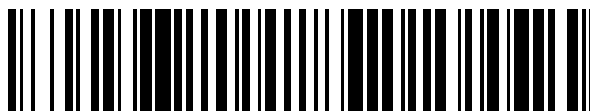


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 515 099**

51 Int. Cl.:

C07D 231/44 (2006.01) **A61K 31/551** (2006.01)

C07D 401/12 (2006.01)

C07D 403/12 (2006.01)

A01N 43/56 (2006.01)

A01N 43/60 (2006.01)

A01N 43/62 (2006.01)

C07D 403/04 (2006.01)

A61K 31/4155 (2006.01)

A61K 31/496 (2006.01)

A61K 31/506 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **02.12.2005 E 05819854 (0)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **24.09.2014 EP 1841744**

54 Título: **1-fenil-3-piperazin-pirazoles y composiciones pesticidas de los mismos**

30 Prioridad:

07.12.2004 EP 04028995

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

29.10.2014

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 2 515 099 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

1-fenil-3-piperazin-pirazoles y composiciones pesticidas de los mismos

5 [0001] La invención se refiere a nuevos derivados de 5-diazacicloalquilpirazol, a procedimientos para su preparación, a composiciones de los mismos y a su uso para el control de plagas, tales como plagas de artrópodos dañinos que incluyen insectos y arácnidos, helmintos que incluyen nematodos y protozoos.

[0002] El control de insectos, arácnidos o helmintos con compuestos de 1-arilpirazol ha sido descrito, por ejemplo, en las publicaciones de patentes números WO-93/06.089, WO-94/21.606, WO-87/03.781, EP-0.295.117, EP-659.745, EP-679.650, EP-201.852 y US-5.232.940. El control de parásitos en animales con compuestos de 1-arilpirazol también ha sido descrito en las publicaciones de patentes números WO-00/35.884, EP-0.846.686, WO-98/24.769 y WO-97/28.126.

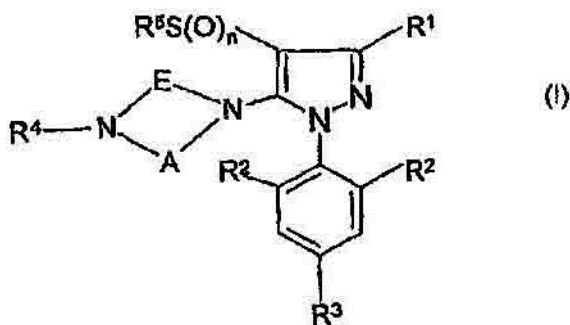
15 [0003] En particular el documento EP-0.352.944-A1 describe derivados de N-fenilpirazol y su uso como insecticidas, en el que algunos derivados fueron eficaces contra las larvas de *Plutella xylostella*. Sin embargo, el nivel de acción y/o de duración de acción de estos compuestos de la técnica anterior no es completamente satisfactorio en todos los campos de aplicación, en particular contra ciertos organismos, la tasa de mortalidad o cuando se aplican concentraciones bajas.

20

[0004] Dado que los pesticidas modernos deben satisfacer una amplia variedad de demandas, por ejemplo, en relación con el nivel, la duración y el espectro de acción, el espectro de uso, la toxicidad, la combinación con otras sustancias activas, la combinación con productos auxiliares de formulación o la síntesis, y dado que es posible la aparición de resistencias, el desarrollo de dichas sustancias nunca puede considerarse concluido, y existe constantemente una alta demanda de nuevos compuestos que son ventajosos con respecto a los compuestos conocidos, al menos en la medida en que se refiere a determinados aspectos.

[0005] La presente invención proporciona compuestos que son derivados de 5-diazacicloalquilpirazol de fórmula (I):

30



en la que:

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

R^2 es halógeno, CH_3 o $NR^{11}R^{12}$;

40 R^3 es (C_1-C_3) -haloalquilo, (C_1-C_3) -haloalcoxi o SF_5 ;

R^4 es hidrógeno, $CO_2-(C_1-C_6)$ -alquilo, $CO_2-(C_3-C_6)$ -alquenilo, $CO_2-(C_3-C_6)$ -alquinilo, $CO_2-(CH_2)_qR^6$, $CO_2-(CH_2)_qR^{10}$, $CONR^6R^7$ o SO_2R^9 ; formilo, $CO-CO_2-(C_1-C_6)$ -alquilo o $CO-(C_1-C_6)$ -alquilo sin sustituir o sustituido por uno o varios radicales seleccionados entre el grupo que consiste en halógeno, (C_1-C_6) -alcoxi, (C_1-C_6) -haloalcoxi, (C_3-C_6) -alquenilo, (C_3-C_6) -haloalquenilo, (C_3-C_6) -alquinilo, (C_3-C_6) -haloalquinilo, (C_3-C_7) -cicloalquilo, $S(O)_pR^9$, CN, NO_2 , OH, R^8 , R^{10} , COR^9 , NR^6R^7 , OR^9 y CO_2R^9 ; o $CO-(CH_2)_mR^8$; o $CO-(CH_2)_mR^{10}$; o fenil- CH_2 ;

45

R⁵ es (C₁-C₆)-alquilo, (C₁-C₆)-haloalquilo, (C₂-C₆)-alqueno, (C₂-C₆)-haloalqueno, (C₂-C₆)-alquino o (C₂-C₆)-haloalquino;

A es C₂-alqueno estando dicho grupo sin sustituir o sustituido por uno o varios (C₁-C₆)-alquilo, (C₂-C₆)-haloalquilo, (C₂-C₆)-alqueno, (C₂-C₆)-haloalqueno, (C₂-C₆)-alquino, (C₂-C₆)-haloalquino, (C₃-C₇)-cicloalquilo, (C₃-C₇)-cicloalquil-(C₁-C₄)-alquilo, (CH₂)_qR⁶ o (CH₂)_qR¹⁰

E es C₂-alqueno estando dicho grupo sin sustituir o sustituido por uno o varios (C₁-C₆)-alquilo, (C₁-C₆)-haloalquilo, (C₂-C₆)-alqueno, (C₂-C₆)-haloalqueno, (C₂-C₆)-alquino, (C₂-C₆)-haloalquino, (C₃-C₇)-cicloalquilo, (C₃-C₇)-cicloalquil-(C₁-C₄)-alquilo, (CH₂)_qR⁶ o (CH₂)_qR¹⁰

R⁶ y R⁷ son cada uno independientemente H, (C₁-C₆)-alquilo, (C₁-C₆)-haloalquilo, (C₂-C₆)-alqueno, (C₂-C₆)-haloalqueno, (C₂-C₆)-alquino, (C₂-C₆)-haloalquino, (C₃-C₇)-cicloalquilo, (C₃-C₇)-cicloalquil-(C₁-C₄)-alquilo, (CH₂)_qR⁸ o (CH₂)_qR¹⁰;

R⁶ y R⁷ pueden formar junto con el átomo N enlazado un anillo saturado de cuatro a siete miembros o un anillo insaturado de cinco a siete miembros, conteniendo opcionalmente dicho anillo uno o varios heteroátomos adicionales en el anillo que se seleccionan entre O, S y N, estando el anillo sin sustituir o sustituido por uno o varios radicales seleccionados entre el grupo que consiste en halógeno, (C₁-C₆)-alquilo, (C₁-C₆)-haloalquilo y oxo, y cuando está presente cualquier átomo N adicional del anillo está sin sustituir o sustituido por (C₁-C₆)-alquilo, CO-(C₁-C₆)-alquilo o un radical CH₂R¹¹;

R⁸ es fenilo sin sustituir o sustituido por uno o varios radicales seleccionados entre el grupo que consiste en halógeno, (C₁-C₆)-alquilo, (C₁-C₆)-haloalquilo, (C₁-C₆)-alcoxi, (C₁-C₆)-haloalcoxi, CN, NO₂, S(O)_pR⁹ y NR⁶R⁷;

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

R¹⁰ es heterociclilo sin sustituir o sustituido por uno o varios radicales seleccionados entre el grupo que consiste en halógeno, (C₁-C₄)-alquilo, (C₁-C₄)-haloalquilo, (C₁-C₄)-alcoxi, S(O)_pR⁹, OH y oxo;

R¹¹ y R¹² son cada uno independientemente H, (C₁-C₆)-alquilo, (C₂-C₆)-alqueno o (C₂-C₆)-alquino, estando los tres últimos grupos mencionados sin sustituir o sustituidos por uno o varios radicales seleccionados entre el grupo que consiste en halógeno, (C₃-C₇)-cicloalquilo, R⁶, R¹⁰, (C₁-C₆)-alcoxi, (C₁-C₆)-haloalcoxi;

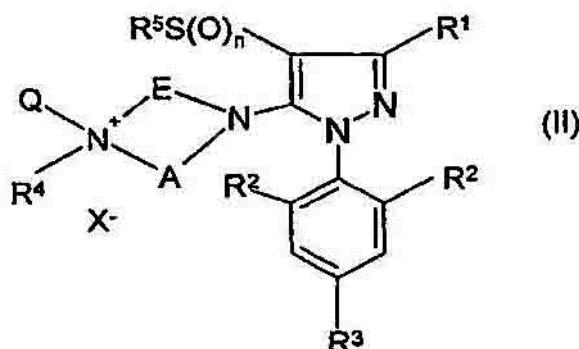
n, p y q son cada uno independientemente cero, uno o dos;

m es cero, uno, dos o tres; y

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

[0006] Por el término "sales aceptables en términos de pesticidas" se entiende sales cuyos aniones o cationes son conocidos y aceptados en la técnica para la formación de sales para uso pesticida. Entre las sales con bases adecuadas, por ejemplo, formadas por compuestos de fórmula (I) que contienen un grupo de ácido carboxílico se incluyen sales de metales alcalinos (por ejemplo, sodio y potasio), de metales alcalinotérreos (por ejemplo, calcio y magnesio), de amonio y amina (por ejemplo, dietanolamina, trietanolamina, octilamina, morfina y diocilmetilamina). Entre las sales de adición ácida adecuadas, por ejemplo, formadas por compuestos de fórmula (I) que contienen un grupo amino, se incluyen sales con ácidos inorgánicos, por ejemplo, clorhidratos, sulfatos, fosfatos y nitratos y sales con ácidos orgánicos por ejemplo, ácido acético.

[0007] Las sales preferidas de los compuestos de fórmula (I) son generadas por protonación o por alquilación en el nitrógeno del grupo R⁴-N para generar compuestos de la fórmula (II):



en la que

5 Q es H, (C₁-C₆)-alquilo, (C₁-C₆)-haloalquilo, (C₂-C₆)-alqueno, (C₂-C₆)-haloalqueno, (C₂-C₆)-alquino, (C₂-C₆)-haloalquino, (C₃-C₇)-cicloalquilo, (C₃-C₇)-cicloalquil-(C₁-C₄)-alquilo, (CH₂)_qR⁸ o (CH₂)_qR¹⁰;

X es un anión como halogenuro, sulfato, fosfato, sulfonato, carboxilato.

10 **[0008]** Estos compuestos poseen valiosas propiedades pesticidas

[0009] La invención comprende también cualquier estereoisómero, enantiómero o isómero geométrico, y mezclas de los mismos de compuestos según la fórmula (I) o (II).

15 **[0010]** En la presente memoria descriptiva de patente, incluidas las reivindicaciones adjuntas, los sustituyentes mencionados anteriormente tienen los siguientes significados:

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

20 **[0011]** El término "halo" antes del nombre de un radical significa que este radical está parcial o totalmente halogenado, es decir, sustituido por F, Cl, Br o I, en cualquier combinación, preferentemente por F o Cl.

[0012] Los grupos alquilo y partes de los mismos (salvo que se defina de otro modo) pueden ser de cadena lineal o ramificada.

25

[0013] La expresión "(C₁-C₆)-alquilo" debe entenderse con el significado de un radical de hidrocarburo ramificado o no ramificado que tiene 1, 2, 3, 4, 5 ó 6 átomos de carbono, tal como, por ejemplo, un radical metilo, etilo, propilo, isopropilo, 1-butilo, 2-butilo, 2-metilpropilo o terc-butilo.

30 **[0014]** Los radicales de alquilo y también en grupos compuestos, salvo que se defina de otro modo, tienen preferentemente de 1 a 4 átomos de carbono.

[0015] "(C₁-C₆)-haloalquilo" significa un grupo alquilo mencionado con la expresión "(C₁-C₆)-alquilo" en el que uno o varios átomos de hidrógeno están sustituidos por el mismo número de átomos de halógeno idénticos o
35 diferentes, tales como monohaloalquilo, perhaloalquilo, CF₃, CHF₂, CH₂F, CHFCH₃, CF₃CH₂, CF₃CF₂, CHF₂CF₂, CH₂FCHCl, CH₂Cl, CCl₃, CHCl₂ o CH₂CH₂Cl.

[0016] La expresión "(C₁-C₆)-alqueno" debe entenderse con el significado de una cadena de carbonos saturados ramificada o no ramificada que tiene de 1 a 6 átomos de carbono.

40

[0017] La expresión "(C₁-C₆)-haloalqueno" debe entenderse con el significado de una cadena de carbonos saturados ramificada o no ramificada que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, en la que uno o varios átomos de hidrógeno están sustituidos por el mismo número de átomos de halógeno idénticos o diferentes.

45 **[0018]** La expresión "(C₂-C₆)-alqueno" debe entenderse con el significado de una cadena de carbonos saturados ramificada o no ramificada que tiene de 2 a 6 átomos de carbono, y que contiene al menos un doble

enlace que puede estar situado en cualquier posición del radical insaturado respectivo.

[0019] "(C₁-C₆)-alcoxi" significa un grupo alcoxi cuya cadena de carbonos tiene el significado dado en la expresión "(C₁-C₆)-alquilo". "Haloalcoxi" es, por ejemplo, OCF₃, OCHF₂, OCH₂F, CF₃CF₂O, OCH₂CF₃ u OCH₂CH₂Cl.

5

[0020] "(C₂-C₆)-alqueno" significa una cadena de carbonos no cíclica ramificada o no ramificada que tiene un número de átomos de carbono que corresponde a este intervalo enunciado y que contiene al menos un doble enlace que puede estar situado en cualquier posición del radical insaturado respectivo. "(C₂-C₆)-alqueno" denota en consecuencia, por ejemplo, el grupo vinilo, alilo, 2-metil-2-propeno, 2-butenilo, penteno, 2-metilpenteno o hexeno.

10

[0021] "(C₂-C₆)-alquino" significa una cadena de carbonos no cíclica ramificada o no ramificada que tiene un número de átomos de carbono que corresponde a este intervalo enunciado y que contiene un triple enlace que puede estar situado en cualquier posición del radical insaturado respectivo. "(C₂-C₆)-alquino" denota en consecuencia, por ejemplo, el grupo propargilo, 1-metil-2-propino, 2-butino o 3-butino. Los grupos cicloalquilo tienen preferentemente de tres a siete átomos de carbono en el anillo y están sustituidos opcionalmente por halógeno o alquilo.

15

[0022] En compuestos de fórmula (I) o (II) se proporcionan los siguientes ejemplos de radicales:

20

Un ejemplo de alquilo sustituido por cicloalquilo es ciclopropilmetilo;
un ejemplo de alquilo sustituido por alcoxi es metoximetilo (CH₃OCH₂-); y
un ejemplo de alquilo sustituido por alquiltio es metiltiometilo (CH₃SCH₂-).

25

[0023] El arilo es un sistema aromático monocíclico y bicíclico, por ejemplo, fenilo, naftilo, tetrahidronaftilo, indenilo, indanilo y similares, preferentemente fenilo.

[0024] Un grupo "heterociclilo" puede ser saturado, insaturado o heteroaromático; preferentemente contiene uno o más, en particular 1, 2 ó 3, heteroátomos en el anillo heterocíclico, seleccionados preferentemente entre el grupo que consiste en N, O y S; preferentemente es un radical de heterociclilo alifático que tiene de 3 a 7 átomos en el anillo o un radical heteroaromático radical que tiene 5 ó 6 átomos en el anillo. El radical heterocíclico puede ser, por ejemplo, un radical o anillo heteroaromático (heteroarilo) como, por ejemplo, un sistema aromático monocíclico, bicíclico o policíclico en el que al menos 1 anillo contiene uno o varios 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 como oxiranilo, oxetanilo, oxolanilo (= tetrahydrofurilo), oxanilo, pirrolidilo, piperidilo, piperazinilo, dioxolanilo, oxazolinilo, isoxazolinilo, oxazolidinilo, isoxazolidinilo y morfolinilo. El grupo "heterociclilo" puede estar sin sustituir o sustituido por uno o varios radicales (preferentemente 1, 2 ó 3 radicales) seleccionados entre el grupo que consiste en halógeno, alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, hidroxilo, amino, nitro, carboxilo, ciano, alcoxycarbonilo, alquilcarbonilo, formilo, carbamoilo, mono- y dialquilaminocarbonilo, amino sustituido como acilamino, monoalquilamino y dialquilamino, y alquilsulfino, haloalquilsulfino, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, alquilo y haloalquilo, y adicionalmente también oxo. El grupo oxo puede estar presente también en aquellos heteroátomos en el anillo en los que son posibles varios números de oxidación, por ejemplo, en el caso de N y S.

30

35

40

45

[0025] El término plagas significa plagas de artrópodos (incluidos insectos y arácnidos) y helmintos (incluidos nematodos).

[0026] Los compuestos preferidos de la fórmula (I) o (II) se caracterizan por los siguientes residuos en los que

50

R¹ es CN o CSNH₂, más preferentemente R¹ es CN, o

R² es Cl

o

R³ es CF₃

55

o
R⁶ es CF₃

[0027] Una realización preferida adicional de la presente invención son compuestos de la fórmula (I) o (II) en la que R⁴ es CO₂-(C₁-C₆)-alquilo, CO₂-(C₃-C₆)-alqueno, CO₂-(C₃-C₆)-alquino, CO₂-(CH₂)_qR⁸, CO₂-(CH₂)_qR¹⁰,

CONR⁶R⁷ o SO₂R⁹; formilo, CO-CO₂-(C₁-C₆)-alquilo o CO-(C₁-C₆)-alquilo sin sustituir o sustituido por uno o varios radicales seleccionados entre el grupo que consiste en halógeno, (C₁-C₆)-alcoxi, (C₁-C₆)-haloalcoxi, (C₃-C₆)-alqueniloxi, (C₃-C₆)-haloalquenoiloxi, (C₃-C₆)-alquinoiloxi, (C₃-C₆)-haloalquinoiloxi, (C₃-C₇)-cicloalquilo, S(O)_pR⁹, CN, NO₂, OH, R⁸, R¹⁰, COR⁹, NR⁶R⁷, OR⁹ y CO₂R⁹; o CO-(CH₂)_nR⁸;

5 o CO-(CH₂)_nR¹⁰.

