

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 525 481**

51 Int. Cl.:

**C07D 307/94** (2006.01)

**C07D 407/12** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **09.01.2008** **E 08701022 (9)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **15.10.2014** **EP 2111398**

54 Título: **Derivados espirocíclicos de ácido tetrónico**

30 Prioridad:

**12.01.2007 DE 102007001866**

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:  
**23.12.2014**

73 Titular/es:

**BAYER INTELLECTUAL PROPERTY GMBH  
(100.0%)  
Alfred-Nobel-Strasse 10  
40789 Monheim am Rhein, DE**

72 Inventor/es:

**FISCHER, REINER;  
BRETSCHNEIDER, THOMAS;  
SCHULTE, HUBERTUS;  
KRAUTSTRUNK, GERHARD;  
ARNOLD, CHRISTIAN y  
SANWALD, ERICH**

74 Agente/Representante:

**CARPINTERO LÓPEZ, Mario**

**Observaciones :**

**Véase nota informativa (Remarks) en el folleto original publicado por la Oficina Europea de Patentes**

**ES 2 525 481 T3**

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

## DESCRIPCIÓN

Derivados espirocíclicos de ácido tetrónico

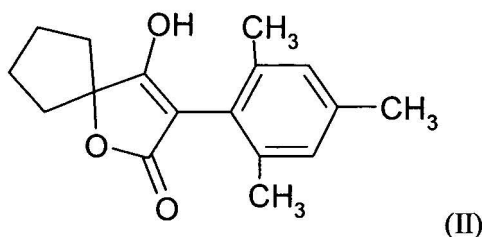
La presente invención se refiere a nuevos derivados espirocíclicos de ácido tetrónico, a varios procedimientos para su preparación y a su uso como agente para combatir plagas.

- 5 Es conocido que determinados derivados sustituidos de  $\Delta^3$ -dihidrofuran-2-ona poseen propiedades herbicidas (véase el documento DE-A-4.014.420). Se describe igualmente en el documento DE-A-4.014.420 la síntesis de derivados de ácido tetrónico (como, por ejemplo, 3-(2-metilfenil)-4-hidroxi-5-(4-fluorofenil)- $\Delta^3$ -dihidrofuranona(2)), usados como compuestos de partida. Son conocidos compuestos estructuralmente similares sin datos de actividad insecticida y/o acaricida por la publicación de Campbell y col., *J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1*, 1985 (8), 1567-1576.
- 10 Además, son conocidos derivados de 3-aryl- $\Delta^3$ -dihidrofuranona con propiedades herbicidas, acaricidas e insecticidas por los documentos EP-A-528.156, EP-A-0.647.637, WO 95/26.345, WO 96/20.196, WO 96/25.395, WO 96/35.664, WO 97/01.535, WO 97/02.243, WO 97/36.868, WO 98/05638, WO 98/25.928, WO 99/16.748, WO 99/43.649, WO 99/48.869, WO 99/55.673, WO 00/42.850, WO 01/17.972, WO 01/23.354, WO 01/74.770, WO 03/013.249, WO 04/024.688, WO 04/080.962, WO 04/111.042, WO 05/092.897, WO 06/000.355, WO 06/029.799, WO 06/089.633, WO 07/048.545 y WO 07/073.856.

15 Sin embargo, la actividad acaricida y/o insecticida y/o la amplitud del efecto acaricida y/o insecticida de estos compuestos no es siempre totalmente satisfactoria, particularmente a bajas cantidades de aplicación y concentraciones. Además, la fitotolerancia de estos compuestos frente a las plantas de cultivo no es siempre suficiente. Además, las propiedades toxicológicas y/o propiedades ambientales de estos compuestos no son siempre totalmente satisfactorias.

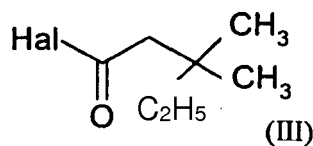
Se han encontrado ahora un nuevo compuesto de fórmula (I-3)

Se obtiene el compuesto de fórmula (I-3) haciendo reaccionar el compuesto (II)



respectivamente

- 25 A  $\alpha$ ) con compuestos de fórmula (III)

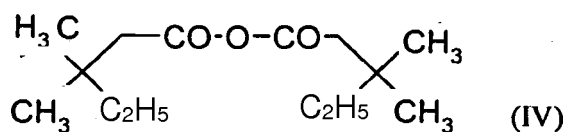


en la que

Hal representa halógeno (particularmente cloro o bromo)

o

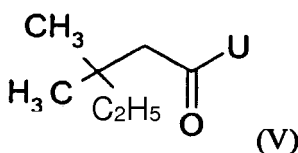
- 30 A  $\beta$ ) con anhídridos de ácido carboxílico de fórmula (IV)



dado el caso en presencia de un diluyente y dado el caso en presencia de un aceptor de ácido;

o

A γ) con derivados de ácido carboxílico activados de fórmula (V)



5

en la que

U representa un grupo saliente introducido mediante reactivos de activación de ácido carboxílico como carbonildiimidazol, carbonildiimidazoles (como, por ejemplo, dicitclohexilcarbodiimida), reactivos de fosforilación (como, por ejemplo, POCl<sub>3</sub>, BOP-Cl), agentes de halogenación como, por ejemplo, cloruro de tionilo, cloruro de oxalilo, fosgeno o éster de ácido clorofórmico,

10

dado el caso en presencia de un diluyente y dado el caso en presencia de un aceptor de ácido.

El compuesto (II) necesario como sustancia de partida en el procedimiento (A) según la invención es conocido por el documento EP-A-528.156, ejemplo I-a-33.

15

Los cloruros de ácido carboxílico (III), anhídridos de ácido carboxílico (IV) y derivados de ácido carboxílico (V) necesarios como sustancias de partida en el procedimiento (A) según la invención son parcialmente comerciales o pueden prepararse según procedimientos generales conocidos (véanse ejemplos de preparación).

El procedimiento (A-α) se caracteriza porque se hace reaccionar el compuesto de fórmula (II) respectivamente con halogenuros de ácido carboxílico de fórmula (III) dado el caso en presencia de un diluyente y dado el caso en presencia de un aceptor de ácido.

20

Como diluyente pueden usarse en el procedimiento (A-α) según la invención todos los disolventes inertes frente a halogenuros de ácido. Se pueden usar preferentemente hidrocarburos como gasolina, benceno, tolueno, xileno y tetralina, además hidrocarburos halogenados como cloruro de metileno, cloroformo, tetracloruro de carbono, clorobenceno y o-diclorobenceno, además cetonas como acetona y metilisopropilcetina, además éteres como dietiléter, tetrahidrofurano y dioxano, además ésteres de ácido carboxílico como acetato de etilo y también disolventes polares fuertes como dimetilsulfóxido y sulfolano. Si la estabilidad a la hidrólisis del halogenuro de ácido lo permite, la reacción puede llevarse a cabo también en presencia de agua.

25

Como aceptor de ácido se tienen en consideración en la reacción según el procedimiento (A-α) según la invención todos los aceptores de ácido habituales. Se pueden usar preferentemente aminas terciarias como trietilamina, piridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicycloundeceno (DBU), diazabicyclononeno (DBN), base de Hünig y *N,N*-dimetilalanilina, además óxidos de metales alcalinotérreos como óxido de magnesio y calcio, además carbonatos de metales alcalinos y alcalinotérreos como carbonato de sodio, carbonato de potasio y carbonato de calcio, así como hidróxidos alcalinos como hidróxido de sodio e hidróxido de potasio.

30

Las temperaturas de reacción pueden variar dentro de un amplio intervalo en el procedimiento (A-α) según la invención. En general, se trabaja a temperaturas entre -20 °C y +150 °C, preferentemente entre 0 °C y 100 °C.

35

En la realización del procedimiento (A-α) según la invención, se usan la sustancia de partida de fórmula (II) y el halogenuro de ácido carboxílico de fórmula (III) en general respectivamente en cantidades aproximadamente equivalentes. Sin embargo, también es posible usar el halogenuro de ácido en un gran exceso (hasta 5 moles). El procesamiento se realiza según procedimientos habituales.

40

El procedimiento (A-β) se caracteriza porque se hace reaccionar el compuesto de fórmula (II) con anhídridos de ácido carboxílico de fórmula (IV) dado el caso en presencia de un diluyente y dado el caso en presencia de un

aceptor de ácido.

Como diluyentes pueden usarse en el procedimiento (A-β) según la invención preferentemente aquellos diluyentes que se tienen en consideración también en el uso de halogenuros de ácido. Por lo demás, puede funcionar simultáneamente como diluyente también un anhídrido de ácido carboxílico usado en exceso.

- 5 Se tienen en cuenta como aceptores de ácido añadidos dado el caso en el procedimiento (A-β) preferentemente aquellos aceptores de ácido que se tienen en consideración preferentemente también en el uso de halogenuros de ácido.

Las temperaturas de reacción pueden variar dentro de un amplio intervalo en el procedimiento (A-β) según la invención. En general, se trabaja a temperaturas entre -20 °C y +150 °C, preferentemente entre 0 °C y 100 °C.

- 10 En la realización del procedimiento (A-β) según la invención, se usa la sustancia de partida de fórmula (II) y el anhídrido de ácido carboxílico de fórmula (IV) en general en cantidades respectivamente casi equivalentes. Sin embargo, también es posible usar el anhídrido de ácido carboxílico en un gran exceso (hasta 5 moles). El procesamiento se realiza según procedimientos habituales.

- 15 En general, se procede de modo que se elimina el diluyente y anhídrido de ácido carboxílico presente en exceso, así como el ácido carboxílico formado, mediante destilación o lavado con un disolvente orgánico o con agua.

