

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 454 690**

51 Int. Cl.:

C07D 231/44 (2006.01)

C07D 405/12 (2006.01)

A01N 43/56 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **02.12.2005 E 05814293 (6)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **05.03.2014 EP 1828140**

54 Título: **Derivados de 5-aminopirazol como compuestos plaguicidas**

30 Prioridad:

07.12.2004 EP 04028940

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

11.04.2014

73 Titular/es:

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

72 Inventor/es:

**SCHNATTERER, STEFAN;
MAIER, MICHAEL;
PETRY, FRIEDERIKE;
KNAUF, WERNER y
SEEGER, KARL**

74 Agente/Representante:

PONTI SALES, Adelaida

ES 2 454 690 T3

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

DESCRIPCIÓN

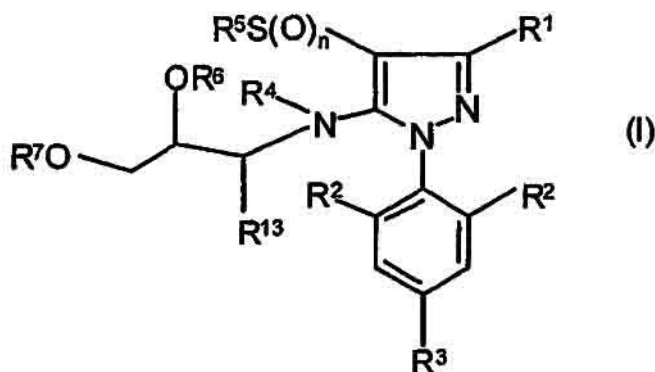
Derivados de 5-aminopirazol como compuestos plaguicidas

5 **[0001]** La invención se refiere a derivados de *N*-fenilpirazol 5-sustituídos, a un proceso para su preparación y a derivados para uso en el control de plagas.

10 **[0002]** Se han descrito ya varios compuestos de *N*-fenilpirazol como plaguicidas para el control de plagas (por ejemplo, en los documentos WO 87/03781, EP 0.295.117). Sin embargo, los plaguicidas modernos deben satisfacer un amplio intervalo de requisitos, por ejemplo, respecto al nivel, duración y espectro de acción, espectro de uso, toxicidad, combinación con otras sustancias activas, combinación con auxiliares de formulación o síntesis. En particular, el nivel de acción y/o duración de la acción de estos compuestos de la técnica anterior no es enteramente satisfactorio en todos los campos de aplicación, en particular contra ciertos organismos o cuando se aplican concentraciones bajas.

15 **[0003]** Para superar algunos de los inconvenientes mencionados, se desarrollan derivados de alquilaminopirazol 5-sustituídos novedosos que muestran propiedades plaguicidas útiles (documento WO 03/074492). Pero, en consideración de la aparición de resistencias, el desarrollo de sustancias adicionales no puede considerarse nunca como concluido, y existe constantemente una alta demanda de compuestos alternativos
20 novedosos que posean las ventajas de los compuestos conocidos o incluso propiedades plaguicidas mejoradas, al menos en los que se refiere a algunos aspectos.

[0004] La presente invención proporciona derivados de 5-alquilaminopirazol de fórmula (I):



25 en la que
 30 R^1 es CN, CH₃, CF₃, C(=N-Z)-S(O)_p-alquilo C₁-C₄ o CSNH₂; en la que Z es H, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₆, alqueno C₃-C₆, alquino C₃-C₆, -(CH₂)_qR⁸, COR⁹, CO₂-alquilo C₁-C₆ o S(O)_pR⁹;

R^2 para ambos residuos, independientemente entre sí, se selecciona del grupo consistente en halógeno, CH₃ o NR¹¹R¹²;

35 R^3 es halogenoalquilo C₁-C₃, halogenoalcoxilo C₁-C₃ o SF₅;

40 R^4 es hidrógeno, alqueno C₂-C₆, halogenoalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, halogenoalquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₇, cicloalquil C₃-C₇-alquilo C₁-C₆, CO₂-alquilo C₁-C₆, CO₂-alqueno C₃-C₆, CO₂-alquino C₃-C₆, CO₂-(CH₂)_qR⁸, CO₂-(CH₂)_qR¹⁰ o SO₂R⁹; formilo, CO-COO-alquilo C₁-C₆ o CO-alquilo C₁-C₆ no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alcoxilo C₁-C₆, halogenoalcoxilo C₁-C₆, alqueno C₃-C₆-oxilo, halogenoalqueno C₃-C₆-oxilo, alquino C₃-C₆-oxilo, halogenoalquino C₃-C₆-oxilo, cicloalquilo C₃-C₇, S(O)_pR⁹, CN, NO₂, OH, R⁸, R¹⁰, COR⁹, NR¹¹R¹², OR⁹ y CO₂R⁹; o CO-(CH₂)_mR⁸; o CO-(CH₂)_mR¹⁰; o alquilo C₁-C₆ no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alcoxilo C₁-C₆, halogenoalcoxilo C₁-C₆, alqueno C₃-C₆-oxilo, halogenoalqueno C₃-C₆-oxilo, alquino C₃-C₆-oxilo, halogenoalquino C₃-C₆-oxilo, cicloalquilo C₃-C₇, S(O)_pR⁹, CN, NO₂, OH, R⁸, R¹⁰, COR⁹, NR¹¹R¹², OR⁹ y CO₂R⁹;

45 R^5 es alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, halogenoalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆ o halogenoalquino C₂-C₆;

50 R^6 y R^7 son cada uno independientemente halogenoalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆ o alquino C₂-C₆, y todos ellos pueden estar sustituidos con uno o más radicales R⁹ u OR⁹; o R⁸, R¹⁰; o son cada uno independientemente grupos acilo de tipo formilo, CO-alquilo C₁-C₆ y CO-alquilo C₁-C₆ sustituido con uno o más radicales R⁹; o del tipo COO-alquilo C₁-C₆ y COO-alquilo C₁-C₆ sustituido con uno o más radicales R⁹; o del tipo SO₂-alquilo C₁-C₆ y SO₂-alquilo

C₁-C₆ no sustituido o sustituido con uno o más radicales R⁹,

R⁶ y R⁷ pueden formar conjuntamente con la unidad C₂ con la que están enlazados un anillo de 5 a 7 miembros. En este caso, R⁶ y R⁷ forman conjuntamente grupos divalentes como CO, CS, CO-CO, CH₂CO, CHR⁹CO, CR⁹R⁹CO, SO, SO₂, PO(OH), PO(OR⁹), PO(R⁹), PO(OR¹⁰), PO(R¹⁰), PO(OR⁸), PO(R⁸) o similares;

alquileo C₁-C₃, cicloalquileo C₃-C₇, cicloalquil C₃-C₇-alquileo C₁-C₆, 1,2-fenileno, todos ellos no sustituidos o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alcoxilo C₁-C₆, halogenoalcoxilo C₁-C₆, alquenil C₃-C₆-oxilo, halogenoalquenil C₃-C₆-oxilo, alquinil C₃-C₆-oxilo, halogenoalquinil C₃-C₆-oxilo, cicloalquilo C₃-C₇, S(O)_pR⁹, CN, NO₂, OH, R⁸, R¹⁰, COR⁹, NR¹¹R¹², OR⁹ y CO₂R⁹;

R⁸ es fenilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₆, alcoxilo C₁-C₆, halogenoalcoxilo C₁-C₆, CN, NO₂, S(O)_pR⁹ y NR¹¹R¹²;

R⁹ es alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₇, -alquil C₁-C₄-cicloalquilo C₃-C₇, -(CH₂)_qR⁸ o -(CH₂)_qR¹⁰;

R¹⁰ es heterociclilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo C₁-C₄, halogenoalquilo C₁-C₄, alcoxilo C₁-C₄, S(O)_pR¹³, OH y oxo;

R¹¹ y R¹² son cada uno independientemente H o alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, y todos ellos pueden estar sustituidos con uno o más radicales R⁹ u OR⁹;

R¹³ es hidrógeno, alquilo C₁-C₆ o fenilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₆, alcoxilo C₁-C₆, halogenoalcoxilo C₁-C₆, CN, NO₂, S(O)_pR⁹ y NR¹¹R¹²;

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

m es 0, 1, 2 o 3; y

cada heterociclilo en los radicales anteriormente mencionados es independientemente un radical heterocíclico que tiene de 3 a 7 átomos de anillo y 1, 2 o 3 heteroátomos en el anillo seleccionados del grupo consistente en N, O y S;

o una sal plaguicidamente aceptable de los mismos.

[0005] La invención comprende también cualquier estereoisómero, enantiómero o isómero geométrico y mezclas de los compuestos de fórmula (I).

[0006] Se entiende por el término "sales plaguicidamente aceptables" sales cuyos aniones o cationes son conocidos y aceptados en la materia para la formación de sales para uso plaguicida. Las sales adecuadas con bases, por ejemplo formadas por compuestos de fórmula (I) que contienen un grupo ácido carboxílico, incluyen sales de metal alcalino (por ejemplo, sodio y potasio), metal alcalinotérreo (por ejemplo, calcio y magnesio), amonio y amina (por ejemplo, dietanolamina, trietanolamina, octilamina, morfolina y diocilmetilamina). Las sales de adición de ácido adecuadas, formadas por ejemplo por compuestos de fórmula (I) que contienen un grupo amino, incluyen sales con ácidos inorgánicos, por ejemplo clorhidratos, sulfatos, fosfatos y nitratos, y sales con ácidos orgánicos, por ejemplo ácido acético.

[0007] En un aspecto adicional de la invención, se proporcionan compuestos de fórmula (I) o una sal plaguicidamente aceptable de los mismos para uso en el control de parásitos en o sobre animales.

[0008] En un aspecto adicional de la presente invención, se proporciona el uso de los compuestos de fórmula (I) o una sal plaguicidamente aceptable de los mismos para preparar un medicamento veterinario, preferiblemente para el tratamiento de parásitos, específicamente ectoparásitos y endoparásitos, en y sobre animales.

[0009] En la presente memoria descriptiva de patente, incluyendo las reivindicaciones adjuntas, los sustituyentes anteriormente mencionados tienen los siguientes significados:

[0010] Átomo de halógeno significa flúor, cloro, bromo o yodo.

[0011] El término "halogeno" antes del nombre de un radical significa que este radical está parcial o completamente halogenado, es decir, sustituido con F, Cl, Br, o I en cualquier combinación, preferiblemente con F o Cl.

[0012] Los grupos alquilo y porciones de los mismos (a menos que se defina de otro modo) pueden ser de

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

5 **[0013]** Los radicales alquilo, y también en grupos compuestos, a menos que se defina de otro modo, tienen preferiblemente de 1 a 4 átomos de carbono.

10 **[0014]** "Halogenoalquilo C₁-C₆" significa un grupo alquilo mencionado en la expresión "alquilo C₁-C₆" en que uno o más átomos de hidrógeno están reemplazados por el mismo número de átomos de halógeno idénticos o diferentes, tales como monohalogenoalquilo, perhalogenoalquilo, CF₃, CHF₂, CH₂F, CHFCH₃, CF₃CH₂, CF₃CF₂, CHF₂CF₂, CH₂FCHCl, CH₂Cl, CCl₃, CHCl₂ o CH₂CH₂Cl.

15 **[0015]** "Alcoxilo C₁-C₆" significa un grupo alcoxilo cuya cadena de carbono tiene el significado dado en la expresión "alquilo C₁-C₆". "Halogenoalcoxilo" es, por ejemplo, OCF₃, OCHF₂, OCH₂F, CF₃CF₂O, OCH₂CF₃ u OCH₂CH₂Cl. "Alquilenilo C₂-C₆" ha de entenderse que significa un grupo alcanodiilo de cadena no ramificada o ramificada que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, -CH₂-, -CH₂-CH₂-, -CH₂-CH₂-CH₂- o -CH₂-CH(CH₃)-. La expresión "halogenoalqueno C₁-C₆" significa un grupo alquilenilo C₁-C₆ en que uno o más átomos de hidrógeno están reemplazados por el mismo número de átomos de halógeno idénticos o diferentes.

20 **[0016]** "Alquenilo C₂-C₆" significa una cadena de carbono no cíclica no ramificada o ramificada que tiene un número de átomos de carbono que corresponde a este intervalo indicado y que contiene al menos un doble enlace, que puede estar localizado en cualquier posición del radical insaturado respectivo. "Alquenilo C₂-C₆" designa por consiguiente, por ejemplo, el grupo vinilo, alilo, 2-metil-2-propenilo, 2-butenilo, pentenilo, 2-metilpentenilo o hexenilo.

25 **[0017]** "Alquinilo C₂-C₆" significa una cadena de carbono no cíclica no ramificada o ramificada que tiene un número de átomos de carbono que corresponde a este intervalo indicado y que contiene un triple enlace, que puede estar localizado en cualquier posición del radical insaturado respectivo. "Alquinilo C₂-C₆" designa por consiguiente, por ejemplo, el grupo propargilo, 1-metil-2-propinilo, 2-butinilo o 3-butinilo. Los grupos cicloalquilo tienen preferiblemente de 3 a 7 átomos de carbono en el anillo y están opcionalmente sustituidos con halógeno o alquilo.

30 **[0018]** En compuestos de fórmula (I), se proporcionan los siguientes ejemplos de radicales: es un ejemplo de alquilo sustituido con cicloalquilo el ciclopropilmetilo; es un ejemplo de alquilo sustituido con alcoxilo el metoximetilo (CH₃OCH₂-); y es un ejemplo de alquilo sustituido con alquiltio el metiltiometilo (CH₃SCH₂-). Arilo es un sistema aromático monocíclico o bicíclico, por ejemplo fenilo, naftilo, tetrahidronaftilo, indenilo, indanilo y similares, preferiblemente fenilo.

35 **[0019]** Un grupo "heterociclilo" puede ser saturado, insaturado o heteroaromático; preferiblemente contiene uno o más, en particular 1, 2 o 3 heteroátomos en el anillo heterocíclico, preferiblemente seleccionados del grupo consistente en N, O y S; es preferiblemente un radical heterociclilo alifático que tiene de 3 a 7 átomos de anillo o un radical heteroaromático que tiene de 5 a 7 átomos de anillo. El radical heterocíclico puede ser, por ejemplo, un radical o anillo heteroaromático (heteroarilo) tal como, por ejemplo, un sistema aromático mono-, bi- o policíclico en que al menos un anillo contiene uno o más heteroátomos, por ejemplo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tienilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, furilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo y triazolilo, o es un radical parcial o totalmente hidrogenado tal como oxiranilo, oxetanilo, oxolanilo (=tetrahidrofuranilo), oxanilo, pirrolidilo, piperidilo, piperazinilo, dioxolanilo, oxazolinilo, isoxazolinilo, oxazolidinilo, isoxazolidinilo y morfolinilo. El grupo "heterociclilo" puede estar no sustituido o sustituido, preferiblemente con uno o más radicales (preferiblemente 1, 2 o 3 radicales) seleccionados del grupo consistente en halógeno, alcoxilo, halogenoalcoxilo, alquiltio, hidroxilo, amino, nitro, carboxilo, ciano, alcoxycarbonilo, alquilcarbonilo, formilo, carbamoilo, mono- y dialquilaminocarbonilo, amino sustituido tal como acilamino, mono- y dialquilamino y alquilsulfino, halogenoalquilsulfino, alquilsulfonilo, halogenoalquilsulfonilo, alquilo y halogenoalquilo, y adicionalmente también oxo. El grupo oxo puede estar presente también en aquellos átomos de heteroanillo en que son posibles diversos números de oxidación, por ejemplo, en el caso de N y S.

40 **[0020]** Las realizaciones preferidas de la presente invención comprenden compuestos de fórmula (I) en que preferiblemente R¹ es CN, C(=N-Z)-S(O)_p-alquilo C₁-C₄ o CSNH₂; en la que Z es H, alquilo C₁-C₃, -(CH₂)_qR⁶, COR⁹, CO₂-alquilo C₁-C₃ o S(O)_pR⁹; y/o R² es halógeno, en particular F o Cl y/o R³ es halogenoalquilo C₁-C₃; en particular CF₃ o OCF₃ (más preferiblemente CF₃) y/o R⁵ es halogenoalquilo C₁-C₃; en particular CF₃ u OCF₃ (más preferiblemente CF₃) y/o R¹³ es hidrógeno o alquilo C₁-C₃ no sustituido o sustituido con uno o más halógenos.

45 **[0021]** Preferiblemente, R⁴ es hidrógeno, alquenilo C₂-C₄, halogenoalquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, halogenoalquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₇, cicloalquil C₃-C₇-alquilo C₁-C₄, CO₂-alquilo C₁-C₄, CO₂-alquenilo C₃-C₄, CO₂-alquinilo C₃-C₄, CO₂-(CH₂)_qR⁸, CO₂-(CH₂)_qR¹⁰ o SO₂R⁹; formilo, CO-COO-alquilo C₁-C₄, CO-alquilo C₁-C₄ o alquilo C₁-C₄, no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo C₁-C₃, halogenoalquilo C₁-C₃, alcoxilo C₁-C₃, halogenoalcoxilo C₁-C₃, S(O)_pR⁹, CN y NO₂. Más preferiblemente, R⁴ es hidrógeno, CO₂-alquilo C₁-C₃, SO₂R⁹, alquilo C₁-C₃ no sustituido o sustituido con uno o más

radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alcoxilo C₁-C₃, CO₂-alquilo C₁-C₃, S(O)_pR⁹, en la que cada R⁹ se selecciona del grupo consistente en alquilo C₁-C₃ o halogenoalquilo C₁-C₃. Lo más preferiblemente, R⁴ es alquilo C₁-C₃.

5 **[0022]** Las realizaciones preferidas de la presente invención comprenden adicionalmente compuestos de fórmula (I) en que, independientemente entre sí, R⁶ y R⁷ son halogenoalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆ o alquino C₂-C₆, en todos ellos uno o más átomos de hidrógeno pueden estar sustituidos por uno o más radicales R⁹ u OR⁹; o R⁸, R¹⁰; o son cada uno independientemente grupos acilo de tipo formilo, CO-alquilo C₁-C₆ y CO-alquilo C₁-C₆ sustituido con uno o más radicales R⁹; o del tipo COO-alquilo C₁-C₆ y COO-alquilo C₁-C₆ sustituido con uno o más radicales R⁹; o del tipo CO-COO-alquilo C₁-C₆ y CO-COO-alquilo C₁-C₆ sustituido con uno o más radicales R⁹; o del tipo SO₂-alquilo C₁-C₆ y SO₂-alquilo C₁-C₆ no sustituido o sustituido con uno o más radicales R⁹, en los que R⁶ y R⁷ pueden formar junto con la unidad C₂ con la que están enlazados un anillo de 5 a 7 miembros. En este caso, R⁶ y R⁷ forman conjuntamente grupos divalentes como CO, CS, CO-CO, CH₂CO, SO, SO₂, PO(OH), PO(OR⁸), PO(R⁸), PO(OR⁹), PO(R⁹) o similares; alqueno C₁-C₃, cicloalqueno C₃-C₇, cicloalquil C₃-C₇-alqueno C₁-C₆, 1,2-fenileno, todos ellos no sustituidos o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alcoxilo C₁-C₆, halogenoalcoxilo C₁-C₆, alqueno C₃-C₆-oxilo, halogenoalqueno C₃-C₆-oxilo, alqueno C₃-C₆-oxilo, halogenoalqueno C₃-C₆-oxilo, cicloalquilo C₃-C₇, S(O)_pR⁹, CN, NO₂, OH, R⁸, R¹⁰, COR⁹, NR¹¹R¹², OR⁹ y CO₂R⁹.

20 **[0023]** Específicamente, se prefieren los compuestos de fórmula (I) en la que al menos uno de los residuos R⁶ y R⁷ se selecciona del grupo consistente en formilo, CO-alquilo C₁-C₆, CO-alquilo C₁-C₆ sustituido con uno o más radicales R⁹; COO-alquilo C₁-C₆, COO-alquilo C₁-C₆ sustituido con uno o más radicales R⁹; CO-COO-alquilo C₁-C₆, CO-COO-alquilo C₁-C₆ sustituido con uno o más radicales R⁹; SO₂-alquilo C₁-C₆, SO₂-alquilo C₁-C₆ sustituido con uno o más radicales R⁹; o en los que R⁶ y R⁷ forman conjuntamente un grupo divalente seleccionado del grupo consistente en CO, CS, CO-CO, CH₂CO, SO, SO₂, PO(OH), PO(OR⁹), PO(R⁹), PO(OR⁸), PO(R⁸).