[0028] Se prefieren en particular grupos acilo como COH, COCH₃, COC₂H₅, CO(n-C₃H₇), CO(iso-C₃H₅), CO(n-C₄H₇), CO(terc-C₄H₇), CO(iso-C₄H₇), CO(sec-C₄H₇), CO(ciclo-C₃H₅), CO(ciclo-C₄H₇), CO(ciclo-C₅H₉), CO(ciclo-C₆H₁₁), COCH=CH₂, COC(CH₃)=CH₂, fenil-CO, (4-Cl-fenil)-CO, (4-CH₃-fenil)-CO, (2,6-F,F-fenil)-CO, (2-Cl-fenil)-CO,

10 (4-CH₃O-fenil)-CO, fenil-CH₂CO, fenil-C₂H₄CO, COCOOH, COCOOCH₃, COCOOC₂H₅, COCOO(n-C₄H₇), COCOO(terc-C₄H₇), COC₂H₄COOH, COC₂H₄COOCH₃, COC₂H₄CON(CH₃)₂, COCH₂CN(CH₃)₂, COCH₂Cl, COCH₂OCH₃, COCH₂OC₂H₅, COCF₃,

grupos sulfonilo como SO₂CH₃, SO₂C₂H₅, SO₂(n-C₃H₇), SO₂(iso-C₃H₇), SO₂C₃H₆Cl, SO₂CF₃, fenil-CH₂SO₂, fenil-SO₂, (4-CH₃-fenil)-SO₂, (4-Cl-fenil)-SO₂, SO₂N(CH₃)₂, SO₂N(C₂H₅)₂,

15 grupos carbamato como COOCH₃, COOC₂H₅, COO(n-C₃H₇), COO(iso-C₃H₇), COO(n-C₄H₉), COO(terc-C₄H₉), COO(sec-C₄H₉), COO(iso-C₄H₉), COO(n-C₅H₁₁), COO(neo-C₅H₁₁), COO(ciclo-C₆H₁₃), COOCH₂CHCH₂, COOCH₂CCH, COO(ciclo-C₅H₉), COO(ciclo-C₆H₁₁), COOCH₂-fenilo, COOC₂H₅-fenilo, COOC₃H₆-fenilo, fenil-COO, (4-Cl-fenil)-COO, COOCH(CH₃)fenilo, COOCH₂(4-Cl-fenilo), COOCH₂(2-piridil)COOCH₂(3-piridilo), COOCH₂(4-piridilo), CONH(CH₃), CONH(C₂H₅), CON(CH₃)₂, CON(C₂H₅)₂, CONH(4-Cl-fenilo), CONH(fenilo).

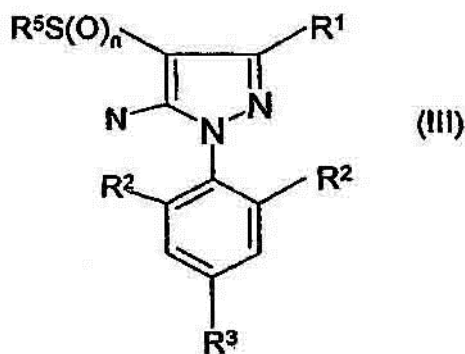
20

[0029] Los compuestos de fórmula general (I) pueden prepararse mediante la aplicación o adaptación de procedimientos conocidos (es decir, procedimientos usados anteriormente o descritos en la literatura química). Se entenderá que en algunos casos puede ser necesario el uso de agentes protectores bien conocidos en la técnica con el fin de obtener resultados satisfactorios.

25

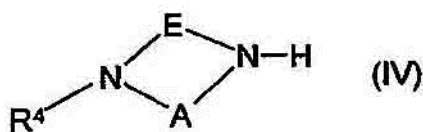
[0030] En la siguiente descripción de procedimientos cuando los símbolos que aparecen en las fórmulas no están definidos específicamente, se entiende que son "tal como se define anteriormente" de acuerdo con la primera definición de cada símbolo en la presente memoria descriptiva.

30 **[0031]** Según una característica adicional la invención los compuestos de fórmula (I) en la que R¹ es CN, CH₃ o CF₃ y todos los demás residuos y valores son tal como se define anteriormente, pueden prepararse mediante la reacción de un compuesto de fórmula (III),



35

con un compuesto de fórmula (IV) en la que R⁴, E, A y todos los demás residuos y valores son tal como se define anteriormente:

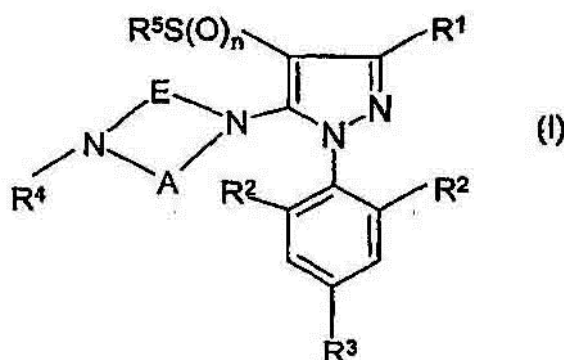


40

en la que Hal es un halógeno que actúa como grupo saliente preferentemente bromo. La reacción se realiza

generalmente en presencia de una base tal como una amina terciaria (por ejemplo, trietilamina, diisopropiltilamina o piridina) o una base de sal metálica (por ejemplo, carbonato de potasio, hidruro de sodio) en un disolvente inerte a una temperatura de 0°C a 100°C, preferentemente de 20°C a 50°C.

- 5 **[0032]** Según una característica adicional de la invención los compuestos de fórmula (I)



- 10 en la que R¹ es CN, CH₃ o CF₃, y los demás valores y residuos son tal como se define anteriormente, pueden prepararse mediante la reacción de un compuesto de fórmula (I), en la que R⁴ es hidrógeno y todos los demás residuos y valores son tal como se define anteriormente, con un compuesto de fórmula (V)



- 15 en la que L es un grupo saliente preferentemente cloro y en la que R⁴ es tal como se define anteriormente con la exclusión de hidrógeno. La reacción se realiza generalmente en presencia de una base tal como una amina terciaria (por ejemplo, trietilamina, diisopropiltilamina o piridina) en un disolvente inerte a una temperatura de 0°C a 100°C, preferentemente de 20°C a 50°C.

- 20 **[0033]** Las sales preferidas de los compuestos de fórmula (I) se generan por protonación o alquilación en el nitrógeno del grupo R⁴-N para generar compuestos de fórmula (II) en la que un compuesto de fórmula (I) se hace reaccionar con un compuesto de fórmula (VI)



- 25 en la que

Q es H, (C₁-C₆)-alquilo, (C₁-C₆)-haloalquilo, (C₂-C₆)-alqueno, (C₂-C₆)-haloalqueno, (C₂-C₆)-alquino, (C₂-C₆)-haloalquino, (C₃-C₇)-cicloalquilo, (C₃-C₇)-cicloalquil-(C₁-C₄)-alquilo, (CH₂)_qR⁸ o (CH₂)_qR¹⁰;

- 30 X es un anión como por ejemplo halogenuro, sulfato, fosfato, sulfonato, carboxilato.

[0034] La reacción puede realizarse en un disolvente inerte tal como tetrahidrofurano o N,N-dimetilformamida a una temperatura de 0 °C a 100 °C, preferentemente de 20 °C a 50 °C.

- 35 **[0035]** Según una característica adicional de la presente invención los compuestos de fórmula (I) o (II) en las que R¹ es CSNH₂ y todos los demás residuos y valores son tal como se define anteriormente pueden prepararse mediante reacción del compuesto correspondiente de fórmula (I) en la que R¹ es CN, con un sulfhidrato de metal alcalino o alcalinotérreo, tal como litio, potasio, calcio o preferentemente sulfhidrato de sodio, en un disolvente inerte por ejemplo N,N-dimetilformamida, piridina, dioxano, tetrahidrofurano, sulfolano, sulfóxido de dimetilo, metanol o etanol a una temperatura de -35°C a 50°C, preferentemente de 0°C a 30°C. Opcionalmente el sulfhidrato puede generarse *in situ* por tratamiento con H₂S en presencia de una base orgánica, tal como alcóxido de metal o trialkilamina o una base inorgánica, tal como carbonato de sodio, potasio o amonio. El uso de un agente de formación de complejo metálico, tal como éter corona, puede ser beneficioso para acelerar la reacción.

- 45 **[0036]** La reacción de sal de sulfhidrato con el compuesto de fórmula (III) o de fórmula (I) con R⁴ = H puede llevarse a cabo también en un sistema bifásico de agua/disolvente orgánico usando un catalizador de transferencia

de fase tal como un éter corona o una sal de tetraalquilamonio como bromuro de tetra-n-butilamonio o cloruro de benciltrimetilamonio. Los disolventes orgánicos adecuados para su uso en un sistema bifásico con agua incluyen benceno, tolueno, diclorometano, 1-clorobutano y éter metil-terc-butílico.

5 **[0037]** Alternativamente pueden prepararse también compuestos de fórmula (I) o (II) en la que R¹ es CSNH₂, a partir del compuesto correspondiente de fórmula (I) en la que R¹ es CN, por tratamiento con el reactivo PH₂PS₂, tal como se describe en Tet. Lett., 24 (20), 2059 (1983).

10 **[0038]** Según una característica adicional de la invención los compuestos de fórmula (I) o (II) en la que R¹ es CSNH₂ y todos los demás residuos y valores son tal como se define anteriormente, pueden prepararse mediante la reacción del compuesto correspondiente de fórmula (I) o (II) en la que R¹ es CN, con un bis(trialquililil)sulfuro, preferentemente bis(trimetilsilil)sulfuro, 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°C a 60°C. El procedimiento se describe en general en Lin, Ku y Shiao en Synthesis 1219 (1992).

15 **[0039]** Según una característica adicional de la invención los compuestos de fórmula (I) o (II) en la que R¹ es C(=NH)-S-(C₁-C₄)-alquilo y todos los demás residuos y valores son tal como se define anteriormente, pueden prepararse mediante la reacción del compuesto correspondiente de fórmula (I) o (II) en la que R¹ es CSNH₂ con un agente de alquilación de fórmula (VII) para (VIII):

20 (C₁-C₄)-alquil-L² (VII)

((C₁-C₄)-alquil)₃O⁺BF₄⁻ (VIII)

25 en la que L² es un grupo saliente, generalmente halógeno y preferentemente cloro, bromo o yodo. La reacción se realiza 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 °C a 60 °C. Alternativamente puede usarse un carbonato de metal alcalino tal como carbonato de potasio, o una base orgánica tal como una trialquilamina, por ejemplo, trietilamina, o N,N-diisopropilamina, 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 (III) tal como tetrafluorborato de trimetiloxonio como agente de alquilación, la base es preferentemente 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.

35 **[0040]** Según una característica adicional de la presente invención los compuestos de fórmula (I) o (II) en la que R¹ es C(=N-Z)-S-(C₁-C₄)-alquilo, Z es tal como se define anteriormente con la exclusión de H, y los otros valores son tal como se define anteriormente, pueden prepararse por la alquilación, acilación o sulfonilación del compuesto correspondiente de fórmula (I) o (II) en la que Z es H, con un compuesto de fórmula (IX):

40 Z-L³ (IX)

en la que Z se define anteriormente con la exclusión de H y en la que L³ es un grupo saliente. Para alquilaciones, en las que Z es (C₁-C₆)-alquilo, (C₁-C₆)-haloalquilo, (C₃-C₆)-alqueno, (C₃-C₆)-alquino o -(CH₂)_qR⁷, L³ es preferentemente halógeno, alquilsulfonilo o arilsulfonilo (más preferentemente cloro, bromo, yodo, metilsulfonilo o p-toluensulfonilo). Una base está presente opcionalmente en la reacción que se realiza generalmente en un disolvente inerte tal como tetrahidrofurano, dioxano, acetonitrilo, tolueno, éter dietílico, diclorometano, dimetilsulfóxido o N,N-dimetilformamida, a una temperatura de -30 °C a 200°C, preferentemente de 20 °C 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).

45 **[0041]** Para acilaciones, en las que Z es COR⁸ o CO₂-(C₁-C₆)-alquilo, (IX) es preferentemente un haluro ácido en el que L³ es preferentemente cloro o bromo (más preferentemente cloro). En la reacción está presente opcionalmente una base, y se realiza generalmente usando bases, disolventes y temperaturas similares a los empleados para las alquilaciones.

[0042] Para sulfonilaciones, en las que Z es S(O)_pR⁸, (IX) es preferentemente un haluro de sulfonilo en el que

L³ es preferentemente cloro o bromo (más preferentemente cloro). Una base está presente opcionalmente en la reacción, que se realiza en general usando bases, disolventes y temperaturas similares empleados para las alquilaciones.

5 **[0043]** Las colecciones de compuestos de la fórmula (I) o (II) que pueden sintetizarse mediante el procedimiento mencionado anteriormente también pueden prepararse de una forma paralela, y esto puede efectuarse manualmente o de una forma semiautomatizada o totalmente automatizada. En este caso, es posible, por ejemplo, automatizar el procedimiento de la reacción, el tratamiento final o la purificación de los productos o de los productos intermedios. En total, lo anterior debe entenderse con el significado de un procedimiento tal como se describe, por ejemplo, en S.H. DeWitt en "Annual Reports in Combinatorial Chemistry and Molecular Diversity: Automated Synthesis", Volumen 1, Verlag Escom 1997, páginas 69 a 77.

15 **[0044]** Puede usarse una serie de aparatos disponibles comercialmente tales como los ofrecidos, 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 la reacción y el tratamiento final en paralelo. Para la purificación en paralelo de compuestos de la fórmula (I) o (II), o de productos intermedios obtenidos durante la preparación, puede hacerse uso, entre otros, de aparatos de cromatografía, por ejemplo, los de ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, EE.UU.

20 **[0045]** Los aparatos mencionados conducen a un procedimiento modular en el que las etapas individuales del procedimiento están automatizadas, si bien las operaciones manuales deben realizarse entre las etapas del procedimiento. Esto puede evitarse empleando sistemas de automatización semiintegrados o totalmente integrados en los que los módulos de automatización en cuestión están accionados, por ejemplo, por robots. Dichos sistemas de automatización pueden obtenerse, por ejemplo, de Zymark Corporation, Zymark Center, Hopkinton, MA 01748, EE.UU.

25 **[0046]** Además de lo que se ha descrito en el presente documento, los compuestos de la fórmula (I) o (II) pueden prepararse en parte o en su totalidad mediante procedimientos con soporte de fase sólida. Para este fin, las etapas intermedias individuales o todas las etapas intermedias de la síntesis o de una síntesis adaptada para acomodarse al procedimiento en cuestión están relacionadas con una resina sintética. Los procedimientos de síntesis con soporte de fase sólida se describen extensamente en la literatura especializada, por ejemplo, por Barry A. Bunin en "The Combinatorial Index", Academic Press, 1998.

35 **[0047]** El uso de procedimientos de síntesis con soporte de fase sólida permite una serie de protocolos que son conocidos en la literatura y que, a su vez, puede realizarse manualmente o de una forma 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 el que se emplean productos de IRORI, 11149 North Torrey Pines Road, La Jolla, CA 92037, EE.UU., puede ser semiautomatizado. La automatización de síntesis en paralelo con soporte de fase sólida se realiza con éxito, por ejemplo, mediante los aparatos por Argonaut Technologies, Inc., 887 Industrial Road, San Carlos, CA 94070, EE.UU. o MultiSynTech GmbH, Wullener Feld 4, 58454 Witten, Alemania.

45 **[0048]** La preparación de los procedimientos descritos en la presente memoria descriptiva produce compuestos de la fórmula (I) o (II) en forma de colecciones de sustancias que se denominan bibliotecas. La presente invención también se refiere a bibliotecas que comprenden al menos dos compuestos de la fórmula (I) o (II).

50 **[0049]** Según una característica adicional de la presente invención se proporciona un procedimiento para el control de plagas en un lugar que comprende la aplicación de una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula (I) o una sal del mismo en la que el lugar es la plaga en sí, una planta, terreno, bosque, huerto, vía navegable, suelo, producto vegetal, cultivo agrícola, cultivo hortícola, plantación, invernadero, cultivo vitícola, gran cultivo, producto almacenado, semillas, producto doméstico, una propiedad o una zona del entorno general. Para este fin, dicho compuesto se usa normalmente en forma de una composición pesticida (es decir, en asociación con compatible diluyentes o soportes y/o agentes tensioactivos adecuados para su uso en composiciones pesticidas), por ejemplo, tal como se describe más adelante.

55 **[0050]** El término "compuesto de la invención" tal como se usa más adelante comprende un alquilaminopirazol sustituido en 5 de fórmula (I) tal como se define anteriormente y una sal del mismo aceptable en términos de pesticidas.

[0051] Un aspecto de la presente descripción es un procedimiento para el control de plagas en un lugar. El lugar incluye, por ejemplo, la plaga en sí, el emplazamiento (planta, terreno, bosque, huerto, vía navegable, suelo, producto vegetal, o similares) en el que reside o se alimenta la plaga, o un emplazamiento susceptible de infestación futura por la plaga. El compuesto de la invención puede aplicarse por tanto directamente a la plaga, al emplazamiento en el que reside o se alimenta la plaga, o al emplazamiento susceptible de infestación futura por la plaga.

[0052] Como resulta evidente a partir de los usos pesticidas precedentes, la presente invención proporciona compuestos activos como pesticidas y compuestos para su uso en el control de una serie de especies de plagas que incluyen: artrópodos, especialmente insectos o arácnidos, tales como ácaros, o helmintos, tales como nematodos de las plantas. El compuesto de la invención puede así emplearse ventajosamente en usos prácticos, por ejemplo, en cultivos agrícolas u hortícolas, en explotaciones forestales, en medicina veterinaria o en explotación ganadera, o en salud pública.

[0053] Los compuestos de la invención pueden ser para su uso, por ejemplo, en las siguientes aplicaciones y en las siguientes plagas:

Para el control de insectos del suelo, tales como gusanos de la raíz del maíz, termitas (especialmente para protección de estructuras), moscas de la raíz, gusanos del alambre, gorgojos de la raíz, barrenadores, gusanos cortadores, pulgones de la raíz o larvas. También pueden usarse para proporcionar actividad contra nematodos patógenos de las plantas, tales como nematodos de las raíces, de los quistes, daga, de la lesión o del tallo o el bulbo, o contra ácaros. Para el control de plagas del suelo, por ejemplo, gusanos de la raíz del maíz, los compuestos se aplican o incorporan ventajosamente en una tasa eficaz en el suelo en el que los cultivos se plantan o van a ser plantados o en las semillas o en las raíces de las plantas en crecimiento.

[0054] En el ámbito 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 las cuerdas, moscas soldado, moscas de los cuernos, ciervos voladores, tábanos, mosquitas, moscas sable, moscas negras o mosquitos.

[0055] En la protección de productos almacenados, por ejemplo, cereales, lo que incluye el grano y la harina, frutos secos, piensos animales, madera o artículos domésticos como, por ejemplo, alfombras y productos textiles, los compuestos de la invención son útiles contra el ataque de los artrópodos, más especialmente escarabajos, incluyendo gorgojos, polillas o ácaros, por ejemplo, *Ephestia* spp. (polillas de la harina), *Anthrenus* spp. (escarabajos de las alfombras), *Tribolium* spp. (escarabajos de la harina), *Sitophilus* spp. (gorgojos del grano) o *Acarus* spp. (ácaros).

[0056] En el control de plagas de cucarachas, hormigas o termitas o artrópodos similares en instalaciones industriales o domésticas infestadas o en el control de larvas de mosquitos en vías navegables, pozos, embalses u otros lugares de agua corriente o estancada.

[0057] Para el tratamiento de cimientos, estructuras o suelo en la prevención del ataque en edificios por termitas, por ejemplo, *Reticulitermes* spp., *Heterotermes* spp., *Coptotermes* spp.

[0058] Por otra parte se ha encontrado que los compuestos de la invención muestran una importante acción insecticida contra insectos que destruyen materiales técnicos.

[0059] A modo de ejemplo y preferentemente, pero de forma no limitativa, se nombran los siguientes insectos:

Escarabajos 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*;

Hymenoptera como *Sirex juvencus*, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus*, *Urocerus augur*;

Termitas como *Kaloterms flavicollis*, *Cryptotermes brevis*, *Heterotermes indicola*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes santonensis*, *Reticulitermes lucifugus*, *Mastotermes darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis*,

Coptotermes formosanus;

Pececillos de plata como Lepisma saccharina.