El procedimiento (A-γ) se caracteriza porque se hace reaccionar el compuesto de fórmula (II) respectivamente con derivados de ácido carboxílico activados de fórmula (V) dado el caso en presencia de un diluyente y dado el caso en presencia de un aceptor de ácido.

- 20 Se tienen en consideración como aceptores de ácido en la reacción según el procedimiento (A-γ) según la invención todos los aceptores de ácido habituales. Se pueden usar preferentemente aminas terciarias como trietilamina, piridina, DABCO, DBU, DBA, base de Hünig y *N,N*-dimetilanimilina, además óxidos de metales alcalinotérreos como óxido de magnesio y calcio, además carbonatos de metales alcalinos y alcalinotérreos como carbonato de sodio, carbonato de potasio y carbonato de calcio, así como hidróxidos alcalinos como hidróxido de sodio e hidróxido de potasio.

- 25 Pueden usarse como diluyente en el procedimiento (A-γ) según la invención todos los disolventes inertes frente a ésteres de ácido clorofórmico o tiolésteres de ácido clorofórmico. Se pueden usar preferentemente hidrocarburos como gasolina, benceno, tolueno, xileno y tetralina, además hidrocarburos halogenados como cloruro de metileno, cloroformo, tetracloruro de carbono, clorobenceno y *o*-diclorobenceno, además cetonas como acetona y metilisopropilcetona, además éteres como dietiléter, tetrahidrofurano y dioxano, además ésteres de ácido carboxílico como acetato de etilo y también disolventes polares fuertes como dimetilsulfóxido y sulfolano.
- 30

Las temperaturas de reacción pueden variar dentro de un amplio intervalo en la realización del procedimiento (A-γ) según la invención. Si se trabaja en presencia de un diluyente y un aceptor de ácido, las temperaturas de reacción se encuentran en general entre -20 °C y +100 °C, preferentemente entre 0 °C y 50 °C.

El procedimiento (A-γ) según la invención se lleva a cabo en general a presión normal.

- 35 En la realización del procedimiento (A-γ) según la invención, se usa la sustancia de partida de fórmula (II) y el correspondiente derivado de ácido carboxílico activado de fórmula (V) en general respectivamente en cantidades casi equivalentes. Sin embargo, también es posible usar uno u otro componente en un gran exceso (hasta 2 moles). El procesamiento se realiza según procedimientos habituales. En general, se procede de modo que se eliminan las sales precipitadas y se concentra la mezcla de reacción restante mediante extracción del diluyente.

- 40 Los principios activos según la invención son adecuados por su buena fitotolerancia, favorable toxicidad para mamíferos y buen impacto medioambiental para la protección de plantas y órganos de plantas, para aumentar el rendimiento de cosecha, mejorar la calidad del producto de cosecha y para combatir plagas animales, particularmente insectos, arácnidos, helmintos, nematodos y moluscos que aparecen en agricultura, en horticultura, en la cría de animales, en bosques, en jardines e instalaciones de tiempo libre, en la protección de productos almacenados y materiales, así como en el sector de la higiene. Pueden usarse preferentemente como agentes fitoprotectores. Son activos contra especies de sensibilidad normal y resistentes, así como contra todos o algunos estadios de desarrollo. Pertenecen a las plagas anteriormente mencionadas:
- 45

Del orden de los anopluros (*Phthiraptera*), por ejemplo, *Damalinea spp.*, *Haematopinus spp.*, *Linognathus spp.*, *Pediculus spp.*, *Trichodectes spp.*

- 50 De la clase de los arácnidos, 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*.

De la clase de los bivalvos, por ejemplo, *Dreissena spp.*

Del orden de los quilópodos, por ejemplo, *Geophilus spp.*, *Scutigera spp.*

5 Del orden de los coleópteros, 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.*, *Ceuthorhynchus spp.*, *Cleonus mendicus*, *Cono-*  
*derus spp.*, *Cosmopolites spp.*, *Costelytra zealandica*, *Curculio spp.*, *Cryptorhynchus lapathi*, *Dermestes spp.*,  
*Diabrotica spp.*, *Epilachna spp.*, *Faustinus cubae*, *Gibbium psyllioides*, *Heteronychus arator*, *Hylamorpha elegans*,  
10 *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypothenemus spp.*, *Lachnosterna consanguinea*, *Leptinotarsa decemlineata*,  
*Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lixus spp.*, *Lyctus spp.*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha melolontha*, *Migdolus spp.*,  
*Monochamus spp.*, *Naupactus xanthographus*, *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*,  
*Otiorrhynchus sulcatus*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllophaga spp.*, *Popillia japonica*,  
*Premnotypes spp.*, *Psylliodes chrysocephala*, *Ptinus spp.*, *Rhizobius ventralis*, *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus*  
15 *spp.*, *Sphenophorus spp.*, *Sternechus spp.*, *Symphyletes spp.*, *Tenebrio molitor*, *Tribolium spp.*, *Trogoderma spp.*,  
*Tychius spp.*, *Xylotrechus spp.*, *Zabrus spp.*

Del orden de los colémbolos, por ejemplo, *Onychiurus armatus*.

Del orden de los dermápteros, por ejemplo, *Forficula auricularia*.

Del orden de los diplópodos, por ejemplo, *Blaniulus guttulatus*.

20 Del orden de los dípteros, 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.*, *Hypo-*  
*derma 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.*

25 De la clase de los gasterópodos, por ejemplo, *Arion spp.*, *Biomphalaria spp.*, *Bulinus spp.*, *Deroceras spp.*, *Galba*  
*spp.*, *Lymnaea spp.*, *Oncomelania spp.*, *Succinea spp.*

30 De la clase de los helmintos, por ejemplo, *Ancylostoma duodenale*, *Ancylostoma ceylanicum*, *Acylostoma*  
*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*  
35 *spp.*, *Haemonchus spp.*, *Heterakis spp.*, *Hymenolepis nana*, *Hyostrongylus spp.*, *Loa Loa*, *Nematodirus spp.*,  
*Oesophagostomum spp.*, *Opisthorchis spp.*, *Onchocerca volvulus*, *Ostertagia spp.*, *Paragonimus spp.*,  
*Schistosomen spp.*, *Strongyloides fuelleborni*, *Strongyloides stercoralis*, *Strongyloides spp.*, *Taenia saginata*, *Taenia*  
*solium*, *Trichinella spiralis*, *Trichinella nativa*, *Trichinella britovi*, *Trichinella nelsoni*, *Trichinella pseudopsiralis*,  
*Trichostrongylus spp.*, *Trichuris trichuria*, *Wuchereria bancrofti*.

35 Además, pueden combatirse protozoos como *Eimeria*.

40 Del orden de los heterópteros, por ejemplo, *Anasa tristis*, *Antestiopsis spp.*, *Blissus spp.*, *Calocoris spp.*,  
*Campylomma livida*, *Cavelerius spp.*, *Cimex spp.*, *Creontiades dilutus*, *Dasynus piperis*, *Dichelops furcatus*,  
*Diconocoris hewetti*, *Dysdercus spp.*, *Euschistus spp.*, *Eurygaster spp.*, *Heliopeltis spp.*, *Horcias nobillellus*,  
*Leptocoris spp.*, *Leptoglossus phyllopus*, *Lygus spp.*, *Macropes excavatus*, *Miridae*, *Nezara spp.*, *Oebalus spp.*,  
45 *Pentomidae*, *Piesma quadrata*, *Piezodorus spp.*, *Psallus seriatus*, *Pseudacysta perseae*, *Rhodnius spp.*, *Sahlbergella*  
*singularis*, *Scotinophora spp.*, *Stephanitis nashi*, *Tibraca spp.*, *Triatoma spp.*

50 Del orden de los homópteros, por ejemplo, *Acyrtosiphon spp.*, *Aeneolamia spp.*, *Agonosceca 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.*,  
45 *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycolus spp.*, *Brevicoryne brassicae*, *Calligypona marginata*, *Carneiocephala fulgida*,  
*Ceratovacuna lanigera*, *Cercopidae*, *Ceroplastes spp.*, *Chaetosiphon fragaefolii*, *Chionaspis tegalensis*, *Chlorita*  
*onukii*, *Chromaphis juglandicola*, *Chrysomphalus ficus*, *Cicadulina mbila*, *Coccomytilus halli*, *Coccus spp.*,  
*Cryptomyzus ribis*, *Dalbulus spp.*, *Dialeurodes spp.*, *Diaphorina spp.*, *Diaspis spp.*, *Doralis spp.*, *Drosicha spp.*,  
*Dysaphis spp.*, *Dysmicoccus spp.*, *Empoasca spp.*, *Eriosoma spp.*, *Erythroneura spp.*, *Euscelis bilobatus*, *Geococcus*  
55 *coffeeae*, *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*, *Parlatoria spp.*, *Parlatoria spp.*, *Pemphigus spp.*, *Peregrinus maidis*, *Phenacoccus spp.*, *Phloeomyzus*  
*passerini*, *Phorodon humuli*, *Phylloxera spp.*, *Pinnaspis aspidistrae*, *Planococcus spp.*, *Protopulvinaria pyriformis*,  
*Pseudaulacaspis pentagona*, *Pseudococcus spp.*, *Psylla spp.*, *Pteromalus spp.*, *Pyrilla spp.*, *Quadraspidotus spp.*

*Quesada gigas*, *Rastrococcus* spp., *Rhopalosiphum* spp., *Saissetia* spp., *Scaphoides titanus*, *Schizaphis graminum*, *Selenaspis articulatus*, *Sogata* spp., *Sogatella furcifera*, *Sogatodes* spp., *Stictocephala festina*, *Tenalaphara malayensis*, *Tinocallis caryaefoliae*, *Tomaspis* spp., *Toxoptera* spp., *Trialeurodes vaporariorum*, *Trioza* spp., *Typhlocyba* spp., *Unaspis* spp., *Viteus vitifolii*.