25 **[0024]** Son realizaciones particularmente preferidas de la presente invención los compuestos de fórmula (I) en la que

R¹ es CN;

R² es halógeno;

R³ es halogenoalquilo C₁-C₃;

35 R⁴ es hidrógeno, alqueno C₂-C₆, halogenoalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, halogenoalquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₇, cicloalquil C₃-C₇-alquilo C₁-C₆, CO₂-alquilo C₁-C₆, CO₂-alqueno C₃-C₆, CO₂-alquino C₃-C₆, CO₂-(CH₂)_qR⁸, CO₂-(CH₂)_qR¹⁰ o SO₂R⁹; formilo, CO-COO-alquilo C₁-C₆ o CO-alquilo C₁-C₆, no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alcoxilo C₁-C₆, halogenoalcoxilo C₁-C₆, alqueno C₃-C₆-oxilo, halogenoalqueno C₃-C₆-oxilo, alqueno C₃-C₆-oxilo, halogenoalqueno C₃-C₆-oxilo, cicloalquilo C₃-C₇, S(O)_pR⁹, CN, NO₂, OH, R⁸, R¹⁰, COR⁹, NR¹¹R¹², OR⁹ y CO₂R⁹; o CO-(CH₂)_nR⁸; o CO-(CH₂)_nR¹⁰;

40 o R⁴ es alquilo C₁-C₆ no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alcoxilo C₁-C₆, halogenoalcoxilo C₁-C₆, alqueno C₃-C₆-oxilo, halogenoalqueno C₃-C₆-oxilo, alqueno C₃-C₆-oxilo, halogenoalqueno C₃-C₆-oxilo, cicloalquilo C₃-C₇, S(O)_pR⁹, CN, NO₂, OH, R⁸, R¹⁰, COR⁹, NR¹¹R¹², OR⁹ y CO₂R⁹; R⁵ es alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₆;

50 R⁶ y R⁷ son cada uno independientemente halogenoalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, todos ellos pueden estar sustituidos con uno o más radicales R⁹ u OR⁹; o R⁸, R¹⁰; o son cada uno independientemente grupos acilo de tipo formilo, CO-alquilo C₁-C₆ y CO-alquilo C₁-C₆ sustituido con uno o más radicales R⁹; o del tipo COO-alquilo C₁-C₆ y COO-alquilo C₁-C₆ sustituido con uno o más radicales R⁹; o del tipo CO-COO-alquilo C₁-C₆ y CO-COO-alquilo C₁-C₆ sustituido con uno o más radicales R⁹; o del tipo SO₂-alquilo C₁-C₆ y SO₂-alquilo C₁-C₆ sustituido con uno o más radicales R⁹, en los que R⁶ y R⁷ pueden formar conjuntamente con la unidad C₂ con la que están enlazados un anillo de 5 a 7 miembros. En este caso, R⁶ y R⁷ forman conjuntamente grupos divalentes como CO, CS, CO-CO, CH₂CO, SO, SO₂, PO(OH), PO(OR⁹), PO(R⁹), PO(OR⁸), PO(R⁸) o similares; alqueno C₁-C₃, cicloalqueno C₃-C₇, cicloalquil C₃-C₇-alqueno C₁-C₆, 1,2-fenileno, todos ellos no sustituidos o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alcoxilo C₁-C₆, halogenoalcoxilo C₁-C₆, alqueno C₃-C₆-oxilo, halogenoalqueno C₃-C₆-oxilo, alqueno C₃-C₆-oxilo, halogenoalqueno C₃-C₆-oxilo, cicloalquilo C₃-C₇, S(O)_pR⁹, CN, NO₂, OH, R⁸, R¹⁰, COR⁹, NR¹¹R¹², OR⁹ y CO₂R⁹;

60 R⁸ es fenilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₆, alcoxilo C₁-C₆, halogenoalcoxilo C₁-C₆, CN, NO₂, S(O)_pR⁹ y NR¹¹R¹²;

R⁹ es alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₇, -alquil C₁-C₄-cicloalquilo C₃-C₇, -(CH₂)_qR⁸ o -(CH₂)_qR¹⁰;

65 R¹⁰ es heterociclilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en

halógeno, alquilo C₁-C₄, halogenoalquilo C₁-C₄, alcoxilo C₁-C₄, S(O)_pR¹³, OH y oxo;

R¹¹ y R¹² son cada uno independientemente H; o alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, y todos ellos pueden estar sustituidos con uno o más radicales R⁹ u OR⁹;

5 R¹³ es hidrógeno, alquilo C₁-C₆ o fenilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₆, alcoxilo C₁-C₆, halogenoalcoxilo C₁-C₆, CN, NO₂, S(O)_pR⁹ y NR¹¹R¹².

10 **[0025]** Los compuestos más preferidos de acuerdo con la presente invención son las sustancias de fórmula (I) en la que

R¹ es CN;

15 R² es Cl;

R³ es CF₃;

20 R⁴ es hidrógeno o alquilo C₁-C₆ no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alcoxilo C₁-C₆, halogenoalcoxilo C₁-C₆, alqueno C₃-C₆-oxilo, halogenoalqueno C₃-C₆-oxilo, alquino C₃-C₆-oxilo, halogenoalquino C₃-C₆-oxilo, cicloalquilo C₃-C₇, S(O)_pR⁹, CN, NO₂, OH, R⁸, R¹⁰, COR⁹, NR¹¹R¹², OR⁹ y CO₂R⁹;

R⁵ es CF₃;

25 R⁶ y R⁷ son cada uno independientemente halogenoalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, y todos ellos pueden estar sustituidos con uno o más radicales R⁹ u OR⁹; o R⁸, R¹⁰; o son cada uno independientemente grupos acilo de tipo formilo, CO-alquilo C₁-C₆ y CO-alquilo C₁-C₆ sustituido con uno o más radicales R⁹; o del tipo COO-alquilo C₁-C₆ y COO-alquilo C₁-C₆ sustituido con uno o más radicales R⁹; o del tipo CO-COO-alquilo C₁-C₆ y CO-COO-alquilo C₁-C₆ sustituido con uno o más radicales R⁹; o del tipo SO₂-alquilo C₁-C₆ y SO₂-alquilo C₁-C₆ sustituido con uno o más radicales R⁹, en los que R⁶ y R⁷ pueden formar junto con la unidad C₂ con la que están enlazados un anillo de 5 a 7 miembros. En este caso, R⁶ y R⁷ forman conjuntamente grupos divalentes como CO, CS, CO-CO, CH₂CO, SO, SO₂, PO(OH), PO(OR⁹), PO(R⁹), PO(OR⁸), PO(R⁸) o similares; alqueno C₁-C₄, cicloalqueno C₃-C₇, cicloalquil C₃-C₇-alqueno C₁-C₆, 1,2-fenileno, todos ellos no sustituidos o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alcoxilo C₁-C₆, halogenoalcoxilo C₁-C₆, alqueno C₃-C₆-oxilo, halogenoalqueno C₃-C₆-oxilo, alquino C₃-C₆-oxilo, halogenoalquino C₃-C₆-oxilo, cicloalquilo C₃-C₇, S(O)_pR⁹, CN, NO₂, OH, R⁸, R¹⁰, COR⁹, NR¹¹R¹², OR⁹ y CO₂R⁹;

40 R⁸ es fenilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₆, alcoxilo C₁-C₆, halogenoalcoxilo C₁-C₆, CN, NO₂, S(O)_pR⁹ y NR¹¹R¹²;

R⁹ es alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₇, -alquil C₁-C₄-cicloalquilo C₃-C₇, -(CH₂)_qR⁸ o -(CH₂)_qR¹⁰;

45 R¹⁰ es heterociclilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo C₁-C₄, halogenoalquilo C₁-C₄, alcoxilo C₁-C₄, S(O)_pR¹³, OH y oxo;

R¹¹ y R¹² son cada uno independientemente H; o alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, todos ellos pueden estar sustituidos con uno o más radicales R⁹ u OR⁹;

50 R¹³ es hidrógeno, alquilo C₁-C₆ o fenilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₆, alcoxilo C₁-C₆, halogenoalcoxilo C₁-C₆, CN, NO₂, S(O)_pR⁹ y NR¹¹R¹².

55 **[0026]** Son una clase preferida adicional de compuestos de fórmula (I) aquellos en los que

R¹ es CN;

R² es Cl;

60 R³ y R⁵ son CF₃;

R⁴ y R¹³ son independientemente entre sí hidrógeno o CH₃;

65 R⁶ y R⁷ son independientemente entre sí un radical CO-alquilo C₁-C₄, COO-alquilo C₁-C₄ o CO-COO-alquilo C₁-C₄, en particular seleccionado del grupo consistente en HCO, CH₃CO, C₂H₅CO, n-C₃H₇CO, iso-C₃H₇CO, n-C₄H₉CO,

tert-butil-CO (tBuCO), iso-C₄H₉CO (iBuCO), *sec*-butil-CO (secBuCO), fenil-CO (PhCO), CH₃OCH₂CO (MeOCH₂CO), CH₃OCO (MeOCO), C₂H₅OCO (EtOCO), n-C₃H₇OCO (nPrOCO), iso-C₃H₇OCO (iPrOCO), n-C₄H₉OCO (nBuOCO), iso-C₄H₉OCO (iBuOCO), *tert*-C₄H₉OCO (tBuOCO), *sec*-C₄H₉OCO (secBuOCO), CO-COO-CH₃ (CO-COOMe), CO-COO-C₂H₅ (CO-COOEt), CO-COO-n-C₃H₇ (CO-COOnPr), CO-COO-iso-C₃H₇ (CO-COOiPr), CO-COO-n-C₄H₉ (CO-COOnBu), CO-COO-iso-C₃H₇ (CO-COOiBu), CO-COO-*tert*-C₄H₉ (COCOOtBu), CO-COO-*sec*-C₄H₉ (CO-COOsecBu).

[0027] Son una clase preferida adicional de compuestos de fórmula (I) aquellos en los que

R¹ es CN;

R² es Cl;

R³ y R⁵ son CF₃;

R⁴ y R¹³ son independientemente entre sí hidrógeno o CH₃ y en los que R⁶ y R⁷ forman junto con la unidad C₂ con la que están enlazados un anillo de 5 a 7 miembros. Los grupos divalentes formados por R⁶ y R⁷ se seleccionan en particular del grupo consistente en CH₂, C(CH₃)₂ (CMe₂), C₂H₄, C₃H₆, fenil-CH (CHPh), 1,2-C₆H₄, ciclopentano-1,1-diilo y ciclohexano-1,1-diilo.

[0028] Son una clase preferida adicional de compuestos de fórmula (I) aquellos en los que

R¹ es CN;

R² es Cl;

R³ y R⁵ son CF₃;

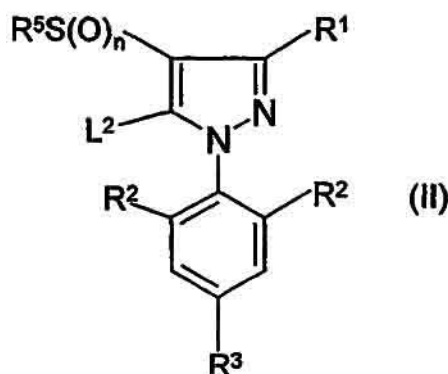
R⁴ y R¹³ son independientemente entre sí hidrógeno o CH₃ y en los que R⁶ y R⁷ forman junto con la unidad C₂ con la que están enlazados un anillo de 5 a 7 miembros. Los grupos divalentes formados por R⁶ y R⁷ se seleccionan en particular del grupo consistente en CO, CS, CO-CO, CH₂CO, SO, SO₂, PO(OH), PO(OR⁹), PO(R⁹), PO(OR⁸) y PO(R⁸), en los que R⁹ es lo más preferiblemente un radical alquilo C₁-C₃ y R⁸ es lo más preferiblemente un radical fenilo.

Procesos generales para la síntesis de compuestos de fórmula (I)

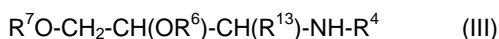
[0029] Los compuestos de fórmula general (I) pueden prepararse mediante la aplicación o adaptación de procedimientos conocidos (es decir, procedimientos usados hasta el momento o descritos en la bibliografía química).

[0030] En la siguiente descripción de procesos, cuando los símbolos que aparecen en las fórmulas no se definen específicamente, se entiende que son "como se define anteriormente" de acuerdo con la primera definición de cada símbolo en la memoria descriptiva.

[0031] Según un rasgo adicional de la invención, los compuestos de fórmula (I) en la que R¹ es CN, CH₃ o CF₃, y R², R³, R⁵ y n son como se definen anteriormente, pueden prepararse mediante la reacción de un compuesto de fórmula (II):



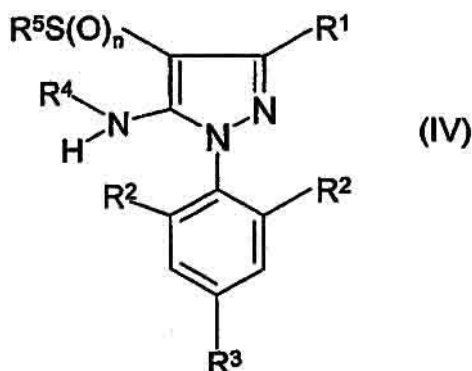
en la que L² es un grupo saliente, generalmente halógeno y preferiblemente bromo, y los demás valores son como se definen anteriormente, con un compuesto de fórmula (III):



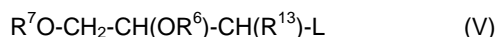
en la que R^4 , R^6 , R^7 y R^{13} son como se definen anteriormente.

5 **[0032]** La reacción se efectúa preferiblemente en presencia de una base tal como un hidruro de metal alcalino tal como hidruro de sodio, o un carbonato de metal alcalino tal como carbonato de potasio o carbonato de sodio, o una base orgánica tal como una amina terciaria, por ejemplo trietilamina o etildiisopropilamina, en un disolvente tal como tetrahidrofurano, dioxano o acetonitrilo, a una temperatura de 20 a 150 °C.

10 **[0033]** Según un rasgo adicional de la invención, los compuestos de fórmula (I) en la que R^1 es CN, CH_3 o CF_3 , y R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , n y los demás valores son como se definen anteriormente, pueden prepararse mediante la reacción de un compuesto de fórmula (IV):



15 con un agente alquilante de fórmula (V):

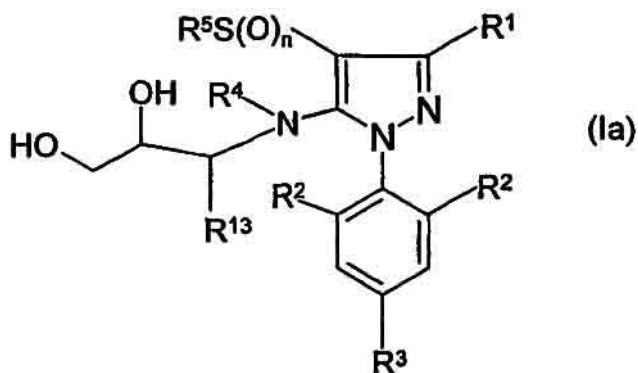


20 en la que R^6 , R^7 y R^{13} son como se definen anteriormente y L es un grupo saliente, generalmente halógeno y preferiblemente cloro, bromo o yodo, y una base.

25 **[0034]** La reacción se lleva a cabo generalmente usando un disolvente tal como tetrahidrofurano, dioxano o acetonitrilo, a una temperatura de 20 a 120 °C.

30 **[0035]** La base es preferiblemente un hidruro de metal alcalino tal como hidruro de sodio, o un carbonato de metal alcalino tal como carbonato de potasio o carbonato de sodio, o un fosfato de metal alcalino tal como fosfato de potasio, o una base orgánica tal como una amina terciaria, por ejemplo trietilamina o etildiisopropilamina. Se prefieren particularmente los fosfatos de metal alcalino tales como fosfato de potasio.

35 **[0036]** Según un rasgo adicional de la invención, los compuestos de fórmula (I) en la que R^1 es CN, CH_3 o CF_3 , y R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^{13} y n y los demás valores son como se definen anteriormente, pueden prepararse mediante la reacción de un compuesto de fórmula (Ia), en la que R^6 y R^7 son H,



40 con un agente de acilación seleccionado del grupo de $R^{14}-COCl$ o $R^{14}-O-O-CO-R^{15}$ o un dicloruro de ácido del grupo de fosgeno, cloruro de oxalilo, cloruro de tionilo, dicloruros de fósforo y una base. Preferiblemente, R^{14} y R^{15} son independientemente H o alquilo C_1-C_6 , en los que el residuo alquilo puede estar no sustituido o sustituido con uno o más radicales R^9 .

[0037] La reacción se lleva a cabo generalmente usando un disolvente tal como tetrahidrofurano, dioxano o acetonitrilo, a una temperatura de 20 a 120 °C. La base es preferiblemente una base orgánica tal como una amina terciaria, por ejemplo trietilamina o etildiisopropilamina.

5 **[0038]** Según un rasgo adicional de la presente invención, los compuestos de fórmula (I) en la que R¹ es CSNH₂, y los demás residuos y valores son como se definen anteriormente, pueden prepararse mediante reacción del correspondiente compuesto de fórmula (I), en la que R¹ es CN, con un hidrosulfuro de metal alcalino o alcalinotérreo tal como hidrosulfuro de litio, potasio, calcio o preferiblemente sodio, en un disolvente inerte, por ejemplo *N,N*-dimetilformamida, piridina, dioxano, tetrahidrofurano, sulfolano, dimetilsulfóxido, metanol o etanol a una temperatura de -35 a 50 °C, preferiblemente de 0 a 30 °C. Opcionalmente, el hidrosulfuro puede generarse *in situ* mediante tratamiento con H₂S en presencia de una base orgánica tal como un alcóxido metálico o trialkilamina o una base inorgánica tal como carbonato de sodio, potasio o amonio. El uso de un agente complejante de metal, tal como un éter corona, puede ser beneficioso para acelerar la reacción. La reacción de la sal hidrosulfuro con el compuesto de fórmula (Ia), (II) o (IV) puede realizarse también en un sistema de disolvente acuoso/orgánico bifásico usando un catalizador de transferencia de fase tal como un éter corona o una sal de tetraalkilamonio tal como bromuro de tetra-*n*-butilamonio o cloruro de benciltrimetilamonio. Los disolventes orgánicos adecuados para uso en un sistema bifásico con agua incluyen benceno, tolueno, diclorometano, 1-clorobutano y metil-*terc*-butiléter.

20 Como alternativa, los compuestos de fórmula (I) en la que uno R¹ es CSNH₂ pueden prepararse también a partir del correspondiente compuesto de fórmula (I) en la que R¹ es CN, mediante tratamiento con el reactivo Ph₂PS₂, por ejemplo como se describe en Tet. Lett., 24 (20), 2059 (1983).

25 **[0039]** Según un rasgo adicional de la invención, los compuestos de fórmula (I) en la que R¹ es CSNH₂, y los demás residuos y valores son como se definen anteriormente, pueden prepararse mediante la reacción del correspondiente compuesto de fórmula (I) en la que R¹ es CN con un sulfuro de bis(trialquilililo), preferiblemente sulfuro de bis(trimetilililo), en presencia de una base, generalmente un alcóxido de metal alcalino tal como metóxido de sodio, en un disolvente tal como *N,N*-dimetilformamida, a una temperatura de 0 a 60 °C. El procedimiento se describe en general por Lin, Ku y Shiao en Synthesis 1219 (1992).

30 **[0040]** Según un rasgo adicional de la invención, los compuestos de fórmula (I) en la que R¹ es C(=N-H)-S-alkilo C₁-C₄, y los demás residuos y valores son como se definen anteriormente, pueden prepararse mediante la reacción del correspondiente compuesto de fórmula (I) en la que R¹ es CSNH₂ con un agente alquilante de fórmulas (VI) o (VII):

35
$$\begin{array}{ll} \text{alquil C}_1\text{-C}_4\text{-L}^3 & \text{(VI)} \\ (\text{alquil C}_1\text{-C}_4)_3\text{O}^+ \text{BF}_4^- & \text{(VII)} \end{array}$$

40 en las que L³ es un grupo saliente, generalmente halógeno y preferiblemente cloro, bromo o yodo. La reacción se efectúa generalmente en presencia de una base, por ejemplo un hidruro de metal alcalino tal como hidruro de sodio o un alcóxido de metal alcalino tal como *terc*-butóxido de potasio, en un disolvente inerte tal como tetrahidrofurano a una temperatura de 0 a 60 °C. Como alternativa, puede usarse un carbonato de metal alcalino tal como carbonato de potasio, o una base orgánica tal como una trialkilamina, por ejemplo trietilamina o *N,N*-diisopropiletilamina, en un disolvente inerte tal como acetona, a una temperatura de 0 °C a la temperatura de reflujo del disolvente. Cuando se usa un compuesto de fórmula (VII) tal como tetrafluoroborato de trimetiloxonio como agente alquilante, la base es preferiblemente un bicarbonato de metal alcalino tal como bicarbonato de sodio, el disolvente es por ejemplo diclorometano y la temperatura es de 0 °C a la temperatura de reflujo del disolvente.

50 **[0041]** Según un rasgo adicional de la presente invención, los compuestos de fórmula (I) en la que R¹ es C(=N-Z)-S-alkilo C₁-C₄, Z es como se define anteriormente con la exclusión de H y los demás valores son como se definen en la fórmula (I), pueden prepararse mediante la alquilación, acilación o sulfonilación del correspondiente compuesto de fórmula (I), en la que Z es H, con un compuesto de fórmula (VIII):

$$\text{Z-L}^4 \quad \text{(VIII)}$$

55 en la que Z es como se define anteriormente, con la exclusión de H, y L⁴ es un grupo saliente. Para alquilaciones, cuando Z es alkilo C₁-C₆, halogenoalkilo C₁-C₆, alqueno C₃-C₆, alquino C₃-C₆ o (CH₂)₆R⁷, L⁴ es preferiblemente halógeno, alquilsulfoniloxilo o arilsulfoniloxilo (más preferiblemente cloro, bromo, yodo, metilsulfoniloxilo o *p*-toluenosulfoniloxilo). Está opcionalmente presente una base en la reacción, que se efectúa generalmente en un disolvente inerte tal como tetrahidrofurano, dioxano, acetonitrilo, tolueno, dietiléter, diclorometano, dimetilsulfóxido o *N,N*-dimetilformamida, a una temperatura de -30 a 200 °C, preferiblemente a 20 a 100 °C. La base es generalmente un hidróxido de metal alcalino tal como hidróxido de potasio, un hidruro de metal alcalino tal como hidruro de sodio, un carbonato de metal alcalino tal como carbonato de potasio o carbonato de sodio, un alcóxido de metal alcalino tal como metóxido de sodio, un carbonato de metal alcalinotérreo tal como carbonato de calcio o una base orgánica tal como una amina terciaria, por ejemplo, trietilamina o etildiisopropilamina o piridina o 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno (DBU).