- 5 **[0060]** Dentro de los materiales técnicos del presente contexto se entiende que se incluyen materiales inertes tales como preferentemente plásticos, adhesivos, colas, papel y cartón, cuero, madera, productos de fabricación de madera y pinturas.
- [0061]** Al mismo tiempo los compuestos de la invención pueden usarse para protección contra la suciedad de
10 los objetos, especialmente cascos de barcos, cedazos, redes, edificios, embarcaderos e instalaciones de señales que entran en contacto con agua marina o salobre.
- [0062]** Por otra parte, los compuestos de la invención pueden usarse en combinación con otros compuestos activos tales como agentes antiincrustantes.
15
- [0063]** Los compuestos activos son adecuados para el control de plagas zoológicas en protección de hogares, higiene y almacenamiento, especialmente insectos, arácnidos y ácaros que aparecen en espacios cerrados tales como apartamentos, vestíbulos de las fábricas, oficinas, cabinas de vehículos, etc. Pueden usarse en solitario o en combinación con otros compuestos activos y auxiliares en productos insecticidas domésticos para el control de
20 estas plagas. Muestran actividad frente a especies sensibles y resistentes así como contra todas las fases de desarrollo. Estas plagas incluyen:
- El orden Scorpionidea por ejemplo Buthus occitanus.
- 25 **[0064]** 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.
- [0065]** El orden Araneae por ejemplo Aviculariidae, Araneidae.
30
- [0066]** El orden Opiliones por ejemplo Pseudoscorpiones chelifer, Pseudoscorpiones cheiridium, Opiliones phalangium.
- [0067]** El orden Isopoda por ejemplo Oniscus asellus, Porcellio scaber.
35
- [0068]** El orden Diplopoda por ejemplo Blaniulus guttulatus, Polydesmus spp.
- [0069]** El orden Chilopoda por ejemplo Geophilus spp.
- 40 **[0070]** El orden Zygentoma por ejemplo Ctenolepisma spp., Lepisma saccharina, Lepismodes inquilinus.
- [0071]** 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.
45
- [0072]** El orden Saltatoria por ejemplo Acheta domesticus.
- [0073]** El orden Dermaptera por ejemplo Forficula auricularia.
- 50 **[0074]** El orden Isoptera por ejemplo Kaloterms spp., Reticulitermes spp.
- [0075]** El orden Psocoptera por ejemplo Lepinatus spp., Liposcelis spp.
- [0076]** El orden Coleoptera por ejemplo Anthrenus spp., Attagenus spp., Dermestes spp., Latheticus oryzae,
55 Necrobia spp., Ptinus spp., Rhizopertha dominica, Sitophilus granarius, Sitophilus oryzae, Sitophilus zeamais, Stegobium paniceum.
- [0077]** 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 carnaria*, *Simulium* spp., *Stomoxys calcitrans*, *Tipula paludosa*.

- 5 **[0078]** El orden Lepidoptera por ejemplo *Achroia grisella*, *Galleria mellonella*, *Plodia interpunctella*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*.
- [0079]** El orden Siphonaptera por ejemplo *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopis*.
- 10 **[0080]** El orden Hymenoptera por ejemplo *Camponotus herculeanus*, *Lasius fuliginosus*, *Lasius niger*, *Lasius umbratus*, *Monomorium pharaonis*, *Paravespula* spp., *Tetramorium caespitum*.
- [0081]** El orden Anoplura por ejemplo *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pemphigus* spp., *Phylloera vastatrix*, *Phthirus pubis*.
- 15 **[0082]** El orden Heteroptera por ejemplo *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Rhodinus prolixus*, *Triatoma infestans*.
- [0083]** El uso en el sector de insecticidas domésticos se lleva a cabo en solitario o en combinación con compuestos activos adecuados tales como fosfatos, carbamatos, piretroides, neonicotinoides, reguladores del crecimiento o compuestos activos de otras clases de insecticidas conocidas.
- 20 **[0084]** El uso se lleva a cabo con aerosoles, agentes de nebulización no presurizados, por ejemplo, atomizadores de bomba y de espolvoreo, nebulizadores, atomizadores, agentes espumantes, geles, productos de evaporación con placas de evaporación de celulosa o plástico, evaporadores líquidos, evaporadores de gel y membrana, evaporadores activados por propelentes, sistemas de evaporación pasivos o sin energía, papeles atrapamoscas, trampas para moscas y geles para moscas, como granulados o polvos, en cebos sueltos o estaciones de cebos.
- 30 **[0085]** En agricultura contra adultos, larvas y huevos de Lepidoptera (mariposas y polillas), por ejemplo, *Heliothis* spp. tal como *Heliothis virescens* (gusano del tabaco), *Heliothis armigera* y *Heliothis zea*. Contra adultos y larvas de Coleoptera (escarabajos) por ejemplo *Anthonomus* spp. por ejemplo *grandis* (gorgojo del algodón), *Leptinotarsa decemlineata* (escarabajo de la patata del Colorado), *Diabrotica* spp. (gusanos de la raíz del maíz). Contra Heteroptera (Hemiptera y Homoptera) por ejemplo *Psylla* spp., *Bemisia* spp., *Trialeurodes* spp., *Aphis* spp.,
- 35 *Myzus* spp., *Megoura viciae*, *Phylloxera* spp., *Nephotettix* spp. (saltamontes verdes), *Nilaparvata* spp.
- [0086]** Contra Diptera por ejemplo *Musca* spp. Contra Thysanoptera tales como *Thrips tabaci*. Contra Orthoptera 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
- 40 *Schistocerca gregaria*. Contra Collembola por ejemplo *Periplaneta* spp. y *Blatella* spp. (cucarachas).
- [0087]** Contra artrópodos de importancia agrícola tales como Acari (ácaros) por ejemplo *Tetranychus* spp., y *Panonychus* spp.
- 45 **[0088]** Contra nematodos que atacan plantas o árboles de importancia para la agricultura, la explotación forestal o la horticultura ya sea directamente o por diseminación de enfermedades bacterianas, víricas, por micoplasmas o fúngicas de las plantas. Por ejemplo, nematodos de las raíces tales como *Meloidogine* spp. (por ejemplo, *M. incognita*).
- 50 **[0089]** En el campo de la medicina veterinaria o explotación ganadera o en el mantenimiento de la salud pública contra artrópodos que son parásitos internos o externos de los vertebrados, en particular los vertebrados de sangre caliente como los animales domésticos, por ejemplo, vacas, ovejas, cabras, equinos, cerdos, aves de corral, perros o gatos, por ejemplo, Acarina, lo que incluye garrapatas (por ejemplo, garrapatas de cuerpo blando que incluyen *Argasidae* spp. por ejemplo *Argas* spp. y *Ornithodoros* spp. (por ejemplo, *Ornithodoros moubata*);
- 55 garrapatas de cuerpo duro que incluyen *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 los gatos) y *Ctenocephalides canis* (pulga de los perros)); piojos por ejemplo *Menopon* spp.; Diptera (por ejemplo, *Aedes* spp.; *Anopheles* spp., *Musca* spp., *Hypoderma* spp.); Hemiptera; Dictyoptera (por ejemplo, *Periplaneta* spp., *Blatella* spp.);

Hymenoptera; por ejemplo, contra infecciones del aparato gastrointestinal causadas por gusanos nematodos parásitos, por ejemplo, miembros de la familia Trichostrongilidae.

[0090] En un aspecto preferido de la invención los compuestos de fórmula (I) o una sal de los mismos son para su uso en el control de parásitos de animales. Preferentemente el animal que se someterá a tratamiento es un animal doméstico de compañía como un perro o un gato.

[0091] Los parásitos que deben controlarse incluyen por ejemplo:

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

[0092] El orden Mallophagida y los subórdenes Amblycerina e Ischnocerina por ejemplo *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp.,
15 *Felicola* spp.

[0093] 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.,
20 *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.

[0094] El orden Siphonaptera por ejemplo *Pulex* spp., *Ctenocephalides* spp., *Xenopsylla* spp., *Ceratophyllus* spp.
25 spp.

[0095] El orden Heteroptera por ejemplo *Cimex* spp., *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp.

[0096] El orden Blattaria por ejemplo *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blattella germanica*, *Supella* spp.
30 spp.

[0097] La subclase Acari (Acarina) y el orden Meta- 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.,
35 *Varroa* spp.

[0098] El orden Actiniedida (Prostigmata) y Acaridida (Astigmata) por ejemplo *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Omitocheyletiella* 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.,
40 *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp., *Laminosioptes* spp.

[0099] Los compuestos de la invención de estructura (I) son también adecuados para el control de artrópodos que afectan a animales agrícolas tales como vacas, ovejas, cabras, caballos, cerdos, burros, camellos, búfalos, conejos, pollos, pavos, patos, gansos, abejas, otros animales domésticos como perros, gatos, aves enjauladas,
45 peces de acuario así como los denominados animales experimentales tales como hámsteres, cobayas, ratas y ratones. Mediante el control de estos artrópodos se reducirán las tasas de mortalidad y las pérdidas en el rendimiento (en carne, leche, lana, pieles, huevos, miel, etc.) de manera que es posible una actividad ganadera más económica y sencilla mediante el uso de los compuestos de la invención.

50 **[0100]** El uso de los compuestos activos en el sector veterinario y en ganadería se lleva a cabo por medios conocidos mediante administración entérica en forma, por ejemplo, de comprimidos, cápsulas, bebidas, pociones, granulados, pastas, bolos, aplicación de piensos, supositorios, por administración parenteral, por ejemplo, por inyección (intramuscular, subcutánea, intravenosa, interperitoneal, entre otros), implantes, por aplicación nasal, por administración dérmica en forma, por ejemplo, de goteo, pulverización, vertido y punteado, lavado, espolvoreo y con
55 la ayuda de dispositivos que contienen el compuesto activo tales como collares, marcadores de oreja, marcadores de cola, bandas para las extremidades, dogales, dispositivos de marcado, etc.

[0101] Durante el uso en vacas, aves de corral, animales domésticos, etc., los compuestos activos de estructura (I) pueden usarse como formulaciones (por ejemplo, polvo, emulsiones, agentes fluidos) que contienen los

compuestos activos en una cantidad del 1 al 80 % en peso, directamente o después de una dilución de 100 a 10.000 veces o como un baño químico.

[0102] 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.

[0103] Entre las plagas nombradas anteriormente se incluyen por ejemplo:

el orden Anoplura (Phthiraptera) por ejemplo *Damalinia* spp., *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Trichodectes* spp.

[0104] 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., *Epitrimerus pyri*, *Eutetranychus* spp., *Eriophyes* spp., *Hemitarsonemus* spp., *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Latrodectus mactans*, *Metatetranychus* spp., *Oligonychus* spp., *Ornithodoros* spp., *Panonychus* spp., *Phyllocoptura oleivora*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psoroptes* spp., *Rhipicephalus* spp., *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., *Scorpio maurus*, *Stenotarsonemus* spp., *Tarsonemus* spp., *Tetranychus* spp., *Vasates lycopersici*.

[0105] La clase de Bivalva por ejemplo *Dreissena* spp.

[0106] El orden Chilopoda por ejemplo *Geophilus* spp., *Scutigera* spp.

[0107] El orden Coleoptera por ejemplo *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus* spp., *Agelastica alni*, *Agriotes* spp., *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora* spp., *Anthonomus* spp., *Anthrenus* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp., *Attagenus* spp., *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., *Ceutho-rhynchus* 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*, *Oryzae-philus surinamensis*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllophaga* spp., *Popillia japonica*, *Premnotypes* 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.

[0108] El orden Collembola por ejemplo *Onychiurus armatus*.

[0109] El orden Dermaptera por ejemplo *Forficula auricularia*.

[0110] El orden Diplopoda por ejemplo *Blaniulus guttulatus*.

[0111] 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.

[0112] La clase Gastropoda por ejemplo *Arion* spp., *Biomphalaria* spp., *Bulinus* spp., *Deroceras* spp., *Galba* spp., *Lymnaea* spp., *Oncomelania* spp., *Succinea* spp.

[0113] 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*, *Diphyllobothrium latum*, *Dracunculus medinensis*, *Echinococcus granulosus*, *Echinococcus multilocularis*, *Enterobius vermicularis*, *Faciola* spp., *Haemonchus* spp., *Heterakis* spp., *Hymenolepis nana*, *Hyostrogylus* 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 pseudospiralis*, *Trichostrongylus* spp., *Trichuris trichuria*, *Wuchereria bancrofti*.

[0114] Además pueden controlarse protozoos como *Eimeria*.

[0115] El orden Heteroptera por ejemplo *Anasa tristis*, *Antestiopsis* spp., *Blissus* spp., *Calocoris* spp.,
5 *Campylomma livida*, *Cavelerius* 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*
10 *singularis*, *Scotinophora* spp., *Stephanitis nashi*, *Tibraca* spp., *Triatoma* spp.

[0116] 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*, *Carneocephala fulgida*,
15 *Ceratovacuna lanigera*, *Cercopidae*, *Ceroplastes* spp., *Chaetosiphon fragaefolii*, *Chionaspis tegalensis*, *Chlorita*
onukii, *Chromaphis juglandicola*, *Chrysomphalus ficus*, *Cicadulina mbila*, *Coccoxymylus 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*
20 *coffea*, *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*, *Nephotettix* 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*,
25 *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pseudococcus* spp., *Psylla* spp., *Pteromalus* spp., *Pyrilla* spp., *Quadraspidotus* spp.,
Quesada gigas, *Rastrococcus* spp., *Rhopalosiphum* spp., *Saissetia* spp., *Scaphoides titanus*, *Schizaphis graminum*,
Selenaspidus articulatus, *Sogata* spp., *Sogatella furcifera*, *Sogatodes* spp., *Stictocephala festina*, *Tenalaphara*
malayensis, *Tinocallis caryaefoliae*, *Tomaspis* spp., *Toxoptera* spp., *Trialeurodes vaporariorum*, *Triozia* spp.,
Typhlocyba spp., *Unaspis* spp., *Viteus vitifolii*.

[0117] El orden Hymenoptera por ejemplo *Diprion* spp., *Hoplocampa* spp., *Lasius* spp., *Monomorium*
30 *pharaonis*, *Vespa* spp.

[0118] El orden Isopoda por ejemplo *Armadillidium vulgare*, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*.

[0119] El orden Isoptera por ejemplo *Reticulitermes* spp., *Odontotermes* spp.

[0120] El orden Lepidoptera por ejemplo *Acronicta major*, *Aedia leucomelas*, *Agrotis* spp., *Alabama argillacea*,
Anticarsia spp., *Barathra brassicae*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*,
40 *Carpocapsa pomonella*, *Cheimatobia 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*, *Oria* spp., *Oulema oryzae*, *Panolis*
45 *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.

[0121] El orden Orthoptera por ejemplo *Acheta domesticus*, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Gryllotalpa*
50 spp., *Leucophaea maderae*, *Locusta* spp., *Melanoplus* spp., *Periplaneta americana*, *Schistocerca gregaria*.

[0122] El orden Siphonaptera por ejemplo *Ceratophyllus* spp., *Xenopsylla cheopis*.

[0123] El orden Symphyla por ejemplo *Scutigera* spp.

[0124] El orden Thysanoptera por ejemplo *Baliothrips biformis*, *Enneothrips flavens*, *Frankliniella* spp.,
Heliothrips spp., *Hercinothrips femoralis*, *Kakothrips* spp., *Rhipiphorothrips cruentatus*, *Scirtothrips* spp., *Taeniothrips*
55 *cardamoni*, *Thrips* spp.

[0125] El orden Thysanura por ejemplo *Lepisma saccharina*.

[0126] Entre los nematodos parásitos de las plantas se incluyen, por ejemplo, *Anguina* spp., *Aphelenchoides* spp., *Belonoaimus* spp., *Bursaphelenchus* spp., *Ditylenchus dipsaci*, *Globodera* spp., *Helicotylenchus* spp.,
5 *Heterodera* spp., *Longidorus* spp., *Meloidogyne* spp., *Pratylenchus* spp., *Radopholus similis*, *Rotylenchus* spp.,
Trichodorus spp., *Tylenchorhynchus* spp., *Tylenchulus* spp., *Tylenchulus semipenetrans*, *Xiphinema* spp.

[0127] Los compuestos de estructura (I) de la invención se caracterizan en particular por la intensa acción
10 contra pulgones (por ejemplo, *Aphis gossypii* y *Myzus persicae*), larvas de escarabajos (por ejemplo, *Phaedon cochleariae*), orugas (por ejemplo, *Plutella xylostella*, *Spodoptera exigua* y *Spodoptera frugiperda*).

[0128] Los compuestos de la invención pueden usarse también opcionalmente en determinadas
concentraciones o cantidades de aplicación como herbicidas, antidotos de plaguicidas, reguladores del crecimiento,
o como agentes para mejorar las propiedades de las plantas o como microbiocidas, por ejemplo, como fungicidas,
15 antimicóticos, bactericidas, viricidas (incluidos agentes contra viroides) o como agentes contra MLO (organismos
similares a micoplasmas) y RLO (organismos similares a rickettsias). También pueden usarse opcionalmente como
productos intermedios o precursores para la síntesis de compuestos activos adicionales.

[0129] Según la invención todas las plantas y partes de las plantas pueden ser objeto de tratamiento. En este
20 caso se entiende por plantas todas las plantas y poblaciones vegetales tales como plantas silvestres deseables y no
deseables o cultígenos (que incluyen cultígenos de ocurrencia natural). Los cultígenos pueden ser plantas
susceptibles de ser obtenidas por procedimientos convencionales de cría y optimización o por procedimientos de
biotecnología o ingeniería genética o combinaciones de estos procedimientos, lo que incluye plantas transgénicas e
25 incluye variedades de plantas que pueden ser objeto o no de protección por los derechos de protección de las
variedades vegetales. Por partes de las plantas se entienden todas las partes y órganos de las plantas por encima y
por debajo del suelo tales como vástagos, hojas, flores y raíces, lo que incluye, por ejemplo, hojas, acículas,
peciolos, tallos, flores, infrutescencias, frutos y semillas así como raíces, bulbos, rizomas. Los cultivos recolectados
así como el material de reproducción vegetativa y generativa, por ejemplo, esquejes, bulbos, rizomas, acodos y
30 semillas también pertenecen a las partes de las plantas.

[0130] En el uso práctico para el control de artrópodos, especialmente insectos o arácnidos, tales como
ácaros, o helmintos, tales como nematodos que son plagas de plantas, un procedimiento, por ejemplo, comprende la
aplicación a las plantas o al medio en el 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 el que debe controlarse la
35 infestación por artrópodos o nematodos en una tasa eficaz en el intervalo de aproximadamente 2 g a
aproximadamente 1 kg del compuesto activo por hectárea de lugar tratado. En condiciones ideales, dependiendo de
la plaga que debe controlarse, una tasa inferior puede ofrecer una protección adecuada. Por otra parte, las
condiciones meteorológicas adversas, la resistencia de la plaga u otros factores puede requerir que el ingrediente
activo se use en tasas superiores. La tasa óptima depende normalmente de una serie de factores, por ejemplo, el
40 tipo de plaga que se va a controlar, el tipo o la fase de crecimiento de la planta infestada, la separación de hileras o
también el procedimiento de aplicación. Preferentemente un intervalo de tasa eficaz del compuesto activo está
comprendido entre aproximadamente 10 g/ha y aproximadamente 400 g/ha, más preferentemente de
aproximadamente 50 g/ha a aproximadamente 200 g/ha.