- 5 Del orden de los himenópteros, por ejemplo, *Diprion* spp., *Hoplocampa* spp., *Lasius* spp., *Monomorium pharaonis*, *Vespa* spp.

Del orden de los isópodos, por ejemplo, *Armadillidium vulgare*, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*.

Del orden de los isópteros, por ejemplo, *Reticulitermes* spp., *Odontotermes* spp.

- 10 Del orden de los lepidópteros, por ejemplo, *Acronicta major*, *Aedia leucomelas*, *Agrotis* spp., *Alabama argillacea*, *Anticarsia* spp., *Barathra brassicae*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Carpocapsa pomonella*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo* spp., *Choristoneura fumiferana*, *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocerus* spp., *Earias insulana*, *Ephestia kuehniella*, *Euproctis chrysothorax*, *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 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.

- 20 Del orden de los ortópteros, por ejemplo, *Acheta domesticus*, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Grylotalpa* spp., *Leucophaea maderae*, *Locusta* spp., *Melanoplus* spp., *Periplaneta americana*, *Schistocerca gregaria*.

Del orden de los sifonápteros, por ejemplo, *Ceratophyllus* spp., *Xenopsylla cheopis*.

Del orden de los sínfilos, por ejemplo, *Scutigera immaculata*.

- 25 Del orden de los tisanópteros, por ejemplo, *Baliothrips biformis*, *Enneothrips flavens*, *Frankliniella* spp., *Heliothrips* spp., *Hercinothrips femoralis*, *Kakothrips* spp., *Rhipiphorothrips cruentatus*, *Scirtothrips* spp., *Taeniothrips cardamoni*, *Thrips* spp.

Del orden de los tisanuros, por ejemplo, *Lepisma saccharina*. Ableger

- 30 Pertenece a los nematodos parásitos de plantas, por ejemplo, *Anguina* spp., *Aphelenchoides* spp., *Belonoaimus* spp., *Bursaphelenchus* spp., *Ditylenchus dipsaci*, *Globodera* spp., *Helicotylenchus* spp., *Heterodera* spp., *Longidorus* spp., *Meloidogyne* spp., *Pratylenchus* spp., *Radopholus similis*, *Rotylenchus* spp., *Trichodorus* spp., *Tylenchorhynchus* spp., *Tylenchulus* spp., *Tylenchulus semipenetrans*, *Xiphinema* spp.

- 35 Los compuestos según la invención pueden usarse dado el caso a determinadas concentraciones o cantidades de aplicación también como herbicidas, protectores, reguladores del crecimiento o agentes para mejorar las propiedades de las plantas, o como microbicidas, por ejemplo, como fungicidas, antimicóticos, bactericidas, viricidas (incluyendo agentes contra viroides) o como agentes contra MLO (organismo similar a micoplasma) y RLO (organismo similar a Rickettsia). Pueden usarse dado el caso también como productos intermedios o precursores para la síntesis de otros principios activos.

- 40 Según la invención, pueden tratarse todas las plantas y partes de planta. Por plantas se entiende, a este respecto, todas las plantas y poblaciones de plantas como plantas silvestres deseadas y no deseadas o plantas de cultivo (incluyendo plantas de cultivo de aparición natural). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que pueden obtenerse mediante procedimientos de cultivo y optimización convencionales o mediante procedimientos biotecnológicos y de ingeniería genética o combinaciones de estos procedimientos, incluyendo las plantas transgénicas e incluyendo las variedades de plantas protegibles por el derecho de protección de variedades o las variedades de plantas no protegibles. Por partes de planta debe entenderse todas las partes y órganos de la planta aéreos y subterráneos, como brote, hoja, flor y raíz, citándose por ejemplo hojas, agujas, tallos, troncos, flores, cuerpos frutales, frutos y semillas, así como raíces, tubérculos y rizomas. Pertenece a las partes de planta también productos de cosecha, así como material de reproducción vegetativa y generativa, por ejemplo plantones, tubérculos, rizomas, esquejes y semillas.

- 50 El tratamiento según la invención de plantas y partes de planta con los principios activos se realiza directamente o mediante acción sobre su entorno, hábitat o espacio de almacenamiento según procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo, mediante inmersión, pulverización, vaporización, nebulización, dispersión, extensión, inyección y en material reproductivo, particularmente en semillas, además mediante recubrimientos de una o varias capas.

Los principios activos pueden transformarse en las formulaciones habituales, como disoluciones, emulsiones, polvos para pulverización, suspensiones basadas en agua y aceite, polvos, pulverizaciones, pastas, polvos solubles,

gránulos solubles, gránulos dispersados, concentrados en suspensión-emulsión, sustancias naturales impregnadas con principio activo, sustancias sintéticas impregnadas con principio activo, fertilizantes, así como encapsulaciones finas en sustancias poliméricas.

5 Estas formulaciones se preparan de modo conocido, por ejemplo, mediante mezclado de los principios activos con diluyentes, a saber disolventes líquidos, y/o vehículos sólidos, dado el caso usando agentes tensioactivos, a saber emulsionantes y/o dispersantes y/o espumantes. La preparación de las formulaciones se realiza en instalaciones adecuadas o también antes o durante la aplicación.

10 Como sustancias coadyuvantes pueden encontrar uso aquellas sustancias que sean adecuadas para conferir propiedades especiales al agente mismo y/o a preparados derivados del mismo (por ejemplo líquidos de pulverización, desinfectantes de semilla), como determinadas propiedades técnicas y/o también propiedades biológicas especiales. Como coadyuvantes típicos se tienen en cuenta: diluyentes, disolventes y vehículos.

15 Como diluyentes son adecuados, por ejemplo, agua, líquidos químico-orgánicos polares y no polares, por ejemplo, de las clases de hidrocarburos aromáticos y no aromáticos (como parafinas, alquilbencenos, alquilnaftalenos, clorobencenos), de alcoholes y polioles (que pueden estar también dado el caso sustituidos, esterificados y/o esterificados), de cetonas (como acetona, ciclohexanona), ésteres (también grasas y aceites) y (poli)éteres, de aminas sencillas y sustituidas, amidas, lactamas (como *N*-alquilpirrolidonas) y lactonas, de sulfonas y sulfóxidos (como dimetilsulfóxido).

20 En el caso de usar agua como diluyente, pueden usarse también, por ejemplo, disolventes orgánicos como disolventes auxiliares. Como disolventes líquidos se tienen esencialmente en cuenta: compuestos aromáticos como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, compuestos aromáticos clorados e hidrocarburos alifáticos clorados como clorobencenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos como ciclohexano o parafinas, por ejemplo, fracciones de petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoholes como butanol o glicol, así como sus éteres y ésteres, cetonas como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, disolventes polares fuertes como dimetilsulfóxido, así como agua.

25 Como vehículos sólidos se tienen en cuenta: por ejemplo, sales de amoníaco y polvos de rocas naturales como caolines, arcillas, talco, creta, cuarzo, atapulgita, montmorillonita o tierra de diatomeas y polvos de rocas sintéticos como sílice de alta dispersión, óxido y silicatos de aluminio; como vehículos sólidos para gránulos se tienen en cuenta: por ejemplo, rocas naturales rotas y fraccionadas como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita, así como gránulos sintéticos de polvos inorgánicos y orgánicos, así como gránulos de material orgánico como papel, serrín, cáscaras de coco, mazorcas de maíz y tallos de tabaco; como agentes emulsionantes y/o espumantes se tienen en cuenta, por ejemplo, agentes emulsionantes no ionogénicos y aniónicos como polioxietileno-éster de ácido graso, polioxietileno-éter de alcohol graso, por ejemplo, alquilarilpoliglicoléteres, sulfonatos de alquilo, sulfatos de alquilo, sulfonatos de arilo, así como hidrolizados de proteína; como agentes de dispersión se tienen en cuenta sustancias no iónicas y/o iónicas, por ejemplo, de las clases de aductos de alcohol-POE- y/o POP-éter, ésteres de ácido- y/o POP-POE, alquilaril- y/o POP-POE-éter, grasa- y/o POP-POE, derivados de POE- y/o POP-poliol, aductos de POE- y/o POP-sorbitán o -azúcar, sulfatos, sulfonatos y fosfatos de alquilo o arilo, o los correspondientes aductos de PO-éter. Además, oligómeros o polímeros adecuados, por ejemplo, a partir de monómeros vinílicos, de ácido acrílico, de EO y/o de PO solos o junto con, por ejemplo, (poli)alcoholes o (poli)aminas. Además, pueden encontrar uso lignina y sus derivados de ácido sulfónico, celulosas sencillas y modificadas, ácidos sulfónicos aromáticos y/o alifáticos, así como sus aductos con formaldehído.

Pueden usarse en las formulaciones adhesivos como carboximetilcelulosa, polímeros naturales y sintéticos en forma de polvo, grano o látex, como goma arábiga, poli(alcohol vinílico), poli(acetato de vinilo), así como fosfolípidos naturales como cefalinas y lecitinas y fosfolípidos sintéticos.

45 Pueden usarse colorantes como pigmentos inorgánicos, por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, azul de ferrocianuro y colorantes orgánicos como colorantes de alizarina, azoicos y de ftalocianina metálica y oligonutrientes como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

Pueden ser aditivos adicionales aromatizantes, aceites minerales o vegetales dado el caso modificados, ceras y nutrientes (también oligonutrientes) como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

50 Además, pueden contener estabilizantes como estabilizantes del frío, conservantes, protectores de oxidación, fotoprotectores u otros agentes mejoradores de la estabilidad química y/o física.