5 [0042] Para acilaciones, cuando Z es COR¹⁹ o CO₂-alquilo C₁-C₆, (VIII) es preferiblemente un haluro de ácido en que L⁴ es preferiblemente cloro o bromo (más preferiblemente cloro). Está opcionalmente presente una base en la reacción, que se efectúa generalmente usando bases, disolventes y temperaturas similares a las empleadas para las alquilaciones.

10 Para sulfonilaciones, cuando Z es SO₂R⁸, (VIII) es preferiblemente un haluro de sulfonilo en que L⁴ es preferiblemente cloro o bromo (más preferiblemente cloro). Está opcionalmente presente una base en la reacción, que se efectúa generalmente usando bases, disolventes y temperaturas similares a las empleadas para las alquilaciones.

15 [0043] Pueden prepararse también de manera paralela colecciones de compuestos de fórmula (I) que pueden sintetizarse mediante el proceso anteriormente mencionado, y esto puede efectuarse manualmente o de manera semiautomatizada o totalmente automatizada. En este caso, es posible automatizar, por ejemplo, el procedimiento de reacción, procesamiento o purificación de los productos o los intermedios. En total, ha de entenderse que esto significa un procedimiento como se describe, por ejemplo, por S.H. DeWitt en "Annual Reports in Combinatorial Chemistry and Molecular Diversity: Automated Synthesis", volumen 1, Verlag Escom 1997, páginas 69 a 77.

20 [0044] Pueden usarse una serie de aparatos comercialmente disponibles como se ofrecen, por ejemplo, por Stem Corporation, Woodrolfe Road, Tollesbury, Essex, CM9 8SE, Inglaterra o H+P Labortechnik GmbH, Bruckmannring 28, 85764 Oberschleißheim, Alemania o Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, Inglaterra, para el procedimiento de reacción y procesamiento paralelo. Para la purificación paralela de compuestos de fórmula (I), o los intermedios obtenidos durante la preparación, puede hacerse uso de, entre otros, aparatos de cromatografía, por ejemplo aquellos de ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, EE.UU.

25 [0045] Los aparatos mencionados conducen a un procedimiento modular en que las etapas de proceso individuales se automatizan, pero deben efectuarse operaciones manuales entre las etapas de proceso. Esto puede evitarse empleando sistemas de automatización semiintegrados o totalmente integrados en que los módulos de automatización en cuestión son accionados, por ejemplo, por robots. Dichos sistemas de automatización pueden obtenerse, por ejemplo, en Zymark Corporation, Zymark Center, Hopkinton, MA 01748, EE.UU.

30 [0046] Además de lo que se ha descrito aquí, los compuestos de fórmula (I) pueden prepararse en parte o totalmente mediante procedimientos soportados en fase sólida. Con este fin, se unen a una resina sintética etapas intermedias individuales o todas las etapas intermedias de la síntesis o de una síntesis adaptada para adecuarse al procedimiento en cuestión. Los procedimientos de síntesis soportada en fase sólida se describen extensamente en la bibliografía especializada, por ejemplo Barry A. Bunin en "The Combinatorial Index", Academic Press, 1998.

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

40 [0047] La preparación de los procesos descritos en la presente memoria procura compuestos de fórmula (I) en forma de colecciones de sustancias que se denominan bancos. La presente invención se refiere también a bancos que comprenden al menos dos compuestos de fórmula (I).

45 [0048] Según un rasgo adicional de la presente invención, se proporciona un procedimiento para el control de plagas en un lugar, en el que el lugar se selecciona de la plaga misma, un cultivo, lugar de crecimiento de cultivo, semilla, producto almacenado, artículo doméstico, propiedad o zona ambiental general, que comprende aplicar al mismo una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula (I) o una sal del mismo. Con este fin, dicho compuesto se usa normalmente en forma de una composición plaguicida (concretamente, en asociación con diluyentes o portadores y/o agentes tensioactivos compatibles adecuados para uso en composiciones plaguicidas), por ejemplo, como se describe de aquí en adelante en la presente memoria.

50 [0049] El término "compuesto de la invención" como se usa de aquí en adelante en la presente memoria abarca un alquilaminopirazol 5-sustituido de fórmula (I) como se define anteriormente y una sal plaguicidamente aceptable del mismo.

55 [0050] Es un aspecto de la presente invención como se define anteriormente un procedimiento para el control de plagas en un lugar. El lugar incluye, por ejemplo, la plaga misma, el sitio (planta, campo, bosque, huerto, canal, suelo, producto de planta o similar) donde la plaga reside o se alimenta o un sitio susceptible de futura infestación por la plaga. Por lo tanto, el compuesto de la invención puede aplicarse directamente a la plaga, al sitio donde la plaga reside o se alimenta o al sitio susceptible de futura infestación por la plaga.

5 **[0051]** Como resulta evidente por los usos plaguicidas anteriores, la presente invención proporciona compuestos plaguicidamente activos y procedimientos de uso de dichos compuestos para el control de una serie de especies de plagas que incluyen: artrópodos, especialmente insectos o ácaros, o nematodos de plantas. El compuesto de la invención puede emplearse por tanto ventajosamente en usos prácticos, por ejemplo, en cultivos agrícolas u hortícolas, en silvicultura, en medicina veterinaria o cría de ganado o en salud pública. Los compuestos de la invención pueden usarse, por ejemplo, en las siguientes aplicaciones y sobre las siguientes plagas: para el control de insectos de suelo, tales como gusano de la raíz del maíz, termitas (especialmente para la protección de estructuras), gusanos de raíces, gusanos de elatérico, gorgojos de las raíces, taladradores de tallos, gusanos cortadores, áfidos de las raíces o larvas. Pueden usarse también para proporcionar actividad frente a nematodos patogénicos de planta tales como nematodos de nódulos de raíz, quiste, daga, lesión o tallo o bulbo, o frente a ácaros. Para el control de plagas de suelo, por ejemplo, gusano de la raíz del maíz, los compuestos se aplican o incorporan ventajosamente a una tasa eficaz al suelo en que los cultivos se plantan o se van a plantar o a las semillas o raíces de plantas en crecimiento.

15 **[0052]** En el campo de la salud pública, los compuestos son especialmente útiles en el control de muchos insectos, especialmente moscas de la inmundicia u otras plagas de dípteros, tales como moscas comunes, moscas de establo, moscas soldado, moscas de los cuernos, moscas del venado, moscas de caballo, jejenes, chinches chupadoras, moscas negras o mosquitos.

20 **[0053]** En la protección de productos almacenados, por ejemplo cereales, incluyendo grano o harina, cacahuetes, piensos animales, artículos de madera o domésticos, por ejemplo, alfombras y textiles, los compuestos de la invención son útiles contra el ataque por artrópodos, más especialmente escarabajos, incluyendo gorgojos, polillas o ácaros, por ejemplo *Ephestia spp.* (polillas de harina), *Anthrenus spp.* (escarabajos de alfombra), *Tribolium spp.* (escarabajos de harina), *Sitophilus spp.* (gorgojos de grano) o *Acarus spp.* (ácaros).

25 En el control de cucarachas, hormigas o termitas o plagas de artrópodos similares en instalaciones domésticas o industriales o en el control de larvas de mosquito en canales, pozos, depósitos u otras aguas corrientes o estancadas.

30 Para el tratamiento de cimientos, estructuras o suelos en la prevención del ataque al edificio por termitas, por ejemplo, *Reticulitermes spp.*, *Heterotermes spp.*, *Coptotermes spp.*.

Además, se ha encontrado que los compuestos de la invención exhiben una alta acción insecticida contra insectos que destruyen materiales técnicos.

35 **[0054]** Se citan como ejemplos y preferiblemente, pero sin limitación, los siguientes insectos:

40 escarabajos tales como *Hylotrupes bajulus*, *Chlorophorus pilosis*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinus pecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Ernobius mollis*, *Priobium carpini*, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*, *Lyctus planicollis*, *Lyctus linearis*, *Lyctus pubescens*, *Trogoxylon aequale*, *Minthes rugicollis*, *Xyleborus spec.* *Tryptodendron spec.* *Apate monachus*, *Bostrychus capucins*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxylon spec.* *Dinoderus minutus*;

45 himenópteros tales como *Sirex juvencus*, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus*, *Urocerus augur*;

termitas tales como *Kaloterms flavicollis*, *Cryptotermes brevis*, *Heterotermes indicola*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes santonensis*, *Reticulitermes lucifugus*, *Mastotermes darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis*, *Coptotermes formosanus*;

50 lepismas tales como *Lepisma saccharina*.

55 **[0055]** Dentro del presente contexto, se entiende que materiales técnicos significa materiales no vivos tales como preferiblemente plásticos, adhesivos, colas, papel y cartón, cuero, madera, productos de fabricación de la madera y pinturas.

[0056] Al mismo tiempo, los compuestos de la invención pueden usarse para protección frente al incrustamiento de objetos, especialmente cascos de barcos, rejillas, redes, edificios, muelles e instalaciones de señalización que entran en contacto con agua salada o salobre.

60 **[0057]** Además, los compuestos de la invención pueden usarse en combinación con otros compuestos activos como agentes antiincrustación.

65 **[0058]** Los compuestos activos son adecuados para el control de plagas animales en el hogar, higiene y protección de almacenamiento, especialmente insectos, arácnidos y ácaros que aparecen en espacios cerrados tales como apartamentos, salas de fábricas, oficinas, cabinas de vehículos, etc. Pueden usarse solos o en

combinación con otros compuestos activos y auxiliares en productos insecticidas domésticos para el control de estas plagas. Son activos contra especies sensibles y resistentes así como contra todas las etapas de desarrollo. Estas plagas incluyen:

5 El orden *Scorpionidea*, por ejemplo, *Buthus occitanus*.

El orden *Acarina*, por ejemplo, *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Bryobia ssp.*, *Dermanyssus gallinae*, *Glyciphagus domesticus*, *Ornithodoros moubat*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Trombicula alfreddugesi*, *Neutrombicula autumnalis*, *Dermatophagoides pteronissimus*, *Dermatophagoides forinae*.

10 El orden *Araneae*, por ejemplo, *Aviculariidae*, *Araneidae*.

El orden *Opiliones*, por ejemplo, *Pseudoscorpiones chelifer*, *Pseudoscorpiones cheiridium*, *Opiliones phalangium*.

15 El orden *Isopoda*, por ejemplo, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*.

El orden *Diplopoda*, por ejemplo, *Blaniulus guttulatus*, *Polydesmus spp.*

20 El orden *Chilopoda*, por ejemplo, *Geophilus spp.*

El orden *Zygentoma*, por ejemplo, *Ctenolepisma spp.*, *Lepisma saccharina*, *Lepismodes inquilinus*.

25 El orden *Blattaria*, por ejemplo, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Blattella asahinai*, *Leucophaea maderae*, *Panchlora spp.*, *Parcoblatta spp.*, *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Supella longipalpa*.

El orden *Saltatoria*, por ejemplo, *Acheta domesticus*.

30 El orden *Dermaptera*, por ejemplo, *Forficula auricularia*.

El orden *Isoptera*, por ejemplo, *Kaloterms spp.*, *Reticuliterms spp.*

El orden *Psocoptera*, por ejemplo, *Lepinatus spp.*, *Liposcelis spp.*

35 El orden *Coleoptera*, por ejemplo, *Anthrenus spp.*, *Attagenus spp.*, *Dermestes spp.*, *Latheticus oryzae*, *Necrobia spp.*, *Ptinus spp.*, *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus granarius*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Stegobium paniceum*.

40 El orden *Diptera*, por ejemplo, *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes taeniorhynchus*, *Anopheles spp.*, *Calliphora erythrocephala*, *Chrysozona pluvialis*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*, *Drosophila spp.*, *Fannia canicularis*, *Musca domestica*, *Phlebotomus spp.*, *Sarcophaga camaria*, *Simulium spp.*, *Stomoxys calcitrans*, *Tipula paludosa*.

45 El orden *Lepidoptera*, por ejemplo, *Achroia grisella*, *Galleria mellonella*, *Plodia interpunctella*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*.

El orden *Siphonaptera*, por ejemplo, *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopis*.

50 El orden *Hymenoptera*, por ejemplo, *Camponotus herculeanus*, *Lasius fuliginosus*, *Lasius niger*, *Lasius umbratus*, *Monomorium pharaonis*, *Paravespula spp.*, *Tetramorium caespitum*.

El orden *Anoplura*, por ejemplo, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pemphigus spp.*, *Phylloera vastatrix*, *Phthirus pubis*.

55 El orden *Heteroptera*, por ejemplo, *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Rhodinus prolixus*, *Triatoma infestans*.

60 **[0059]** El uso en el sector insecticida doméstico se lleva a cabo solo o en combinación con otros compuestos activos adecuados tales como fosfatos, carbamatos, piretroides, neonicotinoides, reguladores del crecimiento o compuestos activos de otras clases conocidas de insecticidas.

65 **[0060]** El uso se lleva a cabo con aerosoles, agentes pulverizadores sin presión, por ejemplo, pulverizadores de bombeo y atomización, nebulizadores automáticos, nebulizadores, espumantes, geles, productos de evaporación con placas de evaporación de celulosa o plástico, evaporadores de líquido, evaporadores de gel y membrana, evaporadores accionados por propulsores, sistemas de evaporación sin energía o pasivos, papeles antipollas,

saquitos antipolillas y geles antipolillas, en forma de gránulos o polvos, en cebos dispersados o trampas con cebo.

5 **[0061]** En agricultura contra adultos, larvas y huevos de lepidópteros (mariposas y polillas), por ejemplo *Heliothis* spp. tal como *Heliothis virescens* (gusano cogollero del tabaco), *Heliothis armigera* y *Heliothis zea*. Contra adultos y larvas de coleópteros (escarabajos), por ejemplo *Anthonomus* spp. por ejemplo *grandis* (gorgojo del algodón), *Leptinotarsa decemlineata* (escarabajo de la patata), *Diabrotica* spp. (gusanos de la raíz del maíz). Contra heterópteros (hemípteros y homópteros) por ejemplo *Psylla* spp., *Bemisia* spp., *Trialeurodes* spp., *Aphis* spp., *Myzus* spp., *Megoura viciae*, *Phylloxera* spp., *Nephotettix* spp. (saltahojas del arroz), *Nilaparvata* spp. Contra dípteros, por ejemplo, *Musca* spp.. Contra tisanópteros tales como *Thrips tabaci*. Contra ortópteros tales como *Locusta* y *Schistocerca* spp., (langostas y grillos), por ejemplo, *Gryllus* spp. y *Acheta* spp., por ejemplo, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blatella germanica*, *Locusta migratoria migratorioides* y *Schistocerca gregaria*.

15 **[0062]** Contra colémbolos, por ejemplo, *Periplaneta* spp. y *Blatella* spp. (cucarachas). Contra artrópodos de importancia agrícola tales como *Acar* (ácaros), por ejemplo, *Tetranychus* spp. y *Panonychus* spp.. Contra nematodos que atacan plantas o árboles de importancia en agricultura, silvicultura u horticultura directamente o propagando enfermedades bacterianas, víricas, micoplasmáticas o fúngicas de las plantas. Por ejemplo, nematodos de nódulo de raíz tales como *Meloidogyne* spp. (por ejemplo, *M. incognita*).

20 **[0063]** En el campo de la medicina veterinaria o la cría de ganado o el mantenimiento de la salud pública, contra artrópodos que son parásitos internos o externos de vertebrados, particularmente vertebrados de sangre caliente, por ejemplo animales domésticos, por ejemplo, reses, ovejas, cabras, equinos, porcinos, aves de corral, perros o gatos, por ejemplo *Acarina*, incluyendo garrapatas (por ejemplo, garrapatas de cuerpo blando incluyendo *Argasidae* spp. por ejemplo *Argas* spp. y *Ornithodoros* spp. (por ejemplo, *Ornithodoros moubata*); garrapatas de cuerpo duro incluyendo *Ixodidae* spp., por ejemplo *Boophilus* spp. por ejemplo *Boophilus microplus*, *Rhipicephalus* spp. por ejemplo *Rhipicephalus appendiculatus* y *Rhipicephalus sanguineus*; ácaros (por ejemplo, *Damalinea* spp.); pulgas (por ejemplo, *Ctenocephalides* spp. por ejemplo *Ctenocephalides felis* (pulga de gato) y *Ctenocephalides canis* (pulga de perro)); piojos, por ejemplo *Menopon* spp.; dípteros (por ejemplo, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Musca* spp., *Hypoderma* spp.); hemípteros; dictiópteros (por ejemplo, *Periplaneta* spp., *Blatella* spp.); himenópteros; por ejemplo contra infecciones del tracto gastrointestinal causadas por gusanos nematodos parásitos, por ejemplo, miembros de la familia *Trichostrongylidae*.

30 **[0064]** En un aspecto preferido de la invención, los compuestos de fórmula (I) son para uso en el control de parásitos de animales. Preferiblemente, el animal es un animal de compañía doméstico tal como un perro o un gato.

35 **[0065]** Los parásitos para controlar incluyen, por ejemplo:

El orden *Anoplurida*, por ejemplo, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phthirus* spp., *Solenopotes* spp.

40 El orden *Mallophagida* y los subórdenes *Amblycerina* e *Ischnocerina*, por ejemplo, *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Wemeckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalinea* spp., *Trichodectes* spp., *Felicola* spp.

45 El orden *Diptera* y los subórdenes *Nematocera* y *Brachycera*, por ejemplo, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp., *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides* spp., *Chrysops* spp., *Hybomitra* spp., *Atylotus* spp., *Tabanus* spp., *Haematopota* spp., *Philipomyia* spp., *Braula* spp., *Musca* spp., *Hydrotaea* spp., *Stomoxys* spp., *Haematobia* spp., *Morellia* spp., *Fannia* spp., *Glossina* spp., *Calliphora* spp., *Lucilia* spp., *Chrysomyia* spp., *Wohlfahrtia* spp., *Sarcophaga* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Gasterophilus* spp., *Hippobosca* spp., *Lipoptena* spp., *Melophagus* spp.

50 El orden *Siphonaptera*, por ejemplo, *Pulex* spp., *Ctenocephalides* spp., *Xenopsylla* spp., *Ceratophyllus* spp.

El orden *Heteroptera*, por ejemplo, *Cimex* spp., *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp.

55 El orden *Blattaria*, por ejemplo, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blattella germanica*, *Supella* spp.

La subclase *Acar* (*Acarina*) y el orden *Metastigmata* y *Mesostigmata*, por ejemplo, *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., *Ixodes* spp., *Amblyomma* spp., *Boophilus* spp., *Dermacentor* spp., *Haemophysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Rhipicephalus* spp., *Dermanyssus* spp., *Raillietia* spp., *Pneumonyssus* spp., *Sternostoma* spp., *Varroa* spp.

60 El orden *Actiniedida* (*Prostigmata*) y *Acaridida* (*Astigmata*), por ejemplo, *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Ornithocheyletia* 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., *Laminosioptes* spp.

65 **[0066]** Los compuestos de la invención de estructura (I) son también adecuados para uso en el control de

5 artrópodos que afectan a animales agrícolas tales como reses, ovejas, cabras, caballos, cerdos, asnos, camellos, búfalos, conejos, pollos, pavos, patos, gansos, abejas, otros animales domésticos tales como perros, gatos, aves enjauladas, peces de acuario así como los denominados animales experimentales tales como hámsteres, conejillos de Indias, ratas y ratones. Al controlar estos artrópodos, se reducirán las tasas de muertes y la pérdida de rendimiento (de carne, leche, lana, piel, huevos, miel, etc.) de modo que sea posible una cría de animales más económica y sencilla mediante el uso de los compuestos de la invención.

10 **[0067]** El uso de los compuestos activos en el sector veterinario y la cría de animales se lleva a cabo por medios conocidos mediante administración entérica en forma de, por ejemplo, comprimidos, cápsulas, pociones, brebajes, gránulos, pastas, bolos, procedimiento con la alimentación, supositorios, mediante administración parenteral como, por ejemplo, mediante inyección (intramuscular, subcutánea, intravenosa, intraperitoneal, entre otras), implantes, mediante aplicación nasal, mediante administración dérmica en forma, por ejemplo, de inmersión, pulverización, unción dorsal continua y puntual, lavado, empolvado, así como con ayuda de aparatos que contienen el compuesto activo tales como collares, crotales, marcas en el rabo, brazaletes, ronzales, dispositivos de marcaje, etc.

15 **[0068]** Durante el uso en reses, aves de corral, animales domésticos, etc., los compuestos activos de estructura (I) pueden usarse como formulaciones (por ejemplo, polvos, emulsiones, agentes fluidos) que contienen los compuestos activos en una cantidad de 1 a 80 % en peso, directamente o después de dilución a 100 a 10.000 veces, o como baño químico.

20 **[0069]** En un aspecto adicional de la invención, los compuestos de fórmula (I) o sales o composiciones de los mismos se usan para la preparación de un medicamento veterinario.

25 **[0070]** Por tanto, un rasgo adicional de la invención se refiere a un compuesto de fórmula (I) o una sal del mismo o una composición del mismo, para uso en el control de plagas.