[0131] Cuando una plaga es transportada por la tierra, el compuesto activo, generalmente en una
composición formulada, se distribuye de manera uniforme por la zona que se someterá a tratamiento (por ejemplo,
tratamiento en difusión o en bandas) de cualquier forma conveniente y se aplica en tasas de aproximadamente 10
g/ha a aproximadamente 400 g ia/ha, preferentemente de aproximadamente 50 g/ha a aproximadamente 200 g
ia/ha. Cuando se aplica como inmersión de raíces a las plántulas o riego por goteo a las plantas la solución o
50 suspensión líquida contiene de aproximadamente 0,075 a aproximadamente 1.000 mg ia/l, preferentemente de
aproximadamente 25 a aproximadamente 200 mg ia/l. La aplicación puede realizarse, si se desea, al terreno o la
zona de crecimiento del cultivo generalmente o en estrecha proximidad a la semilla o planta que se va a proteger del
ataque. El compuesto de la invención puede lavarse en el suelo por pulverización con agua en toda la zona o puede
dejarse a la acción natural de la lluvia. Durante o después de la aplicación, el compuesto formulado puede, si se
55 desea, ser distribuido mecánicamente en el suelo, por ejemplo, mediante arado, paso del disco, o uso de cadenas
de arrastre. La aplicación puede ser anterior a la plantación, realizarse en la plantación, ser posterior a la plantación
pero antes de que haya tenido lugar el brote, o después del brote.

[0132] El compuesto de la invención y los procedimientos de control de plagas asociados tienen un valor

especial en la protección de campos, forraje, plantaciones, invernaderos, huertos o cultivos vitícolas, de plantas ornamentales, o de árboles de plantación o de bosque, por ejemplo: cereales (como trigo o arroz), algodón, verduras (como pimientos), grandes cultivos (como remolacha azucarera, soja o colza), cultivos de pastos o forraje (como maíz o sorgo), huertos o frutales (por ejemplo, frutos con hueso o con pepitas o cítricos), plantas ornamentales, flores o verduras o arbustos en invernadero o en jardines o parques, o árboles (caducos y perennifolios) en bosques, plantaciones o viveros.

5 **[0133]** También son valiosos en la protección de madera (vertical, cortada, convertida, almacenada o estructural) de los ataques, por ejemplo, de moscas de sierra o escarabajos o termitas.

10 **[0134]** Tienen aplicaciones en la protección de productos almacenados tales como granos, frutos, frutos secos, especias o tabaco, ya sean enteros, molidos o compuestos en productos, del ataque de polillas, escarabajos, ácaros o gorgojos del grano. También protegen productos animales almacenados tales como pieles, pelo, lana o plumas en forma natural o convertida (por ejemplo, como alfombras o material textil) del ataque de polillas o escarabajos así como la carne, el pescado o el cereal almacenado del ataque de escarabajos, ácaros o moscas.

20 **[0135]** Además, el compuesto de la invención y los procedimientos de uso del mismo tienen un valor especial en el control de artrópodos o helmintos que son perjudiciales para, o que se diseminan o actúan como vectores de enfermedades de animales domésticos, por ejemplo, los mencionados anteriormente, y más especialmente en el control de garrapatas, ácaros, piojos, pulgas, mosquitas, o de la picadura, perjuicios o miasis de las moscas. Los compuestos de la invención son útiles especialmente en el control de artrópodos o helmintos que están presentes en el interior de los animales domésticos hospedadores o que se alimentan en o sobre la piel o chupan la sangre del animal, para cuyo fin pueden administrarse por vía oral, parenteral, percutánea o tópica.

25 **[0136]** Las composiciones descritas más adelante para su aplicación a cultivos en crecimiento o lugares de cultivos en crecimiento o como recubrimiento de semillas pueden emplearse, en general, alternativamente en la protección de productos almacenados, artículos domésticos, propiedades o zonas del entorno general. Entre los medios adecuados de aplicación de los compuestos de la invención se incluyen:

30 para cultivos en crecimiento como pulverización foliar (por ejemplo, como pulverización en surcos), polvos, gránulos, aspersiones o espumas o también como suspensiones de composiciones encapsuladas o finamente divididas como tratamientos para el suelo o las raíces mediante pociones líquidas, polvos, gránulos, humos o espumas; para semillas de cultivos por medio de la aplicación como recubrimientos de semillas por polvos o suspensiones líquidas espesas;

35 para animales infestados por o expuestos a infestación por artrópodos o helmintos, por aplicación parenteral, oral o tópica de composiciones en las que el ingrediente activo muestra una acción inmediata y/o prolongada durante un periodo de tiempo contra los artrópodos o helmintos, por ejemplo, por incorporación en piensos o formulaciones farmacéuticas adecuadas que se ingieren por vía oral, cebos comestibles, piedras de sal, suplementos de la dieta, formulaciones de vertido, nebulizadores, baños, goteo, duchas, chorros, polvos, grasas, champús, cremas, láminas de cera o sistemas de autotratamiento del ganado;

40 para el entorno en general o para lugares específicos en los que las plagas pueden prosperar, lo que incluye productos almacenados, madera, artículos domésticos, o instalaciones industriales o domésticas, como nebulizadores, aspersiones, polvos, humos, láminas de cera, lacas, gránulos o cebos, o en suministro continuo en vías navegables, pozos, embalses u otros lugares de agua corriente o estancada.

45 **[0137]** Los compuestos de fórmula (I) o una sal de los mismos son útiles especialmente para el control de parásitos de animales cuando se aplican oralmente, y en un aspecto preferido adicional de la invención los compuestos de fórmula (I) o una sal de los mismos se usan para el control de parásitos de animales por aplicación oral. Los compuestos de la fórmula (I) o sales de los mismos pueden administrarse antes, durante o después de las comidas. Los compuestos de la fórmula (I) o sales de los mismos pueden mezclarse con un soporte y/o un pienso.

50 **[0138]** El compuesto de la fórmula (I) o sal del mismo se administra oralmente en una dosis al animal en un intervalo de dosis comprendido generalmente entre 0,1 y 500 mg/kg del compuesto de la fórmula (I) o sal del mismo por kilogramo de peso corporal del animal (mg/kg).

55 **[0139]** La frecuencia de tratamiento del animal, preferentemente el animal doméstico que se someterá a tratamiento mediante el compuesto de la fórmula (I) o sal del mismo es generalmente de aproximadamente una vez por semana a aproximadamente una vez al año, preferentemente de aproximadamente una vez cada dos semanas a una vez cada tres meses.

[0140] Los compuestos de la invención pueden administrarse de la forma más ventajosa con otro material eficaz como parasiticida, tal como un endoparasiticida, y/o un ectoparasiticida, y/o un endoectoparasiticida. 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.

[0141] Los compuestos de la fórmula (I) o una sal de los mismos pueden emplearse también para el control de plagas en cultivos de plantas de ingeniería genética conocidas o plantas de ingeniería genética todavía por desarrollar. Como norma, las plantas transgénicas se distinguen por propiedades especialmente ventajosas, por ejemplo, por resistencias a agentes de protección de cultivos determinados, resistencias a enfermedades de las plantas o a patógenos de enfermedades de las plantas, tales como insectos o microorganismos determinados como hongos, bacterias o virus. Otras propiedades en particular se refieren, por ejemplo, al material recolectado en relación con la cantidad, calidad, propiedades de almacenamiento, composición y constituyentes específicos. Así, se conocen plantas transgénicas en las que se incrementa el contenido en almidón, o se modifica la calidad de almidón, o en las que el material recolectado tiene una composición diferente de ácidos grasos.

[0142] Todas las plantas que han recibido material genético por modificación por ingeniería genética que imparte propiedades ("rasgos") valiosas especialmente ventajosas a esas plantas pertenecen a las plantas transgénicas (obtenidas por ingeniería genética) o variedades de plantas que serán tratadas preferentemente de acuerdo con la invención. Ejemplos de dichas propiedades son crecimiento mejorado de las plantas, aumento en la tolerancia hacia altas o bajas temperaturas, aumento de la tolerancia hacia las sequías o hacia el contenido salino del agua o el suelo, rendimiento de floración mejorado, simplificación de la recolección, maduración acelerada, mayor rendimiento de la cosecha, mejora en la calidad y/o el valor nutricional del cultivo, mejor duración en el almacenamiento y/o el procesamiento del cultivo. Ejemplos adicionales y destacados especialmente de dichas propiedades son aumento de la resistencia de las plantas hacia plagas zoológicas y plagas microbianas, tales como hacia insectos, ácaros, hongos, bacterias y/o virus patógenos de las plantas, así como un aumento en la tolerancia de las plantas hacia determinados herbicidas. Algunos ejemplos de dichas plantas transgénicas son importantes cultígenos tales como cereales (trigo, arroz), maíz, soja, patata, remolacha azucarera, tomate, guisantes, y otras variedades vegetales, algodón, tabaco, colza así como frutales (con los frutos manzana, pera, cítricos y uvas), entre los que se destacan en particular maíz, soja, patata, algodón, tabaco y colza. Las propiedades ("rasgos") especialmente destacadas son el aumento en la tolerancia de las plantas hacia insectos, arácnidos, nematodos y gastrópodos a través de las toxinas formadas en las plantas, especialmente las que son producidas en las plantas (denominadas más adelante "plantas Bt") por el material genético de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo, de los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF así como sus combinaciones). También se destacan especialmente como propiedades ("rasgos") el aumento en la resistencia de las plantas hacia hongos, bacterias y virus a través de una resistencia sistémica adquirida (RSA), sistemina, fitoalexina, elicitores y genes de resistencia y proteínas y toxinas expresadas de forma correspondiente. Son propiedades ("rasgos") destacadas especialmente el aumento en la tolerancia de las plantas a ciertos compuestos herbicidas activos, por ejemplo, imidazolinonas, sulfonilureas, glifosato o fosfinotricina (por ejemplo, gen "PAT"). Los genes respectivos que imparten las propiedades ("rasgos") deseadas también pueden aparecer en las plantas transgénicas en combinación entre sí. Son ejemplos de dichas "plantas Bt" variedades del maíz, variedades del algodón, variedades de la soja y variedades de la 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), NucoIn® (algodón) y NewLeaf® (patata). Son ejemplos de plantas tolerantes a herbicidas variedades del maíz, variedades del algodón y variedades de la soja que se comercializan con las marcas comerciales Roundup Ready® (tolerancia hacia glifosato, por ejemplo, maíz, algodón, soja), Liberty Link® (tolerancia hacia fosfinotricina, por ejemplo, colza), IMI® (tolerancia hacia imidazolinonas) y STS® (tolerancia hacia sulfonilureas, por ejemplo, maíz). También se mencionan como plantas resistentes a herbicidas (cultivadas convencionalmente por su tolerancia a herbicidas) aquellas variedades comercializadas con el nombre de Clearfield® (por ejemplo, maíz). Naturalmente estas afirmaciones se aplican también a variedades de plantas desarrolladas o comercializadas en el futuro con estas propiedades ("rasgos") genéticas o las desarrolladas en el futuro.

[0143] Se prefiere el uso en cultivos transgénicos importantes en términos económicos de plantas y plantas ornamentales útiles, por ejemplo, de cereales tales como trigo, cebada, centeno, avena, mijo, arroz, yuca y maíz o también cultivos de remolacha azucarera, algodón, soja, colza, patatas, tomates, guisantes y otros tipos de verduras.

[0144] Cuando se usan en cultivos transgénicos, en particular en aquéllos que tienen resistencias a los

insectos, frecuentemente se observan efectos, además de los efectos contra plagas que se observarán en otros cultivos, que son específicos de la aplicación en el cultivo transgénico en cuestión, por ejemplo, un espectro alterado o ampliado específicamente de plagas que pueden ser controladas, o tasas de aplicación modificadas que pueden emplearse para su aplicación.

5

[0145] Por tanto, la presente descripción también se refiere al uso de compuestos de la fórmula (I) o una sal de los mismos para el control de plagas en plantas de cultivos transgénicos.

[0146] Según una característica adicional de la presente invención se proporciona una composición pesticida que comprende uno o varios compuestos de la invención tal como se define anteriormente, en asociación con, y preferentemente dispersados de forma homogénea en uno o varios diluyentes o soportes y/o agentes tensioactivos compatibles y aceptables en términos de pesticidas [es decir, diluyentes o soportes y/o agentes tensioactivos del tipo aceptado generalmente en la técnica como adecuado para su uso en composiciones pesticidas y que son compatibles con compuestos de la invención]. En la práctica, los compuestos de la invención forman con la máxima frecuencia parte de composiciones. Estas composiciones pueden emplearse para el control de artrópodos, especialmente insectos y arácnidos, tales como ácaros, o helmintos, por ejemplo, nematodos de las plantas. Las composiciones pueden ser de cualquier tipo conocido en la técnica adecuado para su aplicación a la plaga deseada en cualquier instalación o área interior o al aire libre. Estas composiciones contienen al menos un compuesto de la invención como ingrediente activo en combinación o asociación con uno o varios otros componentes compatibles que son, por ejemplo, soportes o diluyentes sólidos o líquidos, adyuvantes, agentes tensioactivos o similares apropiados para el uso que se pretende y que son aceptables en términos agronómicos o medicinales. Estas composiciones, que pueden prepararse por cualquier modo conocido en la técnica, forman parte asimismo de la presente invención.

[0147] Los compuestos de la invención, en sus formulaciones disponibles comercialmente y en las formas de uso preparadas a partir de estas formulaciones pueden estar presentes en mezclas con otras sustancias activas tales como insecticidas, atrayentes, esterilizantes, acaricidas, nematocidas, fungicidas, sustancias reguladoras del crecimiento o herbicidas.

[0148] Los pesticidas incluyen, por ejemplo, ésteres fosfóricos, carbamatos, ésteres carboxílicos, formamidinas, compuestos de estaño y materiales producidos por microorganismos.

Fungicidas:

35 Inhibidores de síntesis de ácidos nucleicos
benalaxilo, benalaxil-M, bupirimato, quiralexilo, clozilación, dimetirimol, etirimol, furalaxilo, himexazol, metalaxilo, metalaxil-M, ofurace, oxadixilo, ácido oxolínico

Inhibidores de la mitosis y la división celular

40 benomilo, carbendazim, dietofencarb, fuberidazol, pencicurón, tiabendazol, tiofanato-metilo, zoxamida

Inhibidor del complejo respiratorio I
diflumetorim

45 Inhibidores del complejo respiratorio II
boscalid, carboxina, fenfuram, flutolanilo, furametpir, mepronilo, oxicarboxina, pentiopirad, tifluzamida

Inhibidor del complejo respiratorio III

50 azoxistrobina, ciazofamida, dimoxistrobina, enestrobina, famoxadona, fenamidona, fluoxastrobina, kresoxim-metilo, metominostrobin, orisastrobina, piraclostrobina, picoxistrobina

Desacopladores
dinocap, fluazinam

55 Inhibidores de producción de ATP
acetato de fentina, cloruro de fentina, hidróxido de fentina, siltiofam

Inhibidor de la biosíntesis de aminoácidos y proteínas

andoprim, blasticidin-S, ciprodinilo, kasugamicina, clorhidrato de kasugamicina hidratado, mepanipirim, pirimetanilo

Inhibidores de la transducción de señales
fencipilonilo, fludioxonilo, quinoxifeno

5 Inhibidores de la síntesis de lípidos y membranas

clozolinato, iprodiona, procimidona, vinclozolina
ampropilfos, ampropilfos potásico, edifenfos, iprobenfos (IBP), isoprotilano, pirazofos
tolclofos-metilo, bifenilo
yodocarb, propamocarb, clorhidrato de propamocarb

10

Inhibidores de la biosíntesis del ergosterol

fenhexamida,

azaconazol, bitercanol, bromuconazol, ciproconazol, diclobutrazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M,
epoxiconazol, etaconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, furconazol, furconazol-cis, hexaconazol,
15 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,

aldimorf, dodemorf, acetato de dodemorf, fenpropimorf, tridemorf, fenpropidina, espiroxamina,

20 naftifina, piributicarb, terbinafina

Inhibidores de la síntesis de la pared celular

bentiavalicarb, bialafos, dimetomorf, flumorf, iprovalicarb, polioxinas, polioxorim, validamicina A

25 Inhibidores de biosíntesis de la melanina

capropamida, diclocimet, fenoxanilo, ftalida, piroquilón, triciclazol

Inducción de resistencia

acibenzolar-S-metilo, probenazol, tiadinilo

30

Multisitio

captafol, captan, clorotalonilo, sales de cobre: hidróxido de cobre, naftenato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de
cobre, óxido de cobre, oxina-cobre y mezcla de Burdeos, diclofluanida, ditianón, dodina, base libre de dodina,
ferbam, fluorfolpet, guazatina, acetato de guazatina, iminocadina, albesilato de iminocadina, triacetato de
35 iminocadina, mancozeb, mancozeb, maneb, metiram, metiram cinc, propineb, azufre y preparaciones de azufre que
contienen polisulfuro de calcio, tiram, tolilfluanida, zineb, ziram

Mecanismos desconocidos

- 40 amibromdol, bentiazol, betoxacina, capsimicina, carvona, metionato de quinolina, cloropicrina, cufraneb,
ciflufenamida, cimoxanilo, dazomet, debacarb, diclomezina, diclorofeno, dicloran, difenzoquat, sulfato de difenzoquat
metilo, 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, octilinona, oxamocarb, oxifentiina, pentaclorofenol y
sus sales, 2-fenilfenol y sus sales, piperalina, propanosin-sodio, proquinazid, pirrolnitrina, quintozeno, tecloftalam,
45 tecnazen, 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-tiazol-carboxamida, 2-cloro-N-(2,3-dihidro-1,1,3-trimetil-1H-
inden-4-il)-3-piridin-carboxamida, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetilisoxazolidin-3-il]piridina, cis-1-(4-clorofenil)-2-(1H-
1,2,4-triazol-1-il)cicloheptanol, 2,4-dihidro-5-metoxi-2-metil-4-[[[1-[3-(trifluorometil)-fenil]etiliden]amino]oxi]metil]fenil]-
3H-1,2,3-triazol-3-ona (185336-79-2), 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato de metilo,
50 3,4,5-tricloro-2,6-piridin-dicarbonitriol, 2-[[[ciclopropil[(4-metoxifenil)imino]metil]tio]metil]-.alfa-(metoximetilen)-
benzacetato de metilo, 4-cloro-alfa-propinilo-N-[2-[3-metoxi-4-(2-propinilo)fenil]etil]-benzacetamida, (2S)-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-[(1R)-1,2,2-
trimetilpropil][1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina-7-amina, 5-cloro-N-[(1R)-1,2-dimetilpropil]-6-(2,4,6-
55 trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina-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-benzacetamida, N-(3-etil-3,5,5-trimetilciclohexil)-
3-formilamino-2-hidroxibenzamida, 2-[[[1-[3(1-fluoro-2-feniletil)oxi]feniletiliden]amino]oxi]metil]-alfa-(metoxiimino)-N-
metil-alfaE-benzacetamida, 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-1H-pirazol-4-carboxamida, N-(6-metoxi-3-piridinil)-ciclopropano-carboxamida, ácido 1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil-1H-imidazol-1-carboxílico, ácido O-[1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil]-1H-imidazol-1-carbotioico, 2-(2-[[6-(3-clor-2-metilfenoxi)-5-fluoropirimidin-4-il]oxi]fenil)-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida

5

Bactericidas:

bronopol, diclorofeno, nitrapirina, dimetilditiocarbamato de níquel, kasugamicina, octilín, ácido furanocarboxílico, oxitetraciclina, probenazol, estreptomocina, tecloftalam, sulfato de cobre y otras preparaciones de cobre.

