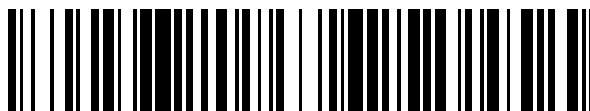


19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 565 684**

51 Int. Cl.:

**A01N 43/90** (2006.01)

**A01P 5/00** (2006.01)

**A01P 7/00** (2006.01)

**C07D 495/04** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **15.05.2007 E 07729165 (6)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **23.12.2015 EP 2026656**

54 Título: **Procedimientos insecticidas que utilizan compuestos de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]-pirimidina**

30 Prioridad:

**22.05.2006 US 802354 P**

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

**06.04.2016**

73 Titular/es:

**MERIAL, INC. (100.0%)  
3239 Satellite Boulevard, Bldg. 500  
Duluth, GA 30096, US**

72 Inventor/es:

**BAUMANN, ERNST;  
BASTIAANS, HENRICUS MARIA MARTINUS;  
VON DEYN, WOLFGANG;  
PUHL, MICHAEL;  
RACK, MICHAEL;  
ANSPAUGH, DOUGLAS D.;  
CULBERTSON, DEBORAH L. y  
OLOUMI-SADEGHI, HASSAN**

74 Agente/Representante:

**PONTI SALES, Adelaida**

ES 2 565 684 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**

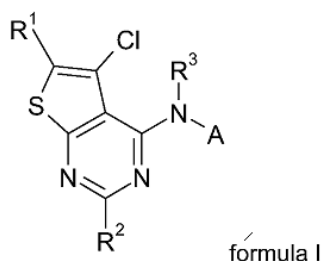
Procedimientos insecticidas que utilizan compuestos de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]-pirimidina

5 **[0001]** La presente invención se refiere a nuevos procedimientos insecticidas que utilizan compuestos de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]-pirimidina y sales de los mismos.

10 **[0002]** Las plagas de animales destruyen cultivos en crecimiento y la cosecha de cultivos y atacan viviendas de madera y estructuras comerciales, causando grandes pérdidas económicas para el suministro de alimentos y la propiedad. Aunque se conocen un gran número de agentes plaguicidas, debido a la capacidad de las plagas diana de desarrollar resistencia a dichos agentes, hay una necesidad continua de nuevos agentes para combatir las plagas de animales. En particular, las plagas de animales, tales como insectos y ácaros, son difíciles de controlar de manera eficaz.

15 **[0003]** Es por tanto un objetivo de la presente invención proporcionar procedimientos no terapéuticos y compuestos que tienen una buena actividad plaguicida, especialmente contra insectos y ácaros difíciles de controlar.

20 **[0004]** Se ha encontrado que estos objetivos se resuelven mediante derivados de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]-pirimidina de la fórmula general I:



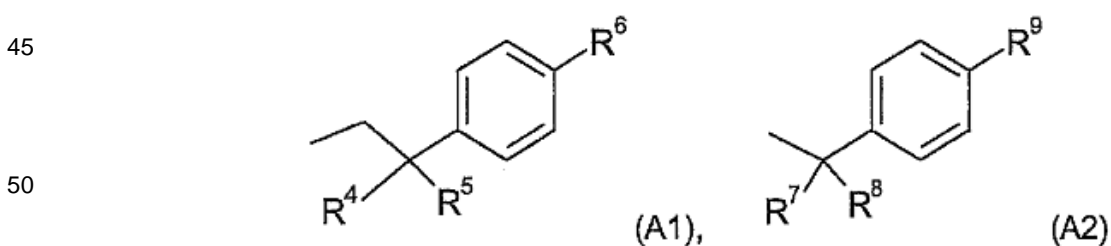
en la que

35  $R^1$  se selecciona entre hidrógeno, halógeno, formilo, alquilo  $C_1-C_{10}$ , alquenilo  $C_1-C_{10}$ , alquinilo  $C_1-C_{10}$ , haloalquilo  $C_1-C_{10}$ , haloalquenilo  $C_1-C_{10}$ , haloalquinilo  $C_1-C_{10}$ , alcoxi  $C_1-C_{10}$ , alcoxi  $C_1-C_6$ -alquilo  $C_1-C_6$ , haloalcoxi  $C_1-C_{10}$ , alquil  $C_1-C_{10}$ -tio, alquil  $C_1-C_{10}$ -sulfinilo, alquil  $C_1-C_{10}$ -sulfonilo, alquil  $C_1-C_{10}$ -amino, di(alquil  $C_1-C_{10}$ )amino, CN, CNOH, CNOCH<sub>3</sub> O CNOC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>;