30 **[0071]** Las plagas anteriormente nombradas incluyen, por ejemplo: El orden *Anoplura* (*Phthiraptera*), por ejemplo, *Damalinia* spp., *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Trichodectes* spp.

35 **[0072]** La clase de *Arachnida*, por ejemplo, *Acarus siro*, *Aceria sheldoni*, *Aculops* spp., *Aculus* spp., *Amblyomma* spp., *Argas* spp., *Boophilus* spp., *Brevipalpus* spp., *Bryobia praetiosa*, *Chorioptes* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Eotetranychus* spp., *Epitimerus pyri*, *Eutetranychus* spp., *Eriophyes* spp., *Hemitarsonemus* spp., *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Latrodectus mactans*, *Metatetranychus* spp., *Oligonychus* spp., *Ornithodoros* spp., *Panonychus* spp., *Phyllocoptruta oleivora*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psoroptes* spp., *Rhipicephalus* spp., *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., *Scorpio maurus*, *Stenotarsonemus* spp., *Tarsonemus* spp., *Tetranychus* spp., *Vasates lycopersici*.

40 **[0073]** La clase de *Bivalva*, por ejemplo, *Dreissena* spp.

[0074] El orden *Chilopoda*, por ejemplo, *Geophilus* spp., *Scutigera* spp.

45 **[0075]** El orden *Coleoptera*, por ejemplo, *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus* spp., *Agelastica alni*, *Agriotes* spp., *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophoras* spp., *Anthonomus* spp., *Anthrenus* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp., *Attagenus* spp., *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., *Ceuthorhynchus* spp., *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp., *Costelytra zealandica*, *Curculio* spp., *Cryptorhynchus lapathi*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., *Epilachna* spp., *Faustinus cubae*, *Gibbium psylloides*, *Heteronychus arator*, *Hylamorpha elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypothenemus* spp., *Lachnosterna consanguinea*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lixus* spp., *Lyctus* spp., *Meligethes aeneus*, *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp., *Naupactus xanthographus*, *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllophaga* spp., *Popillia japonica*, *Premnotrypes* spp., *Psylliodes chrysocephala*, *Ptinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus* spp., *Sphenophorus* spp., *Sternechus* spp., *Symphyletes* spp., *Tenebrio molitor*, *Tribolium* spp., *Trogoderma* spp., *Tychius* spp., *Xylotrechus* spp., *Zabrus* spp.

50 **[0076]** El orden *Collembola*, por ejemplo, *Onychiurus armatus*.

[0077] El orden *Dermaptera*, por ejemplo, *Forficula auricularia*.

60 **[0078]** El orden *Diplopoda*, por ejemplo, *Blaniulus guttulatus*.

[0079] El orden *Diptera*, por ejemplo, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Bibio hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomyia* spp., *Cochliomyia* spp., *Cordylobia anthropophaga*, *Culex* spp., *Cuterebra* spp., *Dacus oleae*, *Dermatobia hominis*, *Drosophila* spp., *Fannia* spp., *Gastrophilus* spp., *Hylemyia* spp., *Hyppobosca* spp., *Hypoderma* spp., *Liriomyza* spp., *Lucilia* spp., *Musca* spp., *Nezara* spp., *Oestrus* spp., *Oscinella frit*, *Pegomyia*

hyoscyami, Phorbia spp., Stomoxys spp., Tabanus spp., Tannia spp., Tipula paludosa, Wohlfahrtia spp.

[0080] La clase de *Gastropoda*, por ejemplo, *Arion spp., Biomphalaria spp., Bulinus spp., Deroceras spp., Galba spp., Lymnaea spp., Oncomelania spp., Succinea spp.*

5 **[0081]** La clase de helmintos, por ejemplo, *Ancylostoma duodenale, Ancylostoma ceylanicum, Ancylostoma braziliensis, Ancylostoma spp., Ascaris lubricoides, Ascaris spp., Brugia malayi, Brugia timori, Bunostomum spp., Chabertia spp., Clonorchis spp., Cooperia spp., Dicrocoelium spp., Dictyocaulus filaria, Diphylobothrium latum, Dracunculus medinensis, Echinococcus granulosus, Echinococcus multilocularis, Enterobius vermicularis, Faciola spp., Haemonchus spp., Heterakis spp., Hymenolepis nana, Hyostrongylus spp., Loa Loa, Nematodirus spp., Oesophagostomum spp., Opisthorchis spp., Onchocerca volvulus, Ostertagia spp., Paragonimus spp., Schistosomen spp., Strongyloides fuelleborni, Strongyloides stercoralis, Strongyloides spp., Taenia saginata, Taenia solium, Trichinella spiralis, Trichinella nativa, Trichinella britovi, Trichinella nelsoni, Trichinella pseudopsiralis, Trichostrongylus spp., Trichuris trichuria, Wuchereria bancrofti.*

15 **[0082]** Además, pueden controlarse protozoos tales como *Eimeria*.

[0083] El orden *Heteroptera*, por ejemplo, *Anasa tristis, Antestiopsis spp., Blissus spp., Calocoris spp., Campylomma livida, Cavalerius spp., Cimex spp., Creontiades dilutus, Dasynus piperis, Dichelops furcatus, Diconocoris hewetti, Dysdercus spp., Euschistus spp., Eurygaster spp., Heliopeltis spp., Horcias nobilellus, Leptocoris spp., Leptoglossus phyllopus, Lygus spp., Macropes excavatus, Miridae, Nezara spp., Oebalus spp., Pentomidae, Piesma quadrata, Piezodorus spp., Psallus seriatus, Pseudacysta perseae, Rhodnius spp., Sahlbergella singularis, Scotinophora spp., Stephanitis nashi, Tibraca spp., Triatoma spp.*

25 **[0084]** El orden *Homoptera*, por ejemplo, *Acyrtosipon spp., Aeneolamia spp., Agonosцена spp., Aleurodes spp., Aleurolobus barodensis, Aleurothrixus spp., Amrasca spp., Anuraphis cardui, Aonidiella spp., Aphanostigma piri, Aphis spp., Arboridia apicalis, Aspidiella spp., Aspidiotus spp., Atanus spp., Aulacorthum solani, Bemisia spp., Brachycaudus helichrysi, Brachycolus spp., Brevicoryne brassicae, Calligypona marginata, Carneiocephala fulgida, Ceratovacuna lanigera, Cercopidae, Ceroplastes spp., Chaetosiphon fragaefolii, Chionaspis tegalensis, Chlorita onukii, Chromaphis juglandicola, Chrysomphalus ficus, Cicadulina mbila, Coccomytilus halli, Coccus spp., Cryptomyzus ribis, Dalbulus spp., Dialeurodes spp., Diaphorina spp., Diaspis spp., Doralis spp., Drosicha spp., Dysaphis spp., Dysmicoccus spp., Empoasca spp., Eriosoma spp., Erythroneura spp., Euscelis bilobatus, Geococcus coffeae, Homalodisca coagulata, Hyalopterus arundinis, Icerya spp., Idiocerus spp., Idioscopus spp., Laodelphax striatellus, Lecanium spp., Lepidosaphes spp., Lipaphis erysimi; Macrosiphum spp., Mahanarva fimbriolata, Melanaphis sacchari, Metcalfiella spp., Metopolophium dirhodum, Monellia costalis, Monelliopsis pecanis, Myzus spp., Nasonovia ribisnigri, Nephrotettix spp., Nilaparvata lugens, Oncometopia spp., Orthezia praelonga, Parabemisia myricae, Paratrioza spp., Parlatoria spp., Pemphigus spp., Peregrinus maidis, Phenacoccus spp., Phloeomyzus passerinii, Phorodon humuli, Phylloxera spp., Pinnaspis aspidistrae, Planococcus spp., Protopulvinaria pyriformis, Pseudaulacaspis pentagona, Pseudococcus spp., Psylla spp., Pteromalus spp., Pyrilla spp., Quadraspidiotus spp., Quesada gigas, Rastrococcus spp., Rhopalosiphum spp., Saissetia spp., Scaphoides titanus, Schizaphis graminum, Selenaspis articulatus, Sogata spp., Sogatella furcifera, Sogatodes spp., Stictocephala festina, Tenalaphara malayensis, Tinocallis caryaefoliae, Tomaspis spp., Toxoptera spp., Trialeurodes vaporariorum, Trioza spp., Typhlocyba spp., Unaspis spp., Viteus vitifolii.*

45 **[0085]** El orden *Hymenoptera*, por ejemplo, *Diprion. spp., Hoplocampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Vespa spp.*

[0086] El orden *Isopoda*, por ejemplo, *Armadillidium vulgare, Oniscus asellus, Porcellio scaber.*

50 **[0087]** El orden *Isoptera*, por ejemplo, *Reticulitermes spp., Odontotermes spp..*

[0088] El orden *Lepidoptera*, por ejemplo, *Acronicta major, Aedia leucomelas, Agrotis spp., Alabama argillacea, Anticarsia spp., Barathra brassicae, Bucculatrix thur beriella, Bupalus piniarius, Cacoecia podana, Capua reticulana, Carpocapsa pomonella, Cheimantobia brumata, Chilo spp., Choristoneura fumiferana, Clysia ambiguella, Cnaphalocerus spp., Earias insulana, Ephestia kuehniella, Euproctis chrysorrhoea, Euxoa spp., Feltia spp., Galleria mellonella, Helicoverpa spp., Heliothis spp., Hofmannophila pseudospretella, Homona magnanima, Hyponomeuta padella, Laphygma spp., Lithocolletis blancardella, Lithophane antennata, Loxagrotis albicosta, Lymantria spp., Malacosoma neustria, Mamestra brassicae, Mocis repanda, Mythimna separata, Oriia spp., Oulema oryzae, Panolis flammea, Pectinophora gossypiella, Phyllocnistis citrella, Pieris spp., Plutella xylostella, Prodenia spp., Pseudaletia spp., Pseudoplusia includens, Pyrausta nubilalis, Spodoptera spp., Thermesia gemmatalis, Tinea pellionella, Tineola bisselliella, Tortrix viridana, Trichoplusia spp.*

[0089] El orden *Orthoptera*, por ejemplo, *Acheta domesticus, Blatta orientalis, Blattella germanica, Gryllotalpa spp., Leucophaea maderae, Locusta spp., Melanoplus spp., Periplaneta americana, Schistocerca gregaria.*

65

- [0090] El orden *Siphonaptera*, por ejemplo, *Ceratophyllus spp.*, *Xenopsylla cheopis*.
- [0091] El orden *Symphyla*, por ejemplo, *Scutigera immaculata*.
- 5 [0092] El orden *Thysanoptera*, por ejemplo, *Baliothrips biformis*, *Enneothrips flavens*, *Frankliniella spp.*, *Heliothrips spp.*, *Hercinothrips femoralis*, *Kakothrips spp.*, *Rhipiphorothrips cruentatus*, *Scirtothrips spp.*, *Taeniothrips cardamoni*, *Thrips spp.*
- 10 [0093] El orden *Thysanura*, por ejemplo, *Lepisma saccharina*.
- [0094] Los nematodos parásitos de plantas incluyen, por ejemplo, *Anguina spp.*, *Aphelenchoides spp.*, *Belonoaimus spp.*, *Bursaphelenchus spp.*, *Ditylenchus dipsaci*, *Globodera spp.*, *Helicocotylenchus spp.*, *Heterodera spp.*, *Longidorus spp.*, *Meloidogyne spp.*, *Pratylenchus spp.*, *Radopholus similis*, *Rotylenchus spp.*, *Trichodorus spp.*, *Tylenchorhynchus spp.*, *Tylenchulus spp.*, *Tylenchulus semipenetrans*, *Xiphinema spp.*
- 15 [0095] Los compuestos de estructura (I) de la invención se caracterizan particularmente por una fuerte acción contra áfidos (por ejemplo, *Aphis gossypii* y *Myzus persicae*), larvas de escarabajo (por ejemplo, *Phaedon cochleariae*) y orugas de mariposa (por ejemplo, *Plutella xylostella*, *Spodoptera exigua* y *Spodoptera frugiperda*).
- 20 [0096] Los compuestos de la invención pueden usarse opcionalmente también en ciertas concentraciones o cantidades de aplicación como herbicidas, protectores, reguladores del crecimiento o agentes para mejorar las propiedades de las plantas, o como microbicidas, por ejemplo, como fungicidas, antimicóticos, bactericidas, viricidas (incluyendo agentes contra viroides) o como agentes contra MLO (organismo similar a micoplasma) y RLO (organismo similar a Rickettsia). Pueden usarse opcionalmente también como intermedios o precursores para la síntesis de compuestos activos adicionales.
- 25 [0097] Según la invención, pueden tratarse todas las plantas y partes de planta. Plantas se entiende que significa, en la presente memoria, todas las plantas y poblaciones de plantas tales como plantas silvestres deseadas y no deseadas o cultígenos (incluyendo cultígenos de aparición natural). Los cultígenos pueden ser plantas que pueden obtenerse mediante procedimientos de cultivo y optimización convencionales o mediante procedimientos biotecnológicos y de ingeniería genética o combinaciones de estos procedimientos, incluyendo las plantas transgénicas e incluyendo las variedades de plantas que son protegibles o no protegibles por el derecho de protección de variedades. Partes de planta se entiende que son todas las partes y órganos de la planta aéreos y subterráneos tales como vástago, hoja, flor y raíz, indicándose por ejemplo hojas, agujas, tallos, troncos, flores, cuerpos frutales, frutos y semillas, así como raíces, bulbos y rizomas. Pertenecen a las partes de planta también productos de cosecha, así como material de reproducción vegetativa y generativa, por ejemplo esquejes, bulbos, rizomas, brotes y semillas.
- 30 [0098] En el uso práctico para el control de artrópodos, especialmente insectos o ácaros o helmintos, especialmente nematodos plagas de plantas, un procedimiento comprende, por ejemplo, aplicar a las plantas o al medio en que crecen una cantidad eficaz de un compuesto de la invención. Para dicho procedimiento, el compuesto de la invención se aplica generalmente al lugar en que la infestación por artrópodos o nematodos ha de controlarse a una tasa eficaz en el intervalo de aproximadamente 2 g a aproximadamente 1 kg de compuesto activo por hectárea de lugar tratado. En condiciones ideales, dependiendo de la plaga para controlar, una tasa menor puede ofrecer una protección adecuada. Por otro lado, las condiciones meteorológicas adversas, la resistencia de la plaga u otros factores pueden requerir que el ingrediente activo se use a tasas mayores. La tasa óptima depende habitualmente de una serie de factores, por ejemplo, el tipo de plaga que se esté controlando, el tipo o etapa de crecimiento de la planta infestada, el espaciado de filas o también el procedimiento de aplicación. Preferiblemente, es un intervalo de tasa de compuesto activo eficaz de aproximadamente 10 g/ha a aproximadamente 400 g/ha, más preferiblemente de aproximadamente 50 g/ha a aproximadamente 200 g/ha. Cuando una plaga se transmite por el suelo, el compuesto activo se distribuye uniformemente por la zona para tratar (es decir, por ejemplo tratamiento de diseminación o por bandas) de cualquier manera conveniente, y se aplica a tasas de aproximadamente 10 g/ha a aproximadamente 400 g de ia/ha, preferiblemente de aproximadamente 50 g/ha a aproximadamente 200 g de ia/ha. Cuando se aplica como inoculante de raíz a vástagos o por irrigación por goteo a plantas, la disolución o suspensión líquida contiene de aproximadamente 0,075 a aproximadamente 1000 mg de ia/l, preferiblemente de aproximadamente 25 a aproximadamente 200 mg de ia/l. La aplicación puede realizarse, si se desea, en el campo o zona de crecimiento del cultivo generalmente, o en estrecha proximidad a la semilla o planta para proteger del ataque. El compuesto de la invención puede lavarse en el suelo mediante pulverización con agua sobre la zona o puede dejarse a la acción natural de la lluvia. Durante o después de la aplicación, el compuesto formulado puede, si se desea, distribuirse mecánicamente en el suelo, por ejemplo mediante arado, arado de disco o el uso de cadenas de arrastre. La aplicación puede ser antes de plantar, al plantar, después de plantar pero antes de tener lugar la germinación o después de la germinación.
- 35 [0099] El compuesto de la invención y los procedimientos de control de plagas con el mismo son particularmente valiosos para la protección de cultivos extensivos, forrajeros, de plantación, invernadero, huerto o
- 40
- 45
- 50
- 55
- 60
- 65

viñedo, de árboles ornamentales o de plantación o bosque, por ejemplo: cereales (tales como trigo o arroz), algodón, hortalizas (tales como pimientos), cultivos extensivos (tales como remolacha azucarera, soja o colza de semilla oleaginosa), cultivos de pradera o forrajeros (tales como maíz o sorgo), huertos o arboledas (tales como frutas o cítricos de hueso o pepita), plantas ornamentales, flores u hortalizas o matorrales en invernaderos o en jardines o parques, o árboles de bosque (tanto caducos como perennes) en bosques, plantaciones o viveros. Son también valiosos en la protección de madera (en pie, caída, convertida, almacenada o estructural) frente al ataque de, por ejemplo, moscas de sierra o escarabajos o termitas.

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

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

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

[0103] Los compuestos de fórmula (I) son particularmente útiles para el control de parásitos de animales cuando se aplican por vía oral, y en un aspecto preferido adicional de la invención, los compuestos de fórmula (I) son para uso en el control de parásitos de animales por aplicación oral. Los compuestos de fórmula (I) o sales de los mismos pueden administrarse antes, durante o después de las comidas. Los compuestos de fórmula (I) o sales de los mismos pueden mezclarse con un portador y/o alimento. El compuesto de fórmula (I) o sal del mismo se administra por vía oral al animal a una dosis en el intervalo de dosis de generalmente 0,1 a 500 mg/kg del compuesto de fórmula (I) o sal del mismo por kilogramo de peso corporal animal (mg/kg).

[0104] La frecuencia de tratamiento del animal, preferiblemente el animal doméstico para tratar por el compuesto de fórmula (I) o sal del mismo, es generalmente de aproximadamente una vez a la semana a aproximadamente una vez al año, preferiblemente de aproximadamente una vez cada dos semanas a una vez cada tres meses. Los compuestos de la invención pueden administrarse lo mas ventajosamente con otro material parasiticida eficaz, tal como un endoparasiticida y/o un ectoparasiticida y/o un endectoparasiticida. Por ejemplo, dichos compuestos incluyen lactonas macrocíclicas tales como avermectinas o milbemicinas, por ejemplo ivermectina, piratel o un regulador del crecimiento de insectos tal como lufenurón o metopreno.

[0105] Los compuestos de fórmula (I) pueden emplearse también para controlar organismos dañinos en cultivos de plantas genéticamente modificadas conocidas o plantas genéticamente modificadas por desarrollar todavía. Como norma, las plantas transgénicas se distinguen por propiedades especialmente ventajosas, por ejemplo resistencias a agentes de protección de cultivo particulares, resistencias a enfermedades de plantas o patógenos de enfermedades de plantas, tales como insectos o microorganismos particulares tales como hongos, bacterias o virus. Otras propiedades particulares se refieren, por ejemplo, al material cosechado con respecto a la cantidad, calidad, propiedades de almacenamiento, composición y constituyentes específicos. Por tanto, son conocidas plantas transgénicas en que el contenido de almidón está aumentado, o la calidad de almidón está

alterada, o en que el material cosechado tiene una composición diferente de ácidos grasos. Pertenecen a las plantas o variedades de plantas transgénicas preferidas según la invención para tratar (obtenidas por ingeniería genética) todas las plantas que mediante la modificación por ingeniería genética han recibido material genético que confiere a estas plantas propiedades valiosas especialmente ventajosas ("rasgos"). Son ejemplos de dichas propiedades mejor crecimiento de planta, tolerancia aumentada frente a temperaturas altas o bajas, tolerancia aumentada frente a la sequía o frente al contenido de sales de agua o suelo, rendimiento de floración mejorado, recolección facilitada, aceleramiento de la maduración, rendimientos de cosecha aumentados, calidad y/o valor nutritivo mejorados de la cosecha, mejor tiempo de almacenamiento y/o procesabilidad de la cosecha. Son ejemplos adicionales y especialmente destacados de dichas propiedades una defensa aumentada de las plantas frente a plagas animales y microbianas, como frente a insectos, ácaros, hongos, bacterias y/o virus fitopatógenos, así como una tolerancia aumentada de las plantas frente a ciertos herbicidas. Son ejemplos de dichas plantas transgénicas cultígenos importantes tales como cereales (trigo, arroz), maíz, soja, patata, remolacha azucarera, tomates, guisantes y otras variedades de hortalizas, algodón, tabaco, colza, así como plantas frutales (con los frutos manzanas, pera, frutos cítricos y uvas de vino), siendo especialmente destacadas maíz, soja, patata, algodón, tabaco y colza. Son propiedades ("rasgos") especialmente destacadas la tolerancia aumentada de las plantas frente a insectos, arácnidos, nematodos y gastrópodos mediante toxinas formadas en las plantas, especialmente aquellas que se producen en las plantas mediante el material genético de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo, mediante los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF, así como sus combinaciones) (de aquí en adelante conocidas como "plantas Bt"). Se destacan particularmente también como propiedades ("rasgos") la resistencia aumentada de las plantas frente a hongos, bacterias y virus mediante resistencia sistémica adquirida (SAR), sistemina, fitoalexinas, desencadenantes, así como genes de resistencia y las correspondientes proteínas y toxinas expresadas. Son propiedades particularmente destacadas ("rasgos") adicionales la tolerancia aumentada de las plantas frente a ciertos compuestos activos herbicidas, por ejemplo, imidazolinonas, sulfonilureas, glifosato o fosfinotricina (por ejemplo, gen "PAT"). Los genes que confieren las propiedades respectivamente deseadas ("rasgos") pueden aparecer también en combinaciones entre sí en las plantas transgénicas. Como ejemplos de "plantas Bt", se citan variedades de maíz, variedades de algodón, variedades de soja y variedades de patata, que se comercializan con las marcas comerciales YIELD GARD® (por ejemplo, maíz, algodón, soja), KnockOut® (por ejemplo, maíz), StarLink® (por ejemplo, maíz), Bollgard® (algodón), Nucotn® (algodón) y NewLeaf® (patata). Son ejemplos de plantas tolerantes a herbicidas variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja que se comercializan con las marcas comerciales Roundup Ready® (tolerancia frente a glifosato, por ejemplo, maíz, algodón, soja), Liberty Link® (tolerancia frente a fosfinotricina, por ejemplo, colza), IMI® (tolerancia frente a imidazolinonas) y STS® (tolerancia frente a sulfonilureas, por ejemplo, maíz). Se mencionan también como plantas resistentes a herbicidas (cultivadas convencionalmente con tolerancia a herbicidas) aquellas variedades comercializadas con el nombre Clearfield® (por ejemplo, maíz). Naturalmente, estas indicaciones se aplican también a las variedades de plantas desarrolladas o comercializadas en el futuro con estas u otras propiedades genéticas desarrolladas en el futuro ("rasgos").