10

Insecticida / Acaricida / Nematicida:

Inhibidores de la acetilcolinesterasa (AChE)
carbarnatos,

15 por ejemplo, alanicarb, aldicarb, aldoxicarb, alilixcarb, aminocarb, bendiocarb, benfurcarb, bufencarb, butacarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbarilo, carbofurano, carbosulfano, cloetocarb, dimetilano, etiofencarb, fenobucarb, fenotiocarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metam-sodio, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamilo, pirimicarb, promecarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, trimetacarb, XMC, xililcarb, organofosfatos de triazamato,

20 por ejemplo, acefato, azametifos, azinfos (-metilo, -etilo), aromofos-etilo, aromfenvinfos (-metilo), autatofos, cadusafos, carbofenotión, cloretoxifos, clorfenvinfos, clormefos, clorpirifos (-metilo/-etilo), coumafos, cianofenos, cianofos, clorfenvinfos, demeton-S-metilo, demeton-S-metilsulfona, dialifos, diazinona, diclofentona, diclorvos/DDVP, dicrotofos, dimetoato, dimetilvinfos, dioxabenzofos, disulfotón, EPN, etión, etoprofos, etrimfos, famfur, fenamifos, fenitrotión, fensulfotión, fentiión, flupirazofos, foriofos, formotión, fosmetilano, fostiazato, heptenofos, yodofenos, iprobenfos, isazofos, isofenos, isopropilo O-salicilato, isoxatión, malatión, mecarbarn, metacrifos, metamidofos, metidatión, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidometon-metilo, paratión (-metilo/-etilo), fentoato, forato, fosadona, fosmet, fosfamidona, fosfocarb, Phoxim, pirimifos (-metilo/-etilo), profenofos, propafos, propetamfos, protiofos, protoato, piraclfos, piridafentiión, piridatión, quinalfos, sebufos, sulfotep, sulprofos, tebupirimfos, temefos, terbufos, tetraclorvinfos, tiometón, triazofos, triclorfón, vamidotión

Moduladores del canal del sodio/bloqueadores del canal del sodio dependientes de la tensión

30 piretroides,

por ejemplo, acrinatrina, aletrina (d-cis-trans, d-trans), beta-ciflutrina, bifentrina, bioaletrina, bioaletrin-esciclopentil-isómero, bioetanometrina, biopermetrina, bioresmetrina, clovaportrina, cis-cipermetrina, cis-resmetrina, cis-permetrina, clocitrina, cicloprotrina, ciflutrina, cihalotrina, cipermetrina (alfa-, beta-, theta-, zeta), cifenotrina, deltametrina, empentrina (1R-isómero), esfenvalerato, etofenprox, fenflutrina, fenpropatrina, fenpiritrina, fenvalerato, flubrocitrinato, flucitrinato, flufenprox, flumetrina, fluvalinato, fubfenprox, gammacihalotrina, imiprotrina, kadetrina, lambda-cihalotrina, metoflutrina, permetrina (cis-, trans-), fenotrina (isómero 1R-trans), pralletrina, proflutrina, protrifenbuto, piresmetrina, resmetrina, RU 15525, silafluofeno, tau-fluvalinato, teflutrina, teraletrina, tetrametrina (-1R-isómero), tralometrina, transflutrina, ZXI 8901, piretrinas (piretro)

DDT

40 oxadiacinas,

por ejemplo, indoxacarb

Agonistas/antagonistas de receptores de acetilcolina
cloronicotinilos,

por ejemplo, acetamiprida, clotianidina, dinotefurano, imidacloprida, nitenpiram, nitiacina, tiacloprida, tiametoxam

45 nicotina, bensultap, cartap

Moduladores de receptores de acetilcolina

Espinosinas,

por ejemplo, espinosad

Antagonistas del canal de cloruro controlado por GABA

50 Organocloro,

por ejemplo, campfeclor, clordano, endosulfano, gamma-HCH, HCH, heptacloro, lindano, metoxicloro

Fiproles,

por ejemplo, acetoprol, etiprol, fipronilo, pirafluprol, piriprol, vaniliprol

Activadores del canal de cloruro

55 Mectinas,

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

Miméticos de hormonas juveniles,

por ejemplo, diofenolano, epofenonano, fenoxicarb, hidropreno, quinopreno, metopreno, piriproxifeno, tripreno

Agonistas/disruptores de ecdisona

- diacilhidracinas,
 por ejemplo, cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida, tebufenozida
 Inhibidores de la biosíntesis de la quitina
 Benzoilureas,
 5 por ejemplo, bistriflurón, clofluzurón, diflubenzurón, fluazurón, flucicloxurón, flufenoxurón, hexaflumurón, lufenurón,
 novalurón, noviflumurón, penflurón, teflubenzurón, triflumurón
 buprofecina
 ciromacina
 Inhibidores de la fosforilación oxidativa, disruptores de ATP
 10 diafentiurón
 compuestos de organotina,
 por ejemplo, azociclotina, cihexatina, fenbutatin-óxido
 Desacopladores de la fosforilación oxidativa por interrupción de los gradientes de protones H
 pirrol,
 15 por ejemplo, clorfenapir
 dinitrofenoles,
 por ejemplo, binapacirl, dinobutón, dinocap, DNOC
 Inhibidores del transporte de electrones del sitio I
 METI
 20 por ejemplo, fenazaquina, fenpiroximato, pirimidifeno, piridabeno, tebufenpirad, tolfenpirad
 hidrametilnón
 dicofol
 Inhibidores del transporte de electrones del sitio II
 rotenones
 25 Inhibidores del transporte de electrones del sitio III
 acequinocilo, fluacripirim
 disruptores microbianos de membrana intestinal de insectos
 Cepas de *Bacillus thuringiensis*
 Inhibidores de la síntesis de grasas
 30 ácidos tetrónicos,
 por ejemplo, espiroclifeno, espiromesifeno
 ácidos tetrámicos,
 por ejemplo, espirotetramat (nº Reg. CAS: 203313-25-1) y carbonato de 3-(2,5-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1-
 azaspiro[4.5]dec-3-en-4-iletilo (también llamado: ácido carbónico, éster de 3-(2,5-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1-
 35 azaspiro[4.5]dec-3-en-4-iletilo, nº Reg. CAS: 382608-10-8)
 carboxamidas,
 por ejemplo, flonicamid
 agonistas octopaminérgicos,
 por ejemplo, amitraz
 40 Inhibidor de ATPasa estimulada por magnesio,
 propargita
 dicarboxamidas del ácido benzoico,
 por ejemplo, flubendiamida
 análogos de Nereistoxina,
 45 por ejemplo, tiociclám hidrógeno oxalato, tiosultap-sodio
 Agonistas del receptor de rianodina,
 dicarboxamidas del ácido benzoico,
 por ejemplo flubendiamida
 Productos biológicos, hormonas o feromonas
 50 azadiractina, *Bacillus spec.*, *Beauveria spec.*, codlemona, *Metarrhizium spec.*, *Paecilomyces spec.*, *thuringiensis*,
Verticillium spec.
 Compuestos activos con modo de acción desconocido o inespecífico
 fumigantes,
 por ejemplo, fosfuro de aluminio, bromuro de metilo, fluoruro de sulfuro
 55 inhibidores de la alimentación,
 por ejemplo, criolita, flonicamid, pimetrozina
 inhibidores del crecimiento de los ácaros,
 por ejemplo, clofentezina, etoxazol, hexitiazox
 amidoflumet, benclotiaz, benzoximato, bifenazato, bromopropilato, buprofezina, quinometionato, clordimeform,

clorobencilato, cloropicrina, clotiazobeno, ciclopreno, ciflumetofeno, diciclanilo, fenoxacrim, fentripanilo, flubencimina, flufenimer, flutenzina, gosipluro, hidrametilnona, japoniluro, metoxadiazona, petróleo, butóxido de piperonilo, oleato de potasio, piridililo, sulfluramida, tetradifón, tetrasul, triaratenó, verbutina

5 **[0149]** También es 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.

10 **[0150]** Los compuestos activos de la invención también pueden estar presentes en sus formulaciones comerciales normales cuando se usan como insecticidas así como en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones en mezcla con sinergistas. Los sinergistas son compuestos a través de los cuales puede incrementarse la actividad del compuesto activo sin que el sinergista añadido en sí tenga que ser activo.

15 **[0151]** Los compuestos activos de la invención pueden estar presentes también en sus formulaciones comerciales normales cuando se usan como insecticidas así como en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones en mezcla con inhibidores que reducen la degradación del compuesto activo después de su uso en el entorno de las plantas, en la superficie de las plantas o en los tejidos de las plantas.

20 **[0152]** Los componentes mencionados anteriormente para combinaciones son sustancias activas conocidas, muchas de las cuales se describen en Ch.R Worthing, S.B. Walker, The Pesticide Manual, 12ª edición, British Crop Protection Council, Farnham 2000.

25 **[0153]** Las dosis de uso eficaces de los compuestos empleados en la invención pueden variar dentro de amplios límites, dependiendo especialmente de la naturaleza de la plaga que se va a eliminar o del grado de infestación, por ejemplo, de cultivos con estas plagas. En general, las composiciones según la invención contienen normalmente de aproximadamente el 0,05 a aproximadamente el 95 % (en peso) de uno o varios ingredientes activos según la invención, de aproximadamente el 1 a aproximadamente el 95 % de uno o varios soportes sólidos o líquidos y, opcionalmente, de aproximadamente el 0,1 a aproximadamente el 50 % de uno o varios otros componentes compatibles, tales como agentes tensioactivos o similares.

30 **[0154]** En el presente documento, el término "soporte" denota un ingrediente orgánico o inorgánico, natural o sintético, con el que se combina el ingrediente activo para facilitar su aplicación, por ejemplo, a la planta, a las semillas o al suelo. Por tanto, este soporte es generalmente inerte y debe ser aceptable (por ejemplo, aceptable agronómicamente, en particular para la planta tratada).

35 **[0155]** El soporte puede ser un sólido, por ejemplo, arcillas, silicatos naturales o sintéticos, sílice, resinas, ceras, fertilizantes sólidos (por ejemplo, sales de amonio), minerales naturales pulverizados, tales como caolines, arcillas, talco, tiza, cuarzo, atapulgita, montmorillonita, bentonita o tierra diatomea, o minerales sintéticos pulverizados, tales como sílice, alúmina, o silicatos especialmente silicatos de aluminio o de magnesio. Como soportes sólidos para gránulos son adecuados los siguientes: rocas naturales trituradas o fraccionadas tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita y dolomita; gránulos sintéticos de harinas inorgánicas u orgánicas; gránulos de material orgánico tal como serrín, cáscaras de coco, mazorcas de maíz, cáscaras de maíz o tallos de tabaco; kieselguhr, fosfato de tricalcio, corcho pulverizado, o negro de carbón absorbente; polímeros, resinas y ceras solubles en agua; o fertilizantes sólidos. Dichas composiciones sólidas pueden contener, si se desea, uno o varios compatibles agentes de humectación, dispersantes, emulsionantes o colorantes que, cuando son sólidos, también pueden servir como diluyente

[0156] Los soportes sólidos adecuados son:

50 por ejemplo, polvos de minerales naturales y sales de amonio como caolín, arcillas, talco, tiza, cuarzo atapulgita, montmorillonita o tierra diatomea, y polvos minerales sintéticos tales como sílice, óxido de aluminio y silicatos altamente dispersados, adecuados como soportes para granulados son: por ejemplo, minerales naturales triturados y fraccionados tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita así como granulados sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas así como granulados de materiales orgánicos tales como papel, serrín, cáscaras de 55 coco, mazorcas de maíz y tallos de tabaco; son adecuados como emulsionantes y agentes espumantes; por ejemplo, emulsionantes no ionógenos y aniónicos tales como ésteres de ácidos grasos polioxietilénicos, éteres de alcoholes grasos polioxietilénicos, por ejemplo, éteres alquilarilpoliglicólicos, alquilsulfonatos, alquilsulfatos, arilsulfonatos e hidrolizados de proteínas; son adecuados como dispersantes materiales no iónicos y iónicos, por ejemplo, de la clase de ésteres de alcohol-POE y/o POP, ésteres de ácidos y/o POP o POE, éteres alquilarílico y/o

de POP o POE, aductos de grasas y/o POP o POE, derivados de polioles de POE y/o POP, POE-sorbitano y/o POP-sorbitano o aductos de azúcares, sulfatos, sulfonatos y fosfatos de alquilo o arilo o los aductos de éter PO respectivos. Además pueden usarse oligómeros o polímeros adecuados, por ejemplo, a partir de monómeros vinílicos, de ácido acrílico, de EO y/o PO en solitario o en combinación con, por ejemplo, (poli)alcoholes o (poli)aminas. Además pueden usarse lignina y sus derivados de ácidos sulfónicos, celulosas simples y modificadas, ácidos sulfónicos aromáticos y/o alifáticos así como sus aductos con formaldehído.

[0157] En las formulaciones pueden usarse acumuladores de depósitos tales como carboximetilcelulosa, polímeros naturales y sintéticos en polvo, granulares o de tipo látex, tales como goma arábica, polialcohol vinílico, poliacetato de vinilo así como fosfolípidos naturales como cefalinas y lecitinas y fosfolípidos sintéticos.

[0158] El soporte puede ser también líquido, por ejemplo: agua; alcoholes, en particular butanol o glicol, así como sus éteres o ésteres, en particular acetato de metilglicol; cetonas, especialmente acetona, ciclohexanona, metiletilcetona, metilisobutilcetona, o isoforona; fracciones de petróleo tales como hidrocarburos parafínicos o aromáticos, especialmente xilenos o alquilnaftalenos; aceites minerales o vegetales; hidrocarburos clorados alifáticos, en particular tricloroetano o cloruro de metileno; hidrocarburos clorados aromáticos, en particular clorobencenos; disolventes solubles en agua o fuertemente polares tales como dimetilformamida, sulfóxido de dimetilo o N-metilpirrolidona; gases licuados; o similares o una mezcla de los mismos.

[0159] El agente tensioactivo puede ser un agente emulsionante, agente dispersante o agente de humectación del tipo iónico o no iónico o una mezcla de dichos agentes tensioactivos. Entre estos están, por ejemplo, sales de poliácidos acrílicos, sales de ácidos lignosulfónicos, sales de ácidos fenolsulfónicos o naftalenosulfónicos, policondensados de óxido etilénico con alcoholes grasos o ácidos grasos o ésteres grasos o aminas grasas, fenoles sustituidos (en particular alquilfenoles o arilfenoles), sales de ésteres de ácido sulfosuccínico, derivados de taurina (en particular alquiltauratos), ésteres fosfóricos de alcoholes o de policondensados de óxido de etileno con fenoles, ésteres de ácidos grasos con polioles o derivados funcionales de sulfatos, sulfonatos o fosfatos de los compuestos anteriores. La presencia de al menos un agente tensioactivo es generalmente esencial cuando el ingrediente activo y/o el soporte inerte son sólo ligeramente solubles en agua o no son solubles en agua y el agente de soporte de la composición para su aplicación es el agua.

[0160] Las composiciones de la invención pueden contener además otros aditivos tales como adhesivos o colorantes. En las formulaciones pueden usarse adhesivos tales como carboximetilcelulosa o polímeros naturales o sintéticos en forma de polvos, gránulos o retículas, tales como goma arábica, polialcohol vinílico o poliacetato 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 azo o tintes de ftalocianina metálica; o nutrientes traza tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno o cinc.

[0161] Para su aplicación agrícola, los compuestos de la invención están por tanto generalmente en forma de composiciones, que están en varias formas sólidas o líquidas.

[0162] Las formas sólidas de las composiciones que pueden usarse son polvos (con un contenido del compuesto de la invención, que es de hasta el 80 %), polvos o gránulos humectables (que incluyen gránulos dispersables en agua), en particular los obtenidos por extrusión, compactación, impregnación de un soporte o granulación a partir de un polvo (estando el contenido del compuesto de la invención, en estos polvos o gránulos humectables comprendido entre aproximadamente el 0,5 y aproximadamente el 80 %). Pueden usarse composiciones homogéneas o heterogéneas sólidas que contienen uno o varios compuestos de la invención, por ejemplo, gránulos, granzas, briquetas o cápsulas, para tratar agua estancada o corriente durante un periodo de tiempo. Puede conseguirse un efecto similar usando suministro continuo o intermitente de concentrados dispersables en agua tal como se describe en la presente memoria descriptiva.

[0163] Entre las composiciones líquidas se incluyen, por ejemplo, soluciones o suspensiones acuosas o no acuosas (tales como concentrados emulsionables, emulsiones, productos fluidos, dispersiones o soluciones) o aerosoles. Entre las composiciones líquidas se incluyen también, en particular, concentrados emulsionables, dispersiones, emulsiones, productos fluidos, aerosoles, polvos humectables (o polvos para pulverización), productos fluidos secos o pastas en forma de composiciones que son líquidas o están destinadas a composiciones en forma líquida cuando se aplican, por ejemplo, como nebulizadores acuosos (lo que incluye volumen bajo y ultrabajo) o como aspersiones o aerosoles.

[0164] Las composiciones líquidas, por ejemplo, en forma de concentrados emulsionables o solubles comprenden con la máxima frecuencia de aproximadamente el 5 a aproximadamente el 80 % en peso del ingrediente activo, mientras que las emulsiones o soluciones que están preparadas para su aplicación contienen, en su caso, de aproximadamente el 0,01 a aproximadamente el 20 % del ingrediente activo. Además del disolvente, los 5 concentrados emulsionables o solubles pueden contener, cuando se requiere, de aproximadamente el 2 a aproximadamente el 50 % de aditivos adecuados, tales como estabilizadores, agentes tensioactivos, agentes de penetración, inhibidores de corrosión, colorantes o adhesivos. A partir de estos concentrados pueden obtenerse emulsiones de cualquier concentración requerida, que son adecuadas especialmente para su aplicación, por ejemplo, a plantas por dilución con agua. Estas composiciones se incluyen dentro del ámbito de las composiciones 10 que pueden emplearse en la presente invención. Las emulsiones pueden estar en forma de agua sobre aceite o aceite sobre agua y pueden tener una consistencia espesa.

[0165] Las composiciones líquidas de la presente invención pueden usarse, además de en aplicaciones de uso agrícola normal, por ejemplo, para tratar sustratos o sitios infestados o susceptibles de infestación por 15 artrópodos (u otras plagas controladas por compuestos de la presente invención) lo que incluye instalaciones, zonas de almacenamiento o procesamiento al aire libre o en interior, contenedores o equipos o agua estancada o corriente.

[0166] Todas estas dispersiones o emulsiones acuosas o mezclas de pulverización pueden aplicarse, por ejemplo, a cultivos por cualquier medio adecuado, principalmente por pulverización, en tasas que son generalmente 20 del orden de aproximadamente 100 a aproximadamente 1.200 litros de mezcla de pulverización por hectárea, si bien puede ser superior o inferior (por ejemplo, volumen bajo o ultrabajo) dependiendo de la necesidad o la técnica de aplicación. El compuesto o las composiciones según la invención se aplican convenientemente a la vegetación y en particular a raíces u hojas que tienen plagas que deben eliminarse. Otro procedimiento de aplicación de los compuestos o composiciones según la invención es por quimirriego, es decir, la adición de una formulación que 25 contiene el ingrediente activo en el agua de riego. Este riego puede ser riego por aspersión para pesticidas foliares o puede ser riego en el terreno o riego subterráneo para el suelo o para pesticidas sistémicos.

[0167] Las suspensiones concentradas, que pueden aplicarse por pulverización, se preparan de manera que produzcan un producto fluido estable que no se sedimenta (pulverización fina) y contienen normalmente de 30 aproximadamente el 10 a aproximadamente el 75 % en peso de ingrediente activo, de aproximadamente el 0,5 a aproximadamente el 30 % de agentes tensioactivos, de aproximadamente el 0,1 a aproximadamente el 10 % de agentes tixotrópicos, de aproximadamente el 0 a aproximadamente el 30 % de aditivos adecuados, tales como agentes antiespumantes, inhibidores de corrosión, estabilizadores, agentes de penetración, adhesivos y, como soporte, agua o un líquido orgánico en el que el ingrediente activo es escasamente soluble o insoluble. Algunos 35 sólidos orgánicos o sales inorgánicas pueden disolverse en el soporte para ayudar a la sedimentación o como anticongelantes para el agua.

