram, nicotina, espinosad (agonista alostérico), espinetoram (agonista alostérico), tiacloprid, tiociclam, tiosultap-sodio y AKD1022;

- M.6. compuestos antagonistas de canal de cloruro activado por GABA: clordano, endosulfán, γ -HCH (lindano); etiprol, fipronil, pirafluprol, piriprol;
- M.7. activadores de canal de cloruro: abamectina, benzoato de emamectina, milbemectina, lepimectina;
- 5 M.8. compuestos METI I: fenazaquina, fenpiroximato, pirimidifeno, piridabeno, tebufenpirad, tolfenpirad, flufenerim, rotenona;
- M.9. compuestos METI II y III: acequinocilo, fluaciprim, hidrametilnona;
- M.10. desacopladores de la fosforilación oxidativa: clorfenapir, DNOC;
- M.11. inhibidores de la fosforilación oxidativa: azociclotina, cihexatina, diafentiurón, óxido de fenbutatina, propargita, tetradifón;
- 10 M.12. alteradores de la muda: ciromazina, cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida, tebufenozida;
- M.13. sinergistas: butóxido de piperonilo, tribufos;
- M.14. compuestos bloqueantes de canal de sodio: indoxacarb, metaflumizona;
- M.15. fumigadores: bromuro de metilo, fluoruro de cloropicrinsulfurilo;
- M.16. bloqueantes selectivos de alimentación: criolita, pimetrozina, flonicamid;
- 15 M.17. inhibidores del crecimiento de ácaros: clofentezina, hexitiazox, etoxazol;
- M.18. inhibidores de la síntesis de quitina: buprofezina, bistriflurón, clorfluazurón, diflubenzurón, flucicloxurón, flufenoxurón, hexaflumurón, lufenurón, novalurón, noviflumurón, teflubenzurón, triflumurón;
- M.19. inhibidores de la biosíntesis de lípidos: espiroclorfenol, espiromesifeno, espirotetramato;
- M.20. agonistas octopaminérgicos: amitraz;
- 20 M.21. moduladores de receptor de rianodina: flubendiamida; (*R*)-, (*S*)-3-cloro-N1-{2-metil-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil}-N2-(1-metil-2-metilsulfonietil)ftalamida (M21.1);
- M.22. varios: fosfuro de aluminio, amidoalumet, bencloflaz, benzoximato, bifenazato, bórax, bromopropilato, cianuro, cianopirafeno, ciflometofeno, quinometionato, dicofol, fluoroacetato, fosfina, piridililo, pirifluquinazona, azufre, compuestos organosulfúricos, tartrato de antimonio y potasio, sulfoxaflo, 4-but-2-inilo-6-(3,5-dimetilpiperidin-1-il)-2-fluoropirimidina (M22.1), 3-benzoilamino-*N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil)etil]fenil]-2-fluorobenzamida (M22.2), 4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidroisoxazol-3-il]-2-metil-*N*-piridin-2-ilmetilbenzamida (M22.3), 4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidroisoxazol-3-il]-2-metil-*N*-(2,2,2-trifluoroetil)benzamida (M22.4), 4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidroisoxazol-3-il]-2-metil-*N*-tiazol-2-ilmetilbenzamida (M22.5), 4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidroisoxazol-3-il]-2-metil-*N*-(tetrahydrofuran-2-ilmetil)benzamida (M22.6), 4-[[[(6-bromopirid-3-il)metil]-(2-fluoroetil)amino]furan-2(5*H*)-ona (M22.7), 4-[[[(6-fluoropirid-3-il)metil]-(2,2-difluoroetil)amino]furan-2(5*H*)-ona (M22.8), 4-[[[(2-cloro-1,3-tiazolo-5-il)metil]-(2-fluoroetil)amino]furan-2(5*H*)-ona (M22.9), 4-[[[(6-cloropirid-3-il)metil]-(2-fluoroetil)amino]furan-2(5*H*)-ona (M22.10), 4-[[[(6-cloropirid-3-il)metil]-(2,2-difluoroetil)amino]furan-2(5*H*)-ona (M22.11), 4-[[[(6-cloro-5-fluoropirid-3-il)metil]-(metil)amino]furan-2(5*H*)-ona (M22.12), 4-[[[(5,6-dicloropirid-3-il)metil]-(2-fluoroetil)amino]furan-2(5*H*)-ona (M22.13), 4-[[[(6-cloro-5-fluoropirid-3-il)metil]-(ciclopropil)amino]furan-2(5*H*)-ona (M22.14), 4-[[[(6-cloropirid-3-il)metil]-(ciclopropil)amino]furan-2(5*H*)-ona (M22.15), 4-[[[(6-cloropirid-3-il)metil]-(metil)amino]furan-2(5*H*)-ona (M22.16), éster 1,1'-[3*S*,4*R*,4*a**R*,6*S*,6*a**S*,12*R*,12*a**S*,12*b**S*]-4-[[[(2-ciclopropilacetil)oxi]metil]-1,3,4,4*a*,5,6,6*a*,12,12*a*,12*b*-decahidro-12-hidroxi-4,6*a*,12*b*-trimetil-11-oxo-9-(3-piridinil)-2*H*,11*H*-nafto[2,1-*b*]pirano[3,4-*e*]piran-3,6-dilico] del ácido ciclopropanoacético (M22.17), 8-(2-ciclopropilmetoxi-4-metilfenoxi)-3-(6-metilpiridazin-3-il)-3-azabicyclo[3.2.1]octano (M22.18),
- 40 M.23. 2-(2,6-dicloro- α,α,α -trifluoro-*p*-tolil)hidrazona de *N*-R'-2,2-dihalogeno-1-R''-ciclopropanocarboxamida o 2-(2,6-dicloro- α,α,α -trifluoro-*p*-tolil)hidrazona de *N*-R'-2,2-di(R''')propionamida, en las que R' es metilo o etilo, halógeno es cloro o bromo, R'' es hidrógeno o metilo y R''' es metilo o etilo;
- M.24. antranilamidas: clorantraniliprol, ciantraniliprol, [4-ciano-2-(1-ciclopropiletilcarbamoil)-6-metilfenil]amida del ácido 5-bromo-2-(3-cloropiridin-2-il)-2*H*-pirazol-3-carboxílico (M24.1), [2-cloro-4-ciano-6-(1-ciclopropiletilcarbamoil)fenil]amida del ácido 5-bromo-2-(3-cloropiridin-2-il)-2*H*-pirazol-3-carboxílico (M24.2), [2-bromo-4-ciano-6-(1-ciclopropiletilcarbamoil)fenil]amida del ácido 5-bromo-2-(3-cloropiridin-2-il)-2*H*-pirazol-3-carboxílico (M24.3), [2-bromo-4-cloro-6-(1-ciclopropiletilcarbamoil)fenil]amida del ácido 5-bromo-2-(3-cloropiridin-2-il)-2*H*-pirazol-3-carboxílico (M24.4), [2,4-dicloro-6-(1-ciclopropiletilcarbamoil)fenil]amida del ácido 5-bromo-2-(3-cloropiridin-2-il)-2*H*-pirazol-3-carboxílico (M24.5), [4-cloro-2-(1-ciclopropiletilcarbamoil)-6-metilfenil]amida del ácido 5-bromo-2-(3-cloropiridin-2-il)-2*H*-pirazol-3-carboxílico (M24.6),
- 50

M.25. compuestos de malononitrilo: $\text{CF}_2\text{HCF}_2\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$, (2-(2,2,3,3,4,4,5,5-octafluoropentil)-2-(3,3,3-trifluoropropil)malononitrilo), $\text{CF}_2\text{HCF}_2\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ (2-(2,2,3,3,4,4,5,5-octafluoropentil)-2-(3,3,4,4,4-pentafluorobutil)malonodinitrilo);

5 M.26. disruptores microbianos: *Bacillus thuringiensis* subsp. *Israelensi*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *Aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *Kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *Tenebrionis*.