Las formulaciones contienen en general entre 0,01 y 98 % en peso, preferentemente entre 0,5 y 90 %, de principio activo.

55 El principio activo según la invención puede presentarse en sus formulaciones comerciales así como en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones, mezclado con otros principios activos como insecticidas, cebos, esterilizadores, bactericidas, acaricidas, nematocidas, fungicidas, sustancias reguladoras del crecimiento, herbicidas, protectores, fertilizantes o productos semioquímicos.

Son asociados de mezcla particularmente ventajosos, por ejemplo, los siguientes:

**Fungicidas:**

*Inhibidores de la síntesis de ácidos nucleicos*

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

*Inhibidores de la mitosis y la división celular*

benomilo, carbendazim, dietofencarb, fuberidazol, pencicurón, tiabendazol, tiofanato de metilo, zoxamida.

*Inhibidores del complejo I de la cadena respiratoria*

diflumentorim.

- 10 *Inhibidores del complejo II de la cadena respiratoria*

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

*Inhibidores del complejo III de la cadena respiratoria*

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

- 15 *Desacopladores*

dinocap, fluazinam.

*Inhibidores de la producción de ATP*

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

*Inhibidores de la biosíntesis de aminoácidos y proteínas*

- 20 andoprim, blasticidina-S, ciprodinilo, casugamicina, clorhidrato de casugamicina hidratado, mepanipirim, pirimetanilo.

*Inhibidores de la transducción de señal*

feniclonilo, fludioxonilo, quinoxifeno.

*Inhibidores de la síntesis de grasa y membrana*

clozolinat, iprodiona, procimidona, vinclozolina,

- 25 ampropilfós, ampropilfós de potasio, edifenfós, iprobenfós (IBP), isoprotilano, pirazofós,

tolclofós-metilo, bifenilo,

yodocarb, propamocarb, clorhidrato de propamocarb.

*Inhibidores de la biosíntesis de ergosterol*

fenhexamida,

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

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

naftifina, piributicarb, terbinafina.

*Inhibidores de la síntesis de pared celular*

bentiavalicarb, bialafos, dimetomorf, flumorf, iprovalicarb, polioxina, polioxorim, validamicina A.

- 40 *Inhibidores de la biosíntesis de melanina*



capropamida, diclocimet, fenoxanilo, ftalida, piroquilón, triciclazol.

#### *Inducción de resistencia*

acibenzolar-S-metilo, probenazol, tiadinilo.

#### *Multisitio*

- 5 captafol, captán, clorotalonilo, sales de cobre como: hidróxido de cobre, naftenato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre, óxido de cobre, oxina de cobre y mezcla Bordeaux, diclofluanida, ditanón, dodina, base libre de dodina, ferbam, folpet, fluorofolpet, guazatina, acetato de guazatina, iminocadina, besilato de iminocadina, triacetato de iminocadina, mancozeb, mancozeb, maneb, metiram, metiram de cinc, propineb, azufre y preparados de azufre que contienen polisulfuro de calcio, tiram, tolilfluanida, zineb, ziram.

#### 10 *Mecanismo desconocido*

- ambromdol, bentiazol, betoxazina, capsimicina, carvón, quinometionato, cloropicrina, cufraneb, ciflufenamida, cimoxanilo, dazomet, debacarb, diclomezina, diclorofeno, diclorán, difenzoquat, metilsulfato de difenzoquat, difenilamina, etaboxam, ferimzón, flumetover, flusulfamida, fluopicolida, fluoroimida, hexaclorobenceno, sulfato de 8-hidroxiquinolina, irumamicina, metasulfocarb, metrafenona, isotiocianato de metilo, mildiomicina, natamicina, dimetilditiocarbamato de níquel, nitrotal-isopropilo, octilina, oxamocarb, oxifentiina, pentaclorofenol y sales, 2-fenifenol y sales, piperalina, propanosina de sodio, proquinazid, pirrolnitrina, quintozeno, tecloftalam, tecnaceno, triazóxido, triclámida, zarilamida y 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)piridina, *N*-(4-cloro-2-nitrofenil)-*N*-etil-4-metilbencenosulfonamida, 2-amino-4-metil-*N*-fenil-5-tiazolcarboxamida, 2-cloro-*N*-(2,3-dihidro-1,1,3-trimetil-1*H*-inden-4-il)-3-piridincarboxamida, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetilisoxazolidin-3-il]piridina, cis-1-(4-clorofenil)-2-(1*H*-1,2,4-triazol-1-il)cicloheptanol, 2,4-dihidro-5-metoxi-2-metil-4-[[[1-[3-(trifluorometil)fenil]etiliden]amino]oxi]metil]fenil]-3*H*-1,2,3-triazol-3-ona (185336-79-2), 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1*H*-inden-1-il)-1*H*-imidazol-5-carboxilato de metilo, 3,4,5-tricloro-2,6-pirindindicarbonitrilo, 2-[[[ciclopropil[(4-metoxifenil)imino]metil]tio]metil]- $\alpha$ -(metoximetilen)-benzoacetato de metilo, 4-cloro- $\alpha$ -propiniloxi-*N*-[2-[3-metoxi-4-(2-propiniloxi)fenil]etil]benzoacetamida, (2*S*)-*N*-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propinil]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(metilsulfonil)amino]butanamida, 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-*a*]pirimidina, 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-*N*-[(1*R*)-1,2,2-trimetilpropil][1,2,4]triazolo[1,5-*a*]pirimidin-7-amina, 5-cloro-*N*-[(1*R*)-1,2-dimetilpropil]-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-*a*]pirimidin-7-amina, *N*-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloronicotinamida, *N*-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)metil-2,4-dicloronicotinamida, 2-butoxi-6-yodo-3-propilbenzopiranon-4-ona, *N*-{(Z)-[(ciclopropilmetoxi)imino]-[6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-benzoacetamida, *N*-(3-etil-3,5,5-trimetilciclohexil)-3-formilamino-2-hidroxibenzamida, 2-[[[1-[3-(1-fluoro-2-feniletil)oxi]fenil]etiliden]amino]oxi]metil]- $\alpha$ -(metoxiimino)-*N*-metil-alfa-E-benzoacetamida, *N*-{2-[3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]etil]-2-(trifluorometil)benzamida, *N*-(3',4'-dicloro-5-fluorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1*H*-pirazol-4-carboxamida, *N*-(6-metoxi-3-piridinil)ciclopropanocarboxamida, ácido 1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil-1*H*-imidazol-1-carboxílico, ácido O-[1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil]-1*H*-imidazol-1-carbotioico, 2-(2-[[6-(3-cloro-2-metilfenoxi)-5-fluoropirimidin-4-il]oxi]fenil)-2-(metoxiimino)-*N*-metilacetamida.

#### **Bactericidas:**

- 35 bronopol, diclorofeno, nitrapiquina, dimetilditiocarbamato de níquel, casugamicina, octilina, ácido furanocarboxílico, oxitetraciclina, probenazol, estreptomina, tecloftalam, sulfato de cobre y otras preparaciones de cobre.

#### **Insecticidas/acaricidas/nematicidas:**

##### *Inhibidores de acetilcolinesterasa (AChE)*

carbamatos,

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

organofosfatos,

- 45 por ejemplo acefato, azametifós, azinfós (-metilo, -etilo), bromofós-etilo, bromfenvinfós (-metilo), butatofós, cadusafós, carbofenotión, cloretoxifós, clorfenvinfós, clormefós, clorpirifós (-metilo/-etilo), cumafós, cianofenós, cianofós, clorfenvinfós, demetón-S-metilo, demetón-S-metilsulfona, dialifós, diazinón, diclofentión, diclorvós/DDVP, dicrotofós, dimetoato, dimetilvinfós, dioxabenzofós, disulfotón, EPN, etión, etoprofós, etrimfós, famfur, fenamifós, fenitrotión, fensulfotión, fentión, flupirazofós, fonofós, formatión, fosmetilán, fostiazato, heptenofós, yodofenós, iprofenfós, isazofós, isofenfós, O-salicilato de isopropilo, isoxatión, malatión, mecarbam, metacrifós, metamidofós, metidatión, mevinfós, monocrotofós, naled, ometoato, oxidemetón-metilo, paratión (-metilo/-etilo), fentoato, forato, fosadona, fosmet, fosfamidón, fosfocarb, foxim, pirimifós (-metilo/-etilo), profenofós, propafós, propetamfós, protiofós, protoato, piraclofós, piridafentión, piridatión, quinalfós, sebufós, sulfotep, sulprofós, tebupirimfós, temefós, terbufós, tetraclorvinfós, tiometón, triazofós, triclorfón, vamidotión.

*Moduladores de canal de sodio / bloqueantes de canal de sodio dependientes del voltaje*

5 piretroides, por ejemplo, acrinatrina, aletrina (d-cis-trans, d-trans), beta-ciflutrina, bifentrina, bioaletrina, isómero S-ciclopentilo de bioaletrina, bioetanometrina, biopermetrina, bioesmetrina, clovaportrina, cis-cipermetrina, cis-resmetrina, cis-permetrina, clocitrina, cicloprotrina, ciflutrina, cihalotrina, cipermetrina (alfa-, beta-, teta-, zeta-), cifenotrina, deltametrina, empentrina (isómero 1R), esfenvalerato, etofenprox, fenflutrina, fenpropatrina, fenpiritrina, fenvalerato, flubrocitrinato, flucitrinato, flufenprox, flumetrina, fluvalinato, fubfenprox, gamma-cihalotrina, imiprotrina, kadetrina, lambda-cihalotrina, metoflutrina, permetrina (cis-, trans-), fenotrina (isómero 1R-trans), praletrina, proflutrina, protrifenbuto, piresmetrina, resmetrina, RU 15525, silafluofeno, tau-fluvalinato, teflutrina, teraletrina, tetrametrina (isómero 1R), tralometrina, translutrina, ZXI 8901, piretrinas (piretro);

10 DDT

oxadiazinas,

por ejemplo, indoxacarb,

semicarbazonas,

por ejemplo, metaflumizón (BAS3201)

15 Agonistas/antagonistas de receptor de acetilcolina

cloronicotínicos,

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

nicotina, bensultap, cartap.