[0168] Los polvos humectables (o polvos para pulverización) se preparan normalmente de manera que contienen de aproximadamente el 10 a aproximadamente el 80 % en peso de ingrediente activo, de 40 aproximadamente el 20 a aproximadamente el 90 % de un soporte sólido, de aproximadamente el 0 a aproximadamente el 5 % de un agente de humectación, de aproximadamente el 3 a aproximadamente el 10 % de un agente dispersante y, cuando es necesario, de aproximadamente el 0 a aproximadamente el 80 % de uno o varios estabilizadores y/u otros aditivos, tales como agentes de penetración, adhesivos, agentes antiapelmazantes, colorantes, o similares. Para obtener estos polvos humectables, el ingrediente activo se mezcla detenidamente en 45 una mezcladora adecuada con sustancias adicionales que pueden impregnarse en la carga porosa y se pulverizan con una muela u otra trituradora adecuada. Así se producen polvos humectables, cuya humectabilidad y capacidad de suspensión son ventajosos. Pueden suspenderse en agua para proporcionar cualquier concentración deseada y esta suspensión puede emplearse muy ventajosamente en particular para su aplicación a las hojas de las plantas.

50 **[0169]** Los "gránulos dispersables en agua (GDA)" (gránulos que son fácilmente dispersables en agua) tienen composiciones que son sustancialmente cercanas a las de los polvos humectables. Pueden prepararse por granulación de formulaciones descritas para los polvos humectables, ya sea por una vía húmeda (con puesta en contacto del ingrediente activo finamente dividido con la carga inerte y un poco de agua, por ejemplo, del 1 al 20 % 55 en peso, o con una solución acuosa de un agente dispersante o un aglutinante, seguido de secado y tamizado), o por una vía seca (compactación seguida de trituración y tamizado).

[0170] 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. En términos generales, las composiciones para su aplicación para el control de plagas de artrópodos o nematodos de plantas contienen

normalmente de aproximadamente el 0,00001 % a aproximadamente el 95 %, más en particular de aproximadamente el 0,0005 % a aproximadamente el 50 % en peso de uno o varios compuestos de la invención, o de ingredientes activos totales (es decir, los compuestos de la invención, junto con otras sustancias tóxicas para los artrópodos o nematodos de las plantas, sinergistas, elementos traza o estabilizadores). Las composiciones reales
 5 empleadas y su tasa de aplicación se seleccionarán para conseguir el o los efectos deseados por el agricultor, el productor agrícola, el profesional médico o veterinario, el operador de control de plagas u otro experto en la materia. Las composiciones sólidas o líquidas para su aplicación tópica a animales, madera, productos almacenados o artículos domésticos contienen normalmente de aproximadamente el 0,00005 % a aproximadamente el 90 %, más
 10 en particular de aproximadamente el 0,001 % a aproximadamente el 10 %, en peso de uno o varios compuestos de la invención. Para la administración a animales por vía oral o parenteral, incluida la percutánea de composiciones sólidas o líquidas, éstas contienen normalmente de aproximadamente el 0,1 % a aproximadamente el 90 % en peso de uno o varios compuestos de la invención. Los piensos con medicación contienen normalmente de aproximadamente el 0,001 % a aproximadamente el 3 % en peso de uno o varios compuestos de la invención. Los
 15 concentrados o suplementos para su mezcla con piensos contienen normalmente de aproximadamente el 5 % a aproximadamente el 90 %, preferentemente de aproximadamente el 5 % a aproximadamente el 50 %, en peso de uno o varios compuestos de la invención. Las piedras de sal mineral contienen normalmente de aproximadamente el 0,1 % a aproximadamente el 10 % en peso de uno o varios compuestos de fórmula (I) o sales aceptables en términos de pesticidas de los mismos.

20 **[0171]** Los polvos o composiciones líquidas para su aplicación a ganado, bienes, instalaciones o zonas al aire libre pueden contener de aproximadamente el 0,0001 % a aproximadamente el 15 %, más especialmente de aproximadamente el 0,005 % a aproximadamente el 2,0 %, en peso, de uno o varios compuestos de la invención. Las concentraciones adecuadas en aguas tratadas están comprendidas entre aproximadamente 0,0001 ppm y aproximadamente 20 ppm, más en particular de aproximadamente 0,001 ppm a aproximadamente 5,0 ppm de uno o
 25 varios compuestos de la invención, y pueden usarse terapéuticamente en piscicultura con tiempos de exposición apropiados. Los cebos comestibles pueden contener de aproximadamente el 0,01 % a aproximadamente el 5 %, preferentemente de aproximadamente el 0,01 % a aproximadamente el 1,0 %, en peso, de uno o varios compuestos de la invención.

30 **[0172]** Cuando se administran a vertebrados por vía parenteral, oral o por vía percutánea u otros medios, la dosificación de compuestos de la invención dependerá de la especie, la edad o el estado de salud del vertebrado y de la naturaleza y el grado de su infestación real o potencial por plagas de artrópodos o helmintos. Una única dosis de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 100 mg, preferentemente 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, preferentemente de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 5,0 mg, por kg de peso corporal del animal al día, para medicación sostenida, son generalmente adecuadas por administración oral o
 35 parenteral. Usando estas formulaciones o dispositivos de liberación sostenida, las dosis diarias requeridas durante un periodo de meses pueden combinarse y administrarse animales en una sola vez.

40 **[0173]** Las siguientes composiciones A-M ilustran composiciones para su uso contra artrópodos, especialmente ácaros o insectos, o nematodos de las plantas, que comprenden, como ingrediente activo, compuestos de la invención, tal como se describen en los ejemplos preparatorios. Las composiciones descritas en las composiciones A-M pueden diluirse cada una para proporcionar una composición pulverizable en concentraciones adecuadas para su uso en el terreno.
 45

[0174] A continuación se proporcionan las descripciones químicas genéricas de los ingredientes (para los cuales todos los porcentajes siguientes son porcentajes en peso), usados en las composiciones A-M ilustradas seguidamente:

50	Nombre comercial	Descripción química
	Ethylan BCP	Condensado de óxido de nonilfenoletileno
	Soprophor BSU	Condensado de óxido de trisilfenoletileno
	Arylan CA	Solución al 70 % p/v de dodecibencenosulfonato de calcio
	Solvesso 150	Disolvente aromático C ₁₀ ligero
55	Arylan S	Dodecibencenosulfonato de sodio
	Darvan NO ₂	Lignosulfonato de sodio
	Celite PF	Soporte de silicato de magnesio sintético
	Sopropon T36	Sales sódicas de ácidos policarboxílicos
	Rhodigel 23	Goma de xantano de polisacáridos

Bentone 38 Derivado orgánico de montmorillonita de magnesio
Aerosil Dióxido de silicio microfino

Composición A

5

[0175] Se prepara un concentrado soluble en agua con la composición siguiente:

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

[0176] A una solución de Ethylan BCP disuelto en una parte de N-metilpirrolidona se le añade el ingrediente activo con calentamiento y agitación hasta disolución. La solución resultante se prepara hasta el volumen con el resto del disolvente.

15

Composición B

[0177] Se prepara un concentrado emulsionable (CE) con la composición siguiente:

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

25

[0178] Se disuelven los tres primeros componentes en N-metilpirrolidona y a lo anterior se le añade el Solvesso 150 para proporcionar el volumen final.

Composición C

30

[0179] Se prepara un polvo humectable (PH) con la composición siguiente:

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

[0180] Los ingredientes se mezclan y se trituran en un molino de martillos hasta conseguir un polvo con un tamaño de partícula de menos que 50 micrómetros.

40

Composición D

[0181] Se prepara una formulación fluida acuosa con la composición siguiente:

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

[0182] Los ingredientes se mezclan íntimamente y se pulverizan en un molino de perlas hasta que se obtiene un tamaño de partícula medio de menos de 3 micrómetros.

55 Composición E

[0183] Se prepara un concentrado de suspensión emulsionable con la composición siguiente:

	Ingrediente activo	30,0 %
--	--------------------	--------

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

- 5 **[0184]** Los ingredientes se mezclan íntimamente y se trituran en un molino de perlas hasta que se obtiene un tamaño de partícula medio de menos de 3 micrómetros.

Composición F

- 10 **[0185]** Se prepara un granulo dispersable en agua con la composición siguiente:

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

- [0186]** Los ingredientes se mezclan, se micronizan en un molino de energía de fluidos y a continuación se granulan en un peletizador giratorio por pulverización con agua (hasta el 10 %). Los gránulos resultantes se secan en una secadora de lecho fluido para eliminar el exceso de agua.

20
Composición G

- [0187]** Se prepara un polvo fino con la composición siguiente:

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

- [0188]** Los ingredientes se mezclan íntimamente y se pulverizan adicionalmente según sea necesario para conseguir un polvo fino. Este polvo puede aplicarse a un lugar de infestación con artrópodos, por ejemplo, vertidos de residuos, productos almacenados o artículos domésticos o animales infestados, o en riesgo de infestación, por artrópodos para controlar los artrópodos por ingestión oral. Entre los medios adecuados para distribuir el polvo fino en el lugar de infestación por artrópodo se incluyen ventiladores mecánicos, dispositivos de agitación manual o dispositivos de autotratamiento del ganado.

35
Composición H

- [0189]** Se prepara una base comestible con la composición siguiente:

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

- [0190]** Los ingredientes se mezclan íntimamente y se conforman según se requiera en forma de cebo. Este cebo comestible puede distribuirse en un lugar, por ejemplo, instalaciones industriales o domésticas, como cocinas, hospitales o almacenes, o en zonas al aire libre, infestado por artrópodos como, por ejemplo, hormigas, langostas, cucarachas o moscas, para controlar los artrópodos por ingestión oral.

Composición I

- 50 **[0191]** Se prepara una formulación de la solución con una composición como la siguiente:

	Ingrediente activo	15 %
	Sulfóxido de dimetilo	85 %

- 55 **[0192]** El ingrediente activo se disuelve en sulfóxido de dimetilo con mezclado y/o calentamiento según se requiera. Esta solución puede aplicarse por vía percutánea mediante una aplicación de vertido a animales domésticos infestados por artrópodos o, después de esterilización por filtración a través de una membrana de politetrafluoroetileno (tamaño de poro de 0,22 micrómetros), por inyección parenteral, a una tasa de aplicación de 1,2 a 12 ml de solución por 100 kg de peso corporal del animal.

Composición J

[0193] Se prepara un polvo humectable con la composición siguiente:

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

10

[0194] El Ethylan BCP es absorbido en el Aerosil que a continuación se mezcla con los otros ingredientes y se pulveriza en un molino de martillos para proporcionar un polvo humectable, que puede diluirse con agua hasta una concentración del 0,001 % al 2 % en peso del compuesto activo y se aplica en un lugar de infestación por artrópodos, por ejemplo, larvas de dípteros o nematodos de las plantas, por pulverización, o a animales domésticos infestados, o en riesgo de infección, por artrópodos, por pulverización o goteo, o por administración oral en agua potable, para el control de los artrópodos.

Composición K

20 **[0195]** Se forma una composición de bolo de liberación lenta a partir de gránulos que contienen los siguientes componentes en diversos porcentajes (similares a los descritos para las composiciones anteriores) dependiendo de la necesidad:

25		
	Ingrediente activo	
	Agente de densidad	
	Agente de liberación lenta	
	Aglutinante	

30 **[0196]** Los ingredientes mezclados íntimamente se forman en gránulos que se comprimen en un bolo con una densidad específica de 2 o más. Este preparado puede administrarse oralmente a animales domésticos rumiantes para su retención dentro del retículo-rumen con el fin de proporcionar una liberación lenta continua de compuesto activo durante un periodo de tiempo extendido para controlar la infestación de los animales domésticos rumiantes por artrópodos.

35 Composición L

[0197] Puede prepararse una composición de liberación lenta en forma de gránulos, granzas, briquetas o similares con composiciones del modo siguiente:

40		
	Ingrediente activo	0,5 a 25 %
	Policloruro de vinilo	75 a 99,5 %
	Ftalato de dioctilo (plastificante)	

45 **[0198]** Los componentes se mezclan y a continuación se conforman en formas adecuadas mediante extrusión con fusión o moldeado. Estas composiciones son útiles, por ejemplo, para adición a agua estancada o para fabricación en collares o etiquetas de orejas para su fijación en animales domésticos con el fin de control de plagas por liberación lenta.

Composición M

50

[0199] Se prepara un gránulo dispersable en agua con la composición siguiente:

55		
	Ingrediente activo	85 % (máx.)
	Polivinilpirrolidona	5 %
	Arcilla de atapulgita	6 %
	Laurilsulfato de sodio	2 %
	Glicerina	2 %

[0200] Los ingredientes se mezclan como una suspensión espesa al 45 % con agua y se muelen en húmedo

hasta un tamaño de partícula de 4 micrómetros, y a continuación se secan con pulverización para eliminar el agua.

[0201] Los siguientes Ejemplos no limitativos ilustran la preparación de los compuestos de fórmula (I).

5 Ejemplos químicos

[0202] Los espectros de RMN se obtuvieron en deuterocloroformo salvo que se indique lo contrario, y los desplazamientos de proporcionan en ppm.

10 **[0203]** En los Ejemplos que se muestran a continuación, las cantidades (también los porcentajes) están basadas en pesos, salvo que se indique lo contrario.

Ejemplo 1

15 **1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-5-piperazin-1-il-4-[(trifluorometil)sulfonyl]-1H-pirazol-3-carbonitrilo**

[0204] A una mezcla de 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-5-bromo-4-trifluorometilsulfonylpirazol (5,00 g, 9,7 mmol) en THF (50 mL) se añadieron piperazina (2,08 g, 24,2 mmol) y trietilamina (1,96 g, 19,3 mmol). Se agitó la mezcla a 20-30°C durante 24 h. El trabajo extractivo (heptano-acetato de etilo, agua, NaOH) y la recristalización a partir de isopropanol produjeron el producto del título (Compuesto 01-03, 3,58 g) en forma de sólido; 1H-RMN: 2,71 (4H), 3,13 (4H), 7,85 (2H) ppm; 19F-RMN: -64,2 (PhCF₃); -79,5 ppm (SO₂CF₃).

Ejemplo 2

25 **1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-5-(4-bencilpiperazin-1-il)-4-[(trifluorometil)sulfonyl]-1H-pirazol-3-carbonitrilo**

[0205] A una mezcla de 1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-5-piperazin-1-il-4-[(trifluorometil)sulfonyl]-1H-pirazol-3-carbonitrilo (0,40 g, 0,8 mmol) y diisopropiletilamina (0,13 g, 1,0 mmol) en dioxano (5 mL) se añadió bromuro de bencilo (0,14 g, 0,8 mmol) y se sometió a reflujo durante 5 h. El trabajo extractivo (heptano-acetato de etilo, agua) y la cromatografía produjeron el producto del título (Compuesto 01-45, 0,31 g) en forma de un aceite; 1H-RMN: 2,30 (4H), 3,19 (4H), 3,45 (2H), 7,25 (5H), 7,82 (2H); 19F-RMN: -64,1 (PhCF₃); -79,6 ppm (SO₂CF₃).

Ejemplo 3

35 **1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-5-(4-etoxicarbonilpiperazin-1-il)-4-[(trifluorometil)sulfonyl]-1H-pirazol-3-carbonitrilo**

[0206] A una mezcla de 1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-5-piperazin-1-il-4-[(trifluorometil)sulfonyl]-1H-pirazol-3-carbonitrilo (0,20 g, 0,4 mmol) y diisopropiletilamina (0,10 g, 0,8 mmol) en THF (5 mL) se añadió cloroformiato de etilo (0,05 g, 0,5 mmol) y se agitó a 20°C durante 5 h. El trabajo extractivo (heptano-acetato de etilo, agua) produjo el producto del título (Compuesto 04-06, 0,21 g) en forma de sólido; 1H-RMN: 1,23 (3H), 3,13 (4H), 3,35 (4H), 4,11 (2H); 7,85 (2H); 19F-RMN: -63,7 (PhCF₃); -79,0 ppm (SO₂CF₃).

45 **[0207]** Las tablas siguientes comprenden compuestos de fórmula (I) preparados de acuerdo con o de forma análoga a los ejemplos 1, 2 ó 3 descritos anteriormente o los procedimientos generales descritos anteriormente.

[0208] En las Tablas c significa ciclo (por ejemplo, cPr es ciclopropilo), i significa iso, t significa terc, Me significa metilo, Et significa etilo, Pr significa propilo, Bu significa butilo y Ph significa fenilo. Cuando se omiten los subíndices después de los átomos se entenderá que es deliberado, por ejemplo, CH₃ significa CH₃. Los números de compuestos se proporcionan sólo con fines de referencia.

Tablas

55 **[0209]** En las tablas siguientes los compuestos marcados con un asterisco (*) se incluyen sólo con fines de referencia.

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

Comp. número		R4	n	Pf. °C, RMN (ppm)
01-	01	H	0	
01-	02	H	1	
01-	03	H	2	19F: -64,2; -79,5
*01-	04	CH ₂ CH=CH ₂	0	
*01-	05	CH ₂ CH=CH ₂	1	-
*01-	06	CH ₂ CH=CH ₂	2	-
*01-	07	CH ₂ CH=CH-CH ₃	0	
*01-	08	CH ₂ CH=CH-CH ₃	1	
*01-	09	CH ₂ CH=CH-CH ₃	2	
*01-	10	CH ₂ CH=CCl ₂	0	
*01-	11	CH ₂ CH=CCl ₂	1	
*01-	12	CH ₂ CH=CCl ₂	2	
*01-	13	CH ₂ CF ₃	0	
*01-	14	CH ₂ CF ₃	1	
*01-	15	CH ₂ CF ₃	2	
*01-	16	CH ₂ CCH	0	
*01-	17	CH ₂ CCH	1	
*01-	18	CH ₂ CCH	2	
*01-	19	cC ₃ H ₅	0	
*01-	20	cC ₃ H ₅	1	
*01-	21	cC ₃ H ₅	2	
*01-	22	cC ₄ H ₇	0	
*01-	23	cC ₄ H ₇	1	
*01-	24	cC ₄ H ₇	2	
*01-	25	cC ₅ H ₉	0	
*01-	26	cC ₅ H ₉	1	
*01-	27	cC ₅ H ₉	2	19F: -63,8; -79,1
*01-	28	cC ₆ H ₁₁	0	
*01-	29	cC ₆ H ₁₁	1	
*01-	30	cC ₆ H ₁₁	2	
*01-	31	cC ₇ H ₁₃	0	
*01-	32	cC ₇ H ₁₃	1	
*01-	33	cC ₇ H ₁₃	2	
*01-	34	CC ₃ H ₅ CH ₂	0	
*01-	35	cC ₃ H ₅ CH ₂	1	
*01-	36	cC ₃ H ₅ CH ₂	2	
*01-	37	cC ₅ H ₉ CH ₂	0	
*01-	38	cC ₅ H ₉ CH ₂	1	
*01-	39	cC ₅ H ₉ CH ₂	2	
*01-	40	cC ₆ H ₁₁ CH ₂	0	
*01-	41	cC ₆ H ₁₁ CH ₂	1	
*01-	42	cC ₆ H ₁₁ CH ₂	2	
01-	43	CH ₂ Ph	0	
01-	44	CH ₂ Ph	1	
01-	45	CH ₂ Ph	2	19F: -64,1; -79,6
*01-	46	C ₂ H ₄ Ph	0	
*01-	47	C ₂ H ₄ Ph	1	
*01-	48	C ₂ H ₄ Ph	2	
*01-	49	C ₃ H ₆ Ph	0	
*01-	50	C ₃ H ₆ Ph	1	
*01-	51	C ₃ H ₆ Ph	2	