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

10 Las tioamidas de fórmula M6.1 y su preparación se han descrito en el documento WO 98/28279. La lepimectina es conocida por "Agro Project", PJB Publications Ltd, noviembre de 2004. El benclotiaz y su preparación se han descrito en el documento EPA 1454621. El metidatión y el paraoxón y su preparación se han descrito en "Farm Chemicals Handbook", volumen 88, Meister Publishing Company, 2001. La metaflumizona y su preparación se han descrito en el documento EP-A1.462.456. El flupirazofos se ha descrito en Pesticide Science 54, 1988, pág. 237-243 y en el documento US 4822779. El pirafluprol y su preparación se han descrito en los documentos JP 2002193709 y WO 01/00614. El piriprol y su preparación se han descrito en los documentos WO 98/45274 y US 6335357. El 15 amidoflumet y su preparación se han descrito en los documentos US 6221890 y JP 21010907. La flufenerima y su preparación se han descrito en los documentos WO 03/007717 y WO 03/007718. El AKD-1022 y su preparación se han descrito en el documento US 6300348. El clorantraniliprol se ha descrito en los documentos WO 01/70671, WO 03/015519 y WO 05/118552. El ciantraniliprol se ha descrito en los documentos WO 01/70671, WO 04/067528 y WO 05/118552. Las antranilamidas M 24.1 a M 24.6 se han descrito en los documentos WO 2008/72743 y WO 20 200872783. La ftalamida M 21.1 es conocida por el documento WO 2007/101540. El ciflumetofeno y su preparación se han descrito en el documento WO 04/080180. El compuesto de aminoquinazolinona pirfluquinazona se ha descrito en el documento EP-A 1097932. La sulfoximina sulfoxaflor se ha descrito en los documentos WO 2006/060029 y WO 2007/149134. El compuesto de alquiniléter M22.1 se describe, por ejemplo, en el documento JP 2006131529. Los compuestos organosulfúricos se han descrito en el documento WO 2007060839. El compuesto de 25 carboxamida M 22.2 es conocido por el documento WO 2007/83394. Los compuestos de oxazolina M 22.3 a M 22.6 se han descrito en el documento WO 2007/074789. Los compuestos de furanona M 22.7 a M 22.16 se han descrito, por ejemplo, en el documento WO 2007/115644. El derivado de piripropeno M 22.17 se ha descrito en los documentos WO 2008/66153 y WO 2008/108491. El compuesto de piridazina M 22.18 se ha descrito en el documento JP 2008/115155. Los compuestos de malononitrilo se han descrito en los documentos WO 02/089579, 30 WO 02/090320, WO 02/090321, WO 04/006677, WO 05/068423, WO 05/068432 y WO 05/063694.

Los participantes de mezcla fungicidas son aquellos seleccionados del grupo consistente en acilalaninas tales como benalaxilo, metalaxilo, ofurace, oxadixilo, derivados de amina tales como aldimorf, dodina, dodemorf, fenpropimorf, fenpropidina, guazatina, iminocadina, epiroxamina, tridemorf, anilino pirimidinas tales como pirimetanilo, mepanipirim o cirodinilo;

35 antibióticos tales como cicloheximida, griseofulvina, kasugamicina, natamicina, polioxina o estreptomina;

azoles tales como bitertanol, bromoconazol, ciproconazol, difenoconazol, diniconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquiconazol, flusilazol, hexaconazol, imazalil, metconazol, miclobutanilo, penconazol, propiconazol, procloraz, prothioconazol, tebuconazol, triadimefón, triadimenol, triflumizol, triticonazol, flutriafol

dicarboximidas tales como iprodión, miclozolina, procimidón, vinclozolina;

40 ditiocarbamatos tales como ferbam, nabam, maneb, mancozeb, metam, metiram, propineb, polycarbamato, tiram, ziram, zineb;

45 compuestos heterocíclicos tales como anilazina, benomilo, boscalid, carbendazima, carboxina, oxicarboxina, ciazofamida, dazomet, ditianona, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fuberidazol, flutolanil, furametpir, isoprotilolano, mepronil, nuarimol, probenazol, proquinazid, pirifenox, piroquilón, quinoxifeno, siltiofam, tiabendazol, tifulzamida, tiofanato-metilo, tiadinilo, triciclazol, triforina;

fungicidas de cobre tales como mezcla Bordeaux, acetato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato básico de cobre;

derivados de nitrofenilo tales como binapacril, dinocap, dinobutón, nitroftalisopropilo;

fenilpirroles tales como fenpiclonilo o fludioxonilo,

azufre,

50 otros fungicidas tales como acibenzolar-S-metilo, bentiavalicarb, carpropamida, clorotalonilo, ciflufenamida, cimoxanilo, diclomezina, diclocimet, dietofencarb, edifenfos, etaboxam, fenhexamida, acetato de fentina, fenoxanilo, ferimzona, fluazinam, fosetilo, fosetilo-aluminio, iprovalicarb, hexaclorobenceno, metrafenona, pencicurón, propamocarb, ftalida, tolclorfos-metilo, quintozeno, zoxamida;

estrobilurinas tales como azoxistrobina, dimoxistrobina, fluoxastrobina, kresoxim-metilo, metominostrobin, orisastrobina, picoxistrobina o trifloxistrobina;

derivados de ácido sulfénico tales como captafol, captán, diclofluanida, folpet, tolilfluanida, cinamamidas y análogos tales como dimetomorf, flumetover o flumorf.

- 5 La plaga de invertebrado, concretamente artrópodos y nematodos, o la planta, suelo o agua en que la planta crece puede ponerse en contacto con el presente compuesto o compuestos de fórmula I o composición o composiciones que los contienen mediante cualquier procedimiento de aplicación conocido en la materia. Como tal, "poner en contacto" incluye tanto contacto directo (aplicar los compuestos/composiciones directamente sobre la plaga animal o planta, típicamente al follaje, tallo o raíces de la planta) como contacto indirecto (aplicar los compuestos/composiciones al lugar de la plaga animal o planta).

Además, las plagas de invertebrados pueden controlarse mediante la puesta en contacto de la plaga diana, su suministro de alimento, hábitat, terreno de cría o su lugar con una cantidad plaguicida eficaz de compuestos de fórmula I. Como tal, la aplicación puede llevarse a cabo antes o después de la infección del lugar, cultivo en crecimiento o cultivo recolectado por la plaga.

- 15 "Lugar" significa el hábitat, terreno de cría, plantas cultivadas, material de propagación vegetal (tal como semillas), suelo, zona, material o entorno en que una plaga o parásito crece o puede crecer.

En general, "cantidad plaguicida eficaz" significa la cantidad de ingrediente activo necesaria para conseguir un efecto observable sobre el crecimiento, incluyendo los efectos de necrosis, muerte, retraso, prevención y eliminación, destrucción o disminución de otro modo de la aparición y actividad del organismo diana. La cantidad plaguicida eficaz puede variar para los diversos compuestos/composiciones usados en la invención. La cantidad plaguicida eficaz de las composiciones variará también según las condiciones reinantes tales como el efecto plaguicida deseado y su duración, el tiempo, especie diana, lugar, modo de aplicación y similares.

- 25 Los compuestos de fórmula I y sus composiciones pueden usarse para proteger materiales de madera tales como árboles, vallas de madera, traviesas, etc. y edificios tales como casas, edificios anexos, fábricas, pero también materiales de construcción, mobiliario, cueros, fibras, artículos de vinilo, alambres y cables eléctricos, etc. de hormigas y/o termitas, y para controlar que hormigas y termitas no dañen cultivos o seres humanos (por ejemplo, cuando las plagas invaden casas e instalaciones públicas). Los compuestos se aplican no solo a la superficie del suelo circundante o al suelo bajo tierra para proteger materiales de madera, sino que pueden aplicarse también a artículos de serrería tales como superficies de hormigón bajo el suelo, postes de nicho, contrachapado, mobiliario, etc., artículos de madera tales como tableros de partículas, medios tableros, etc. y artículos de vinilo tales como alambres eléctricos recubiertos, láminas de vinilo, material termoaislante tal como espumas de estireno, etc. En caso de aplicación contra hormigas que dañan cultivos o seres humanos, el controlador de hormigas de la presente invención se aplica a los cultivos o al suelo circundante, o directamente se aplica al nido de hormigas o similar.

- 35 Los compuestos de fórmula I pueden aplicarse también preventivamente a sitios en que se espera la aparición de plagas.

- 40 Los compuestos de fórmula I pueden usarse también para proteger a plantas en crecimiento del ataque o infestación por plagas mediante la puesta en contacto de la planta con una cantidad plaguicida eficaz de compuestos de fórmula I. Como tal, "poner en contacto" incluye tanto el contacto directo (aplicar los compuestos/composiciones directamente sobre la plaga y/o planta, típicamente al follaje, tallo o raíces de la planta) como el contacto indirecto (aplicar los compuestos/composiciones al lugar de la plaga y/o planta).