[0106] Se prefiere el uso en cultivos transgénicos económicamente importantes de plantas útiles y ornamentales, por ejemplo, de cereales tales como trigo, cebada, centeno, avena, mijo, arroz, mandioca y maíz o también cultivos de remolacha azucarera, algodón, soja, colza de semilla oleaginosa, patatas, tomate, guisantes y otros tipos de hortalizas.

[0107] Cuando se usan en cultivos transgénicos, en particular aquellos que tienen resistencias a insectos, se observan frecuentemente efectos, además de los efectos contra organismos dañinos que se observan en otros cultivos, que son específicos de la aplicación al cultivo transgénico en cuestión, por ejemplo por un espectro alterado o específicamente ampliado de plagas que pueden controlarse, o tasas de aplicación alteradas que pueden emplearse para aplicación.

[0108] Por lo tanto, la invención se refiere también al uso de compuestos de fórmula (I) para controlar organismos dañinos en plantas de cultivo transgénicas.

[0109] Según un rasgo adicional de la presente invención, se proporciona una composición plaguicida que comprende uno o más compuestos de la invención como se definen anteriormente en asociación con, y preferiblemente dispersados homogéneamente en, uno o más diluyentes o portadores y/o agentes tensioactivos plaguicidamente aceptables compatibles [concretamente, diluyentes o portadores y/o agentes tensioactivos del tipo generalmente aceptado en la materia por ser adecuado para uso en composiciones plaguicidas y que son compatibles con los compuestos de la invención]. En la práctica, los compuestos de la invención forman lo más frecuentemente parte de composiciones. Estas composiciones son de uso en el control de artrópodos, especialmente insectos, o nematodos de planta o ácaros. Las composiciones pueden ser de cualquier tipo conocido en la materia adecuado para aplicación a la plaga deseada en cualquier instalación o zona interior o exterior. Estas composiciones contienen al menos un compuesto de la invención como ingrediente activo en combinación o asociación con uno o más de otros componentes compatibles que son, por ejemplo, portadores o diluyentes sólidos o líquidos, coadyuvantes, agentes tensioactivos o similares apropiados para el uso pretendido y que son agronómica o médicamente aceptables. Estas composiciones, que pueden prepararse de cualquier manera conocida en la materia, forman igualmente parte de esta invención. Los compuestos de la invención, en sus formulaciones

comercialmente disponibles y en las formas de uso preparadas a partir de estas formulaciones, pueden estar presentes en mezclas con otras sustancias activas tales como insecticidas, atractores, esterilizadores, acaricidas, nematocidas, fungicidas, sustancias reguladoras del crecimiento o herbicidas.

- 5 **[0110]** Los plaguicidas incluyen, por ejemplo, ésteres fosfóricos, carbamatos, ésteres carboxílicos, formamidas, compuestos de estaño y materiales producidos por microorganismos.

Fungicidas:

10 **[0111]**

Inhibidores de la síntesis de ácidos nucleicos

- 15 benalaxilo, benalaxilo-M, bupirimato, quiralaxilo, clozilación, dimetirimol, etirimol, furalaxilo, himexazol, metalaxilo-M, ofurace, oxadixilo, ácido oxolínico.

Inhibidores de la mitosis y la división celular

- 20 benomilo, carbendazima, dietofencarb, fuberidazol, pencicurón, tiabendazol, tiofanato-metilo, zoxamida.

Inhibidor del complejo respiratorio I

Diflumetorim.

- 25 Inhibidores del complejo respiratorio II

boscalida, carboxina, fenfuram, flutolanilo, furametpir, mepronilo, oxicarboxina, pentiopirad, tifluzamida.

Inhibidores del complejo respiratorio III

- 30 azoxistrobina, ciazofamida, dimoxistrobina, enestrobina, famoxadona, fenamidona, fluoxastrobina, cresoxim-metilo, metominostrobina, orisastrobina, piraclostrobina, picoxistrobina.

Desacoplantes

- 35 dinocap, fluazinam.

Inhibidores de la producción de ATP

- 40 acetato de fentina, cloruro de fentina, hidróxido de fentina, siltiofam.

Inhibidor de la biosíntesis de aminoácidos y proteínas

- 45 andoprim, blasticidina-S, ciprodinilo, kasugamicina, clorhidrato de kasugamicina hidratado, mepanipirim, pirimetanilo.

Inhibidores de la transducción de señal

feniclonilo, fludioxonilo, quinoxifeno.

- 50 Inhibidores de la síntesis de grasas y membrana

clozolinato, iprodiona, procimidona, vinclozolina,

- 55 ampropilfós, ampropilfós de potasio, edifenfós, iprobenfós (IBP), isoprotiolano, pirazofós,

tolclofós-metilo, bifenilo,

yodocarb, propamocarb, clorhidrato de propamocarb.

- 60 Inhibidores de la biosíntesis de ergosterol

fenhexamida,

- 65 azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, diclobutrazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M, epoxiconazol, etaconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, furconazol, furconazol-cis, hexaconazol,

- 5 imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanilo, paclobutrazol, penconazol, propiconazol, protioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefón, triadimenol, triticonazol, uniconazol, voriconazol, imazalilo, sulfato de imazalilo, oxpoconazol, fenarimol, flurprimidol, nuarimol, pirifenox, triforina, pefurazoato, procloraz, triflumizol, viniconazol,
- 5 aldimorf, dodemorf, acetato de dodemorf, fenpropimorf, tridemorf, fenpropidina, espiroxamina, naftifina, piributicarb, terbinafina.
- 10 Inhibidores de la síntesis de pared celular
bentiavalicarb, bialafós, dimetomorf, flumorf, iprovalicarb, polioxinas, polioxorim, validamicina A.
- Inhibidores de la biosíntesis de melanina
- 15 carpropamida, diclocimet, fenoxanilo, ftalida, piroquilona, triciclazol.
- Inducción de resistencia
- 20 acibenzolar-S-metilo, probenazol, tiadinilo.
- Multisitio
- 25 captafol, captán, clorotalonilo, sales de cobre: hidróxido de cobre, naftenato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre, óxido de cobre, oxina de cobre y mezcla Bordeaux, diclofluanida, ditianón, dodina, base libre de dodina, ferbam, fluorofolpet, folpet, guazatina, acetato de guazatina, iminoctadina, albesilato de iminoctadina, triacetato de iminoctadina, mancozeb, mancozeb, maneb, metiram, metiram de cinc, propineb, azufre y preparaciones de azufre, incluyendo polisulfuro de calcio, tiram, toliifluanida, zineb y ziram.
- 30 Mecanismo desconocido
- amibromdol, bentiazol, betoxazina, capsimicina, carvona, quinolinametionato, cloropicrina, cufraneb, ciflufenamida, cimoxanilo, dazomet, debacarb, diclomezina, diclorofeno, diclorán, difenzocuat, metilsulfato de difenzocuat, difenilamina, etaboxam, ferimzona, flumetover, flusulfamida, fluopicolida, fluoroimida, hexaclorobenceno, sulfato de 8-hidroxiquinolina, irumamicina, metasulfocarb, metrafenona, isotiocianato de metilo, mildiomicina, natamicina, dimetilditiocarbamato de níquel, nitrotal-isopropilo, octilina, oxamocarb, oxifentiina, pentaclorofenol y sales, 2-fenilfenol y sales, piperalina, propanosina de sodio, proquinazida, pirrolnitrina, quintozeno, tecloftalam, tecnazeno, triazóxido, triclamida, zarilamida y 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)piridina, *N*-(4-cloro-2-nitrofenil)-*N*-etil-4-metilbencenosulfonamida, 2-amino-4-metil-*N*-fenil-5-tiazolcarboxamida, 2-cloro-*N*-(2,3-dihidro-1,1,3-trimetil-1*H*-inden-4-il)-3-piridincarboxamida, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetilisoxazolidin-3-il]piridina, cis-1-(4-clorofenil)-2-(1*H*-1,2,4-triazol-1-il)cicloheptanol, 2,4-dihidro-5-metoxi-2-metil-4-[[[1-[3-(trifluorometil)fenil]etiliden]amino]oxi]metil]fenil]-3*H*-1,2,3-triazol-3-ona (185336-79-2), 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1*H*-inden-1-il)-1*H*-imidazol-5-carboxilato de metilo, 3,4,5-tricloro-2,6-piridindicarbonitrilo, 2-[[[ciclopropil[(4-metoxifenil)imino]metil]tio]metil]- α -(metoximetilen)bencenoacetato de metilo, 4-cloro- α -propinilo-*N*-[2-[3-metoxi-4-(2-propinilo)fenil]etil]bencenoacetamida, (2*S*)-*N*-[2-[4-[3-(4-clorofenil)-2-propinil]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(metilsulfonil)amino]butanamida, 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-*a*]pirimidina, 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-*N*-[(1*R*)-1,2,2-trimetilpropil][1,2,4]triazolo[1,5-*a*]pirimidin-7-amina, 5-cloro-*N*-[(1*R*)-1,2-dimetilpropil]-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-*a*]pirimidin-7-amina, *N*-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloronicotinamida, *N*-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)metil-2,4-dicloronicotinamida, 2-butoxi-6-yodo-3-propilbenzopiranon-4-ona, *N*-{(Z)-[(ciclopropilmetoxi)imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil}-2-benzoacetamida, *N*-(3-etil-3,5,5-trimetilciclohexil)-3-formilamino-2-hidroxibenzamida, 2-[[[1-[3-(1-fluoro-2-feniletil)oxi]fenil]etiliden]amino]oxi]metil]- α -(metoxiimino)-*N*-metil- α E-benzoacetamida, *N*-{2-[3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]etil}-2-(trifluorometil)benzamida, *N*-(3',4'-dicloro-5-fluorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1*H*-pirazol-4-carboxamida, *N*-(6-metoxi-3-piridinil)ciclopropanocarboxamida, ácido 1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil-1*H*-imidazol-1-carboxílico, ácido O-[1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil]-1*H*-imidazol-1-carbotioico, 2-(2-[[6-(3-cloro-2-metilfenoxi)-5-fluoropirimidin-4-il]oxi]fenil)-2-(metoxiimino)-*N*-metilacetamida.

Bactericidas:

- 60 **[0112]** bronopol, diclorofeno, nitrapirina, dimetilditiocarbamato de níquel, kasugamicina, octilina, ácido furanocarboxílico, oxitetraciclina, probenazol, estreptomina, tecloftalam, sulfato de cobre y otras preparaciones de cobre.

Insecticidas/acaricidas/nematicidas:**[0113]** Inhibidores de acetilcolina esterasa (AChE)

5 carbamatos,

por ejemplo, alanicarb, aldicarb, aldoxicarb, alixicarb, aminocarb, bendiocarb, benfuracarb, bufencarb, butacarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbarilo, carbofurano, carbosulfano, cloetocarb, dimetilán, etiofencarb, fenobucarb, fenotiocarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metam-sodio, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamilo, pirimicarb, promecarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, trimetacarb, XMC, xililcarb, triazamato;

10 organofosfatos,

15 por ejemplo, acefato, azametifós, azinfós (-metilo, etilo), aromofós-etilo, aromfenvinfós (-metilo), autatofós, cadusafós, carbofenotión, cloretoxifós, clorfenvinfós, clormefós, clorpirifós (-metilo/-etilo), cumafós, cianofenós, cianofós, clorfenvinfós, demetón-S-metilo, demetón-S-metilsulfona, dialifós, diazinona, diclofentión, diclorvós/DDVP, dicrotofós, dimetoato, dimetilvinfós, dioxabenzofós, disulfotón, EPN, etión, etoprofós, etrimfós, famfur, fenamifós, fenitrotión, fensulfotión, fentión, flupirazofós, fonofós, formotión, fosmetilano, fostiazato, heptenofós, yodofenós, iprobenfós, isazofós, isofenós, o-salicilato de isopropilo, isoxatión, malatión, mecarbam, metacrifós, metamidofós, metidatión, mevinfós, monocrotofós, naled, ometoato, oxidemetón-metilo, paratión (-metilo/-etilo), fentoato, forato, fosalona, fosmet, fosfamidona, fosfocarb, foxim, pirimifós (-metilo/etilo), profenofós, propafós, propetanfós, protiofós, protoato, piraclófós, piridafentión, piridatión, quinalfós, sebufós, sulfotep, sulprofós, tebupirimfós, temefós, terbufós, tetraclorvinfós, tiometón, triazofós, triclorfón, vamidotión.

25 **[0114]** Moduladores de canal de sodio/bloqueantes de canal de sodio dependientes del voltaje

piretroides,

30 por ejemplo, acrinatrina, aletrina (d-cis-trans, d-trans), beta-ciflutrina, bifentrina, bioaletrina, bioaletrina-s-ciclopentilo isomérico, bioetanometrina, biopermetrina, bioresmetrina, clovaportrina, cis-cipermetrina, cis-resmetrina, cis-permetrina, clocitrina, cicloprotrina, ciflutrina, cihalotrina, cipermetrina (α -, β -, θ -, ζ -), cifenotrina, DDT, deltametrina, empentrina (isómero 1R), esfenvalerato, etofenprox, fenflutrina, fenpropatrina, fenpiritrina, fenvalerato, flubrocitrinato, flucitrinato, flufenprox, flumetrina, fluvalinato, fubfenprox, γ -cihalotrina, imiprotrina, kadetrina, λ -cihalotrina, metoflutrina, permetrina (cis, trans), fenotrina (isómero 1R-trans), praletrina, proflutrina, protrifenbute, piresmetrina, resmetrina, RU 15525, silafluofeno, τ -fluvalinato, teflutrina, teraletrina, tetrametrina (isómero 1R), tralometrina, transflutrina, ZXI 8901, piretrinas (piretro).

DDT

40 oxadiazinas,

por ejemplo indoxacarb.

45 **[0115]** Agonistas/antagonistas de receptor de acetilcolina

cloronicotinilos,

por ejemplo acetamiprid, clotianidina, dinotefurán, imidacloprid, nitenpiram, nitiazina, tiacloprid, tiametoxam,

50 nicotina, bensultap, cartap.

[0116] Moduladores de receptor de acetilcolina

espinosinas,

55 por ejemplo espinosad.

[0117] Antagonistas de canal de cloruro controlado por GABA

60 organocloruros,

Por ejemplo, canfeclor, clordano, endosulfano, γ -HCH, HCH, heptaclor, lindano, metoxiclor;

fiproles,

65

por ejemplo acetoprol, etiprol, fipronil, vaniliprol.

[0118] Activadores de canal de cloruro

5 mectinas,

por ejemplo abamectina, avermectina, emamectina, benzoato de emamectina, ivermectina, milbemicina;

miméticos de hormona juvenil

10

por ejemplo, diofenolano, epofenonano, fenoxicarb, hidropreno, cinopreno, metopreno, piriproxifeno, tripreno.

[0119] Agonistas/alteradores de ecdisona

15 diacilhidrazinas

por ejemplo cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida, tebufenozida.

[0120] Inhibidores de la biosíntesis de quitina

20

benzoilureas

por ejemplo bistriflurón, clófluazurón, diflubenzurón, fluazurón, fluciclozurón, flufenoxurón, hexaflumurón, lufenurón, novalurón, noviflumurón, penflurón, teflubenzurón, triflumurón;

25

buprofezina

ciromazina.

30 **[0121]** Inhibidores de la fosforilación oxidativa, alteradores de ATP

diafentiurón

compuestos organoestánicos,

35

por ejemplo azociclotina, cihexatina, óxido de fenbutatina

[0122] Desacoplantes de la fosforilación oxidativa mediante interrupción de los gradientes de protón H

40 pirroles,

por ejemplo clorfenapir

dinitrofenoles,

45

por ejemplo binapacril, dinobutón, dinocap, DNOC.

[0123] Inhibidores del transporte de electrones del sitio I

50 METI,

por ejemplo fenazaquina, fenpiroximato, pirimidifén, piridabén, tebufenpirad, tolfenpirad;

hidrametilnona

55

dicofol.

[0124] Inhibidores del transporte de electrones del sitio II

60 rotenonas

[0125] Inhibidores del transporte de electrones del sitio III

acequinocilo, fluacipirim

65

- [0126]** Alteradores microbianos de la membrana intestinal de insectos
 cepas de *Bacillus thuringiensis*;
- 5 **[0127]** Inhibidores de la síntesis de grasas
 ácidos tetrónicos,
 por ejemplo espiroclifeno, espiromesifeno
 10 ácidos tetrámicos,
 por ejemplo, espirotetramat (nº de reg. CAS: 203313-25-1) y carbonato de 3-(2,5-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1-
 15 azaespiro[4,5]dec-3-en-4-iletilo (alias: éster 3-(2,5-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1-azaespiro[4.5]dec-3-en-4-iletílico del
 ácido carbónico, nº de reg. CAS: 382608-10-8)
 carboxamidas,
 por ejemplo flonicamida
 20 agonistas octopaminérgicos,
 por ejemplo amitraz.
- 25 **[0128]** Inhibidor de ATPasa estimulada con magnesio,
 propargita
 dicarboxamidas de ácido benzoico,
 30 por ejemplo, flubendiamida
 análogos de nereistoxina,
 35 por ejemplo hidrogenoxalato de tiociclám, tiosultap de sodio.
- [0129]** Agonistas del receptor de rianodina,
 dicarboxamidas de ácido benzoico,
 40 por ejemplo flubendiamida.
- [0130]** Productos biológicos, hormonas o feromonas
 45 azadiractina, *Bacillus spec.*, *Beauveria spec.*, codlemona, *Metarrhizium spec.*, *Paecilomyces spec.*, *thuringiensis*,
Verticillium spec.
- [0131]** Compuestos activos de modo de acción desconocido o inespecífico
 50 fumigadores
 por ejemplo fosfuro de aluminio, bromuro de metilo, fluoruro de sulfurilo
 inhibidores de la alimentación
 55 por ejemplo criolita, flonicamida, pimetrozina;
 inhibidores del crecimiento de ácaros,
 60 por ejemplo, clofentezina, etoxazol, hexitiazox, amidoflumet, benclotiaz, benzoximato, bifenazato, bromopropilato,
 buprofezina, quinometionato, clordimeform, clorobenzilato, cloropicrina, clotiazobeno, ciclopreno, ciflumetofeno,
 diciclanilo, fenoxacrim, fentripanilo, flubenzimina, flufenerim, flutenzina, Gossyplure, hidrametilnona, Japonilure,
 metoxadiazona, petróleo, butóxido de piperonilo, oleato de potasio, pirafluprol, piridalilo, piriprol, sulfluramida,
 tetradifón, tetrasul, triarateno, verbutín.
 65

[0132] Es también posible una mezcla con otros compuestos activos conocidos tales como herbicidas, fertilizantes, reguladores del crecimiento, protectores, semioquímicos o también con agentes para mejorar las propiedades de las plantas.

5 **[0133]** Los compuestos activos de la invención pueden estar también presentes en sus formulaciones comerciales normales cuando se usan como insecticidas, así como en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones, mezclados con sinergistas. Los sinergistas son compuestos mediante los que puede aumentarse la actividad del compuesto activo, sin que el sinergista añadido mismo deba ser activo.

10 **[0134]** Los compuestos activos de la invención pueden estar presentes además en sus formulaciones comerciales normales cuando se usan como insecticidas, así como en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones, mezclados con inhibidores que reducen la degradación del compuesto activo después del uso en el entorno de las plantas, sobre la superficie de la plantas o en los tejidos de planta.

15 **[0135]** Los componentes anteriormente mencionados para combinaciones son sustancias activas conocidas, muchas de la cuales se describen en Ch.R Worthing, S.B. Walker, "The Pesticide Manual", 12ª edición, British Crop Protection Council, Famham 2000.

20 **[0136]** Las dosis de uso eficaces de los compuestos empleados en la invención pueden variar dentro de amplios límites, particularmente dependiendo de la naturaleza de la plaga para eliminar o del grado de infestación, por ejemplo de cultivos, con estas plagas. En general, las composiciones según la invención contienen habitualmente de aproximadamente 0,05 a aproximadamente 95 % (en peso) de uno o más ingredientes activos según la invención, de aproximadamente 1 a aproximadamente 95 % de uno o más portadores sólidos o líquidos y, opcionalmente, de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 50 % de uno o más de otros componentes
25 compatibles, tales como agentes tensioactivos o similares. En el presente reporte, el término "portador" designa un ingrediente orgánico o inorgánico, natural o sintético, con que se combina el ingrediente activo para facilitar su aplicación, por ejemplo, a la planta, a las semillas o al suelo. Este portador es por lo tanto generalmente inerte y debe ser aceptable (por ejemplo, agronómicamente aceptable, particularmente para la planta tratada).