ES 2 515 099 T3

*01-	52	CH(Me)Ph	0	
*01-	53	CH(Me)Ph	1	
*01-	54	CH(Me)Ph	2	19F: -63,7; -79,1
*01-	55	Ph	0	
*01-	56	Ph	1	
*01-	57	Ph	2	19F: -63,7; -79,0
*01-	58	14-Cl-C6H4	0	
*01-	59	4-Cl-C6H4	1	
*01-	60	4-Cl-C6H4	2	
*01-	61	4-CF3-C6H4	0	
*01-	62	4-CF3-C6H4	1	
*01-	63	4-CF3-C6H4	2	
*01-	64	4-O2N-C6H4	0	
*01-	65	4-O2N-C6H4	1	
*01-	66	4-O2N-C6H4	2	
*01-	67	4-MeO-C6H4	0	
*01-	68	4-MeO-C6H4	1	
*01-	69	4-MeO-C6H4	2	
*01-	70	4-F-C6H4	0	
*01-	71	4-F-C6H4	1	
*01-	72	4-F-C6H4	2	
*01-	73	2-Piridilo	0	
*01-	74	2-Piridilo	1	
*01-	75	2-Piridilo	2	
*01-	76	3-Piridilo	0	
*01-	77	3-Piridilo	1	
*01-	78	3-Piridilo	2	
*01-	79	4-Piridilo	0	
*01-	80	4-Piridilo	1	
*01-	81	4-Piridilo	2	
*01-	82	2-Pirimidinilo	0	
*01-	83	2-Pirimidinilo	1	
*01-	84	2-Pirimidinilo	2	
*01-	85	4-Pirimidinilo	0	
*01-	86	4-Pirimidinilo	1	
*01-	87	4-Pirimidinilo	2	
*01-	88	C2H4OMe	0	
*01-	89	C2H4OMe	1	
*01-	90	C2H4OMe	2	
*01-	91	C2H4SMe	0	
*01-	92	C2H4SMe	1	
*01-	93	C2H4SMe	2	
*01-	94	C2H4SOMe	0	
*01-	95	C2H4SOMe	1	
*01-	96	C2H4SOMe	2	
*01-	97	C2H4SO2Me	0	
*01-	98	C2H4SO2Me	1	
*01-	99	C2H4SO2Me	2	

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

R¹ es CN; R² es Cl; R³, R⁵ son CF₃; A y E = C₂H₄
R⁴ = Acilo

Comp. número		R4	n	pf. °C, RMN (ppm)
02-	01	CO-H	0	
02-	02	CO-H	1	
02-	03	CO-H	2	
02-	04	COCH3	0	
02-	05	COCH3	1	
02-	06	COCH3	2	
02-	07	COC2H5	0	
02-	08	COC2H5	1	
02-	09	COC2H5	2	19F: -63,7; -79,1
02-	10	COnc3H7	0	
02-	11	COnc3H7	1	
02-	12	COnc3H7	2	
02-	13	COic3H7	0	
02-	14	COic3H7	1	
02-	15	COic3H7	2	
02-	16	COnc4H9	0	
02-	17	COnc4H9	1	
02-	18	COnc4H9	2	
02-	19	COTbu	0	
02-	20	COTbu	1	
02-	21	COTbu	2	19F: -63,7; -79,0
02-	22	COcC3H5	0	
02-	23	COcC3H5	1	
02-	24	COcC3H5	2	
02-	25	COcC4H7	0	
02-	26	COcC4H7	1	
02-	27	COcC4H7	2	
02-	28	COcC5H9	0	
02-	29	COcC5H9	1	
02-	30	COcC5H9	2	
02-	31	COcC6H11	0	
02-	32	COcC6H11	1	
02-	33	COcC6H11	2	
02-	34	COCH=CH2	0	
02-	35	COCH=CH2	1	
02-	36	COCH=CH2	2	
02-	37	COC(Me)=CH2	0	
02-	38	COC(Me)=CH2	1	
02-	39	COC(Me)=CH2	2	
02-	40	COPh	0	
02-	41	COPh	1	
02-	42	COPh	2	19F: -64,1; -79,5
02-	43	CO-(4-Cl-Ph)	0	
02-	44	CO-(4-Cl-Ph)	1	
02-	45	CO-(4-Cl-Ph)	2	
02-	46	CO-(4-Me-Ph)	0	
02-	47	CO-(4-Me-Ph)	1	
02-	48	CO-(4-Me-Ph)	2	
02-	49	CO-(2,6-F2-Ph)	0	
02-	50	CO-(2,6-F2-Ph)	1	
02-	51	CO-(2,6-F2-Ph)	2	19F: -63,7; -79,0; -113,1

ES 2 515 099 T3

02-	52	CO-(2-Cl-Ph)	0	
02-	53	CO-(2-Cl-Ph)	1	
02-	54	CO-(2-Cl-Ph)	2	
02-	55	CO-(4-MeO-Ph)	0	
02-	56	CO-(4-MeO-Ph)	1	
02-	57	CO-(4-MeO-Ph)	2	
02-	58	COCH2Ph	0	
02-	59	COCH2Ph	1	
02-	60	COCH2Ph	2	
02-	61	COCH2CH2Ph	0	
02-	62	COCH2CH2Ph	1	
02-	63	COCH2CH2Ph	2	
02-	64	CO-COOH	0	
02-	65	CO-COOH	1	
02-	66	CO-COOH	2	
02-	67	CO-COOMe	0	
02-	68	CO-COOMe	1	
02-	69	CO-COOMe	2	
02-	70	CO-COOEt	0	
02-	71	CO-COOEt	1	
02-	72	CO-COOEt	2	19F: -63,7; -79,0
02-	73	CO-COOnBu	0	
02-	74	CO-COOnBu	1	
02-	75	CO-COOnBu	2	
02-	76	COC2H4COOH	0	
02-	77	COC2H4COOH	1	
02-	78	COC2H4COOH	2	19F: -63,7; -79,0
02-	79	COC2H4COOMe	0	
02-	80	COC2H4COOMe	1	
02-	81	COC2H4COOMe	2	
02-	82	COC2H4CONMe2	0	
02-	83	COC2H4CONMe2	1	
02-	84	COC2H4CONMe2	2	
02-	85	COCH2NMe2	0	
02-	86	COCH2NMe2	1	
02-	87	COCH2NMe2	2	
02-	88	COCH2Cl	0	
02-	89	COCH2Cl	1	
02-	90	COCH2Cl	2	
02-	91	COCH2OEt	0	
02-	92	COCH2OEt	1	
02-	93	COCH2OEt	2	
02-	94	COCH2OMe	0	
02-	95	COCH2OMe	1	
02-	96	COCH2OMe	2	
02-	97	COCF3	0	
02-	98	COCF3	1	
02-	99	COCF3	2	

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

R¹ es CN; R² es Cl; R³, R⁹ son CF₃; A y E = C₂H₄
R⁴ = sulfonilo

Comp. número	R4	n	pf. °C, RMN (ppm)
03-01	SO ₂ Me	0	
03-02	SO ₂ Me	1	
03-03	SO ₂ Me	2	19F: -63,7; -79,1
03-04	SO ₂ Et	0	
03-05	SO ₂ Et	1	
03-06	SO ₂ Et	2	
03-07	SO ₂ nPr	0	
03-08	SO ₂ nPr	1	
03-09	SO ₂ nPr	2	
03-10	SO ₂ C ₃ H ₆ Cl	0	
03-11	SO ₂ C ₃ H ₆ Cl	1	
03-12	SO ₂ C ₃ H ₆ Cl	2	
03-13	SO ₂ CF ₃	0	
03-14	SO ₂ CF ₃	1	
03-15	SO ₂ CF ₃	2	
03-16	SO ₂ CH ₂ Ph	0	
03-17	SO ₂ CH ₂ Ph	1	
03-18	SO ₂ CH ₂ Ph	2	
03-19	SO ₂ Ph	0	
03-20	SO ₂ Ph	1	
03-21	SO ₂ Ph	2	
03-22	SO ₂ (4-Me-Ph)	0	
03-23	SO ₂ (4-Me-Ph)	1	
03-24	SO ₂ (4-Me-Ph)	2	
03-25	SO ₂ (4-Cl-Ph)	0	
03-26	SO ₂ (4-Cl-Ph)	1	
03-27	SO ₂ (4-Cl-Ph)	2	
03-28	SO ₂ NMe ₂	0	
03-29	SO ₂ NMe ₂	1	
03-30	SO ₂ NMe ₂	2	
03-31	SO ₂ NEt ₂	0	
03-32	SO ₂ NEt ₂	1	
03-33	SO ₂ NEt ₂	2	

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

R¹ es CN; R² es Cl; R³, R⁵ son CF₃; A y E = C₂H₄R⁴N= carbamato

Comp. número		R4	n	pf. °C, RMN (ppm)
04-	01	COOMe	0	
04-	02	COOMe	1	
04-	03	COOMe	2	
04-	04	COOEt	0	
04-	05	COOEt	1	
04-	06	COOEt	2	19F: -63,7; -79,0
04-	07	COOnPr	0	
04-	08	COOnPr	1	
04-	09	COOnPr	2	
04-	10	COOiPr	0	
04-	11	COOiPr	1	
04-	12	COOiPr	2	
04-	13	COOnBu	0	
04-	14	COOnBu	1	
04-	15	COOnBu	2	
04-	16	COOsecBu	0	
04-	17	COOsecBu	1	
04-	18	COOsecBu	2	
04-	19	COOisoBu	0	
04-	20	COOisoBu	1	
04-	21	COOisoBu	2	
04-	22	COOtBu	0	
04-	23	COOtBu	1	
04-	24	COOtBu	2	
04-	25	COOnC5H11	0	
04-	26	COOnC5H11	1	
04-	27	COOnC5H11	2	
04-	28	COOneoC5H11	0	
04-	29	COOneoC5H11	1	
04-	30	COOneoC5H11	2	
04-	31	COOnC6H13	0	
04-	32	COOnC6H13	1	
04-	33	COOnC6H13	2	
04-	34	COOCH ₂ CH=CH ₂	0	
04-	35	COOCH ₂ CH=CH ₂	1	
04-	36	COOCH ₂ CH=CH ₂	2	
04-	37	COOCH ₂ CCH	0	
04-	38	COOCH ₂ CCH	1	
04-	39	COOCH ₂ CCH	2	
04-	40	COO-cC5H9	0	
04-	41	COO-cC5H9	1	
04-	42	COO-cC5H9	2	
04-	43	COO-cC6H11	0	
04-	44	COO-cC6H11	1	
04-	45	COO-cC6H11	2	
04-	46	COOCH ₂ Ph	0	
04-	47	COOCH ₂ Ph	1	
04-	48	COOCH ₂ Ph	2	
04-	49	COOC ₂ H ₄ Ph	0	
04-	50	COOC ₂ H ₄ Ph	1	
04-	51	COOC ₂ H ₄ Ph	2	

ES 2 515 099 T3

04-	52	COOC3H6Ph	0	
04-	53	COOC3H6Ph	1	
04-	54	COOC3H6Ph	2	
04-	55	COOPh	0	
04-	56	COOPh	1	
04-	57	COOPh	2	
04-	58	COO(4-Cl-Ph)	0	
04-	59	COO(4-Cl-Ph)	1	
04-	60	COO(4-Cl-Ph)	2	
04-	61	COOCH(Me)Ph	0	
04-	62	COOCH(Me)Ph	1	
04-	63	COOCH(Me)Ph	2	
04-	64	COOCH2(4-Cl-Ph)	0	
04-	65	COOCH2(4-Cl-Ph)	1	
04-	66	COOCH2(4-Cl-Ph)	2	
04-	67	COOCH2(2-piridilo)	0	
04-	68	COOCH2(2-piridilo)	1	
04-	69	COOCH2(2-piridilo)	2	
04-	70	COOCH2(3-piridilo)	0	
04-	71	COOCH2(3-piridilo)	1	
04-	72	COOCH2(3-piridilo)	2	
04-	73	COOCH2(4-piridilo)	0	
04-	74	COOCH2(4-piridilo)	1	
04-	75	COOCH2(4-piridilo)	2	
04-	76	CONHMe	0	
04-	77	CONHMe	1	
04-	78	CONHMe	2	
04-	79	CONHEt	0	
04-	80	CONHEt	1	
04-	81	CONHEt	2	
04-	82	CONMe2	0	
04-	83	CONMe2	1	
04-	84	CONMe2	2	
04-	85	CONH(4-Cl-fenilo)	0	
04-	86	CONH(4-Cl-fenilo)	1	
04-	87	CONH(4-Cl-fenilo)	2	
04-	88	CONHPh	0	
04-	89	CONHPh	1	
04-	90	CONHPh	2	

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

R¹ es CN; R² es Cl; R³, R⁵ son CF₃, E = C₂H₄
 variación de A y R⁴

Comp.	A	A	R ⁴	n	pf. °C, RMN (ppm)
A	A				
*05-	01	CH ₂ H	H	0	
*05-	02	CH ₂	H	1	
*05-	03	CH ₂	H	2	
*05-	04	CH ₂	Me	0	
*05-	05	CH ₂	Me	1	
*05-	06	CH ₂	Me	2	
*05-	07	CH ₂	CH ₂ Ph	0	
*05-	08	CH ₂	CH ₂ Ph	1	
*05-	09	CH ₂	CH ₂ Ph	2	
*05-	10	COCH ₂	H	0	
*05-	11	COCH ₂	H	1	
*05-	12	COCH ₂	H	2	19F: -63,8; -78,8
*05-	13	COCH ₂	Me	0	
*05-	14	COCH ₂	Me	1	
*05-	15	COCH ₂	Me	2	
*05-	16	COCH ₂	Et	0	
*05-	17	COCH ₂	Et	1	
*05-	18	COCH ₂	Et	2	
*05-	19	CH(Me)CH ₂	H	0	
*05-	20	CH(Me)CH ₂	H	1	
*05-	21	CH(Me)CH ₂	H	2	19F: -63,8; -79,0
*05-	22	CH(Me)CH ₂	Me	0	
*05-	23	CH(Me)CH ₂	Me	1	
*05-	24	CH(Me)CH ₂	Me	2	
05-	25	CH(Me)CH ₂	COCH ₃	0	
05-	26	CH(Me)CH ₂	COCH ₃	1	
05-	27	CH(Me)CH ₂	COCH ₃	2	
05-	28	CH(Me)CH ₂	CO-COOMe	0	
05-	29	CH(Me)CH ₂	CO-COOMe	1	
05-	30	CH(Me)CH ₂	CO-COOMe	2	
05-	31	CH(Me)CH ₂	COOEt	0	
05-	32	CH(Me)CH ₂	COOEt	1	
05-	33	CH(Me)CH ₂	COOEt	2	
05-	34	CH(Me)CH ₂	SO ₂ Me	0	
05-	35	CH(Me)CH ₂	SO ₂ Me	1	
05-	36	CH(Me)CH ₂	SO ₂ Me	2	
05-	37	CH(Ph)CH ₂	H	0	
05-	38	CH(Ph)CH ₂	H	1	
05-	39	CH(Ph)CH ₂	H	2	19F: -63,7; -79,1
*05-	40	CH(Ph)CH ₂	Me	0	
*05-	41	CH(Ph)CH ₂	Me	1	
*05-	42	CH(Ph)CH ₂	Me	2	
05-	43	CH(Ph)CH ₂	COCH ₃	0	
05-	44	CH(Ph)CH ₂	COCH ₃	1	
05-	45	CH(Ph)CH ₂	COCH ₃	2	
05-	46	CH(Ph)CH ₂	CO-COOMe	0	
05-	47	CH(Ph)CH ₂	CO-COOMe	1	
05-	48	CH(Ph)CH ₂	CO-COOMe	2	
05-	49	CH(Ph)CH ₂	COOEt	0	
05-	50	CH(Ph)CH ₂	COOEt	1	
05-	51	CH(Ph)CH ₂	COOEt	2	

ES 2 515 099 T3

05-	52	CH(Ph)CH2	SO2Me	0	
05-	53	CH(Ph)CH2	SO2Me	1	
05-	54	CH(Ph)CH2	SO2Me	2	
*05-	55	C3H6	H	0	
*05-	56	C3H6	H	1	
*05-	57	C3H6	H	2	19F: -63,7; -78,7
*05-	58	C3H6	Me	0	
*05-	59	C3H6	Me	1	
*05-	60	C3H6	Me	2	
*05-	61	C3H6	COCH3	0	
*05-	62	C3H6	COCH3	1	
*05-	63	C3H6	COCH3	2	
*05-	64	C3H6	CO-COOMe	0	
*05-	65	C3H6	CO-COOMe	1	
*05-	66	C3H6	CO-COOMe	2	
*05-	67	C3H6	COOEt	0	
*05-	68	C3H6	COOEt	1	
*05-	69	C3H6	COOEt	2	
*05-	70	C3H6	SO2Me	0	
*05-	71	C3H6	SO2Me	1	
*05-	72	C3H6	SO2Me	2	
*05-	73	C4H8	H	0	
*05-	74	C4H8	H	1	
*05-	75	C4H8	H	2	
*05-	76	C4H8	Me	0	
*05-	77	C4H8	Me	1	
*05-	78	C4H8	Me	2	
*05-	79	C4H8	COCH3	0	
*05-	80	C4H8	COCH3	1	
*05-	81	C4H8	COCH3	2	
*05-	82	C4H8	CO-COOMe	0	
*05-	83	C4H8	CO-COOMe	1	
*05-	84	C4H8	CO-COOMe	2	
*05-	85	C4H8	COOEt	0	
*05-	86	C4H8	COOEt	1	
*05-	87	C4H8	COOEt	2	
*05-	88	C4H8	SO2Me	0	
*05-	89	C4H8	SO2Me	1	
*05-	90	C4H8	SO2Me	2	
*05-	91	C6H12	H	0	
*05-	92	C6H12	H	1	
*05-	93	C6H12	H	2	
*05-	94	C6H12	Me	0	
*05-	95	C6H12	Me	1	
*05-	96	C6H12	Me	2	
*05-	97	C6H12	COCH3	0	
*05-	98	C6H12	COCH3	1	
*05-	99	C6H12	COCH3	2	
*05-	100	C6H12	COOEt	0	
*05-	101	C6H12	COOEt	1	
*05-	102	C6H12	COOEt	2	

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

R¹ es CN; R² es Cl; R³, R⁵ son CF₃; A y E = C₂H₄
R⁴-N-Q

Comp. número		Q/R4	x	n	pf. °C, RMN (ppm)
06-	01	H/H	Cl	0	
06-	02	H/H	Cl	1	
06-	03	H/H	Cl	2	19F: -63,6; -79,0
06-	04	H/H	CH ₃ COO	0	
06-	05	H/H	CH ₃ COO	1	
06-	06	H/H	CH ₃ COO	2	
06-	07	H/H	4-MeC ₆ H ₄ SO ₃	0	
06-	08	H/H	4-MeC ₆ H ₄ SO ₃	1	
06-	09	H/H	4-MeC ₆ H ₄ SO ₃	2	
*06-	10	Me/Me	I	0	
*06-	11	Me/Me	I	1	
*06-	12	Me/Me	I	2	
*06-	13	Et/Et	I	0	
*06-	14	Et/Et	I	1	
*06-	15	Et/Et	I	2	
06-	16	Me/PhCH ₂	Cl	0	
06-	17	Me/PhCH ₂	Cl	1	
06-	18	Me/PhCH ₂	Cl	2	
06-	19	PhCH ₂ /PhCH ₂	Br	0	
06-	20	PhCH ₂ /PhCH ₂	Br	1	
06-	21	PhCH ₂ /PhCH ₂	Br	2	

Tabla de referencia 7: Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

R¹ es CN; R² es Cl; R³, R⁵ son CF₃; A y E = C₂H₄
R⁴= alquilo

Comp. número		R4 =Alquilo	n	pf. °C, RMN (ppm)
07-	01	Me	0	
07-	02	Me	1	
07-	03	Me	2	19F: -63,8; -79,1
07-	04	Et	0	
07-	05	Et	1	
07-	06	Et	2	
07-	07	nPr	0	
07-	08	nPr	1	
07-	09	nPr	2	
07-	10	iPr	0	
07-	11	iPr	1	
07-	12	iPr	2	
07-	13	nBu	0	
07-	14	nBu	1	
07-	15	nBu	2	
07-	16	secBu	0	
07-	17	secBu	1	
07-	18	secBu	2	
07-	19	isoBu	0	
07-	20	isoBu	1	
07-	21	isoBu	2	
07-	22	tBu	0	
07-	23	tBu	1	
07-	24	tBu	2	

07-	25	nC5H11	0	
07-	26	nC5H11	1	
07-	27	nC5H11	2	
07-	28	nC6H13	0	
07-	29	nC6H13	1	
07-	30	nC6H13	2	

Tabla de referencia 8: Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

R ¹ es CN; R ² es Cl; R ³ , R ⁵ son CF ₃ ; R ⁴ = H variación de A y E					
Comp.		A	E	n	pf. °C, RMN (ppm)
	número				
08-	01	C3H6	C3H6	0	
08-	02	C3H6	C3H6	1	
08-	03	C3H6	C3H6	2	
08-	04	C3H6	C4H8	0	
08-	05	C3H6	C4H8	1	
08-	06	C3H6	C4H8	2	
08-	07	C4H8	C4H8	0	
08-	08	C4H8	C4H8	1	
08-	09	C4H8	C4H8	2	
08-	10	C5H10	C5H10	0	
08-	11	C5H10	C5H10	1	
08-	12	C5H10	C5H10	2	
08-	13	C6H12	C6H12	0	
08-	14	C6H12	C6H12	1	
08-	15	C6H12	C6H12	2	
08-	16	CH ₂ CH=CHCH ₂	CH ₂ CH=CHCH ₂	0	
08-	17	CH ₂ CH=CHCH ₂	CH ₂ CH=CHCH ₂	1	
08-	18	CH ₂ CH=CHCH ₂	CH ₂ CH=CHCH ₂	2	

Ejemplos biológicos

5

PROCEDIMIENTO A: Procedimiento de detección selectiva para probar la naturaleza sistémica de los compuestos contra *Ctenocephalides felis* (pulga de los gatos)

[0210] Se llenó un recipiente de ensayo con 10 adultos de *Ctenocephalides felis*. Se cerró un cilindro de vidrio en un extremo con parafilm y se colocó en la parte superior del recipiente de ensayo. A continuación se pipeteó la solución del compuesto de ensayo en sangre bovina y se añadió al cilindro de vidrio. Los *Ctenocephalides felis* tratados se mantuvieron en esta prueba de perro artificial (sangre 37 °C, humedad relativa del 40-60 %; *Ctenocephalides felis* 20-22 °C, humedad relativa del 40-60 %) y se llevó a cabo la evaluación a 24 y 48 horas después de la aplicación. Los compuestos 01-03, 01-45, 03-03, 04-06, 06-03 produjeron al menos un control del 80 % de *Ctenocephalides felis* a una concentración de ensayo de 5 ppm o menos.