En el caso de tratamiento de suelo o de aplicación al sitio de residencia o nido de las plagas, la cantidad de ingrediente activo está en el intervalo de 0,0001 a 500 g por 100 m², preferiblemente de 0,001 a 20 g por 100 m².

Los índices de aplicación habituales en la protección de materiales son, por ejemplo, de 0,01 g a 1000 g de compuesto activo por m² de material tratado, deseablemente de 0,1 g a 50 g por m².

- 45 Las composiciones insecticidas para uso en la impregnación de materiales contienen típicamente de 0,001 a 95% en peso, preferiblemente de 0,1 a 45% en peso, y más preferiblemente de 1 a 25% en peso, de al menos un repelente y/o insecticida.

Para uso en composiciones de cebo, el contenido típico de ingrediente activo es de 0,001% en peso a 15% en peso, deseablemente de 0,001% en peso a 5% en peso de compuesto activo.

- 50 Para uso en composiciones de pulverización, el contenido de ingrediente activo es de 0,001 a 80% en peso, preferiblemente de 0,01 a 50% en peso y lo más preferiblemente de 0,01 a 15% en peso.

Para uso en el tratamiento de plantas de cultivo, el índice de aplicación de los ingredientes activos de esta invención puede estar en el intervalo de 0,1 g a 4000 g por hectárea, deseablemente de 25 g a 600 g por hectárea, más deseablemente de 50 g a 500 g por hectárea.

En el tratamiento de semillas, los índices de aplicación de los ingredientes activos son generalmente de 0,1 a 10 kg por 100 kg de semillas, preferiblemente de 1 g a 5 kg por 100 kg de semillas, en particular de 1 g a 200 g por 100 kg de semillas.

La presente invención se ilustra ahora con más detalle con los siguientes ejemplos.

5 I. Ejemplos de preparación

Se caracterizaron los productos por espectroscopia de RMN-¹H o HPLC (cromatografía líquida de alta resolución-espectrometría de masas). Se llevó a cabo la HPLC usando una columna analítica RP-19 (Chromolith Speed ROD de Merck KGaA, Alemania), que funcionaba a 40°C. Servía como fase móvil acetonitrilo con 0,1% en volumen de una mezcla de ácido trifluoroacético/agua y 0,1% en volumen de ácido trifluoroacético; caudal: 1,8 ml/min y volumen de inyección: 2 ml.

Ejemplo 1 (compuesto I-1)

2-(2,2,2-Trifluoroetilsulfanil)-4-(4-oxoquinazolin-3-il)-5-fluorotolueno (compuesto de fórmula I en la que k es 0, n es 0, R¹ es F₃C-CH₂, R² es F, R³ es H, Y¹ es CH, Y² es C-CH₃ y X es O)

1.1 Cloruro de 3-acetamino-4-fluoro-6-metilfenilsulfonilo

Se añadió gota a gota cloruro de acetilo (156 g, 2 mol) a una solución de 2-fluoro-4-metilnilina (250 g, 2 mol) y trietilamina (202 g, 2 mol) en 2 l de diclorometano. Se agitó la mezcla de reacción durante 2 horas a una temperatura de 0°C y se lavó posteriormente con ácido clorhídrico diluido. Se secó la fase orgánica con sulfato de sodio y se concentró a presión reducida, proporcionando 2-fluoro-4-metilacetanilida en forma de un intermedio bruto (334 g, 87%).

Se añadió ácido clorosulfónico (2000 g, 17,24 mol) a 546 g (3,27 mol) de 2-fluoro-4-metilacetanilida bruta con agitación a una temperatura menor de 70°C. Se continuó la agitación durante 3 horas a una temperatura de 70°C. Se vertió la mezcla de reacción sobre hielo y se extrajo entonces con acetato de etilo. Se secó la fase orgánica con sulfato de sodio y se concentró a presión reducida, proporcionando el compuesto del título (500 g, 57,8%). RMN-¹H (400 MHz, CDCl₃): δ= 9,1 (d, 1H, J= 7,2 Hz), 7,39-7,52 (m, 1H), 7,14 (d, 1H, J= 11,2 Hz), 2,72-2,78 (m, 3H), 2,2-2,3 (m, 3H).

1.2 3-(2,2,2-Trifluoroetilsulfanil)-4-metil-6-fluoroanilina

Se disolvió cloruro de 3-acetamino-4-fluoro-6-metilfenilsulfonilo (500 g, 1,89 mol) en 2 l de ácido acético. Se añadieron a la solución fósforo rojo (100 g, 3,22 mmol) y yodo (10 g, 39 mmol) y se calentó la mezcla a reflujo durante 3 horas. Se retiró el ácido acético a presión reducida, se añadió agua y se extrajo el residuo con acetato de etilo. Se secó la fase orgánica con sulfato de sodio y se concentró a presión reducida, dando 5-acetamino-4-fluoro-2-metilbencenotiol en forma de un intermedio bruto (270 g, 72%).

Se añadió 5-acetamino-4-fluoro-2-metilbencenotiol bruto (280 g, 1,41 mol) a una solución al 5% (p/p) de hidróxido de potasio (250 g, 4,46 mol) en agua y se calentó la mezcla a reflujo durante 5 horas. Se ajustó la solución resultante a pH 7 con ácido clorhídrico diluido y se extrajo entonces con acetato de etilo. Se secó la fase orgánica con sulfato de sodio y se concentró a presión reducida, dando 5-amino-4-fluoro-2-metilbencenotiol en forma de un intermedio bruto (160 g, 88%). RMN-¹H (400 MHz, CDCl₃): δ= 7,18 (d, 1H, J= 1,6 Hz), 6,66-6,74 (m, 2H), 3,2-3,67 (m, 2H), 3,03-3,14 (m, 1H), 2,10-2,15 (m, 3H).

Se añadió gota a gota yoduro de 2,2,2-trifluoroetilo (147,1 g, 0,704 mol) a una solución de hidróxido de potasio (78,5 g, 1,4 mol), hidroximetilsulfonato de sodio (Rongalite®, 74,4 g, 0,63 mol) y 5-amino-4-fluoro-2-metilbencenotiol bruto (110 g, 0,7 mol) en 380 ml de DMF. Se agitó la mezcla de reacción durante 2 horas a temperatura ambiente, se vertió en agua y se extrajo entonces con acetato de etilo. Se secó la fase orgánica con sulfato de sodio y se concentró a presión reducida, proporcionando el compuesto del título (176 g, 99%). RMN-¹H (400 MHz, CDCl₃): δ= 6,84-6,89 (m, 1H), 6,7-6,78 (m, 1H), 3,4-3,7 (m, 3H), 3,14-3,25 (m, 2H), 2,22-2,26 (m, 3H).

1.3 N-(2-Nitrobenzoi)-3-(2,2,2-trifluoroetilsulfanil)-4-metil-6-fluoroanilida

Se disolvió 3-(2,2,2-trifluoroetilsulfanil)-4-metil-6-fluoroanilina (4,0 g, 16,7 mmol) en 100 ml de DMF. Se añadieron a la solución ácido 2-nitrobenzoico (2,79 g, 16,7 mmol) y trietilamina (2,02 g, 20 mmol). Después de enfriar a una temperatura de 0°C, se añadió HATU (7,62 g, 20 mmol) en una porción y se agitó la mezcla resultante durante una noche a temperatura ambiente. Se añadió agua a la mezcla de reacción, que se extrajo entonces con acetato de etilo. Se secó la fase orgánica con sulfato de sodio y se purificó el producto bruto mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice, dando el compuesto del título (5 g, 76,9%) en forma de un sólido amarillo. RMN-¹H (400 MHz, CDCl₃): δ= 8,6 (d, 1H, J= 7,6 Hz), 8,2 (d, 1H, J= 8 Hz), 7,73-7,76 (m, 1H), 7,61-7,67 (m, 3H), 7,0 (s, 1H), 3,39-3,46 (m, 2H), 2,45 (s, 3H).