*Moduladores de receptor de acetilcolina*

20 espinosinas,

por ejemplo, espinosad.

*Antagonistas de canal de cloruro controlados por GABA*

organoclorados,

por ejemplo, camfeclor, clordano, endosulfán, gamma-HCH, HCH, heptacloro, lindano, metoxicloro;

25 fiproles,

por ejemplo, acetoprol, etiprol, fipronilo, pirafluprol, priprol, vaniliprol.

*Activadores de canal de cloruro*

mectinas,

por ejemplo, abamectina, emamectina, benzoato de emamectina, ivermectina, lepimectina, milbemicina.

30 Miméticos de hormona juvenil,

por ejemplo, diofenolán, epofenonano, fenoxicarb, hidropreno, quinopreno, metopreno, piriproxifeno, tripreno.

*Agonistas/desestabilizadores de ecdisona*

diacilhidrazinas, por ejemplo, cromafenoazida, halofenoazida, metoxifenoazida, tebufenoazida.

*Inhibidores de la biosíntesis de quitina*

35 benzoilureas, por ejemplo, bistriflurón, clofluazurón, diflubenzurón, fluazurón, fluciclozurón, flufenoxurón, hexaflumurón, lufenurón, novalurón, noviflumurón, penflurón, teflubenzurón, triflumurón,

buprofezina,

ciromazina.

*Inhibidores de la fosforilación oxidativa, desestabilizadores de ATP*

40 diafentiurón,

compuestos de organoestaño, por ejemplo, azociclotina, cihexatina, fenbutatina-óxido.

*Desacoplantes de la fosforilación oxidativa mediante interrupción del gradiente de protón H*

pirroles,

por ejemplo, clorfenapir,

5 dinitrofenoles,

por ejemplo, binapacril, dinobutón, dinocap, DNOC, meptildinocap.

*Inhibidores del transporte de electrones parte I*

METI,

por ejemplo, fenazaquina, fenpiroximato, pirimidifeno, piridabén, tebufenpirad, tolfenpirad,

10 hidrametilnón,

dicofol.

*Inhibidores del transporte de electrones parte II*

rotenonas.

*Inhibidores del transporte de electrones parte III*

15 acequinocilo, fluaciripirim

Desestabilizadores microbianos de la membrana intestinal de insectos

cepas de *Bacillus thuringiensis*.

Inhibidores de la síntesis de grasas

ácidos tetrónicos,

20 por ejemplo, espirodiclofeno, espiromesifeno;

ácidos tetrámicos,

por ejemplo, espirotetramat: cis-3-(2,5-dimetilfenil)-4-hidroxi-8-metoxi-1-azaespiro[4,5]dec-3-en-2-ona

carboxamidas,

por ejemplo, flonicamida,

25 agonistas octopaminérgicos,

por ejemplo, amitraz.

Inhibidores de la ATPasa estimulada por magnesio,

propargita,

análogos de nereistoxina, por ejemplo, tiociclám hidrogenoxalato, tiosultap de sodio.

30 Agonistas del receptor de rianodina

dicarboxamidas del ácido benzoico, por ejemplo, flubendiamida;

antranilamidas,

por ejemplo, rinaxipir (3-bromo-*N*-{4-cloro-2-metil-6-[(metilamino)carbonil]fenil}-1-(3-cloropiridin-2-il)-1*H*-pirazol-5-carboxamida).

35 Productos biológicos, hormonas o feromonas

azadiractina, *Bacillus spec.*, *Beauveria spec.*, codlemona, *Metarrhizium spec.*, *Paecilomyces spec.*, *Thuringiensin*, *Verticillium spec.*

Principios activos con mecanismos de acción desconocidos o no específicos

agentes de fumigación,

por ejemplo, fosfuro de aluminio, bromuro de metilo, fluoruro de sulfurilo,

inhibidores de la alimentación,

5 por ejemplo, criolita, flonicamida, pimetrozina,

inhibidores del crecimiento de ácaros,

por ejemplo, clofentezina, etoxazol, hexitiazox,

10 amidoflumeť, benclotiaz, benzoximato, bifenazato, bromopropilato, buprofezina, quinometionato, clordimeform, clorobenzilato, cloropicrina, clotiazobeno, ciclopreno, ciflumentofeno, diciclanilo, fenoxacrim, fentrifanilo, flubenzimina, flufenerim, flutenzina, Gossyplure, hidrametilnona, japoniluro, metoxadiazona, Petroleum, butóxido de piperonilo, oleato de potasio, piridalilo, sulfluramida, tetradifón, tetrasul, triaratenó, verbutín.

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

15 Los principios activos según la invención pueden presentarse además en el uso como insecticidas en sus formulaciones comerciales, así como en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones, mezclados con sinergistas. Los sinergistas son compuestos mediante los que se controla el efecto de los principios activos, sin que el sinergista añadido deba ser eficazmente activo por sí mismo.

20 Los principios activos según la invención pueden presentarse además en el uso como insecticidas en sus formulaciones comerciales, así como en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones, en mezclas con sustancias inhibitoras que reducen la degradación del principio activo después de la aplicación en el entorno de las plantas, sobre la superficie de las partes de la planta o en los tejidos de la planta.

El contenido de principio activo de las formas de aplicación preparadas a partir de las formulaciones comerciales puede variar en amplios intervalos. La concentración de principio activo de las formas de aplicación puede encontrarse del 0,00000001 al 95 % en peso de principio activo, preferentemente entre el 0,00001 y el 1 % en peso.

25 La aplicación se efectúa en una de las formas de aplicación adaptadas de modo habitual.

30 Como ya se ha mencionado anteriormente, pueden tratarse según la invención todas las plantas y sus partes. En una forma de realización preferida, se tratan especies de plantas y variedades de plantas de origen silvestre u obtenidas mediante procedimientos de cultivo biológico convencional, como cruzamiento o fusión de protoplastos, así como sus partes. En una forma de realización preferida adicional, se tratan plantas transgénicas y variedades de plantas que se han obtenido mediante procedimientos de ingeniería genética dado el caso en combinación con procedimientos convencionales (organismos modificados genéticamente) y sus partes. Los términos "partes" o "partes de plantas" o "partes de planta" se han ilustrado anteriormente.

35 De forma especialmente preferente, se tratan plantas según la invención de las variedades de plantas respectivamente comerciales o que se encuentran en uso. Por variedades de planta se entiende plantas con nuevas propiedades ("rasgos") que se cultivan tanto mediante cultivo convencional, mediante mutagénesis o mediante técnicas de ADN recombinante. Estas pueden ser variedades, biotipos y genotipos.

40 Según la especie de planta o variedad de planta, su hábitat y condiciones de crecimiento (suelo, clima, periodo vegetativo, alimentación), pueden aparecer también efectos superaditivos ("sinérgicos") mediante el tratamiento según la invención. Así, son posibles por ejemplo cantidades de aplicación reducidas y/o ampliaciones del espectro de acción y/o un reforzamiento del efecto de las sustancias y agentes que pueden usarse según la invención, mejor crecimiento de plantas, tolerancia elevada frente a altas o bajas temperaturas, tolerancia elevada frente a la sequía o frente al contenido de sales del agua o el suelo, rendimiento de floración elevado, recolección facilitada, aceleramiento de la maduración, mayores rendimientos de cosecha, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos de cosecha, mayor capacidad de almacenamiento y/o procesabilidad de los productos de cosecha, que superan los efectos que realmente se esperan.

50 Pertenecen a las plantas o variedades de plantas transgénicas preferidas según la invención para tratar (obtenidas por ingeniería genética) todas las plantas que mediante la modificación por ingeniería genética han recibido material genético que confiere a estas plantas propiedades valiosas especialmente ventajosas ("rasgos"). Son ejemplos de dichas propiedades mejor crecimiento de planta, tolerancia elevada frente a temperaturas altas o bajas, tolerancia aumentada frente a la sequía o frente al contenido de sales de agua o suelo, rendimiento de floración elevado, recolección facilitada, aceleramiento de la maduración, mayores rendimientos de cosecha, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos de cosecha, mayor capacidad de almacenamiento y/o procesabilidad de los productos de cosecha. Son ejemplos adicionales y especialmente destacados de dichas propiedades una defensa