PROCEDIMIENTO B: Procedimiento de detección selectiva para probar la actividad de contacto contra *Rhipicephalus sanguineus* (garrapata canina marrón)

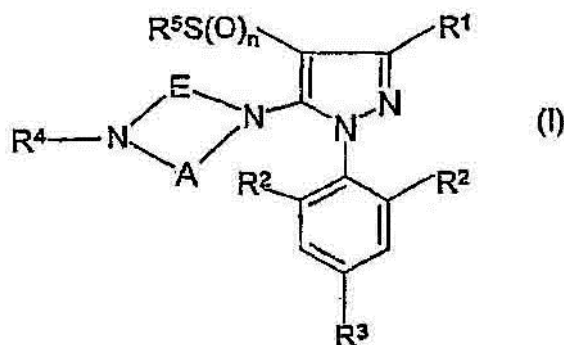
[0211] Se vertieron gota a gota soluciones de los compuestos de ensayo en papel de filtro, se secaron y se colocó el papel de filtro en tubos de ensayo y se infestaron con 20-30 larvas (L1) de *Rhipicephalus sanguineus* y se cerraron los tubos con una pinza. Los *Rhipicephalus sanguineus* tratados se mantuvieron en una cámara climatizada (25 °C, HR del 90 %) y se valoró la eficacia porcentual 24 horas después de la aplicación en comparación con el control sin tratar.

25

[0212] Los números de compuesto 01-03, 06-03 produjeron al menos un control de contacto del 70 % de *Rhipicephalus sanguineus* a una concentración de ensayo de 100 ppm.

REIVINDICACIONES

1. Derivados de 5-diazacicloalquilpirazol de fórmula (I):



5

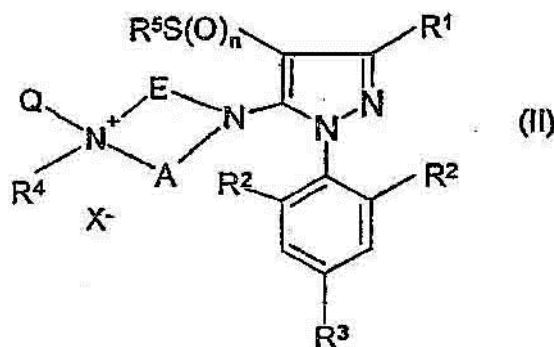
en la que:

- R^1 es CN, CH_3 , CF_3 , $C(=N-Z)-S(O)_p-(C_1-C_4)$ -alquilo o $CSNH_2$; en la que Z es H, (C_1-C_6) -alquilo, (C_1-C_6) -haloalquilo, (C_3-C_6) -alqueniilo, (C_3-C_6) -alquiniilo, $-(CH_2)_qR^8$, COR^9 , $CO_2-(C_1-C_6)$ -alquilo o $S(O)_pR^9$;
- R^2 es halógeno, CH_3 o $NR^{11}R^{12}$;
- R^3 es (C_1-C_3) -haloalquilo, (C_1-C_3) -haloalcoxi o SF_5 ;
- R^4 es hidrógeno; $CO_2-(C_1-C_6)$ -alquilo, $CO_2-(C_3-C_6)$ -alqueniilo, $CO_2-(C_3-C_6)$ -alquiniilo, $CO_2-(CH_2)_qR^8$, $CO_2-(CH_2)_qR^{10}$, $CONR^6R^7$ o SO_2R^9 ; formilo, $CO-CO_2-(C_1-C_6)$ -alquilo o $CO-(C_1-C_6)$ -alquilo sin sustituir o sustituido por uno o varios radicales seleccionados entre el grupo que consiste en halógeno, (C_1-C_6) -alcoxi, (C_1-C_6) -haloalcoxi, (C_3-C_6) -alqueniilo, (C_3-C_6) -haloalqueniilo, (C_3-C_6) -alquiniilo, (C_3-C_6) -haloalquiniilo, (C_3-C_7) -cicloalquilo, $S(O)_pR^9$, CN, NO_2 , OH, R^8 , R^{10} , COR^9 , NR^6R^7 , OR^9 y CO_2R^9 ;
- o $CO-(CH_2)_mR^8$; o $CO-(CH_2)_mR^{10}$; o fenil- CH_2 ;
- R^5 es (C_1-C_6) -alquilo, (C_1-C_6) -haloalquilo, (C_2-C_6) -alqueniilo, (C_2-C_6) -haloalqueniilo, (C_2-C_6) -alquiniilo o (C_2-C_6) -haloalquiniilo;
- A es C_2 -alquilenilo estando dicho grupo sin sustituir o sustituido por uno o varios (C_1-C_6) -alquilo (C_1-C_6) -haloalquilo, (C_2-C_6) -alqueniilo, (C_2-C_6) -haloalqueniilo, (C_2-C_6) -alquiniilo, (C_2-C_6) -haloalquiniilo, (C_3-C_7) -cicloalquilo, (C_3-C_7) -cicloalquil- (C_1-C_4) -alquilo, $(CH_2)_qR^8$ o $(CH_2)_qR^{10}$;
- E es C_2 -alquilenilo estando dicho grupo sin sustituir o sustituido por uno o varios (C_1-C_6) -alquilo, (C_1-C_6) -haloalquilo, (C_2-C_6) -alqueniilo, (C_2-C_6) -haloalqueniilo, (C_2-C_6) -alquiniilo, (C_2-C_6) -haloalquiniilo, (C_3-C_7) -cicloalquilo, (C_3-C_7) -cicloalquil- (C_1-C_4) -alquilo, $(CH_2)_qR^8$ o $(CH_2)_qR^{10}$;
- R^6 y R^7 son cada uno independientemente H, (C_1-C_6) -alquilo, (C_1-C_6) -haloalquilo, (C_2-C_6) -alqueniilo, (C_2-C_6) -haloalqueniilo, (C_2-C_6) -alquiniilo, (C_2-C_6) -haloalquiniilo, (C_3-C_7) -cicloalquilo, (C_3-C_7) -cicloalquil- (C_1-C_4) -alquilo, $(CH_2)_qR^8$ o $(CH_2)_qR^{10}$;
- R^6 y R^7 pueden formar junto con el átomo N enlazado un anillo saturado de cuatro a siete miembros o un anillo insaturado de cinco a siete miembros, conteniendo dicho anillo opcionalmente uno o varios heteroátomos adicionales en el anillo que se seleccionan entre O, S y N, estando el anillo sin sustituir o sustituido por uno o varios radicales seleccionados entre el grupo que consiste en halógeno, (C_1-C_6) -alquilo, (C_1-C_6) -haloalquilo y oxo, y cuando está presente cualquier átomo N adicional del anillo está sin sustituir o sustituido por un (C_1-C_6) -alquilo, $CO-(C_1-C_6)$ -alquilo o un radical CH_2R^{11} ;
- R^8 es fenilo sin sustituir o sustituido por uno o varios radicales seleccionados entre el grupo que consiste en halógeno, (C_1-C_6) -alquilo, (C_1-C_6) -haloalquilo, (C_1-C_6) -alcoxi, (C_1-C_6) -haloalcoxi, CN, NO_2 , $S(O)_pR^9$ y NR^6R^7 ;
- R^9 es (C_1-C_6) -alquilo, (C_1-C_6) -haloalquilo, (C_3-C_7) -cicloalquilo, $-(C_1-C_4)$ -alquil- (C_3-C_7) -cicloalquilo, $-(CH_2)_qR^8$ o $-(CH_2)_qR^{10}$;
- R^{10} es heterociclilo sin sustituir o sustituido por uno o varios radicales seleccionados entre el grupo que consiste en halógeno, (C_1-C_4) -alquilo, (C_1-C_4) -haloalquilo, (C_1-C_4) -alcoxi, $S(O)_pR^9$, OH y oxo;
- R^{11} y R^{12} son cada uno independientemente H, (C_1-C_6) -alquilo, (C_2-C_6) -alqueniilo o (C_2-C_6) -alquiniilo, estando los tres últimos grupos mencionados sin sustituir o sustituidos por uno o varios radicales seleccionados entre el grupo que consiste en halógeno, (C_3-C_7) -cicloalquilo, R^8 , R^{10} , (C_1-C_6) -alcoxi, (C_1-C_6) -haloalcoxi;
- n, p y q son cada uno independientemente cero, uno o dos;
- m es cero, uno, dos o tres; y

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

5 o una sal de los mismos aceptable en términos de pesticidas.

2. Una sal de un compuesto según la reivindicación 1 con la fórmula (II):



10 en la que

Q es H, (C₁-C₆)-alquilo, (C₁-C₆)-haloalquilo, (C₂-C₆)-alqueno, (C₂-C₆)-haloalqueno, (C₂-C₆)-alquino, (C₂-C₆)-haloalquino, (C₃-C₇)-cicloalquilo, (C₃-C₇)-cicloalquil-(C₁-C₄)-alquilo, (CH₂)_qR⁸ o (CH₂)_qR¹⁰;

15 X es un anión,

en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁸, R¹⁰, E, A, n, q y todos los demás residuos o valores son tal como se define en la reivindicación 1.

20 3. Un compuesto o una sal del mismo según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 2 en los que R⁴ se selecciona entre el grupo que consiste en CO₂-(C₁-C₆)-alquilo, CO₂-(C₃-C₆)-alqueno, CO₂-(C₃-C₆)-alquino, CO₂-(CH₂)_qR⁸, CO₂-(CH₂)_qR¹⁰, CONR⁶R⁷ o SO₂R⁹; formilo, CO-CO₂-(C₁-C₆)-alquilo o CO-(C₁-C₆)-alquilo sin sustituir o sustituido por uno o varios radicales seleccionados entre el grupo que consiste en halógeno, (C₁-C₆)-alcoxi, (C₁-C₈)-haloalcoxi, (C₃-C₆)-alqueno, (C₃-C₆)-haloalqueno, (C₃-C₆)-alquino, (C₃-C₆)-haloalquino, (C₃-C₇)-cicloalquilo, S(O)_pR⁹, CN, NO₂, OH, R⁸, R¹⁰, COR⁹, NR⁶R⁷, OR⁹ y CO₂R⁹;

25 o CO-(CH₂)_nR⁸; o CO-(CH₂)_nR¹⁰ y en los que R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, n, p y q son tal como se define en la reivindicación 1.

4. Un compuesto o una sal del mismo según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 2 en los que R⁴ es

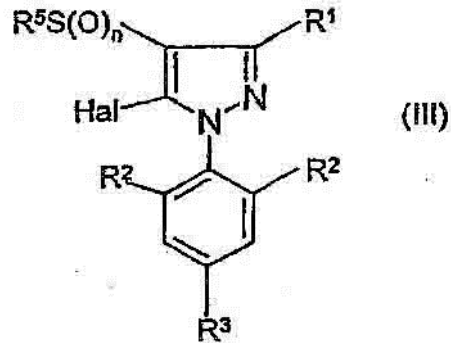
30 fenil-CH₂,
o
hidrógeno.

35 5. Un compuesto o una sal del mismo según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4 en los que R¹ es CN o CSNH₂ y/o R² es Cl y/o R³ es CF₃ y/o R⁵ es CF₃.

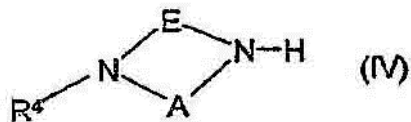
6. Un procedimiento para la preparación de compuestos de fórmula (I) o una sal de los mismos tal como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, en la que R¹ es CN, CH₃ o CF₃ comprendiendo dicho

40 procedimiento

a) la reacción de un compuesto de fórmula (III),

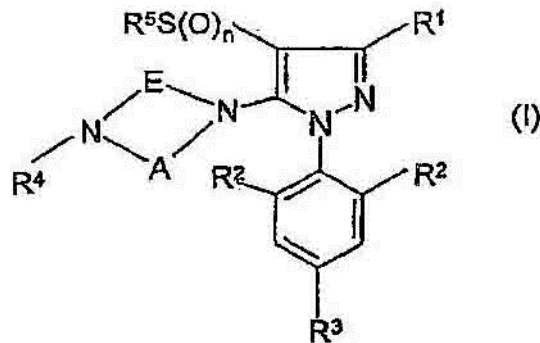


en la que Hal es un halógeno y en la que R¹ es CN, CH₃ o CF₃ y en la que R², R³, R⁵, n y todos los demás residuos y valores son tal como se define en la reivindicación 1,
 5 con un compuesto de fórmula (IV) en la que R⁴, E, A y todos los demás residuos y valores son tal como se define en la reivindicación 1:



10 en presencia de una base;
 o

b) la reacción de un compuesto de fórmula (I) en la que R⁴ es H,



15

y en la que R¹ es CN, CH₃ o CF₃, y en la que R², R³, R⁵, A, E, n y los demás valores y residuos son tal como se define en la reivindicación 1,
 con un compuesto de fórmula (V)

20



en la que L es un grupo saliente y en la que R⁴ es tal como se define en la reivindicación 1 con la exclusión de hidrógeno,
 en presencia de una base;

25 y

c) si se desea, la conversión de un compuesto resultante de fórmula (I) en una sal del mismo aceptable en términos de pesticidas.

7. Un procedimiento para la preparación de compuestos de fórmula (III) tal como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 2 a 5, en el que R¹ es CN, CH₃ o CF₃ comprendiendo dicho procedimiento

5 la protonación o alquilación de un compuesto de fórmula (I) en el nitrógeno del grupo R⁴-N con un compuesto de fórmula (VI)



en la que

10

Q es H, (C₁-C₆)-alquilo, (C₁-C₆)-haloalquilo, (C₂-C₆)-alquenilo, (C₂-C₆)-haloalquenilo, (C₂-C₆)-alquinilo, (C₂-C₆)-haloalquinilo, (C₃-C₇)-cicloalquilo, (C₃-C₇)-cicloalquil-(C₁-C₄)-alquilo, (CH₂)_qR⁸ o (CH₂)_qR¹⁰;
X es un anión,

15 y en la que R⁶, R¹⁰ y q y los demás valores y residuos son tal como se define en la reivindicación 1.

8. Un procedimiento para la preparación de compuestos de fórmula (I) o una sal de los mismos tal como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 en el que R¹ es C(=N-Z)-S(O)_p-(C₁-C₄)-alquilo o CSNH₂ en el que Z y p son tal como se define en la reivindicación 1, comprendiendo dicho procedimiento

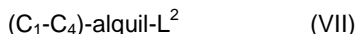
20

a) cuando R¹ es CSNH₂ la reacción del compuesto correspondiente de fórmula (I) en la que R¹ es CN y todos los demás residuos y valores son tal como se define en la reivindicación 1, con un sulfhidrato de metal alcalino o alcalinotérreo o con el reactivo PH₂PS₂, o

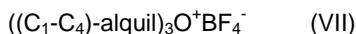
25 b) cuando R¹ es CSNH₂ la reacción del compuesto correspondiente de fórmula (I) en la que R¹ es CN, y todos los demás residuos y valores son tal como se define en la reivindicación 1, con un bis(trialquil)sulfuro, en presencia de una base, o

c) cuando R¹ es C(=NH)-S-(C₁-C₄)-alquilo la reacción del compuesto correspondiente de fórmula (I) en la que R¹ es CSNH₂, y todos los demás residuos y valores son tal como se define en la reivindicación 1, con un agente de alquilación de fórmula (VII) o (VIII):

30



;



en la que L² es un grupo saliente,

35 o

d) cuando R¹ es C(=N-Z)-S-(C₁-C₄)-alquilo con la exclusión de Z es H, la preparación por alquilación, acilación o sulfonilación del compuesto correspondiente de fórmula (I) en la que Z es H, y todos los demás residuos y valores son tal como se define en la reivindicación 1, con un compuesto de fórmula (IX):

40



en la que Z es tal como se define en la reivindicación 1 con la exclusión de H y en la que L³ es un grupo saliente,
y

45 e) si se desea, la conversión de un compuesto resultante de fórmula (I) en una sal de los mismos aceptable en términos de pesticidas.

9. Una composición pesticida que comprende un compuesto de fórmula (1) o una sal del mismo aceptable en términos de pesticidas tal como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, en asociación con un diluyente o un soporte y/o un agente tensioactivo aceptable en términos de pesticidas.

50

10. Un compuesto de fórmula (I) o una sal del mismo según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 o una composición según la reivindicación 9, para su uso como un medicamento veterinario.

11. Un compuesto de fórmula (I) o una sal del mismo según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, o
55 una composición según la reivindicación 9, para su uso como un medicamento veterinario para el control de plagas.

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 5, o de una composición según la reivindicación 9, en la que el lugar es la plaga en sí, una planta, un terreno, un bosque, un

huerto, una vía navegable, un suelo, un producto vegetal, un cultivo agrícola, un cultivo hortícola, una plantación, un invernadero, un cultivo vitícola, un gran cultivo, un producto almacenado, semillas, un producto doméstico, una propiedad o una zona del entorno general.