1.4 2-(2,2,2-Trifluoroetilsulfanil)-4-(4-oxoquinazolin-3-il)-5-fluorotolueno

Se añadió níquel de Raney (0,8 g) a una suspensión de *N*-(2-nitrobenzoil)-3-(2,2,2-trifluoroetilsulfanil)-4-metil-6-fluoroanilida (2,3 g, 5,9 mmol) en 230 ml de etanol y se hidrogenó la mezcla agitada a presión ambiental durante una noche a temperatura ambiente. Se separó el sólido por filtración y se evaporó el filtrado, dando el intermedio *N*-(2-aminobenzoil)-3-(2,2,2-trifluoroetilsulfanil)-4-metil-6-fluoroanilida (2 g, 95%) en forma de un sólido blanco. RMN-¹H (400 MHz, DMSO-*d*₆): δ= 9,79 (s, 1H), 7,75-7,71 (m, 2H), 7,16-7,24 (m, 2H), 6,72 (d, 1H, J= 8,4 Hz), 6,55 (t, 1H, J= 7,4 Hz), 6,44 (s, 2H), 3,79-3,87 (m, 2H), 2,38 (s, 3H).

Se calentó a 140°C una mezcla de la amina *N*-(2-aminobenzoil)-3-(2,2,2-trifluoroetilsulfanil)-4-metil-6-fluoroanilida (2,3 g, 6,4 mmol), ácido sulfúrico concentrado (2 ml) y 1,1,1-trietoximetano (100 ml) y se agitó durante 5 horas a esta temperatura. Se enfrió la mezcla a temperatura ambiente, se retiró el exceso de disolvente a presión reducida y se purificó el producto bruto mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice, proporcionando el compuesto del título (1,4 g, 59%) en forma de un sólido blanquecino. RMN-¹H (400 MHz, CDCl₃): δ= 8,28-8,31 (m, 1H), 7,94 (s, 1H), 7,71-7,78 (m, 2H), 7,48-7,53 (m, 2H), 7,13-7,16 (m, 1H), 3,27-3,34 (m, 2H), 2,50 (s, 3H). Punto de fusión: 145-147°C.

Ejemplo 2 (Compuesto I-2)

2-(2,2,2-Trifluoroetilsulfanil)-4-(4-oxoquinazolin-3-il)-5-fluorotolueno (compuesto de fórmula I en la que k es 0, n es 1, R¹ es F₃C-CH₂, R² es F, R³ es H, Y¹ es CH, Y² es C-CH₃ y X es O)

Se disolvió 2-(2,2,2-trifluoroetilsulfanil)-4-(4-oxoquinazolin-3-il)-5-fluorotolueno (0,80 g, 1,96 mmol) en 20 ml de cloroformo y se añadió ácido meta-cloroperoxibenzoico (0,466 g, 2,29 mmol, 85% de purea) con enfriamiento con hielo. Se agitó la mezcla de reacción durante 1 hora a temperatura de baño de hielo. Se lavó la solución sucesivamente con una solución acuosa de tiosulfato de sodio y una solución acuosa de hidrogenocarbonato de sodio, y se secó con sulfato de sodio. Después de retirar el disolvente en exceso a presión reducida, se purificó el producto bruto mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice, dando el compuesto del título (0,32 g, 42,9%) en forma de un sólido blanquecino. RMN-¹H (400 MHz, CDCl₃): δ= 8,34-8,36 (m, 1H), 8,08 (d, 1H, J= 7,2 Hz), 8,02 (s, 1H), 7,48-7,53 (m, 2H), 7,79-7,87 (m, 2H), 7,56-7,6 (m, 1H), 7,24-7,26 (m, 1H), 3,47-3,55 (m, 2H), 2,49 (s, 3H). Punto de fusión: 184-186°C.

Ejemplo 3 (Compuesto I-3)

2-(2,2,2-Trifluoroetilsulfanil)-4-(2-metil-4-oxoquinazolin-3-il)-5-fluorotolueno (compuesto de fórmula I en la que k es 0, n es 0, R¹ es F₃C-CH₂, R² es F, R³ es CH₃, Y¹ es CH, Y² es C-CH₃ y X es O)

Se calentó a 140°C una mezcla de la amina *N*-(2-aminobenzoil)-3-(2,2,2-trifluoroetilsulfanil)-4-metil-6-fluoroanilida (1,45 g, 4 mmol, preparada según la síntesis descrita en el ejemplo 1), ácido sulfúrico concentrado (2 ml) y 1,1,1-trietoxietano (100 ml) y se agitó durante 5 horas a esta temperatura. Se enfrió la mezcla a temperatura ambiente, se retiró el disolvente en exceso a presión reducida y se purificó el producto bruto mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice, proporcionando el compuesto del título (1,3 g, 85%) en forma de un sólido blanquecino. RMN-¹H (400 MHz, CDCl₃): δ= 8,23~8,26 (m, 1H), 7,74~7,78 (m, 2H), 7,67 (d, 1H, J= 8 Hz), 7,44~7,49 (m, 2H), 7,19 (d, 1H, J= 10 Hz), 3,29~3,39 (m, 2H), 2,55 (s, 3H), 2,26 (s, 3H). Punto de fusión: 95-96°C.

Ejemplo 4 (Compuesto I-4)

2-(2,2,2-Trifluoroetilsulfanil)-4-(2-metil-4-oxoquinazolin-3-il)-5-fluorotolueno (compuesto de fórmula I en la que k es 0, n es 1, R¹ es F₃C-CH₂, R² es F, R³ es CH₃, Y¹ es CH, Y² es C-CH₃ y X es O)

Se disolvió 2-(2,2,2-trifluoroetilsulfanil)-4-(2-metil-4-oxoquinazolin-3-il)-5-fluorotolueno (0,50 g, 1,31 mmol) en 20 ml de cloroformo y se añadió ácido meta-cloroperoxibenzoico (0,265 g, 1,53 mmol, 85% de pureza) con enfriamiento con hielo. Se agitó la mezcla de reacción durante 1 hora a temperatura de baño de hielo. Se lavó la solución sucesivamente con una solución acuosa de tiosulfato de sodio y una solución acuosa de hidrogenocarbonato de sodio, y se secó con sulfato de sodio. Después de retirar el disolvente en exceso a presión reducida, se purificó el producto bruto mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice, dando el compuesto del título (0,3 g, 57,5%) en forma de un sólido amarillento. RMN-¹H (400 MHz, CDCl₃): δ= 8,23~8,26 (m, 1H), 7,93~7,97 (m, 1H), 7,78~7,82 (m, 2H), 7,71 (d, 1H, J= 8,4 Hz), 7,49~7,53 (m, 1H), 7,24~7,26 (m, 1H), 3,47~3,55 (m, 2H), 2,55 (s, 3H), 2,29~2,31 (m, 3H). Punto de fusión: 188-190°C.

Ejemplo 6 (Compuesto I-6)

3-[2-(2,2,2-Trifluoroetilsulfanil)pirimidin-4-il]-3*H*-quinazolin-4-ona

6.1 2-(2,2,2-Trifluoroetilsulfanil)-3*H*-pirimidin-4-ona

Se añadió NaH (13,1 g, 0,327 mol) a una solución de 2-tioxo-2,3-dihidro-1*H*-pirimidin-4-ona (14 g, 0,109 mol) en dimetilformamida (300 ml). Cuando se terminó la adición, se agitó la solución a 40°C durante 1,5 horas y se añadió yoduro de 2,2,2-trifluoroetilo (27,4 g, 0,131 mol) a la solución. Se agitó la reacción a 40°C durante 3 horas. Se retiró el disolvente y se vertió el residuo en agua, se ajustó la mezcla a pH 3~4 con HCl diluido y se extrajo con acetato de etilo, se secó la fase orgánica sobre Na₂SO₄ y se concentró a presión reducida, dando 2-(2,2,2-trifluoroetilsulfanil)-

3*H*-pirimidin-4-ona (26 g, bruto) en forma de sólido. RMN-¹H: (400 MHz, CDCl₃): δ 7,93 (d, 1H, J= 6,8 Hz), 6,32 (d, 1H, J= 6,8 Hz), 4,07-4,0 (m, 2H).

6.2 4-Cloro-2-(2,2,2-trifluoroetilsulfanil)pirimidina

- 5 Se agitó y calentó a reflujo durante 5 horas la solución de 2-(2,2,2-trifluoroetilsulfanil)-3*H*-pirimidin-4-ona (25 g, bruto) en POCl₃ (250 ml). Después de retirar la mayoría de POCl₃, se goteó el residuo sobre hielo y se ajustó el pH a 8-9, se extrajo con acetato de etilo, se secó sobre MgSO₄ y se purificó el material bruto mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice, dando 4-cloro-2-(2,2,2-trifluoroetilsulfanil)pirimidina (14,6 g, 58,8%) en forma de un aceite. RMN-¹H: (400 MHz, CDCl₃): δ 8,45-8,43 (m, 1H), 7,12-7,10 (m, 1H), 4,02-3,95 (m, 2H).