elevada de las plantas frente a plagas animales y microbianas, como frente a insectos, ácaros, hongos fitopatógenos, bacterias y/o virus, así como una tolerancia elevada de las plantas frente a determinados principios activos herbicidas. Como ejemplos de plantas transgénicas, se mencionan las plantas de cultivo importantes como cereales (trigo, arroz), maíz, soja, patata, remolacha azucarera, tomates, guisantes y otras variedades de hortalizas, algodón, tabaco, colza, así como plantas frutales (con los frutos manzana, pera, frutos cítricos y uvas viníferas), siendo especialmente destacadas maíz, soja, patata, algodón, tabaco y colza. Como propiedades ("rasgos"), se destacan especialmente la defensa elevada de las plantas frente a insectos, arácnidos, nematodos y caracoles mediante toxinas formadas en las plantas, particularmente aquellas que se generan en las plantas mediante el material genético de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo, mediante los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF, así como sus combinaciones) (en adelante, "plantas Bt"). Como propiedades ("rasgos"), se destacan también especialmente la defensa elevada de las plantas frente a hongos, bacterias y virus mediante resistencia sistémica adquirida (SAR), sistemina, fitoalexinas, desencadenantes, así como genes de resistencia y las correspondientes proteínas y toxinas expresadas. Como propiedades ("rasgos"), se destacan también especialmente la tolerancia elevada de las plantas frente a determinados principios activos herbicidas, por ejemplo, imidazolinonas, sulfonilureas, glifosato o fosfinotricina (por ejemplo, gen "PAT"). Los genes que confieren las propiedades respectivamente deseadas ("rasgos") pueden aparecer también en combinaciones entre sí en las plantas transgénicas. Como ejemplos de "plantas Bt", se citan variedades de maíz, variedades de algodón, variedades de soja y variedades de patata, que se comercializan con las denominaciones comerciales YIELD GARD® (por ejemplo, maíz, algodón, soja), KnockOut® (por ejemplo, maíz), StarLink® (por ejemplo, maíz), Bollgard® (algodón), NuCotn® (algodón) y NewLeaf® (patata). Como ejemplos de plantas tolerantes a herbicidas, se mencionan variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja que se comercializan con las denominaciones comerciales Roundup Ready® (tolerancia frente a glifosato, por ejemplo, maíz, algodón, soja), Liberty Link® (tolerancia frente a fosfinotricina, por ejemplo, colza), IMI® (tolerancia frente a imidazolinonas) y STS® (tolerancia frente a sulfonilureas, por ejemplo, maíz). Como plantas resistentes a herbicidas (cultivadas convencionalmente con tolerancia a herbicidas), se mencionan también las variedades comercializadas con la referencia Clearfield® (por ejemplo, maíz). Por supuesto, estas indicaciones son válidas también para las variedades de plantas desarrolladas en el futuro o presentes en el mercado futuro con estas u otras propiedades genéticas ("rasgos") desarrolladas en el futuro.

Las plantas indicadas pueden tratarse de forma especialmente ventajosa con los compuestos de fórmula general I o las mezclas de principios activos según la invención. Los intervalos preferidos dados anteriormente en los principios activos o mezclas son también válidos para el tratamiento de estas plantas. Se destaca especialmente el tratamiento de plantas con los compuestos o mezclas citados especialmente en el presente texto.

Los principios activos según la invención no sólo funcionan contra plagas de plantas, contra la higiene y de productos almacenados, sino también en el sector de medicina veterinaria contra parásitos animales (ecto- y endoparásitos) como garrapatas duras, garrapatas blandas, ácaros de la sarna, ácaros chupadores, moscas (picadoras y chupadoras), larvas de moscas parásitas, piojos, malófagos de piel, malófagos de pluma y pulgas. Pertenecen a estos parásitos:

Del orden de los anopluros, por ejemplo, *Haematopinus spp.*, *Linognathus spp.*, *Pediculus spp.*, *Phthirus spp.*, *Solenopotes spp.*

Del orden de los malófagos y los subórdenes *Amblycerina* así como *Ischnocerina*, por ejemplo, *Trimenopon spp.*, *Menopon spp.*, *Trinoton spp.*, *Bovicola spp.*, *Werneckiella spp.*, *Lepikentron spp.*, *Damalina spp.*, *Trichodectes spp.*, *Felicola spp.*

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

Del orden de los sifonápteros, por ejemplo, *Pulex spp.*, *Ctenocephalides spp.*, *Xenopsylla spp.*, *Ceratophyllus spp.*

Del orden de los heterópteros, por ejemplo, *Cimex spp.*, *Triatoma spp.*, *Rhodnius spp.*, *Panstrongylus spp.*

Del orden de los blatáridos, por ejemplo, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blattella germanica*, *Supella spp.*

De la subclase de los ácaros (*Acarina*) y los subórdenes *Metastigmata* así como *Mesostigmata*, por ejemplo, *Argas spp.*, *Ornithodoros spp.*, *Otobius spp.*, *Ixodes spp.*, *Amblyomma spp.*, *Boophilus spp.*, *Dermacentor spp.*, *Haemophysalis spp.*, *Hyalomma spp.*, *Rhipicephalus spp.*, *Dermanyssus spp.*, *Raillietia spp.*, *Pneumonyssus spp.*, *Sternostoma spp.*, *Varroa spp.*

Del orden de los actinédidos (*Prostigmata*) y acarididos (*Astigmata*), por ejemplo, *Acarapis spp.*, *Cheyletiella spp.*, *Ornithocheyletiella spp.*, *Myobia spp.*, *Psorergates spp.*, *Demodex spp.*, *Trombicula spp.*, *Listrophorus spp.*, *Acarus spp.*, *Tyrophagus spp.*, *Caloglyphus spp.*, *Hypodectes spp.*, *Pterolichus spp.*, *Psoroptes spp.*, *Chorioptes spp.*

*Otodectes spp., Sarcoptes spp., Notoedres spp., Knemidocoptes spp., Cytodites spp., Laminosioptes spp.*

Los principios activos de fórmula (I) según la invención son también adecuados para combatir artrópodos que atacan a animales útiles agrícolas como, por ejemplo, vacas, ovejas, cabras, caballos, cerdos, asnos, camellos, búfalos, conejos, gallinas, pavos, patos, gansos, abejas, otras mascotas como, por ejemplo, perros, gatos, aves domésticas, peces de acuario, así como los denominados animales de ensayo como, por ejemplo, hámsteres, conejillos de indias, ratas y ratones. Mediante el combate de estos artrópodos, deben reducirse los fallecimientos y reducciones de rendimiento (de carne, leche, lana, pieles, huevos, miel, etc.), de modo que mediante el uso de los principios activos según la invención es posible una cría de animales más económica y sencilla.

La aplicación de los principios activos según la invención se efectúa de modo conocido en el sector veterinario mediante administración enteral en forma de, por ejemplo, comprimidos, cápsulas, pociones, brebajes, gránulos, pastas, bolos, procedimiento con la alimentación, supositorios, mediante administración parenteral como, por ejemplo, mediante inyecciones (intramusculares, subcutáneas, intravenosas, intraperitoneales, entre otras), implantes, mediante administración nasal, mediante aplicación dérmica en forma, por ejemplo, de inmersión o baño (empapado), pulverización (pulverizador), vertido (vertido dorsal y en la cruz), lavado, empolvado, así como con ayuda de cuerpos de moldeo que contienen principios activos como collares, marcas en la oreja, marcas en el rabo, brazaletes, ronzales, dispositivos de marcaje, etc.

En la aplicación para ganado, aves, mascotas, etc., pueden usarse los principios activos de fórmula (I) como formulaciones (por ejemplo, polvos, emulsiones, agentes fluidos) que contienen el principio activo en una cantidad de 1 a 80 % en peso, directamente o después de dilución a 100 a 10.000 veces, o se usan como baño químico.

Además, se ha encontrado que los compuestos según la invención muestran un alto efecto insecticida frente a insectos que destruyen materiales técnicos.

Por ejemplo y preferentemente, sin embargo sin limitación, se citan 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 capucinus*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxylon spec.* *Dinoderus minutus*.

Himenópteros como *Sirex juvencus*, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus*, *Urocerus augur*.

Termitas como *Kaloterms flavicollis*, *Cryptoterms brevis*, *Heteroterms indicola*, *Reticuliterms flavipes*, *Reticuliterms santonensis*, *Reticuliterms lucifugus*, *Mastoterms darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis*, *Coptoterms formosanus*.

Lepismas como *Lepisma saccharina*.

Por materiales técnicos se entienden en el presente contexto materiales inanimados como preferentemente plásticos, adhesivos, colas, papeles y cartones, cuero, madera, productos del procesamiento de la madera y pinturas.

Los agentes preparados para aplicación pueden contener dado el caso insecticidas adicionales y dado el caso uno o más fungicidas.

Con respecto a los ingredientes de mezcla adicionales posibles, se remite a los insecticidas y fungicidas anteriormente citados.

Al mismo tiempo, los compuestos según la invención pueden usarse para la protección de la incrustación de objetos, particularmente de cascos de barcos, cedazos, redes, construcciones, muelles e instalaciones de señalización que están en contacto con agua marina o salobre.

Además, los compuestos según la invención pueden usarse solos o en combinaciones con otros principios activos como agentes antiincrustación.

Los principios activos son adecuados también para combatir plagas animales en la protección doméstica, de higiene y almacenamiento, particularmente de insectos, arácnidos y ácaros, que aparecen en espacios cerrados como, por ejemplo, viviendas, fábricas, oficinas, cabinas de vehículos, entre otros. Pueden usarse para combatir plagas solos o en combinación con otros principios activos y coadyuvantes en productos insecticidas domésticos. Son eficaces frente a especies sensibles y resistentes, así como frente a todos los estados de desarrollo. Pertenecen a estas plagas:

Al orden de los escorpiones, por ejemplo, *Buthus occitanus*.