40  $R^2$  se selecciona entre hidrógeno, halógeno, alquilo  $C_1-C_{10}$ , haloalquilo  $C_1-C_{10}$ , alcoxi  $C_1-C_{10}$ , alcoxi  $C_1-C_6$  alquilo  $C_1-C_6$ , haloalcoxi  $C_1-C_{10}$ , alquil  $C_1-C_{10}$ -tio, alquil  $C_1-C_{10}$ -sulfinilo, alquil  $C_1-C_{10}$ -sulfonilo, alquil  $C_1-C_{10}$ -amino, di(alquil  $C_1-C_{10}$ )amino;

$R^3$  es hidrógeno o alquilo  $C_1-C_{10}$ ;

A es



65

en la que

$R^4, R^5, R^7$  se seleccionan independientemente el uno del otro de hidrógeno o alquilo  $C_1-C_{10}$ ;

$R^8$  alquilo  $C_1-C_{10}$ ;

$R^6, R^9$  se seleccionan de halógeno, alquilo  $C_1-C_{10}$ , haloalquilo  $C_1-C_{10}$ , alcoxi  $C_1-C_{10}$ , haloalcoxi  $C_1-C_{10}$ ;

$R^{10}$  es alquilo  $C_1-C_{10}$  o haloalquilo  $C_1-C_{10}$ ;

y/o al menos una sal agrícola o veterinariamente aceptable del mismo.

[0005] Dependiendo del patrón de sustitución, los compuestos de fórmula I pueden contener uno o más centros quirales, en cuyo caso están presentes como mezclas de enantiómeros o diastereómeros. La materia de esta invención no es sólo las composiciones que contienen estas mezclas, sino también aquellas que contienen los enantiómeros o diastereoisómeros puros.

[0006] La presente invención se refiere por lo tanto a los siguientes procedimientos insecticidas que aplican dichos compuestos de fórmula I.

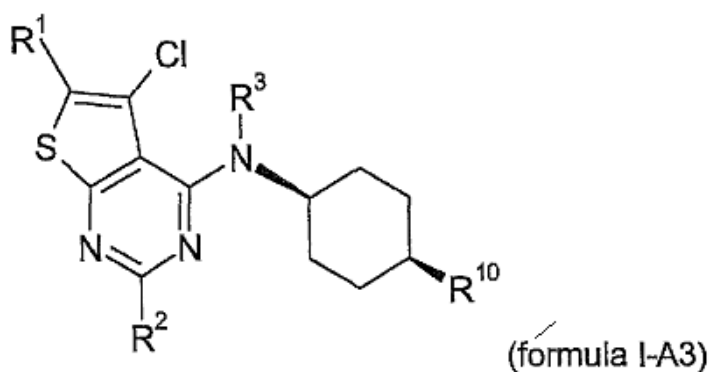
[0007] Era un objetivo de la presente invención proporcionar procedimientos no terapéuticos para combatir y controlar plagas de animales, que comprenden poner en contacto las plagas de animales, su hábitat, sitio de reproducción, suministro de alimentos, planta, semilla, suelo, área, materia o entorno en el que las plagas de animales están creciendo o pueden crecer, o los materiales, plantas, semillas, suelos, superficies o espacios a ser protegidos del ataque de animales o infestación con una cantidad plaguicida eficaz de al menos un compuesto de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]pirimidina de fórmula I y/o al menos una sal agrícolamente aceptable del mismo.

[0008] Era un objetivo adicional de la presente invención proporcionar procedimientos para proteger cultivos del ataque o infestación por plagas de animales, que comprende poner en contacto un cultivo o una planta en crecimiento con una cantidad plaguicidamente eficaz de al menos un compuesto de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]pirimidina de fórmula I y/o al menos una sal agrícolamente aceptable del mismo.

[0009] Otro objetivo de la presente invención era proporcionar procedimientos para proteger a las semillas de insectos del suelo y las raíces y brotes de plántulas de insectos del suelo y foliares que comprenden poner en contacto las semillas antes de la siembra y/o después de la pregerminación con al menos un compuesto de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d] pirimidina de fórmula I y/o al menos una sal agrícolamente aceptable del mismo.

[0010] Y otro objetivo de la presente invención era proporcionar un compuesto de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d] pirimidina y/o al menos una sal veterinariamente aceptable del mismo para usar en el tratamiento, control, prevención o protección de animales frente a la infestación o infección por parásitos. El objetivo de la invención también son un compuesto de la fórmula y/o una sal veterinariamente aceptable del mismo para usar en combatir parásitos en y sobre animales mediante tratamiento de los parásitos con una cantidad antiparasitaria activa de los mismos.