30 **[0137]** El portador puede ser un sólido, por ejemplo, arcillas, silicatos naturales o sintéticos, sílice, resinas, ceras, fertilizantes sólidos (por ejemplo sales de amonio), minerales naturales molidos, tales como caolines, arcillas, talco, creta, cuarzo, atapulgita, montmorillonita, bentonita o tierra de diatomeas, o minerales sintéticos molidos tales como sílice, alúmina o silicatos, especialmente silicatos de aluminio o magnesio. Son adecuados como portadores sólidos para gránulos los siguientes: rocas naturales trituradas o fraccionadas tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita y dolomita; gránulos sintéticos de harinas inorgánicas u orgánicas; gránulos de material orgánico
35 tales como serrín, cáscaras de coco, mazorcas de maíz, cáscaras de maíz o tallos de tabaco; tierra de diatomeas, fosfato tricálcico, corcho en polvo o negro de carbón absorbente; polímeros hidrosolubles, resinas; ceras o fertilizantes sólidos. Dichas composiciones sólidas pueden contener, si se desea, uno o más agentes humectantes, dispersantes, emulsionantes o colorantes compatibles que, cuando son sólidos, pueden servir también como diluyente.

[0138] Son adecuados como portadores sólidos, por ejemplo, sales de amonio y polvos minerales naturales tales como caolín, arcillas, talco, creta, cuarzo, atapulgita, montmorillonita o tierra de diatomeas y polvos minerales sintéticos tales como sílice de alta dispersión, óxido y silicatos de aluminio; son adecuados como portadores para
45 gránulos, por ejemplo, minerales naturales rotos y fraccionados tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita, así como gránulos sintéticos de polvos inorgánicos y orgánicos, así como gránulos de material orgánico tales como papel, serrín, cáscaras de coco, mazorcas de maíz y tallos de tabaco; son adecuados como agentes emulsionantes y/o espumantes, por ejemplo, agentes emulsionantes no ionogénicos y aniónicos tales como polioxietilénesteres de ácido graso, polioxietilénesteres de alcohol graso, por ejemplo, alquilarilpoliglicoléteres, sulfonatos de alquilo, sulfatos de alquilo, sulfonatos de arilo, así como hidrolizados de proteína; son adecuados como agentes de dispersión sustancias no iónicas y/o iónicas, por ejemplo, de las clases de aductos de alcohol-
50 POE- y/o POP-éter, ácido- y/o POP-POE-éster, alquilaril- y/o POP-POE-éter, grasa- y/o POP-POE, derivados de POE- y/o POP-poliol, aductos de POE- y/o POP-sorbitán o -azúcar, sulfatos, sulfonatos y fosfatos de alquilo o arilo, o los correspondientes aductos de PO-éter. Además, oligómeros o polímeros adecuados, por ejemplo, a partir de monómeros vinílicos, de ácido acrílico, de EO y/o de PO solos o en combinación con, por ejemplo, (poli)alcoholes o (poli)aminas. Además, puede usarse lignina y sus derivados de ácido sulfónico, celulosas sencillas y modificadas, ácidos sulfónicos aromáticos y/o alifáticos, así como sus aductos con formaldehído.

60 **[0139]** Pueden usarse en las formulaciones formadores de depósitos tales como carboximetilcelulosa, polímeros naturales y sintéticos en forma de polvo, grano o látex, tales como goma arábiga, poli(alcohol vinílico), poli(acetato de vinilo), así como fosfolípidos naturales como cefalinas y lecitinas y fosfolípidos sintéticos.

[0140] El portador puede ser también líquido, por ejemplo: agua, alcoholes, particularmente butanol o glicol, así como sus éteres o ésteres, particularmente acetato de metilglicol; cetonas, particularmente acetona, ciclohexanona, metiltilcetona, metilisobutilcetona o isoforona; fracciones del petróleo tales como hidrocarburos
65

parafínicos o aromáticos, particularmente xilenos o alquilnaftalenos; aceites minerales o vegetales; hidrocarburos alifáticos clorados, particularmente tricloroetano o cloruro de metileno; hidrocarburos aromáticos clorados, particularmente clorobencenos; disolventes hidrosolubles o fuertemente polares tales como dimetilformamida, dimetilsulfóxido o *N*-metilpirrolidona; gases licuados o similares o una mezcla de los mismos.

5
10
15
20
[0141] El agente tensioactivo puede ser un agente emulsionante, agente dispersante o agente humectante de tipo iónico o no iónico o una mezcla de dichos agentes tensioactivos. Entre estos están, por ejemplo, sales de ácidos poliacrílicos, sales de ácidos lignosulfónicos, sales de ácidos fenolsulfónicos o naftalenosulfónicos, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o ácidos grasos o ésteres grasos o aminas grasas, fenoles sustituidos (particularmente alquilfenoles o arilfenoles), sales de ésteres de ácido sulfosuccínico, derivados de taurina (particularmente alquiltauratos), ésteres fosfóricos de alcoholes o de policondensados de óxido de etileno con fenoles, ésteres de ácidos grasos con polioles, o derivados funcionales de sulfato, sulfonato o fosfato de los compuestos anteriores. La presencia de al menos un agente tensioactivo es generalmente esencial cuando el ingrediente activo y/o el portador son solo ligeramente hidrosolubles o no son hidrosolubles y el agente portador de la composición para aplicación es agua. Las composiciones de la invención pueden contener adicionalmente otros aditivos tales como adhesivos o colorantes. Pueden usarse en las formulaciones adhesivos tales como carboximetilcelulosa o polímeros naturales o sintéticos en forma de polvos, gránulos o látex, tales como goma arábiga, polivinilalcohol o poli(acetato de vinilo), fosfolípidos naturales tales como cefalinas o lecitinas o fosfolípidos sintéticos. Es posible usar colorantes tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo: óxidos de hierro, óxidos de titanio o azul de Prusia; tintes orgánicos tales como tintes de alizarina, tintes azoicos o tintes de ftalocianina metálica u oligonutrientes tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno o cinc.

25
30
[0142] Para su aplicación agrícola, los compuestos de la invención están generalmente por lo tanto en forma de composiciones, que están en diversas formas sólidas o líquidas. Son formas sólidas de composiciones que pueden usarse polvos para espolvoreo (con un contenido del compuesto de la invención en el intervalo de hasta 80 %), polvos o gránulos humectables (incluyendo gránulos dispersables en agua), particularmente aquellos obtenidos mediante extrusión, compactación o impregnación de un portador granular, o granulación a partir de un polvo (siendo el contenido del compuesto de la invención, en estos polvos o gránulos humectables, entre aproximadamente 0,5 y aproximadamente 80 %). Pueden usarse composiciones sólidas homogéneas o heterogéneas que contienen uno o más compuestos de la invención, por ejemplo, gránulos, aglomerados, briquetas o cápsulas, para tratar aguas estancadas o corrientes durante un periodo de tiempo. Puede alcanzarse un efecto similar usando alimentaciones continuas o intermitentes de concentrados dispersables en agua como se describe en la presente memoria.

35
40
[0143] Las composiciones líquidas incluyen, por ejemplo, disoluciones o suspensiones no acuosas (tales como concentrados emulsionables, emulsiones, fluidos, dispersiones o disoluciones) o aerosoles. Las composiciones líquidas incluyen también, en particular, concentrados emulsionables, dispersiones, emulsiones, fluidos, aerosoles, polvos humectables (o polvo para pulverizar), fluidos secos o pastas como formas de composiciones que son líquidas o se pretende que formen composiciones líquidas cuando se aplican, por ejemplo, como pulverizadores acuosos (incluyendo de volumen bajo y ultrabajo) o como nieblas o aerosoles.

45
50
[0144] Las composiciones líquidas, por ejemplo en forma de concentrados emulsionables o solubles, comprenden lo más frecuentemente de aproximadamente 5 a aproximadamente 80 % en peso del ingrediente activo, mientras que las emulsiones o disoluciones que están listas para aplicación contienen, en su caso, de aproximadamente 0,01 a aproximadamente 20 % del ingrediente activo. Además del disolvente, los concentrados emulsionables o solubles pueden contener, cuando sea necesario, de aproximadamente 2 a aproximadamente 50 % de aditivos adecuados tales como estabilizantes, agentes tensioactivos, agentes penetrantes, inhibidores de la corrosión, colorantes o adhesivos. Pueden obtenerse emulsiones de cualquier concentración requerida, que son particularmente adecuadas para aplicación, por ejemplo, a plantas, a partir de estos concentrados mediante dilución con agua. Estas composiciones se incluyen dentro del alcance de las composiciones que pueden emplearse en la presente invención. Las emulsiones pueden estar en forma de tipo agua en aceite o aceite en agua y pueden tener una consistencia densa.

55
[0145] Las composiciones líquidas de esta invención pueden usarse, además de en aplicaciones de uso agrícola normales, por ejemplo para tratar sustratos o sitios infestados o susceptibles de infestación por artrópodos (u otras plagas controladas por compuestos de esta invención) incluyendo instalaciones, zonas de almacenamiento o procesamiento exteriores o interiores, depósitos o equipos o aguas estancadas o corrientes.

60
65
[0146] Todas estas dispersiones o emulsiones o mezclas de pulverización acuosas pueden aplicarse, por ejemplo, a cultivos por cualquier medio adecuado, principalmente mediante pulverización, a tasas que son generalmente del orden de aproximadamente 100 a aproximadamente 1.200 l de mezcla de pulverización por hectárea, pero pueden ser mayores o menores (por ejemplo, de volumen bajo o ultrabajo) dependiendo de la necesidad o de la técnica de aplicación. El compuesto o composiciones según la invención se aplican convenientemente a la vegetación, y en particular a las raíces u hojas, que tiene plagas para eliminar. Otro procedimiento de aplicación de los compuestos o composiciones según la invención es mediante quimigación, es

decir, la adición de una formulación que contiene el ingrediente activo al agua de irrigación. Esta irrigación puede ser irrigación por aspersión para plaguicidas foliares o puede ser irrigación de terreno o irrigación subterránea para suelo o para plaguicidas sistémicos.

5 **[0147]** Las suspensiones concentradas, que pueden aplicarse por pulverización, se preparan para producir un producto fluido estable que no sedimente (molido fino) y contienen habitualmente de aproximadamente 10 a aproximadamente 75 % en peso del ingrediente activo, de aproximadamente 0,5 a aproximadamente 30 % de agentes tensioactivos, de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 10 % de agentes tixotrópicos, de aproximadamente 0 a aproximadamente 30 % de aditivos adecuados, tales como agentes antiespumantes, inhibidores de la corrosión, estabilizantes, agentes penetrantes, adhesivos y, como portador, agua o un líquido orgánico en que el ingrediente activo sea poco soluble o insoluble. Pueden disolverse algunos sólidos orgánicos o sales inorgánicas en el portador para ayudar a evitar la sedimentación o como anticongelantes para el agua.

15 **[0148]** Los polvos humectables (o polvo para pulverización) se preparan habitualmente de modo que contengan de aproximadamente 10 a aproximadamente 80 % en peso de ingrediente activo, de aproximadamente 20 a aproximadamente 90 % de un portador sólido, de aproximadamente 0 a aproximadamente 5 % de un agente humectante, de aproximadamente 3 a aproximadamente 10 % de un agente dispersante y, cuando sea necesario, de aproximadamente 0 a aproximadamente 80 % de uno o más estabilizantes y/u otros aditivos tales como agentes penetrantes, adhesivos, agentes antiapelmazantes, colorantes o similares. Para obtener estos polvos humectables, se mezcla concienzudamente el ingrediente activo en un mezclador adecuado con sustancias adicionales, que pueden estar impregnadas en la carga porosa, y se muele usando un molino u otro triturador adecuado. Esto produce polvos humectables cuyas humectabilidad y suspensibilidad son ventajosas. Pueden suspenderse en agua dando cualquier concentración deseada, y esta suspensión puede emplearse muy ventajosamente en particular para aplicación a follaje de plantas.

25 **[0149]** Los "gránulos dispersables en agua (WG)" (gránulos que son fácilmente dispersables en agua) tienen composiciones que son sustancialmente cercanas a las de los polvos humectables. Pueden prepararse mediante granulación de formulaciones descritas para los polvos humectables, por vía húmeda (poner en contacto ingrediente activo finamente dividido con la carga inerte y un poco de agua, por ejemplo, de 1 a 20 % en peso, o con una disolución acuosa de un agente dispersante o aglutinante, seguido de secado y tamizado), o por vía seca (compactación seguida de molienda y tamizado).

35 **[0150]** Las tasas y concentraciones de las composiciones formuladas pueden variar según el procedimiento de aplicación o la naturaleza de las composiciones o el uso de las mismas. Hablando en general, las composiciones para aplicación al control de plagas de artrópodos o nematodos de plantas contienen habitualmente de aproximadamente 0,00001 a aproximadamente 95 %, más particularmente de aproximadamente 0,0005 a aproximadamente 50 % en peso de uno o más compuestos de la invención, o de los ingredientes activos totales (es decir, los compuestos de la invención junto con otras sustancias tóxicas para los artrópodos o nematodos de plantas, sinergistas, oligoelementos o estabilizantes). Las composiciones reales empleadas y su tasa de aplicación se seleccionarán para alcanzar el efecto o efectos deseados por el granjero, criador de ganado, médico o veterinario, operario de control de plagas u otro especialista en la materia.

45 **[0151]** Las composiciones sólidas o líquidas para aplicación tópica a animales, madera, productos almacenados o artículos domésticos contienen habitualmente de aproximadamente 0,00005 a aproximadamente 90 %, más particularmente de aproximadamente 0,001 a aproximadamente 10 % en peso de uno o más compuestos de la invención. Para administración a animales por vía oral o parenteral, incluyendo percutánea, de composiciones sólidas o líquidas, estas contienen normalmente de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 90 % en peso de uno o más compuestos de la invención.

50 **[0152]** Los alimentos medicados contienen normalmente de aproximadamente 0,001 a aproximadamente 3 % en peso de uno o más compuestos de la invención. Los concentrados o suplementos para mezcla con alimentos contienen normalmente de aproximadamente 5 a aproximadamente 90 %, preferiblemente de aproximadamente 5 a aproximadamente 50 % en peso de uno o más compuestos de la invención. Los bloques de sal mineral contienen normalmente de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 10 % en peso de uno o más compuestos de fórmula (I) o sales plaguicidamente aceptables de los mismos.

55 **[0153]** Los polvos o composiciones líquidas para aplicación a ganado, artículos, instalaciones o zonas exteriores pueden contener de aproximadamente 0,0001 a aproximadamente 15 %, más especialmente de aproximadamente 0,005 a aproximadamente 2,0 % en peso de uno o más compuestos de la invención.

60 **[0154]** Las concentraciones adecuadas en aguas tratadas están entre aproximadamente 0,0001 y aproximadamente 20 ppm, más particularmente de aproximadamente 0,001 a aproximadamente 5,0 ppm de uno o más compuestos de la invención, y pueden usarse terapéuticamente en piscicultura con tiempos de exposición apropiados. Los cebos comestibles pueden contener de aproximadamente 0,01 a aproximadamente 5 %, preferiblemente de aproximadamente 0,01 a aproximadamente 1,0 % en peso de uno o más compuestos de la

65

invención.

5 **[0155]** Cuando se administran a vertebrados por vía parenteral, oral o percutánea u otros medios, la dosificación de compuestos de la invención dependerá de la especie, edad o salud del vertebrado y de la naturaleza y grado de su infestación real o potencial por plagas de artrópodos o helmintos. Es generalmente adecuada para administración oral o parenteral una sola dosis de aproximadamente 0,01 a aproximadamente 100 mg, preferiblemente de aproximadamente 2,0 a aproximadamente 20,0 mg por kg de peso corporal del animal o dosis de aproximadamente 0,01 a aproximadamente 20,0 mg, preferiblemente de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 5,0 mg por kg de peso corporal del animal al día, para una medicación prolongada. Mediante el uso de formulaciones o dispositivos de liberación prolongada, las dosis diarias requeridas durante un periodo de meses pueden combinarse y administrarse a los animales en una sola ocasión.

15 **[0156]** Las siguientes composiciones A-M (A-M comp.) ilustran composiciones para uso contra artrópodos, especialmente ácaros o insectos, o nematodos de plantas, que comprenden, como ingrediente activo, compuestos de la invención, por ejemplo, tales como aquellos descritos en los ejemplos preparativos. Las composiciones descritas en A-M comp. pueden diluirse cada una, dando una composición pulverizable a concentraciones adecuadas para uso en el campo.

20 **[0157]** Las descripciones químicas genéricas de los ingredientes (para los que todos los porcentajes siguientes son porcentajes en peso) usados en la composición de A-M ejemplificados a continuación son como sigue:

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

25 Composición A

[0158] Se prepara un concentrado hidrosoluble con la composición siguiente:

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

30 **[0159]** Se añade a una disolución de Ethylan BCP disuelto en una porción de N-metilpirrolidona el ingrediente activo con calentamiento y agitación hasta disolución. Se completa la disolución resultante hasta el volumen con el resto del disolvente.

[0160] Composición B

35 **[0161]** Se prepara un concentrado emulsionable (EC) con la composición siguiente:

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

40 **[0162]** Se disuelven los tres primeros componentes en N-metilpirrolidona y se añade entonces a esto Solvesso 150, dando el volumen final.

Composición C

[0163] Se prepara un polvo humectable (WP) con la composición siguiente:

ES 2 454 690 T3

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

5 **[0164]** Se mezclan los ingredientes y se muelen en un molino de martillos hasta un polvo con un tamaño de partícula de menos de 50 µm.

Composición D

[0165] Se prepara una formulación fluida acuosa con la composición siguiente:

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

10 **[0166]** Se mezclan estrechamente los ingredientes y se muelen en un molino de perlas hasta obtener un tamaño medio de partícula de menos de 3 µm.

Composición E

15 **[0167]** Se prepara un concentrado en suspensión emulsionable con la composición siguiente:

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

20 **[0168]** Se mezclan estrechamente los ingredientes y se muelen en un molino de perlas hasta obtener un tamaño medio de partícula de menos de 3 µm.

Composición F

25 **[0169]** Se prepara un gránulo dispersable en agua con la composición siguiente:

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

30 **[0170]** Se mezclan los ingredientes, se micronizan en un molino de energía fluida y se granulan entonces en un granulador giratorio pulverizando con agua (hasta 10 %). Se secan los gránulos resultantes en un secador de lecho fluido para retirar el exceso de agua.

Composición G

[0171] Se prepara un polvo para espolvoreo con la composición siguiente:

Ingrediente activo	1 a 10 %
Polvo de talco superfino	99 a 90 %

35 **[0172]** Se mezclan estrechamente los ingredientes y se muelen adicionalmente lo necesario para alcanzar un polvo fino. Este polvo puede aplicarse a un lugar de infestación de artrópodos, por ejemplo, vertederos, productos almacenados o artículos domésticos o animales infestados, o con riesgo de infestación, por artrópodos para controlar los artrópodos por ingestión oral. Los medios adecuados para distribuir el polvo para espolvoreo en el lugar de infestación por artrópodos incluyen sopladores mecánicos, dispersores manuales o dispositivos de autotratamiento de ganado.

Composición H

45 **[0173]** Se prepara un cebo comestible con la composición siguiente:

ES 2 454 690 T3

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

5 **[0174]** Se mezclan estrechamente los ingredientes y se conforman como se requiera en forma de cebo. Este cebo comestible puede distribuirse en un lugar, por ejemplo instalaciones domésticas o industriales, por ejemplo cocinas, hospitales o almacenes, o zonas exteriores, infestadas por artrópodos, por ejemplo hormigas, langostas, cucarachas o moscas, para controlar los artrópodos por ingestión oral.

Composición I

10 **[0175]** Se prepara una formulación en disolución con la composición siguiente:

Ingrediente activo	15 %
Dimetilsulfóxido	85 %

15 **[0176]** Se disuelve el ingrediente activo en dimetilsulfóxido con mezclado y/o calentamiento según se requiera. Esta disolución puede aplicarse por vía percutánea como aplicación de unción dorsal continua a animales domésticos infestados por artrópodos o, después de esterilización por filtración a través de una membrana de politetrafluoroetileno (0,22 µm de tamaño de poro), mediante inyección parenteral a una tasa de aplicación de 1,2 a 12 ml de disolución por 100 kg de peso corporal animal.

Composición J

20

[0177] Se prepara un polvo humectable con la composición siguiente:

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

25 **[0178]** Se absorbe el Ethylan BCP sobre el Aerosil, que se mezcla entonces con los demás ingredientes y se muele en un molino de martillos, dando un polvo humectable que puede diluirse con agua a una concentración de 0,001 a 2 % en peso del compuesto activo y aplicarse a un lugar de infestación por artrópodos, por ejemplo, larvas de díptero o nematodos de planta mediante pulverización, o a animales domésticos infestados, o con riesgo de infestación, por artrópodos mediante pulverización o inmersión, o mediante administración oral a agua de bebida, para controlar los artrópodos.