Al orden de los acarinos, por ejemplo, *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Bryobia ssp.*, *Dermanyssus gallinae*, *Glyciphagus domesticus*, *Ornithodoros moubat*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Trombicula alfreddugesi*, *Neutrombicula*

*autumnalis, Dermatophagoides pteronissimus, Dermatophagoides forinae.*

Al orden de los arañas, por ejemplo, *Aviculariidae, Araneidae.*

Al orden de los opiliones, por ejemplo, *Pseudoscorpiones chelifer, Pseudoscorpiones cheiridium, Opiliones phalangium.*

5 Al orden de los isópodos, por ejemplo, *Oniscus asellus, Porcellio scaber.*

Al orden de los diplópodos, por ejemplo, *Blaniulus guttulatus, Polydesmus spp.*

Al orden de los quilópodos, por ejemplo, *Geophilus spp.*

Al orden de los zigentomos, por ejemplo, *Ctenolepisma spp., Lepisma saccharina, Lepismodes inquilinus.*

10 Al orden de los blatarios, por ejemplo, *Blatta orientalis, Blattella germanica, Blattella asahinai, Leucophaea maderae, Panchlora spp., Parcoblatta spp., Periplaneta australasiae, Periplaneta americana, Periplaneta brunnea, Periplaneta fuliginosa, Supella longipalpa.*

Al orden de los saltatorios, por ejemplo, *Acheta domesticus.*

Al orden de los dermápteros, por ejemplo, *Forficula auricularia.*

Al orden de los isópteros, por ejemplo, *Kaloterms spp., Reticuliterms spp.*

15 Al orden de los psocópteros, por ejemplo, *Lepinatus spp., Liposcelis spp.*

Al orden de los coleópteros, por ejemplo, *Anthrenus spp., Attagenus spp., Dermestes spp., Latheticus oryzae, Necrobia spp., Ptinus spp., Rhizopertha dominica, Sitophilus granarius, Sitophilus oryzae, Sitophilus zeamais, Stegobium paniceum.*

20 Al orden de los dípteros, 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.*

Al orden de los lepidópteros, por ejemplo, *Achroia grisella, Galleria mellonella, Plodia interpunctella, Tinea cloacella, Tinea pellionella, Tineola bisselliella.*

25 Al orden de los sifonápteros, por ejemplo, *Ctenocephalides canis, Ctenocephalides felis, Pulex irritans, Tunga penetrans, Xenopsylla cheopis.*

Al orden de los himenópteros, por ejemplo, *Camponotus herculeanus, Lasius fuliginosus, Lasius niger, Lasius umbratus, Monomorium pharaonis, Paravespula spp., Tetramorium caespitum.*

30 Al orden de los anopluros, por ejemplo, *Pediculus humanus capitis, Pediculus humanus corporis, Pemphigus spp., Phylloera vastatrix, Phthirus pubis.*

Al orden de los heterópteros, por ejemplo, *Cimex hemipterus, Cimex lectularius, Rhodinus prolixus, Triatoma infestans.*

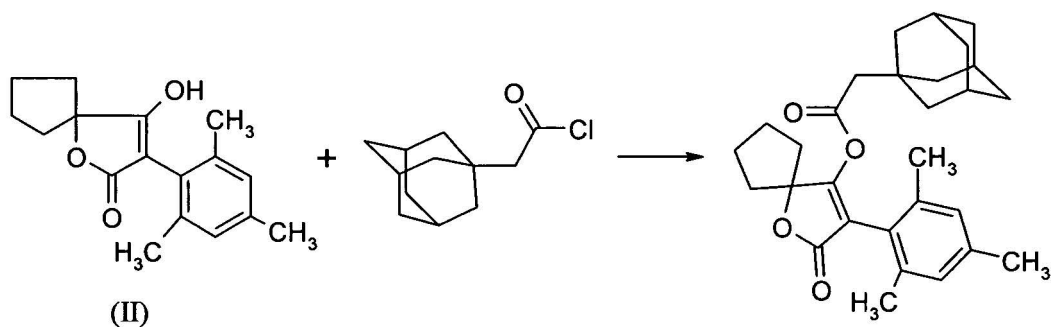
35 La aplicación en el sector de los insecticidas domésticos se realiza sola o en combinación con otros principios activos adecuados como ésteres de ácido fosfórico, carbamatos, piretroides, neonicotinoides, reguladores del crecimiento o principios activos de otras clases de insecticidas conocidas.

40 La aplicación se realiza en aerosoles, pulverizadores sin presión, por ejemplo, pulverizadores de bombeo y atomización, nebulizadores automáticos, nebulizadores, espumas, geles, productos de vaporización con placas vaporizadoras de celulosa o plástico, vaporizadores de líquido, vaporizadores de gel y membrana, vaporizadores propulsores, sistemas de vaporización sin energía o pasivos, papeles antipolillas, saquitos antipolillas y geles antipolillas, en forma de gránulos o polvos, en cebos dispersados o trampas con cebo.

La preparación y uso de los principios activos según la invención se desprende de los siguientes ejemplos.

### **Ejemplos de preparación**

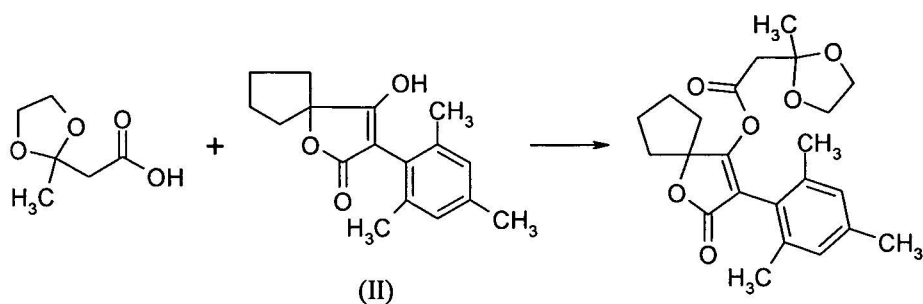
#### **Ejemplo (I-1) Procedimiento A (α)**



- 5 Se disponen 0,545 g (2 mmol) del compuesto II en 50 ml de diclorometano, se añaden a temperatura ambiente 0,223 g (2,2 mmol) de trietilamina, se añaden gota a gota a 0-10 °C 0,447 g (2,1 mmol) de cloruro del ácido adamantilacético y se agita durante una noche a temperatura ambiente. Para el procesamiento, se agita la preparación con ácido cítrico diluido y NaOH al 5 %, se seca la fase orgánica, se concentra y se purifica mediante cromatografía en columna (gel de sílice, diclorometano).

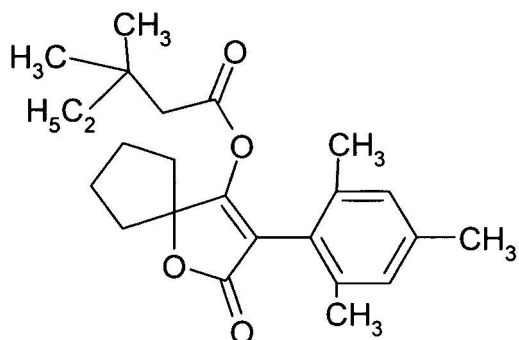
Rendimiento: 0,656 g (73 % d.t.), log P= 6,94.

**Ejemplo (I-2) Procedimiento A (γ)**



- 10 Se disponen 0,5 g (3,42 mmol) de dietilenglicol del ácido acetoacético en 30 ml de acetonitrilo, se añaden 1,327 g (10,26 mmol) de *N,N*-diisopropiletilamina, se añaden a temperatura ambiente 1,045 g (4,11 mmol) de cloruro del ácido bis-(2-oxo-3-oxazolidinil)fosfónico (BOP-Cl), se agita después durante 20 min, se añaden gota a gota 1,118 g (4,11 mmol) del compuesto II, se agita durante una noche a temperatura ambiente, se concentra la preparación y se purifica mediante cromatografía en columna (gel de sílice, ciclohexano/acetato de etilo).
- 15 Rendimiento: 0,117 g (9 % d.t.), log P= 3,85.

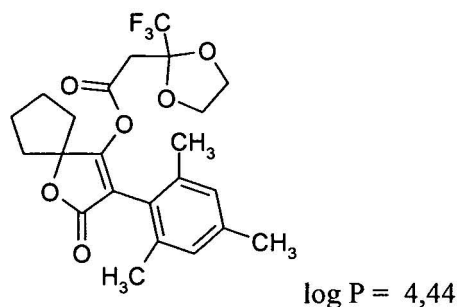
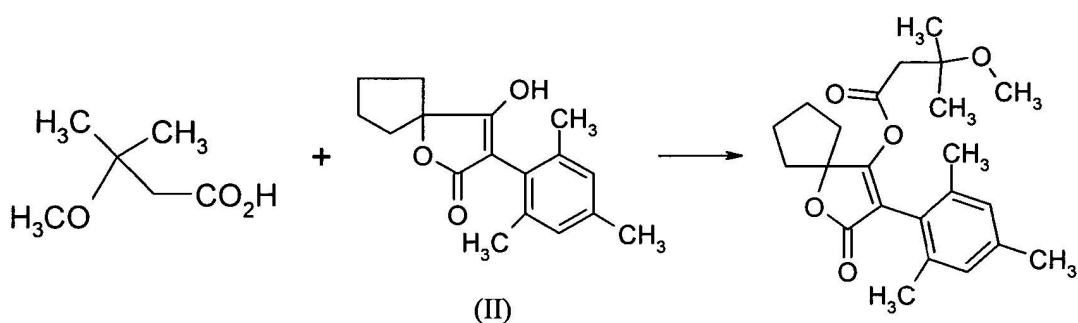
Análogamente al ejemplo (I-1), se obtiene el **ejemplo (I-3)**



**Pf. 77°C**

Análogamente al ejemplo (I-2), se obtiene el **ejemplo (I-4)**



**Ejemplo (I-5)**

- 5 Se agitan 66 mg (0,5 mmol) de ácido 3-metoxi-3-metilbutírico, 0,17 ml (1,2 mmol) de trietilamina, 136 mg (0,5 mmol) del compuesto II y 153 mg (0,6 mmol) de cloruro de 2-cloro-1-metilpiridinio durante una noche a temperatura ambiente en 5 ml de tetrahydrofurano, se concentra la preparación y se purifica mediante cromatografía en columna (gel de sílice, ciclohexano/acetato de etilo).