6.3 2-(2,2,2-Trifluoroetilsulfanil)pirimidin-4-ilamina

- 10 Se añadió NH₄OH (400 ml) a una solución de 4-cloro-2-(2,2,2-trifluoroetilsulfanil)pirimidina (22 g, 0,096 mol) en 350 ml de CH₃CN. Se agitó la mezcla durante 24 horas a 90°C en un tubo sellado. Se enfrió entonces la mezcla a temperatura ambiente y se concentró el disolvente a vacío, se extrajo el residuo con acetato de etilo, se secó sobre MgSO₄ y se purificó el producto bruto mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice, dando 2-(2,2,2-trifluoroetilsulfanil)pirimidin-4-ilamina (14,3 g, 71,3%) en forma de un sólido blanco. RMN-¹H: (400 MHz, CDCl₃): δ 8,08 (d, 1H, J= 6 Hz), 6,20-6,18 (m, 1H), 4,94 (s, 2H), 3,99-3,91 (m, 2H).

6.4 2-Nitro-*N*-[2-(2,2,2-trifluoroetilsulfanil)pirimidin-4-il]benzamida

- 20 Se añadió lentamente una solución de cloruro de 2-nitrobenzoilo (1,85 g, 10 mmol) en CH₂Cl₂ (10 ml) a una solución de 2-(2,2,2-trifluoroetilsulfanil)pirimidin-4-ilamina (2,1 g, 10 mmol) y trietilamina (2 g, 20 mmol) en CH₂Cl₂ (80 ml) a entre 0 y como máximo 7°C. Se agitó la mezcla durante una noche a temperatura ambiente y se vertió entonces en agua con hielo. Se separaron las fases y se secó la parte orgánica con Na₂SO₄, se filtró y se concentró a vacío, proporcionando un aceite viscoso. Se purificó el producto bruto mediante HPLC prep. (1,5 g, 41,8%). RMN-¹H (400 MHz, CDCl₃): δ 3,058-3,087 (m, 2H), 7,558-7,581 (m, 1H), 7,635-7,659 (m, 1H), 7,702-7,723 (m, 1H), 7,939-7,954 (m, 1H), 8,110-8,133 (m, 1H), 8,466-8,480 (m, 1H).

6.5 2-Amino-*N*-[2-(2,2,2-trifluoroetilsulfanil)pirimidin-4-il]benzamida

- 25 Se añadió HCl (0,69 ml) a una solución del compuesto 2 (1,5 g, 4,2 mmol) en ácido acético (14,4 ml) y tetrahidrofurano (21 ml), y después Zn (2,745 g) a 0°C. Se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante 2 horas. Se añadió una solución de NaHCO₃ para ajustar el pH a 8. Se extrajo la mezcla con acetato de etilo. Se secó la fase orgánica, se concentró dando el producto bruto (1,5 g).

6.6 3-[2-(2,2,2-Trifluoroetilsulfanil)pirimidin-4-il]-3*H*-quinazolin-4-ona

- 30 Se calentaron compuesto 2 (1,5 g, 4,2 mmol), 2 ml de ácido sulfúrico concentrado y 1,1,1-trietoximetano (100 ml) a 140°C y se agitó durante 5 horas. Se enfrió la mezcla a temperatura ambiente, se destiló el exceso de disolvente y se purificó el producto bruto mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice, dando 3-[2-(2,2,2-trifluoroetilsulfanil)pirimidin-4-il]-3*H*-quinazolin-4-ona (500 mg, 35%) en forma de un sólido blanquecino. RMN-¹H (400 MHz, CDCl₃): δ 3,956-4,031 (m, 2H), 7,568-7,606 (m, 1H), 7,777-7,797 (m, 1H), 7,828-7,869 (m, 1H), 7,931-7,948 (m, 1H), 8,707-8,723 (m, 1H), 8,823 (s, 1H).

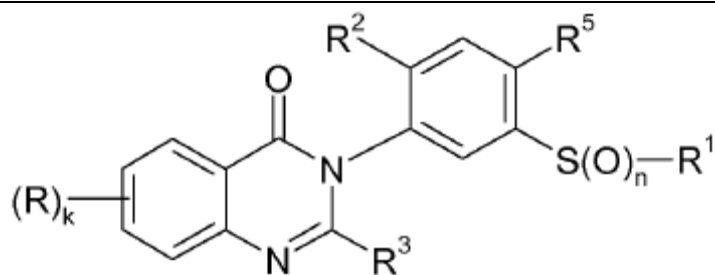
Ejemplo 11 (Compuesto I-11)

3-[2-(2,2,2-Trifluoroetilsulfanil)pirimidin-4-il]-3*H*-quinazolin-4-ona

- 40 Se disolvió 3-[2-(2,2,2-trifluoroetilsulfanil)pirimidin-4-il]-3*H*-quinazolin-4-ona (1,1 g, 3,25 mmol) en 20 ml de cloroformo y se añadió ácido *m*-cloroperoxibenzoico (*m*-CPBA) (0,7 g, 3,57 mmol, 85% de pureza) a temperatura ambiente. Se agitó la mezcla de reacción durante 3 horas a temperatura ambiente. Se lavó con solución de tiosulfato de sodio e hidrogenocarbonato de sodio, se secó con Na₂SO₄ y se purificó el producto bruto mediante TLC prep y después HPLC prep, dando 3-[2-(2,2,2-trifluoroetilsulfanil)pirimidin-4-il]-3*H*-quinazolin-4-ona (0,35 g, 30,5%) en forma de un sólido blanquecino. RMN-¹H (400 MHz, CDCl₃): δ 3,77-3,84 (m, 1H), 4,06-4,12 (m, 1H), 7,58-7,62 (m, 1H), 7,79-7,89 (m, 2H), 8,37-8,39 (m, 1H), 8,43-8,49 (m, 1H), 8,98 (s, 1H), 9,04-9,06 (m, 1H).

- 45 Se usó el procedimiento descrito en los ejemplos de síntesis 1 a 4 anteriores para preparar los compuestos adicionales I-A, a saber los compuestos I-5, I-7 a I-10 e I-12 a I-35, siendo X oxígeno, mediante una modificación apropiada de los compuestos de partida. Los compuestos así obtenidos se enumeran en la tabla C siguiente, y sus datos físicos se enumeran en la tabla D siguiente.

Tabla C:



(I-A)

Compuesto	(R) _k	R ³	R ²	R ⁵	R ¹	n
I-5	k= 0	H	F	CH ₃	CF ₃ -CH ₂ -	2
I-7	k= 0	H	F	CH ₃	n-propilo	0
I-8	k= 0	H	F	CH ₃	n-propilo	1
I-9	8-CH ₃	H	F	CH ₃	CF ₃ -CH ₂ -	0
I-10	8-CH ₃	H	F	CH ₃	CF ₃ -CH ₂ -	1
I-12	8-Cl	H	F	CH ₃	CF ₃ -CH ₂ -	0
I-13	8-Cl	H	F	CH ₃	CF ₃ -CH ₂ -	1
I-14	k= 0	H	F	CH ₃	3,4,4-trifluoro-3-buten-1-ilo	0
I-15	k= 0	H	F	CH ₃	3,4,4-trifluoro-3-buten-1-ilo	1
I-16	k= 0	H	H	CH ₃	CF ₃ -CH ₂ -	0
I-17	k= 0	H	H	CH ₃	CF ₃ -CH ₂ -	1
I-18	k= 0	H	F	CH ₃	ciclopropilmetilo	0
I-19	k= 0	H	F	CH ₃	ciclopropilmetilo	1
I-20	6-Cl	H	F	CH ₃	CF ₃ -CH ₂ -	0
I-21	6-Cl	H	F	CH ₃	CF ₃ -CH ₂ -	1
I-22	7-CH ₃	H	F	CH ₃	CF ₃ -CH ₂ -	0
I-23	7-CH ₃	H	F	CH ₃	CF ₃ -CH ₂ -	1
I-24	7-Cl	H	F	CH ₃	CF ₃ -CH ₂ -	0
I-25	7-Cl	H	F	CH ₃	CF ₃ -CH ₂ -	1
I-26	6-OCH ₃	H	F	CH ₃	CF ₃ -CH ₂ -	0
I-27	6-OCH ₃	H	F	CH ₃	CF ₃ -CH ₂ -	1
I-28	5-CH ₃	H	F	CH ₃	CF ₃ -CH ₂ -	0
I-29	5-CH ₃	H	F	CH ₃	CF ₃ -CH ₂ -	1
I-30	6-CH ₃	H	F	CH ₃	CF ₃ -CH ₂ -	0
I-31	6-CH ₃	H	F	CH ₃	CF ₃ -CH ₂ -	1
I-32	5-Cl	H	F	CH ₃	CF ₃ -CH ₂ -	0
I-33	5-Cl	H	F	CH ₃	CF ₃ -CH ₂ -	1