30

Composición K

35 **[0179]** Se forma una composición de bolo de liberación lenta a partir de gránulos que contienen los siguientes componentes en porcentajes variables (similar a aquellos descritos para las composiciones previas) dependiendo de la necesidad:

Ingrediente activo	
Agente densificador	
Agente de liberación lenta	
Aglutinante	

40 **[0180]** Se conforman los ingredientes mezclados estrechamente en gránulos, que se comprimen en un bolo de densidad relativa de 2 o más. Este puede administrarse por vía oral a animales domésticos rumiantes para retención en el reticulorumen, dando una liberación lenta continua del compuesto activo durante un periodo prolongado de tiempo para controlar la infestación de animales domésticos rumiantes por artrópodos.

Composición L

45 **[0181]** Puede prepararse una composición de liberación lenta en forma de gránulos, aglomerados, briquetas o similares con las composiciones siguientes:

Ingrediente activo	de 0,5 a 25 %
Poli(cloruro de vinilo)	de 75 a 99,9 %
Ftalato de dioctilo (plastificante)	

[0182] Se combinan los componentes y se conforman entonces en formas adecuadas por extrusión en estado

fundido o por moldeo. Estas composiciones son útiles, por ejemplo, para adición a agua estancada o para fabricación de collares o crotales para fijación a animales domésticos para controlar plagas por liberación lenta.

Composición M

5

[0183] Se prepara un gránulo dispersable en agua con la composición siguiente:

Ingrediente activo	85% (máx)
Polivinilpirrolidona	5%
Arcilla de atapulgita	6%
Laurilsulfato de sodio	2%
Glicerina	2%

10 **[0184]** Se mezclan los ingredientes en forma de una suspensión densa al 45% con agua, se muelen en húmedo hasta un tamaño de partícula de 4 µm y se secan entonces por pulverización para retirar el agua.

Ejemplos químicos

15 **[0185]** Se realizaron los espectros de RMN en deuterocloroformo a menos que se afirme otra cosa, y los desplazamientos químicos se dan en ppm.

[0186] En los ejemplos siguientes, las cantidades (también porcentajes) son en peso, a menos que se afirme otra cosa.

20 Ejemplo de referencia 1

1-[2,6-Dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-5-[(2,3-dihidroxipropil)(metil)amino]-4-[(trifluorometil)sulfonil]-1H-pirazol-3-carbonitrilo

25 **[0187]** Se añadió 3-metilamino-1,2-propanodiol (2,68 g, 25,5 mmol) a una mezcla de 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-5-bromo-4-trifluorometilsulfonilpirazol (6,00 g, 11,6 mmol) en THF (20 ml). Se calentó la mezcla a reflujo durante 6 h. El procesamiento extractivo (heptano-acetato de etilo, agua) y recristalización con heptano-acetato de etilo dieron el producto del título (compuesto 01-03, 3,40 g) en forma de un sólido blanco; RMN-¹H: 2,88 y 2,98 (NCH₂), 3,05 (NMe), 3,35 y 3,60 (CH₂O), 3,92 (CHO), 7,84 (ArH) ppm; RMN-¹⁹F: -64,2 (PhCF₃); -78,9 ppm (SO₂CF₃).

30

Ejemplo 2

35 Diacetato de 3-[(3-ciano-1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-4-[(trifluorometil)sulfonil]-1H-pirazol-5-il)(metil)amino]propano-1,2-diilo

40 **[0188]** Se añadieron acetanhidruro (75 mg, 0,7 mmol) y DMAP (14 mg, 0,1 mmol) a una mezcla de 1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-5-[(2,3-dihidroxipropil)(metil)amino]-4-[(trifluorometil)sulfonil]-1H-pirazol-3-carbonitrilo (0,20 g, 0,4 mmol) en THF (4 ml). Se calentó la mezcla a reflujo durante 5 h. El procesamiento extractivo (heptano-acetato de etilo, agua) dio el producto del título (compuesto 02-06, 0,20 g) en forma de un aceite; RMN-¹H: 1,98 y 2,08 (COCH₃), 3,05 (NMe), 3,05 y 3,15 (NCH₂), 3,88 y 4,16 (CH₂O), 5,11 (CHO), 7,85 (ArH) ppm; RMN-¹⁹F: -64,2 (PhCF₃); -79,5 ppm (SO₂CF₃).

40

45 Ejemplo 3

1-[2,6-Dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-5-{metil[(2-oxo-1,3-dioxolan-4-il)metil]amino}-4-[(trifluorometil)sulfonil]-1H-pirazol-3-carbonitrilo

50 **[0189]** Se añadió una disolución de fosgeno-tolueno (0,22 g, 20 % de COCl₂, 0,4 mmol) a una mezcla de 1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-5-[(2,3-dihidroxipropil)(metil)amino]-4-[(trifluorometil)sulfonil]-1H-pirazol-3-carbonitrilo (0,20 g, 0,4 mmol) y diisopropiletilamina (0,14 g, 1,1 mmol) en THF (10 ml). Se agitó la mezcla a 20-30 °C durante 20 h. El procesamiento extractivo (heptano-acetato de etilo, agua) y la cromatografía dieron el producto del título (compuesto 05-18, 0,14 g) en forma de un aceite; RMN-¹H: 2,88 (NMe), 3,35 y 3,45 (NCH₂), 3,96 y 4,55 (CH₂O), 4,82 (CHO), 7,87 (ArH) ppm; RMN-¹⁹F: -63,8 (PhCF₃); -78,8 ppm (SO₂CF₃).

55

[0190] Las siguientes tablas 1 y 3 comprenden compuestos de fórmula (I) preparados de acuerdo con o análogamente al ejemplo 1 descrito anteriormente. Las tablas 2 y 4 comprenden compuestos de fórmula (I) preparados de acuerdo con o análogamente al ejemplo 2 descrito anteriormente y las tablas 5 y 6 comprenden compuestos de fórmula (I) preparados de acuerdo con o análogamente al ejemplo 3 descrito anteriormente.

60

Tablas

[0191] En las siguientes tablas, aquellas tablas marcadas con un asterisco (*) se incluyen solo como referencia.

5

* Tabla 1: Compuestos de fórmula (I) en que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

R ¹ es CN; R ² es Cl; R ³ y R ⁵ son CF ₃ ; R ⁴ = CH ₃ ; R ¹³ = H R ⁶ y R ⁷ = H, alquilo					
Nº de compuesto		R ⁶	R ⁷	n	p.f. °C, RMN (ppm)
01-	01	H	H	0	
01-	02	H	H	1	
01-	03	H	H	2	19F:-64,2; -78,9
01-	04	Me	Me	0	
01-	05	Me	Me	1	
01-	06	Me	Me	2	
01-	07	Et	Et	0	
01-	08	Et	Et	1	
01-	09	Et	Et	2	
01-	10	nPr	nPr	0	
01-	11	nPr	nPr	1	
01-	12	nPr	nPr	2	
01-	13	iPr	iPr	0	
01-	14	iPr	iPr	1	
01-	15	iPr	iPr	2	
01-	16	nBu	nBu	0	
01-	17	nBu	nBu	1	
01-	18	nBu	nBu	2	
01-	19	secBu	secBu	0	
01-	20	secBu	secBu	1	
01-	21	secBu	secBu	2	

R ¹ es CN; R ² es Cl; R ³ y R ⁵ son CF ₃ ; R ⁴ = CH ₃ ; R ¹³ = H R ⁶ y R ⁷ = H, alquilo					
Nº de compuesto		R ⁶	R ⁷	n	p.f. °C, RMN (ppm)
01-	22	isoBu	isoBu	0	
01-	23	isoBu	isoBu	1	
01-	24	isoBu	isoBu	2	
01-	25	tBu	tBu	0	
01-	26	tBu	tBu	1	
01-	27	tBu	tBu	2	
01-	28	nC ₅ H ₁₁	nC ₅ H ₁₁	0	
01-	29	nC ₅ H ₁₁	nC ₅ H ₁₁	1	
01-	30	nC ₅ H ₁₁	nC ₅ H ₁₁	2	
01-	31	nC ₅ H ₁₃	nC ₅ H ₁₃	0	
01-	32	nC ₅ H ₁₃	nC ₅ H ₁₃	1	
01-	33	nC ₅ H ₁₃	nC ₅ H ₁₃	2	
01-	34	H	Me	0	
01-	35	H	Me	1	
01-	36	H	Me	2	
01-	37	H	Et	0	
01-	38	H	Et	1	
01-	39	H	Et	2	
01-	40	H	Ph	0	
01-	41	H	Ph	1	
01-	42	H	Ph	2	
01-	43	Ph	Ph	0	
01-	44	Ph	Ph	1	
01-	45	Ph	Ph	2	

* Tabla 2: Compuestos de fórmula (I) en que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

R ¹ es CN; R ² es Cl; R ³ y R ⁵ son CF ₃ ; R ⁴ = CH ₃ ; R ¹³ = H R ⁶ y R ⁷ = acilo					
Nº de compuesto		R ⁶	R ⁷	n	p.f. °C, RMN (ppm)
02-	01	HCO	HCO	0	
02-	02	HCO	HCO	1	
02-	03	HCO	HCO	2	
02-	04	CH ₃ CO	CH ₃ CO	0	
02-	05	CH ₃ CO	CH ₃ CO	1	

ES 2 454 690 T3

R ¹ es CN; R ² es Cl; R ³ y R ⁵ son CF ₃ ; R ⁴ = CH ₃ ; R ¹³ = H					
R ⁶ y R ⁷ = acilo					
Nº de		R ⁶	R ⁷	n	p.f. °C, RMN (ppm)
compuesto					
02-	06	CH ₃ CO	CH ₃ CO	2	19F:-63,8; -78,5
02-	07	C ₂ H ₅ CO	C ₂ H ₅ CO	0	
02-	08	C ₂ H ₅ CO	C ₂ H ₅ CO	1	
02-	09	C ₂ H ₅ CO	C ₂ H ₅ CO	2	19F:-63,8; -78,5
02-	10	nC ₃ H ₇ CO	nC ₃ H ₇ CO	0	
02-	11	nC ₃ H ₇ CO	nC ₃ H ₇ CO	1	
02-	12	nC ₃ H ₇ CO	nC ₃ H ₇ CO	2	
02-	13	iC ₃ H ₇ CO	iC ₃ H ₇ CO	0	
02-	14	iC ₃ H ₇ CO	iC ₃ H ₇ CO	1	
02-	15	iC ₃ H ₇ CO	iC ₃ H ₇ CO	2	
02-	16	nC ₄ H ₉ CO	nC ₄ H ₉ CO	0	
02-	17	nC ₄ H ₉ CO	nC ₄ H ₉ CO	1	
02-	18	nC ₄ H ₉ CO	nC ₄ H ₉ CO	2	
02-	19	tBuCO	tBuCO	0	
02-	20	tBuCO	tBuCO	1	
02-	21	tBuCO	tBuCO	2	
02-	22	PhCO	PhCO	0	
02-	23	PhCO	PhCO	1	
02-	24	PhCO	PhCO	2	
02-	25	MeOCH ₂ CO	MeOCH ₂ CO	0	
02-	26	MeOCH ₂ CO	MeOCH ₂ CO	1	
02-	27	MeOCH ₂ CO	MeOCH ₂ CO	2	
02-	28	EtOCH ₂ CO	EtOCH ₂ CO	0	
02-	29	EtOCH ₂ CO	EtOCH ₂ CO	1	
02-	30	EtOCH ₂ CO	EtOCH ₂ CO	2	
02-	31	MeOCO	MeOCO	0	
02-	32	MeOCO	MeOCO	1	
02-	33	MeOCO	MeOCO	2	
02-	34	EtOCO	EtOCO	0	
02-	35	EtOCO	EtOCO	1	
02-	36	EtOCO	EtOCO	2	
02-	37	nPrOCO	nPrOCO	0	
02-	38	nPrOCO	nPrOCO	1	
02-	39	nPrOCO	nPrOCO	2	
02-	40	nBuOCO	nBuOCO	0	

R ¹ es CN; R ² es Cl; R ³ y R ⁵ son CF ₃ ; R ⁴ = CH ₃ ; R ¹³ = H R ⁶ y R ⁷ = acilo					
Nº de		R ⁶	R ⁷	n	p.f. °C, RMN (ppm)
compuesto					
02-	41	nBuOCO	nBuOCO	1	
02-	42	nBuOCO	nBuOCO	2	
02-	43	CO-COOMe	CO-COOMe	0	
02-	44	CO-COOMe	CO-COOMe	1	
02-	45	CO-COOMe	CO-COOMe	2	
02-	46	CO-COOEt	CO-COO Et	0	
02-	47	CO-COOEt	CO-COOEt	1	
02-	48	CO-COOEt	CO-COOEt	2	

* Tabla 3: Compuestos de fórmula (I) en que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

R ¹ es CN; R ² es Cl; R ³ y R ⁶ son CF ₃ ; R ⁴ = H; R ¹³ = H R ⁶ y R ⁷ = H, alquilo					
Nº de		R ⁶	R ⁷	n	p.f. °C, RMN (ppm)
compuesto					
03-	01	H	H	0	
03-	02	H	H	1	
03-	03	H	H	2	
03-	04	Me	Me	0	
03-	05	Me	Me	1	
03-	06	Me	Me	2	
03-	07	Et	Et	0	
03-	08	Et	Et	1	
03-	09	Et	Et	2	
03-	10	nPr	nPr	0	
03-	11	nPr	nPr	1	
03-	12	nPr	nPr	2	
03-	13	iPr	iPr	0	
03-	14	iPr	iPr	1	
03-	15	iPr	iPr	2	
03-	16	nBu	nBu	0	
03-	17	nBu	nBu	1	
03-	18	nBu	nBu	2	
03-	19	secBu	secBu	0	
03-	20	secBu	secBu	1	
03-	21	secBu	secBu	2	

R ¹ es CN; R ² es Cl; R ³ y R ⁶ son CF ₃ ; R ⁴ = H; R ¹³ = H R ⁶ y R ⁷ = H, alquilo					
Nº de		R ⁶	R ⁷	n	p.f. °C, RMN (ppm)
compuesto					
03-	22	isoBu	isoBu	0	
03-	23	isoBu	isoBu	1	
03-	24	isoBu	isoBu	2	
03-	25	tBu	tBu	0	
03-	26	tBu	tBu	1	
03-	27	tBu	tBu	2	
03-	28	nC ₅ H ₁₁	nC ₅ H ₁₁	0	
03-	29	nC ₅ H ₁₁	nC ₅ H ₁₁	1	
03-	30	nC ₅ H ₁₁	nC ₅ H ₁₁	2	
03-	31	nC ₆ H ₁₃	nC ₆ H ₁₃	0	
03-	32	nC ₆ H ₁₃	nC ₆ H ₁₃	1	
03-	33	nC ₆ H ₁₃	nC ₆ H ₁₃	2	
03-	34	H	Me	0	
03-	35	H	Me	1	
03-	36	H	Me	2	
03-	37	H	Et	0	
03-	38	H	Et	1	
03-	39	H	Et	2	
03-	40	H	Ph	0	
03-	41	H	Ph	1	
03-	42	H	Ph	2	
03-	43	Ph	Ph	0	
03-	44	Ph	Ph	1	
03-	45	Ph	Ph	2	

Tabla 4: Compuestos de fórmula (I) en que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

R ¹ es CN; R ² es Cl; R ³ y R ⁵ son CF ₃ ; R ⁴ = H; R ¹³ = H R ⁶ y R ⁷ = acilo					
Nº de		R ⁶	R ⁷	n	p.f. °C, RMN (ppm)
compuesto					
04-	01	HCO	HCO	0	
04-	02	HCO	HCO	1	
04-	03	HCO	HCO	2	
04-	04	CH ₃ CO	CH ₃ CO	0	
04-	05	CH ₃ CO	CH ₃ CO	1	

ES 2 454 690 T3

R ¹ es CN; R ² es Cl; R ³ y R ⁵ son CF ₃ ; R ⁴ = H; R ¹³ = H					
R ⁶ y R ⁷ = acilo					
Nº de compuesto		R ⁶	R ⁷	n	p.f. °C, RMN (ppm)
04-	06	CH ₃ CO	CH ₃ CO	2	
04-	07	C ₂ H ₅ CO	C ₂ H ₅ CO	0	
04-	08	C ₂ H ₅ CO	C ₂ H ₅ CO	1	
04-	09	C ₂ H ₅ CO	C ₂ H ₅ CO	2	
04-	10	nC ₃ H ₇ CO	nC ₃ H ₇ CO	0	
04-	11	nC ₃ H ₇ CO	nC ₃ H ₇ CO	1	
04-	12	nC ₃ H ₇ CO	nC ₃ H ₇ CO	2	
04-	13	iC ₃ H ₇ CO	iC ₃ H ₇ CO	0	
04-	14	iC ₃ H ₇ CO	iC ₃ H ₇ CO	1	
04-	15	iC ₃ H ₇ CO	iC ₃ H ₇ CO	2	
04-	16	nC ₄ H ₉ CO	nC ₄ H ₉ CO	0	
04-	17	nC ₄ H ₉ CO	nC ₄ H ₉ CO	1	
04-	18	nC ₄ H ₉ CO	nC ₄ H ₉ CO	2	
04-	19	tBuCO	tBuCO	0	
04-	20	tBuCO	tBuCO	1	
04-	21	tBuCO	tBuCO	2	
04-	22	PhCO	PhCO	0	
04-	23	PhCO	PhCO	1.	
04-	24	PhCO	PhCO	2	
04-	25	MeOCH ₂ CO	MeOCH ₂ CO	0	
04-	26	MeOCH ₂ CO	MeOCH ₂ CO	1	
04-	27	MeOCH ₂ CO	MeOCH ₂ CO	2	
04-	28	EtOCH ₂ CO	EtOCH ₂ CO	0	
04-	29	EtOCH ₂ CO	EtOCH ₂ CO	1	
04-	30	EtOCH ₂ CO	EtOCH ₂ CO	2	
04-	31	MeOCO	MeOCO	0	
04-	32	MeOCO	MeOCO	1	
04-	33	MeOCO	MeOCO	2	
04-	34	EtOCO	EtOCO	0	
04-	35	EtOCO	EtOCO	1	
04-	36	EtOCO	EtOCO	2	
04-	37	nPrOCO	nPrOCO	0	
04-	38	nPrOCO	nPrOCO	1	
04-	39	nPrOCO	nPrOCO	2	
04-	40	nBuOCO	nBuOCO	0	

R ¹ es CN; R ² es Cl; R ³ y R ⁵ son CF ₃ ; R ⁴ = H; R ¹³ = H R ⁶ y R ⁷ = acilo					
Nº de		R ⁶	R ⁷	n	p.f. °C, RMN (ppm)
compuesto					
04-	41	nBuOCO	nBuOCO	1	
04-	42	nBuOCO	nBuOCO	2	
04-	43	CO-COOMe	CO-COOMe	0	
04-	44	CO-COOMe	CO-COOMe	1	
04-	45	CO-COOMe	CO-COOMe	2	
04-	46	CO-COOEt	CO-COOEt	0	
04-	47	CO-COOEt	CO-COOEt	1	
04-	48	CO-COOEt	CO-COOEt	2	

Tabla 5: Compuestos de fórmula (I) en que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

R ¹ es CN; R ² es Cl; R ³ y R ⁵ son CF ₃ ; R ⁴ = CH ₃ ; R ¹³ = H R ⁶ y R ⁷ junto con la unidad OCH-CH ₂ O forman un anillo					
Nº de		R6-R7	n	p.f. °C, RMN (ppm)	
compuesto					
05-	01	CH ₂	0		
05-	02	CH ₂	1		
05-	03	CH ₂	2		
05-	04	CMe ₂	0		
05-	05	CMe ₂	1		
05-	06	CMe ₂	2		
05-	07	CHPh	0		
05-	08	CHPh	1		
05-	09	CHPh	2		
05-	10	ciclopentano-1,1-diilo	0		
05-	11	ciclopentano-1,1-diilo	1		
05-	12	ciclopentano-1,1-diilo	2		
05-	13	ciclohexano-1,1-diilo	0		
05-	14	ciclohexano-1,1-diilo	1		
05-	15	ciclohexano-1,1-diilo	2		
05-	16	CO	0		
05-	17	CO	1		
05-	18	CO	2	19F: -63,8; -78,8	
05-	19	CS	0		
05-	20	CS	1		
05-	21	CS	2		

ES 2 454 690 T3

R ¹ es CN; R ² es Cl; R ³ y R ⁵ son CF ₃ ; R ⁴ = CH ₃ ; R ¹³ = H				
R ⁶ y R ⁷ junto con la unidad OCH-CH ₂ O forman un anillo				
Nº de		R6-R7	n	p.f. °C, RMN (ppm)
compuesto				
05-	22	CO-CO	0	
05-	23	CO-CO	1	
05-	24	CO-CO	2	
05-	25	CH ₂ CO	0	
05-	26	CH ₂ CO	1	
05-	27	CH ₂ CO	2	
05-	28	1,2-C ₆ H ₄	0	
05-	29	1,2-C ₆ H ₄	1	
05-	30	1,2-C ₆ H ₄	2	
05-	31	C ₂ H ₄	0	
05-	32	C ₂ H ₄	1	
05-	33	C ₂ H ₄	2	
05-	34	C ₃ H ₆	0	
05-	35	C ₃ H ₆	1	
05-	36	C ₃ H ₆	2	
05-	37	SO	0	
05-	38	SO	1	
05-	39	so	2	
05-	40	SO ₂	0	
05-	41	SO ₂	1	
05-	42	SO ₂	2	
05-	43	PO(OH)	0	
05-	44	PO(OH)	1	
05-	45	PO(OH)	2	
05-	46	PO(OMe)	0	
05-	47	PO(OMe)	1	
05-	48	PO(OMe)	2	
05-	49	PO(OEt)	0	
05-	50	PO(OEt)	1	
05-	51	PO(OEt)	2	
05-	52	POPh	0	
05-	53	POPh	1	
05-	54	POPh	2	
05-	55	POMe	0	
05-	56	POMe	1	