Rendimiento: 149 mg (70 % d.t.), log P= 4,45.

**Determinación de los valores de log P**

- 10 Se realizó la determinación de los valores de log P dados en la tabla según la directiva de la CEE 79/831, anexo V.A8 mediante HPLC (cromatografía líquida de alta resolución) en una columna de fase inversa (C18). Temperatura: 43 °C.

Eluyentes para la determinación en el intervalo ácido (pH 2,3): ácido fosfórico acuoso al 0,1 %, acetonitrilo; gradiente lineal del 10 % de acetonitrilo al 90 % de acetonitrilo.

- 15 Se realizó la calibración con alcan-2-onas no ramificadas (de 3 a 16 átomos de carbono) cuyos valores de log P son conocidos (determinación de los valores de log P por los tiempos de retención mediante interpolación lineal entre dos alcanonas consecutivas).

Se determinaron los valores de lambda máxima por los espectros UV de 200 nm a 400 nm en los máximos de las señales cromatográficas.

**20 Ejemplo 1*****Tetranychus urticae* (TETRUR RAUS)**

Disolvente 7 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante 10 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

- 25 Para la preparación de un preparado de principio activo conveniente, se mezclan 1 parte en peso de principio activo con las cantidades dadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada.

Se tratan plantas de judías (*Phaseolus vulgaris*), que se han infestado con una población mixta de araña roja resistente (*Tetranychus urticae*, resistente), mediante pulverización con el preparado de principio activo a la concentración deseada.

Después del tiempo deseado, se determina la mortalidad en %. A este respecto, el 100 % significa que todos los animales habían muerto, el 0 % significa que ningún animal había muerto.

5 En este ensayo, por ejemplo, el siguiente compuesto de los ejemplos de preparación muestra una actividad superior a una concentración de 5 ppm frente al ejemplo I del documento WO 00/42850 del estado de la técnica (espiromesifeno)= I-3 (97 %) frente a 30 % de SdT.

### Ejemplo 2

#### Ensayo de *Phaedon* (tratamiento con pulverización de PHAECO)

Disolvente: 78 partes en peso de acetona

1,5 partes en peso de dimetilformamida

10 Emulsionante: 0,5 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

Para la preparación de un preparado de principio activo conveniente, se mezclan 1 parte en peso de principio activo con las cantidades dadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada.

15 Se pulverizan trozos de hoja de col china (*Brassica pekinensis*) con un preparado de principio activo de la concentración deseada y se llenan después del secado con larvas de escarabajo de la mostaza (*Phaedon cochleriae*).

Después del tiempo deseado, se determina la mortalidad en %. A este respecto, el 100 % significa que todas las larvas de escarabajo habían muerto, el 0 % significa que ninguna larva de escarabajo había muerto.

20 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una actividad superior a una cantidad de aplicación de 100 g/ha frente al ejemplo I del documento WO 00/42850 del estado de la técnica (espiromesifeno)= I-2 (67 %) frente al 33 % de SdT.

### Ejemplo 3

#### *Frankliniella occidentalis* (tratamiento de pulverización con FRANOC)

Disolvente: 78,0 partes en peso de acetona

25 1,5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: 0,5 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

30 Para la preparación de un preparado de principio activo conveniente, se mezclan 1 parte en peso de principio activo con las cantidades dadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada. Si es necesario añadir sales de amonio, se pipetea éstas respectivamente a una concentración de 1000 ppm después de la dilución de la disolución de preparado lista.

Se pulverizan trozos de hoja de judía (*Phaseolus vulgaris*), que se han infestado con una población mixta de trips (*Frankliniella occidentalis*), con un preparado de principio activo de la concentración deseada.

Después del tiempo deseado, se determina la mortalidad en %. A este respecto, el 100 % significa que todos los trips habían muerto, el 0 % significa que ningún trips había muerto.

35 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una actividad superior a una cantidad de aplicación de 100 g/ha frente al ejemplo 1 del documento WO 00/42850 del estado de la técnica (espiromesifeno)= I-2 (63 %) frente al 0 % de SdT;

y a una cantidad de aplicación de 500 g/ha frente al ejemplo I del documento WO 00/42850 del estado de la técnica (espiromesifeno): I-1 (80 %) frente al 0 % de SdT.

### 40 Ejemplo 4

#### Ensayo de *Myzus persicae* (MYZUPE)

Disolvente: 7 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: 2 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

45 Para la preparación de un preparado de principio activo conveniente, se mezclan 1 parte en peso de principio activo con las cantidades dadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua que contiene

emulsionante a la concentración deseada. Si es necesario añadir sales de amonio, potenciadores de la penetración o sales de amonio y potenciadores de la penetración, se pipetea estos respectivamente a una concentración de 1000 ppm después de la dilución de la disolución de preparado lista.

- 5 Se tratan hojas de col (*Brassica oleracea*), que se han infestado fuertemente con pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*), mediante inmersión en el preparado de principio activo de la concentración deseada.

Después del tiempo deseado, se determina la mortalidad en %. A este respecto, el 100 % significa que todos los pulgones habían muerto, el 0 % significa que ningún pulgón había muerto.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una actividad superior frente al estado de la técnica: véase la Tabla.

Principio activo	MYZUPE	
	ppm	% 6 d.
Ejemplo I-5 según la invención	100	55
Ejemplo I del documento WO 00/42850 (espiromesifeno) estado de la técnica	100	30

10

#### Ejemplo 5

#### Ensayo de *Tetranychus*- tratamiento resistente a OP/inmersión (TETRUR)

Disolvente: 7 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: 2 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

- 15 Para la preparación de un preparado de principio activo conveniente, se mezclan 1 parte en peso de principio activo con las cantidades dadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada. Si es necesario añadir sales de amonio, potenciadores de la penetración o sales de amonio y potenciadores de la penetración, se pipetea estos respectivamente a una concentración de 1000 ppm después de la dilución de la disolución de preparado lista.

- 20 Se tratan plantas de judías (*Phaseolus vulgaris*), que se han infestado con todos los estadios de la araña roja (*Tetranychus urticae*, sensible), mediante pulverización con el preparado de principio activo a la concentración deseada.

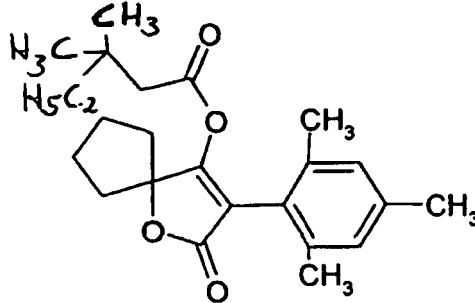
Después del tiempo deseado, se determina la mortalidad en %. A este respecto, el 100 % significa que todas las arañas habían muerto, el 0 % significa que ninguna araña había muerto.

- 25 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una actividad frente al estado de la técnica: véase la Tabla.

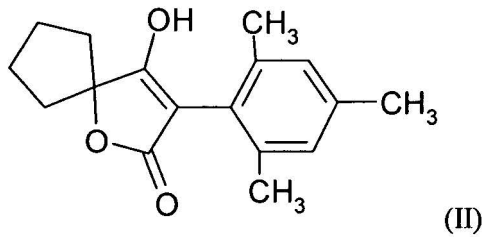
Principio activo	TETRUR	
	ppm	% 7 d.
Ejemplo I-5 según la invención	3,125	90
	1,5625	50
	0,78125	30
Ejemplo I del documento WP 00/42850 (espiromesifeno) estado de la técnica	3,125	50
	1,5625	30
	0,78125	0

REIVINDICACIONES

1. Compuestos de la fórmula (I-3)

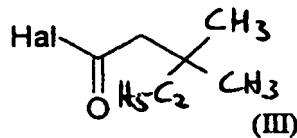


5 2. Procedimiento para la preparación de compuestos de la fórmula I-3 según la reivindicación 1, **caracterizado porque** se hace reaccionar el compuesto (II)



en cada caso

α) con compuestos de la fórmula (III)



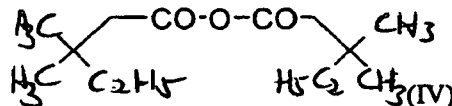
10

en la que

Hal representa halógeno

o

β) con anhídridos de ácido carboxílico de la fórmula (IV)



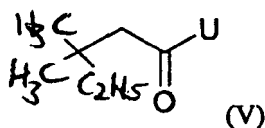
15

en la que

dado el caso en presencia de un diluyente y dado el caso en presencia de un aceptor de ácido;

o

y) con derivados de ácido carboxílico activados de la fórmula (V)



U representa un grupo saliente introducido mediante reactivos de activación de ácido carboxílico como carbonildiimidazol, carbonildiimida, reactivos de fosforilación, agentes de halogenación, fosgeno o éster de ácido clorofórmico,

5

dado el caso en presencia de un diluyente y dado el caso en presencia de un aceptor de ácido.

3. Uso de compuestos de la fórmula I-3 según la reivindicación 1 para la producción de agentes para combatir plagas contra *Tetranychus urticae*.

10

4. Agente para combatir plagas contra *Tetranychus urticae*, **caracterizado por** un contenido de al menos un compuesto de fórmula I-3 según la reivindicación 1.

5. Procedimiento para combatir plagas animales, **caracterizado porque** se dejan actuar compuestos de fórmula I-3 según la reivindicación 1 sobre *Tetranychus urticae* y/o su hábitat.

6. Uso de compuestos de fórmula I-3 según la reivindicación 1 para combatir *Tetranychus urticae*.

15

7. Procedimiento para la producción de agentes para combatir plagas contra *Tetranychus urticae*, **caracterizado porque** se mezclan compuestos de la fórmula I-3 según la reivindicación 1 con diluyentes y/o sustancias tensioactivas.