I-34	k= 0	H	CH ₃	CH ₃	CF ₃ CH ₂ -	0
I-35	k= 0	H	CH ₃	CH ₃	CF ₃ CH ₂ -	1

Tabla D:

Compuesto	Datos fisicoquímicos: RMN- ¹ H (400 MHz) δ o t.a. [min]/M ⁺
I-5	3,13 min/ 400,05
I-7	CDCl ₃ : 8,39~8,36 (m, 1H), 8,01 (s, 1H), 7,84~7,77 (m, 2H), 7,58~7,54 (m, 1H), 7,28~7,25 (m, 1H), 7,17 (d, 1H, J= 10,4 Hz), 2,88~2,84 (m, 2H), 2,45 (s, 3H), 1,74~1,65 (m, 2H), 1,06~1,04 (m, 3H)
I-8	CDCl ₃ : 8,37~8,35 (m, 1H), 8,01 (s, 1H), 8,01 (s, 1H), 7,98 (d, 1H, J= 7,0 Hz), 7,85~7,78 (m, 2H), 7,59~7,55 (m, 1H), 7,18 (d, 1H, J= 10 Hz), 2,86~2,72 (m, 2H), 2,46 (s, 3H), 1,94~1,73 (m, 2H), 1,25 (s, 3H)
I-9	CD ₃ OD: 8,19 (s, 1H), 8,13~8,11 (m, 1H), 7,78 (d, 1H, J= 7,2 Hz), 7,33 (d, 1H, J= 10,8 Hz), 3,73~3,66 (m, 2H), 2,64 (s, 3H), 2,56 (s, 3H)
I-10	CDCl ₃ : 8,13 (d, 1H, J= 8 Hz), 8,01 (d, 1H, J= 7,2 Hz), 7,94 (s, 1H), 7,62 (d, 1H, J= 7,2 Hz), 7,41~7,31 (m, 1H), 7,19~7,17 (m, 1H), 3,48~3,40 (m, 2H), 2,6 (s, 3H), 2,42 (s, 3H)
I-12	CD ₃ OD: 8,29 (s, 1H), 8,24~8,21 (m, 1H), 7,99~7,97 (m, 1H), 7,80 (d, 1H, J= 7,2 Hz), 7,58~7,54 (m, 1H), 7,35~7,32 (m, 1H), 3,73~3,66 (m, 2H), 2,56 (s, 3H)
I-13	CD ₃ OD: 8,36 (s, 1H), 8,25~8,23 (m, 1H), 8,12 (d, 1H, J= 7,2 Hz), 8,01~7,99 (m, 1H), 7,60~7,55 (m, 1H), 7,46~7,45 (m, 1H), 4,09~3,84 (m, 2H), 2,53 (s, 3H)
I-14	CDCl ₃ : 8,31~8,29 (m, 1H), 7,93 (s, 1H), 7,78~7,70 (m, 2H), 7,52~7,48 (m, 1H), 7,30~7,28 (d, 1H, J= 7,2 Hz), 7,12~7,1 (d, 1H, J= 10 Hz), 3,01~2,98 (m, 2H), 2,61~2,50 (m, 2H), 2,41 (s, 3H)
I-15	CDCl ₃ : 8,36 (t, 1H, J= 0,8 Hz), 8,02 (d, 1H, J= 0,8 Hz), 8,00 (d, 1H, J= 7,2 Hz), 7,61~7,56 (m, 1H), 7,23 (d, 1H, J= 9,6 Hz), 3,15~3,11 (m, 1H), 3,09~2,87 (m, 2H), 2,87~2,68 (m, 1H), 2,47 (s, 3H)
I-16	DMSO-d ₆ : 8,32 (s, 1H), 8,21 (d, 1H, J= 8 Hz), 7,90~7,88 (m, 1H), 7,46~7,23 (m, 2H), 7,63~7,61 (m, 1H), 7,45~7,43 (m, 1H), 7,37 (dd, 1H, J= 1 Hz, 8 Hz), 4,08~4,06 (m, 2H), 2,42 (s, 3H)
I-17	DMSO-d ₆ : 8,41 (s, 1H), 8,22 (d, J= 8 Hz), 7,91 (dd, 1H, J= 1,6 Hz, 7,6 Hz), 7,89 (d, 1H, J= 7,6 Hz), 7,78~7,70 (m, 2H), 7,64~7,55 (m, 2H), 7,26~7,04 (m, 2H), 2,32 (s, 3H)
I-18	CDCl ₃ : 8,14 (d, 1H, J= 9,2 Hz), 7,79 (s, 1H), 7,59~7,54 (m, 2H), 7,35~7,13 (m, 1H), 7,08 (d, 1H, J= 7,2 Hz), 6,91 (d, 1H, J= 12,4 Hz), 2,58 (d, 1H, J= 6,8 Hz), 2,24 (s, 3H), 0,82~0,80 (m, 1H), 0,39~0,34 (m, 2H), 0,04~0,03 (m, 2H)
I-19	CDCl ₃ : 8,36~8,34 (m, 1H), 8,02~8,00 (m, 2H), 7,83~7,78 (m, 2H), 7,58 (t, 1H, J= 5,6 Hz), 7,17 (d, 1H, J= 10,4 Hz), 2,81~2,75 (m, 2H), 2,46 (s, 3H), 1,10~1,086 (m, 1H), 0,71~0,66 (m, 2H), 0,31~0,28 (m, 2H)
I-20	CDCl ₃ : 8,25 (d, 1H, J= 2,4 Hz), 7,910 (s, 1H), 7,707~7,647 (m, 2H), 7,51 (d, 1H, J= 7,2 Hz), 7,16 (t, 1H, J= 11,2 Hz), 3,341~3,269 (m, 2H), 2,500 (s, 3H)
I-21	CDCl ₃ : 8,24 (d, 1H, J= 2,8 Hz), 8,010~7,923 (m, 1H), 7,921 (s, 1H), 7,724~7,663 (m, 2H), 7,206~7,181 (m, 1H), 3,478~3,404 (m, 2H), 2,425 (s, 3H)
I-22	CD ₃ OD: 8,25 (d, 1H, J= 8 Hz), 7,97 (d, 1H, J= 0,8 Hz), 7,61~7,58 (m, 2H), 7,41~7,39 (m, 1H), 7,23~7,21 (m, 1H), 3,43~3,36 (m, 2H), 2,58 (s, 3H), 2,56 (s, 3H)
I-23	CDCl ₃ : 8,24 (d, 1H, J= 8 Hz), 8,09 (d, 1H, J= 7,2 Hz), 7,99 (s, 1H), 7,59 (s, 1H), 7,42~7,39 (m, 1H), 7,26 (d, 1H, J= 10,4 Hz), 3,57~3,48 (m, 2H), 2,56 (s, 3H), 2,50 (s, 3H)
I-24	CDCl ₃ : 8,22 (d, 1H, J= 7,6 Hz), 7,93 (s, 1H), 7,71 (d, 1H, J= 2 Hz), 7,51 (d, 1H, J= 7,2 Hz), 7,46~7,44 (m, 1H), 7,15 (d, 1H, J= 10 Hz), 3,34~3,27 (m, 2H), 2,5 (s, 3H)
I-25	CDCl ₃ : 8,33 (s, 1H), 8,27 (d, 1H, J= 8,8 Hz), 8,10 (d, 1H, J= 7,6 Hz), 7,80 (d, 1H, J= 2 Hz), 7,64~7,62 (m, 1H), 7,45 (d, 1H, J= 10,4 Hz), 4,02~3,89 (m, 2H), 2,53 (s, 3H)