R ¹ es CN; R ² es Cl; R ³ y R ⁵ son CF ₃ ; R ⁴ = CH ₃ ; R ¹³ = H R ⁶ y R ⁷ junto con la unidad OCH-CH ₂ O forman un anillo				
Nº de compuesto		R6-R7	n	p.f. °C, RMN (ppm)
05-	57	POMe	2	

Tabla 6: Compuestos de fórmula (I) en que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

R ¹ es CN; R ² es Cl; R ³ y R ⁵ son CF ₃ ; R ⁴ = H; R ¹³ = H R ⁶ y R ⁷ junto con la unidad OCH-CH ₂ O forman un anillo				
Nº de compuesto		R6-R7	n	p.f. °C, RMN (ppm)
06-	01	CH ₂	0	
06-	02	CH ₂	1	
06-	03	CH ₂	2	
06-	04	CMe ₂	0	
06-	05	CMe ₂	1	
06-	06	CMe ₂	2	
06-	07	CHPh	0	
06-	08	CHPh	1	
06-	09	CHPh	2	
06-	10	ciclopentano-1,1-diilo	0	
06-	11	ciclopentano-1,1-diilo	1	
06-	12	ciclopentano-1,1-diilo	2	
06-	13	ciclohexano-1,1-diilo	0	
06-	14	ciclohexano-1,1-diilo	1	
06-	15	ciclohexano-1,1-diilo	2	
06-	16	CO	0	
06-	17	CO	1	
06-	18	CO	2	
06-	19	CS	0	
06-	20	CS	1	
06-	21	CS	2	
06-	22	CO-CO	0	
06-	23	CO-CO	1	
06-	24	CO-CO	2	
06-	25	CH ₂ CO	0	
06-	26	CH ₂ CO	1	
06-	27	CH ₂ CO	2	
06-	28	1,2-C ₆ H ₄	0	

R ¹ es CN; R ² es Cl; R ³ y R ⁵ son CF ₃ ; R ⁴ = H; R ¹³ = H R ⁶ y R ⁷ junto con la unidad OCH-CH ₂ O forman un anillo				
Nº de compuesto		R6-R7	n	p.f. °C, RMN (ppm)
06-	29	1,2-C ₆ H ₄	1	
06-	30	1,2-C ₆ H ₄	2	
06-	31	C ₂ H ₄	0	
06-	32	C ₂ H ₄	1	
06-	33	C ₂ H ₄	2	
06-	34	C ₃ H ₆	0	
06-	35	C ₃ H ₆	1	
06-	36	C ₃ H ₆	2	
06-	37	SO	0	
06-	38	SO	1	
06-	39	SO	2	
06-	40	SO ₂	0	
06-	41	SO ₂	1	
06-	42	SO ₂	2	
06-	43	PO(OH)	0	
06-	44	PO(OH)	1	
06-	45	PO(OH)	2	
06-	46	PO(OMe)	0	
06-	47	PO(OMe)	1	
06-	48	PO(OMe)	2	
06-	49	PO(OEt)	0	
06-	50	PO(OEt)	1	
06-	51	PO(OEt)	2	
06-	52	POPh	0	
06-	53	POPh	1	
06-	54	POPh	2	
06-	55	POMe	0	
06-	56	POMe	1	
06-	57	POMe	2	

[0192] Ejemplos biológicos

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

10 **[0193]** Se llenó un recipiente de ensayo con 10 adultos de *Ctenocephalides felis*. Se cerró un cilindro de vidrio por un extremo con Parafilm y se dispuso sobre el recipiente de ensayo. Se pipeteó entonces la disolución de compuesto de ensayo en sangre bovina y se añadió al cilindro de vidrio. Se mantuvieron las *Ctenocephalides felis* tratadas en este ensayo de perro artificial (sangre a 37 °C, 40-60 % de humedad relativa; *Ctenocephalides felis* 20-22 °C, 40-60 % de humedad relativa) y se efectuó la valoración a las 24 y 48 horas después de la aplicación. Los

compuestos 01-03, 02-09, 05-18 y 05-45 dieron al menos un 80 % de control de *Ctenocephalides felis* a una concentración de ensayo de 5 ppm o menos.

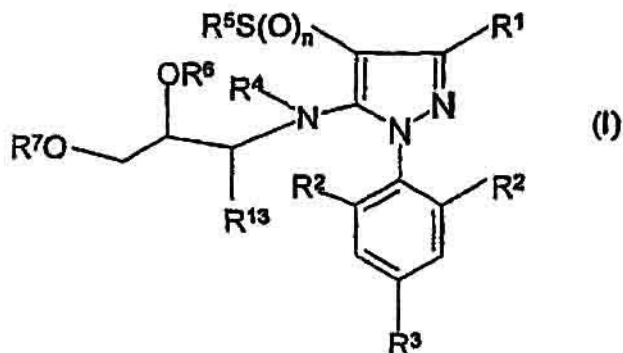
5 PROCEDIMIENTO B: Procedimiento de cribado para ensayar la actividad de contacto contra *Rhipicephalus sanguineus* (garrapata marrón de perro)

10 **[0194]** Se gotearon disoluciones de los compuestos de ensayo sobre papel de filtro, se secó, se puso el papel de filtro en tubos de ensayo, se infestó con 20-30 larvas (L1) de *Rhipicephalus sanguineus* y se cerraron los tubos con una pinza. Se mantuvieron las *Rhipicephalus sanguineus* tratadas en una cámara climatizada (25 °C, 90 % de HR) y se valoró la eficacia porcentual 24 horas después de la aplicación en comparación con el control no tratado.

[0195] El compuesto número 05-45 dio un control por contacto de al menos 70 % de *Rhipicephalus sanguineus* a una concentración de ensayo de 100 ppm.

REIVINDICACIONES

1. Un derivado de 5-aminoalquilaminopirazol de fórmula (I):



5

en la que

10 R^1 es CN, CH_3 , CF_3 , $C(=N-Z)-S(O)_p$ -alquilo C_1-C_4 o $CSNH_2$; en la que Z es H, alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_6 , alqueno C_3-C_6 , alquinilo C_3-C_6 , $-(CH_2)_qR^8$, COR^9 , CO_2 -alquilo C_1-C_6 o $S(O)_pR^9$;

R^2 para ambos residuos, independientemente entre sí, se selecciona del grupo consistente en halógeno, CH_3 o $NR^{11}R^{12}$;

15 R^3 es halogenoalquilo C_1-C_3 , halogenalcoxilo C_1-C_3 o SF_5 ;

20 R^4 es hidrógeno, alqueno C_2-C_6 , halogenalqueno C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , halogenoalquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , cicloalquil C_3-C_7 -alquilo C_1-C_6 , CO_2 -alquilo C_1-C_6 , CO_2 -alqueno C_3-C_6 , CO_2 -alquinilo C_3-C_6 , $CO_2-(CH_2)_qR^8$, $CO_2-(CH_2)_qR^{10}$ o SO_2R^9 ; formilo, $CO-COO$ -alquilo C_1-C_6 o CO -alquilo C_1-C_6 o $CO-(CH_2)_mR^8$; $CO-(CH_2)_mR^{10}$; o alquilo C_1-C_6

25 en los que los residuos de alqueno, alquinilo, cicloalquilo o alquilo pueden estar no sustituidos o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alcoxilo C_1-C_6 , halogenoalcoxilo C_1-C_6 , alqueno C_3-C_6 -oxilo, halogenoalqueno C_3-C_6 -oxilo, alquino C_3-C_6 -oxilo, halogenoalquino C_3-C_6 -oxilo, cicloalquilo C_3-C_7 , $S(O)_pR^9$, CN, NO_2 , OH, R^8 , R^{10} , COR^9 , $NR^{11}R^{12}$, OR^9 y CO_2R^9 ;

R^5 es alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , halogenoalqueno C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 o halogenoalquinilo C_2-C_6 ;

30 R^6 y R^7 son cada uno independientemente halogenoalquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 o alquinilo C_2-C_6 , y todos ellos pueden estar sustituidos con uno o más radicales R^8 , R^{10} , R^9 u OR^9 ;

35 o son cada uno independientemente grupos acilo seleccionados del grupo consistente en formilo, CO -alquilo C_1-C_6 , COO -alquilo C_1-C_6 y SO_2 -alquilo C_1-C_6 y SO_2 -alquilo C_1-C_6 , en los que todos los residuos alquilo pueden estar no sustituidos o sustituidos con uno o más radicales R^9 ; y en los que R^6 y R^7 pueden formar conjuntamente con la unidad C_2 con la que están enlazados un anillo de 5 a 7 miembro, formando grupos divalentes como CO, CS, $CO-CO$, CH_2CO , CHR^9CO , CR^9R^9CO , SO, SO_2 , PO(OH), PO(OR^9), PO(R^9), PO(OR^{10}), PO(R^{10}), PO(OR^8), PO(R^8) o similares; alqueno C_1-C_3 , cicloalqueno C_3-C_7 , cicloalquil C_3-C_7 -alqueno C_1-C_6 , 1,2-fenileno, todos ellos no sustituidos o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alcoxilo C_1-C_6 , halogenoalcoxilo C_1-C_6 , alqueno C_3-C_6 -oxilo, halogenoalqueno C_3-C_6 -oxilo, alquino C_3-C_6 -oxilo, halogenoalquino C_3-C_6 -oxilo, cicloalquilo C_3-C_7 , $S(O)_pR^9$, CN, NO_2 , OH, R^8 , R^{10} , COR^9 , $NR^{11}R^{12}$, OR^9 y CO_2R^9 ;

45 R^8 es fenilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_6 , alcoxilo C_1-C_6 , halogenalcoxilo C_1-C_6 , CN, NO_2 , $S(O)_pR^9$ y $NR^{11}R^{12}$;

R^9 es alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , -alquil C_1-C_4 -cicloalquilo C_3-C_7 , $-(CH_2)_qR^8$ o $-(CH_2)_qR^{10}$;

50 R^{10} es heterociclilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo C_1-C_4 , halogenoalquilo C_1-C_4 , alcoxilo C_1-C_4 , $S(O)_pR^{13}$, OH y oxo;

R^{11} y R^{12} son cada uno independientemente H o alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , y todos ellos pueden estar sustituidos con uno o más radicales R^9 u OR^9 ;

R¹³ es hidrógeno, alquilo C₁-C₆ o fenilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₆, alcoxilo C₁-C₆, halogenoalcoxilo C₁-C₆, CN, NO₂, S(O)_pR⁹ y NR¹¹R¹²,

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

m es 0, 1, 2 o 3; y

10 cada heterociclilo en los radicales anteriormente mencionados es independientemente un radical heterocíclico que tiene de 3 a 7 átomos de anillo y 1, 2 o 3 heteroátomos en el anillo seleccionados del grupo consistente en N, O y S; o una sal plaguicidamente aceptable de los mismos.

15 2. Un compuesto o una sal según la reivindicación 1, en el que R⁶ y R⁷ son independientemente entre sí halogenoalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆ o alquino C₂-C₆, y en todos ellos uno o más hidrógenos pueden estar sustituidos con uno o más radicales R⁹ u OR⁹, o R⁸, R¹⁰, en los que R⁸, R⁹ y R¹⁰ son como se definen en la reivindicación 1.

20 3. Un compuesto o una sal del mismo según la reivindicación 1, en el que R⁶ y R⁷ son independientemente entre sí un grupo acilo de tipo formilo, CO-alquilo C₁-C₆ y CO-alquilo C₁-C₆ sustituido con uno o más radicales R⁹; o del tipo COO-alquilo C₁-C₆ y COO-alquilo C₁-C₆ sustituido con uno o más radicales R⁹; o del tipo CO-COO-alquilo C₁-C₆ y CO-COO-alquilo C₁-C₆ sustituido con uno o más radicales R⁹; o del tipo SO₂-alquilo C₁-C₆ y SO₂-alquilo C₁-C₆ no sustituido o sustituido con uno o más radicales R⁹, en que R⁹ es como se define en la reivindicación 1.

25 4. Un compuesto o una sal del mismo según la reivindicación 1, en el que R⁶ y R⁷ forman, junto con la unidad C₂ con la que están enlazados, un anillo de 5 a 7 miembros, en el que R⁶ y R⁷ forman conjuntamente grupos divalentes seleccionados del grupo consistente en CO, CS, CO-CO, CH₂CO, SO, SO₂, PO(OH), PO(OR⁸), PO(R⁸), PO(OR⁹), PO(R⁹), en los que R⁸ y R⁹ son como se definen en la reivindicación 1.

30 5. Un compuesto o una sal del mismo según la reivindicación 1, en el que R⁶ y R⁷ forman, junto con la unidad C₂ con la que están enlazados, un anillo de 5 a 7 miembros, en el que R⁶ y R⁷ forman conjuntamente grupos divalentes seleccionados del grupo consistente en alqueno C₁-C₃, cicloalqueno C₃-C₇, cicloalquil C₃-C₇-alqueno C₁-C₆, 1,2-fenileno, todos ellos no sustituidos o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alcoxilo C₁-C₆, halogenoalcoxilo C₁-C₆, alqueno C₃-C₆-oxilo, halogenoalqueno C₃-C₆-oxilo, alquino C₃-C₆-oxilo, halogenoalquino C₃-C₆-oxilo, cicloalquilo C₃-C₇, S(O)_pR⁹, CN, NO₂, OH, R⁸, R¹⁰, COR⁹, NR¹¹R¹², OR⁹ y CO₂R⁹, en que R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹² y p son como se definen en la reivindicación 1.

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

40 R¹ es CN, C(=N-Z)-S(O)_p-alquilo C₁-C₄ o CSNH₂; en la que Z es H, alquilo C₁-C₃, -(CH₂)_qR⁸, COR⁹, CO₂-alquilo C₁-C₃ o S(O)_pR⁹; y/o

R² es halógeno y/o

45 R³ es halogenoalquilo C₁-C₃ y/o

R⁵ es halogenoalquilo C₁-C₃ y/o

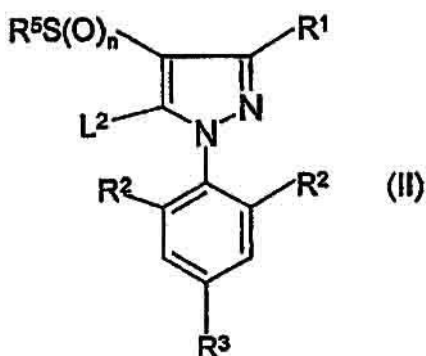
50 R¹³ es hidrógeno o alquilo C₁-C₃ no sustituido o sustituido con uno o más halógenos y/o

R⁴ es hidrógeno, alqueno C₂-C₄, halogenoalqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, halogenoalquino C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₇, cicloalquil C₃-C₇-alquilo C₁-C₄, CO₂-alquilo C₁-C₄, CO₂-alqueno C₃-C₄, CO₂-alquino C₃-C₄, CO₂-(CH₂)_qR⁸, CO₂-(CH₂)_qR¹⁰ o SO₂R⁹; formilo, CO-COO-alquilo C₁-C₄, CO-alquilo C₁-C₄ o alquilo C₁-C₄, no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo C₁-C₃, halogenoalquilo C₁-C₃, alcoxilo C₁-C₃, halogenoalcoxilo C₁-C₃, S(O)_pR⁹, CN y NO₂,

en que R⁸, R⁹, R¹⁰, q y p son como se definen en la reivindicación 1.

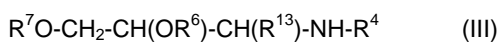
60 7. Un proceso para la preparación de compuestos de fórmula (I) o una sal del mismo como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en el que R¹ es CN, CH₃ o CF₃ y R², R³, R⁶ y n son como se definen en la reivindicación 1, comprendiendo dicho proceso

a) la reacción de un compuesto de fórmula (II):



en la que L^2 es un grupo saliente,

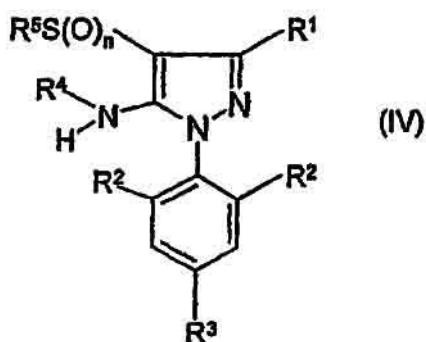
5 con un compuesto de fórmula (III):



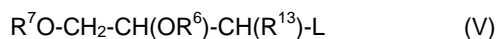
en la que R^4 , R^6 , R^7 y R^{13} son como se definen en la reivindicación 1, o

10

b) la reacción de un compuesto de fórmula (IV), en la que R^4 es como se define en la reivindicación 1



15 con un agente alquilante de fórmula (V):



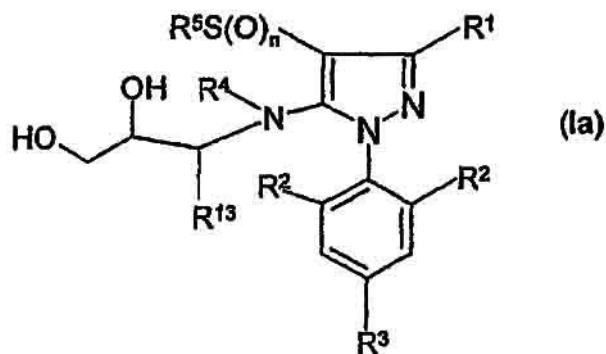
en la que R^6 , R^7 y R^{13} son como se definen en la reivindicación 1 y L es un grupo saliente, y una base.

20

o

c) la reacción de un compuesto de fórmula (Ia), en la que R^4 y R^{13} son como se definen en la reivindicación 1 y R^6 y R^7 son H

25



con un agente de acilación seleccionado del grupo de $R^{14}-COCl$ o $R^{14}-CO-O-CO-R^{15}$ o un dicloruro de ácido del grupo de fosgeno, cloruro de oxalilo, cloruro de tionilo, dicloruros de fósforo y una base, en la que R^{14} y R^{15} son

independientemente H o alquilo C₁-C₆, en el que el residuo alquilo puede estar no sustituido o sustituido con uno o más radicales R⁹, en que R⁹ es como se define en la reivindicación 1;

y

5 d) si se desea, la conversión del compuesto resultante de fórmula (I) en una sal plaguicidamente aceptable del mismo.

8. Un proceso para la preparación de compuestos de fórmula (I) o una del mismo como se definen en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en el que R¹ es C(=N-Z)-S(O)_p-alquilo C₁-C₄ o CSNH₂ en que Z y p son como se definen en la reivindicación 1, comprendiendo dicho proceso

10 a) cuando R¹ es CSNH₂, hacer reaccionar el correspondiente compuesto de fórmula (I), en la que R¹ es CN y los demás residuos y valores son como se definen en la reivindicación 1, con un hidrosulfuro de metal alcalino o alcalinotérreo o con el reactivo Ph₂PS₂,

o

20 b) cuando R¹ es CSNH₂, hacer reaccionar el correspondiente compuesto de fórmula (I), en la que R¹ es CN y los demás residuos y valores son como se definen en la reivindicación 1, con un sulfuro de bis(trialquilsililo), en presencia de una base,

o

25 c) cuando R¹ es C(=NH)-S-alquilo C₁-C₄, hacer reaccionar el correspondiente compuesto de fórmula (I), en la que R¹ es CSNH₂ y los demás residuos y valores son como se definen en la reivindicación 1, con un agente alquilante de fórmula (VI) o (VII):

30
$$\begin{array}{ll} \text{alquil C}_1\text{-C}_4\text{-L}^3 & \text{(VI)} \\ (\text{alquil C}_1\text{-C}_4)_3\text{O}^+\text{BF}_4^- & \text{(VII)} \end{array}$$

en que L³ es un grupo saliente

o

35 d) cuando R¹ es C(=NZ)-S-alquilo C₁-C₄, con la exclusión de H, preparado mediante alquilación, acilación o sulfonilación del correspondiente compuesto de fórmula (I) en la que Z es H y los demás residuos y valores son como se definen en la reivindicación 1, con un compuesto de fórmula (VIII):

40
$$\text{Z-L}^4 \text{ (VIII)}$$

en la que Z se define en la reivindicación 1, con la exclusión de H, y en la que L⁴ es un grupo saliente,

y

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

9. Una composición plaguicida que comprende un compuesto de fórmula (I) o una sal plaguicidamente aceptable del mismo como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en asociación con un diluyente o portador y/o agente tensioactivo plaguicidamente aceptable.

10. El uso de un compuesto de fórmula (I) o una sal del mismo según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, o de una composición según la reivindicación 9, para la preparación de un medicamento veterinario.

55 11. El uso de un compuesto de fórmula (I) o una sal del mismo según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, o de una composición según la reivindicación 9, para la preparación de un medicamento veterinario para controlar plagas.

60 12. Un procedimiento para el control de plagas en un lugar que comprende la aplicación de una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula (I) o una sal del mismo según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, o de una composición según la reivindicación 9, en el que el lugar se selecciona de la plaga misma, un cultivo, lugar de crecimiento de cultivo, semilla, producto almacenado, artículo doméstico, propiedad o zona ambiental general.

65 13. Un compuesto de fórmula (I) o una sal plaguicidamente aceptable del mismo como se definen en una

cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, para uso en el control de plagas.