I-26	CDCl ₃ : 7,92 (d, 1H, J= 1,2 Hz), 7,92~7,72 (m, 2H), 7,60 (d, 1H, J= 7,2 Hz), 7,44~7,41 (m, 1H), 7,28 (s, 1H), 7,23 (d, 1H, J= 10,4 Hz), 3,95 (s, 3H), 3,43~3,36 (m, 2H), 2,58 (s, 3H)
I-27	CDCl ₃ : 8,10 (d, 1H, J= 7,2 Hz), 7,93 (s, 1H), 7,75~7,07 (m, 2H), 7,45~7,42 (m, 1H), 7,27 (d, 1H, J= 8,8 Hz), 3,95 (s, 3H), 3,57~3,50 (m, 2H), 2,51 (s, 3H)
I-28	CDCl ₃ : 7,95 (s, 1H), 7,67~7,61 (m, 2H), 7,57 (d, 1H, J= 7,2 Hz), 7,32 (d, 1H, J= 7,2 Hz), 7,20 (d, 1H, J= 10,4 Hz), 3,41~3,34 (m, 2H), 2,87 (s, 3H), 2,56 (s, 3H)
I-29	CDCl ₃ : 8,07~8,05 (m, 1H), 7,95 (d, 1H, J= 0,8 Hz), 7,69~7,61 (m, 2H), 7,34~7,32 (m, 1H), 7,25~7,23 (m, 1H), 3,56~3,45 (m, 2H), 2,87 (s, 3H), 2,48 (s, 3H)
I-30	CDCl ₃ : 8,14 (s, 1H), 7,94 (s, 1H), 7,69~7,62 (m, 2H), 7,58 (d, 1H, J= 7,6 Hz), 7,21 (d, 1H, J= 10 Hz), 3,41~3,34 (m, 2H), 2,56 (s, 3H), 2,52 (s, 3H)
I-31	CDCl ₃ : 8,25 (s, 1H), 8,14 (d, 2H, J= 7,2 Hz), 7,74~7,76 (m, 1H), 7,70~7,68 (m, 1H), 7,46~7,43 (m, 1H), 4,06~3,88 (m, 2H), 2,53 (s, 6H)
I-32	CDCl ₃ : 7,99 (d, 1H, J= 0,8 Hz), 7,67~7,66 (m, 2H), 7,61~7,56 (m, 2H), 7,22 (d, 1H, J= 10 Hz), 3,43~3,35 (m, 2H), 2,58 (s, 3H)
I-33	CDCl ₃ : 8,07 (d, 1H, J= 7,2 Hz), 7,98 (d, 1H, J= 0,8 Hz), 7,70~7,69 (m, 2H), 7,59~7,56 (m, 1H), 7,25~7,23 (m, 1H), 2,49 (s, 3H)
I-34	362 min/ 365,05
I-35	3,62 min/ 365,05
t.r. = tiempo de retención (HPLC); el ácido acético sirvió como fase móvil; caudal: 1,8 ml/min y volumen de inyección: 2 ml	
M ⁺ = masa molecular de la especie catiónica detectada	

II. Evaluación de la actividad plaguicida:

II.1. Polilla de las crucíferas (*Plutella xylostella*)

II.1.a)

- 5 Se disolvió el compuesto activo a la concentración deseada en una mezcla de acetona:agua 1:1 (vol:vol). Se preparó la solución de ensayo el día de uso.

Se pulverizaron entonces 10 larvas de tercera etapa con 1 ml de solución de ensayo y se introdujeron en hojas no tratadas mantenidas en una placa Petri recubierta con papel de filtro húmedo. Se registró la mortalidad a las 24, 72 y 120 horas después del tratamiento.

- 10 En este ensayo, el compuesto del ejemplo 3 (compuesto I-3) mostró un 100% de mortalidad a 500 ppm en comparación con los controles no tratados.

II.1.b)

- 15 Se formularon los compuestos activos en acetona:agua 50:50 y 0,1% (vol/vol) de tensioactivo Alkamuls EL 620. Se sumergió un disco de hoja de repollo de 6 cm en la solución de ensayo durante 3 segundos y se dejó secar al aire en una placa Petri recubierta con papel de filtro húmedo. Se inoculó el disco de hoja con 10 larvas en tercera etapa y se mantuvieron a 25-27°C y 50-60% de humedad durante 3 días. Se valoró la mortalidad después de 72 h de tratamiento.

En este ensayo, los compuestos I-3 e I-5 a 300 ppm mostraron una mortalidad de al menos un 50% en comparación con los controles no tratados.

- 20 II.2. Mosca blanca de las hojas plateadas (*Bemisia argentifolii*, adulto)

- 25 Se formularon los compuestos activos en ciclohexanona en forma de una solución a 10.000 ppm suministrada en tubos de 1,3 ml ABgene®. Se insertaron estos tubos en un pulverizador electrostático automatizado equipado con tobera atomizadora y sirvieron como soluciones madre para las que se realizaron diluciones menores con 50% de acetona:50% de agua (v/v). Se incluyó en la solución un tensioactivo no iónico (Kinetic®) a un volumen de 0,01% (v/v). Se pulverizaron plantas de algodón en la etapa de cotiledón (una planta por tiesto) mediante un pulverizador de plantas electrostático automatizado equipado con una tobera de pulverización atomizadora. Se secaron las

plantas en la campana de humos del pulverizador y se retiraron entonces del pulverizador. Se dispuso cada tiesto en una cubeta de plástico y se introdujeron de 10 a 12 adultos de mosca blanca (de aproximadamente 3-5 días de edad). Se recogieron los insectos usando una aspiradora y una tubería de 0,6 cm Tygon® (R-3603) no tóxica conectada con una punta de pipeta de barrera. Se insertó entonces suavemente la punta, que contenía los insectos recogidos, en el suelo que contenía la planta tratada, dejando arrastrarse los insectos fuera de la punta para alcanzar el follaje para alimentarse. Se recubrieron las cubetas con una tapa mallada reutilizable (tamiz de poliéster de malla 150 µm PeCap de Tetko, Inc.). Se mantuvieron las plantas de ensayo en una sala de crecimiento a 25°C y 20-40% de humedad relativa durante 3 días, evitando una exposición directa a la luz fluorescente (fotoperiodo de 24 horas) para evitar el atrapamiento del calor dentro de la cubeta. Se valoró la mortalidad 3 días después del tratamiento, en comparación con plantas de control no tratadas.

En este ensayo, los compuestos I-24 e I-16 a 300 rpm mostraron una mortalidad de al menos 50% en comparación con los controles no tratados.

II.3. Actividad contra áfido negro (*Aphis craccivora*)

Se formularon los compuestos activos en acetona:agua 50:50 (vol:vol). Se preparó la solución de ensayo el día de uso.

Se pulverizaron plantas de judía de careta en tiesto colonizadas con 100-150 áfidos en diversas etapas después de registrar la población de plagas. Se valoró la reducción de la población después de 72 horas.

En este ensayo, el compuesto I-6 a 300 ppm mostró una mortalidad de al menos 50% en comparación con los controles no tratados.

II.4. Saltamontes marrón del arroz (*Nilaparvata lugens*)

Se limpiaron plantones de arroz y se lavaron 24 horas antes de pulverizar. Se formularon los compuestos activos en acetona:agua 50:50 y se añadió 0,1% vol/vol de tensioactivo (EL 620). Se pulverizaron plantones de arroz en tiesto con 5 ml de solución de ensayo, se secaron al aire, se dispusieron en jaulas y se inocularon con 10 adultos. Se mantuvieron las plantas de arroz tratadas a 28-29°C y humedad relativa de 50-60%. Se registró el porcentaje de mortalidad después de 72 horas. En este ensayo, el compuesto I-15 a una concentración de la solución de ensayo de 300 ppm mostró una mortalidad de al menos 50% en comparación con los controles no tratados.

II.5. Saltahoja verde del arroz (*Nephotettix virescens*)

Se limpiaron plantones de arroz y se lavaron 24 horas antes de pulverizar. Se formularon los compuestos activos en acetona:agua 50:50 y se añadió 0,1% vol/vol de tensioactivo (EL 620). Se pulverizaron los plantones de arroz en tiesto con 5 ml de solución de ensayo, se secaron al aire, se dispusieron en cajas y se inocularon con 10 adultos. Se mantuvieron las plantas de arroz tratadas a 28-29°C y humedad relativa de 50-60%. Se registró el porcentaje de mortalidad después de 72 horas.

En este ensayo, el compuesto I-15 a una concentración de la solución de ensayo de 300 ppm mostró una mortalidad de al menos 50% en comparación con los controles no tratados.

II.6. Ácaro de dos puntos (*Tetranychus urticae*)

Se formularon los compuestos activos en acetona:agua 50:50 (vol:vol) y 100 ppm de tensioactivo Kinetica™.

Se infestaron plantas de garrofón con hojas primarias extendidas a 7-12 cm disponiendo en cada una un pequeño trozo de hoja infestada (con aproximadamente 100 ácaros) tomados de la colonia principal. Se realizó esto aproximadamente 2 horas antes del tratamiento para permitir a los ácaros moverse por la planta de ensayo para depositar huevos. Se retiró el trozo de hoja usado para transferir los ácaros. Se sumergieron las plantas recién infestadas en la solución de ensayo y se dejaron secar. Se mantuvieron las plantas de ensayo bajo luz fluorescente (fotoperiodo de 24 horas) aproximadamente a 25°C y aproximadamente a 20-40% de humedad relativa. Después de 5 días, se retiró una hoja y se realizaron recuentos de mortalidad.

En este ensayo, los compuestos I-1, I-2, I-18, I-19, I-20, I-21, I-24, I-25, I-26, I-34, I-35 a una concentración de solución de ensayo de 300 ppm mostraron una mortalidad de al menos 50% en comparación con controles no tratados.

II.7. Ácaro de Kanzawa (*Tetranychus kanzawai*)

II.7.a)

Se disolvieron los compuestos activos a la concentración deseada en una mezcla de acetona:agua 1:1 (vol:vol). Se prepararon las soluciones de ensayo el día de uso.

Se pulverizaron plantas de algodón en tiesto colonizadas con aproximadamente 50 ácaros en diversas etapas después de registrar la población de plagas. Se valoraron las reducciones de población (o aumentos) después de 24, 72 y 120 horas.

- 5 En este ensayo, los compuestos de los ejemplos 1 y 2, concretamente los compuestos I-1 e I-2, mostraron 100% de mortalidad a 300 ppm en comparación con los controles no tratados.

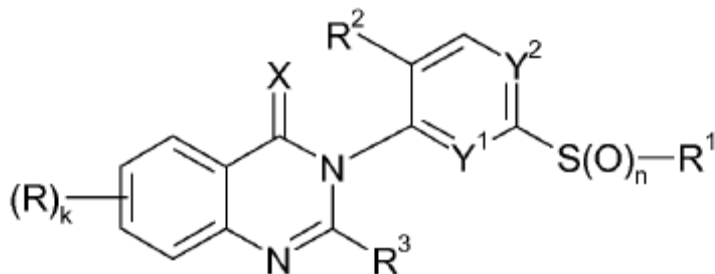
II.7.b)

Se pulverizaron plantas de algodón en tiesto colonizadas con aproximadamente 50 ácaros en diversas etapas después de registrar la población de plagas. Se valora la reducción de la población (o aumento) después de 72 horas.

- 10 En este ensayo, los compuestos I-1, I-2 e I-15 a una concentración de la solución de ensayo de 300 ppm mostraron una mortalidad de al menos 50% en comparación con los controles no tratados.

REIVINDICACIONES

1. Compuestos de 3-arylquinazolin-4-ona



(I)

en la que

- 5 k es 0, 1, 2, 3 o 4;
 n es 0, 1 o 2;
 X es O, S o N-R⁴;
 Y¹ es N o CH;
 Y² es N o C-R⁵;
- 10 R se selecciona del grupo consistente en halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₄, halogenoalquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, halogenoalqueno C₁-C₄, alquino C₂-C₄, halogenoalquino C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, halogenoalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio, halogenoalquil C₁-C₄-tio, alquil C₁-C₄-sulfinilo, halogenoalquil C₁-C₄-sulfinilo, alquil C₁-C₄-sulfonilo y halogenoalquil C₁-C₄-sulfonilo, siendo k 2, 3 o 4, siendo posible que R sea idéntico o diferente;
- 15 R¹ es alquilo C₁-C₁₀, halogenoalquilo C₁-C₁₀, alqueno C₂-C₁₀, halogenoalqueno C₂-C₁₀, alquino C₂-C₁₀, halogenoalquino C₂-C₁₀, cicloalquilo C₃-C₁₂, cicloalqueno C₅-C₁₂, cicloalquil C₃-C₁₂-alquilo C₁-C₄, cicloalqueno C₅-C₁₂-alquilo C₁-C₄, en los que el radical cicloalquilo y el radical cicloalqueno en los últimos cuatro radicales mencionados no están sustituidos, están parcial o totalmente halogenados y/o portan 1, 2, 3, 4, o 5 radicales alquilo C₁-C₄;
- 20 R² es hidrógeno, halógeno CN, C(Z)NH₂, alquilo C₁-C₄ o halogenoalquilo C₁-C₄, en el que Z es O, S o NR⁶;
 R³ es hidrógeno, OH, halógeno, CN, alquilo C₁-C₄, halogenoalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, halogenoalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio, halogenoalquil C₁-C₄-tio, alquil C₁-C₄-sulfinilo, halogenoalquil C₁-C₄-sulfinilo, alquil C₁-C₄-sulfonilo o halogenoalquil C₁-C₄-sulfonilo;
- 25 R⁴ se selecciona del grupo consistente en hidrógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, halogenoalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, halogenoalquino C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆, halogenoalcoxi C₁-C₆, alquilo C₂-C₆-oxilo, halogenoalquilo C₂-C₆-oxilo, alquilo C₂-C₆-oxilo, halogenoalquilo C₂-C₆-oxilo, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalqueno C₅-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, cicloalqueno C₅-C₆-alquilo C₁-C₄, cicloalcoxi C₃-C₆, cicloalqueno C₅-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alcoxi C₁-C₄, cicloalqueno C₅-C₆-alcoxi C₁-C₄, en los que el radical cicloalquilo y el radical cicloalqueno en los ocho últimos radicales mencionados están no sustituidos, parcial o totalmente halogenados y/o portan 1, 2, 3, 4, o 5 radicales alquilo C₁-C₄, fenilo, fenilalquilo C₁-C₄, feniloxilo y fenilalcoxi C₁-C₄, en los que el anillo fenilo de fenilo, fenilalquilo C₁-C₄, fenilalcoxi C₁-C₄ y feniloxilo está no sustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₄, halogenoalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y halogenoalcoxi C₁-C₄; y
- 30 R⁵ es hidrógeno, halógeno, CN, C(Z)NH₂, alquilo C₁-C₄ o halogenoalquilo C₁-C₄, en el que Z es O, S o NR⁶;
 R⁶ tiene uno de los significados dados para R⁴;

y las sales agrícolamente aceptables de los mismos.

2. El compuesto según la reivindicación 1, en el que R¹ es alquilo C₁-C₄, alquilo C₁-C₄ fluorado, alqueno C₂-C₄, alqueno C₂-C₄ fluorado, ciclopropilo o ciclopropilmetilo.

- 40 3. El compuesto según cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en el que R² es hidrógeno, flúor, cloro o metilo.

4. El compuesto según cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en el que R^3 es hidrógeno.
5. El compuesto según cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en el que k es 0.
6. El compuesto según cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en el que k es 1, 2 o 3 y en el que R se selecciona de flúor, cloro, CN, NO_2 , metilo y metoxilo, siendo k 2 o 3 y siendo posible que R sea idéntico o diferente.
- 5 7. El compuesto según cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en el que X es O.
8. El compuesto según cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en el que Y^1 es CH y Y^2 es $C-R^5$, en la que R^5 es cloro, metilo, difluorometilo, trifluorometilo o ciano.
9. El compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, en el que Y^1 e Y^2 son N.
10. El compuesto según cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en el que n es 0.
- 10 11. El compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12, en el que n es 1.
12. El uso de un compuesto de 3-arilquinazolin-4-ona de fórmula I como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11 y las sales agrícolamente aceptables del mismo para combatir plagas de invertebrados.
13. El uso según la reivindicación 12 para proteger a plantas y cultivos en crecimiento del ataque o infestación por plagas de invertebrados.
- 15 14. Un procedimiento de protección de material de propagación vegetal y/o a las plantas que crecen a partir del mismo, comprendiendo dicho procedimiento tratar el material de propagación vegetal con una cantidad plaguicida eficaz del compuesto de 3-arilquinazolin-4-ona o una sal agrícolamente aceptable del mismo como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11.
- 20 15. Material de propagación vegetal que comprende al menos un compuesto de 3-arilquinazolin-4-ona de fórmula I como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11 y/o una sal agrícolamente aceptable del mismo.
16. Un compuesto de 3-arilquinazolin-4-ona de fórmula I como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11 y las sales veterinariamente aceptables del mismo para uso en el tratamiento o protección de un animal ante la infestación o infección por parásitos invertebrados.