[0011] Además, la presente invención se refiere también a un nuevo compuesto de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d] pirimidina sustituido con ciclohexilo de la fórmula general I-A3, a sus sales agrícolas o veterinarias útiles y a composiciones veterinarias o agrícolas que los comprenden y al menos un portador agrónomicamente aceptable líquido y/o sólido inerte:



$R^1$  se selecciona entre hidrógeno, halógeno, formilo, alquilo  $C_1-C_{10}$ , alqueno  $C_1-C_{10}$ , alquino  $C_1-C_{10}$ , haloalquilo  $C_1-C_{10}$ , haloalqueno  $C_1-C_{10}$ , haloalquino  $C_1-C_{10}$ , alcoxi  $C_1-C_{10}$ , alcoxi  $C_1-C_6$ -alquilo  $C_1-C_6$ , haloalcoxi  $C_1-C_{10}$ , alquil  $C_1-C_{10}$ -tio, alquil  $C_1-C_{10}$ -sulfinilo, alquil  $C_1-C_{10}$ -sulfonilo, alquil  $C_1-C_{10}$ -amino, di(alquil  $C_1-C_{10}$ )amino, CN, CNOH, CNOCH<sub>3</sub> O CNOCH<sub>2</sub>H<sub>5</sub>;

R<sup>2</sup> se selecciona entre hidrógeno, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-tio, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-sulfinilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-sulfonilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-amino, di(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)amino;

R<sup>3</sup> es hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>;

5 R<sup>10</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>.

[0012] Las tienopirimidinas son conocidas y han sido descritas en la técnica anterior. Las 4-amino tienopirimidinas se han mencionado en el documento EP-A 0.370.704 como derivados de aralquilamina que tienen propiedades bactericidas. Las composiciones de derivados de 4-amino tienopirimidinas también se han descrito en el documento DE-A 2.654.090 para el control de enfermedades por hongos, virus y bacterias en plantas y daños por insectos. En el documento EP-A-0452002 se describen tienopirimidin-4-aminas N-sustituidas que tienen utilidad fungicida, insecticida y acaricida. El documento JP-A 2004-238380 describe la preparación de 4-feniletilaminopirimidina y sus usos como plaguicidas. Los compuestos de tieno-pirimidina que tienen actividad fungicida se han descrito en el documento WO 2006/047397. Los compuestos de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d] pirimidina N-sustituidos con actividad herbicida, reguladora del crecimiento e insecticida se han descrito en el documento EP-A 0.447.891.

[0013] En comparación con los compuestos descritos en el documento EP-A 0447891, los compuestos de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]pirimidina de la presente invención muestran sorprendentemente una mejor actividad insecticida. Especialmente dichos compuestos que tienen un anillo cíclico de seis miembros sustituido en para unido al nitrógeno del grupo amino.

[0014] Los compuestos de la fórmula I, y sus sales agrícola o veterinariamente aceptables son muy activos contra plagas de animales, es decir artrópodos y nemátodos perjudiciales, especialmente contra insectos y ácaros difíciles de controlar.

[0015] Además, las sales de los compuestos de la fórmula I son preferiblemente sales agrícola o veterinariamente aceptables. Se pueden formar en un procedimiento habitual, por ejemplo por reacción del compuesto con un ácido del anión en cuestión si el compuesto de fórmula I tiene una funcionalidad básica o haciendo reaccionar un compuesto ácido de fórmula I con una base adecuada.

[0016] Las sales útiles son especialmente las sales de aquellos cationes o las sales de adición de ácido de aquellos ácidos cuyos cationes y aniones, respectivamente, no tienen ningún efecto adverso sobre la acción de los compuestos de acuerdo con la presente invención. Los cationes adecuados son en particular los iones de los metales alcalinos, preferiblemente litio, sodio y potasio, de los metales alcalinotérreos, preferiblemente calcio, magnesio y bario, y de los metales de transición, preferiblemente manganeso, cobre, zinc y hierro, y también amonio (NH<sub>4</sub><sup>+</sup>) y amonio sustituido en el que uno a cuatro de los átomos de hidrógeno están sustituidos por alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, hidroxialquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, hidroxialcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, fenilo o bencilo. Ejemplos de iones amonio sustituidos comprenden metilamonio, isopropilamonio, dimetilamonio, diisopropilamonio, trimetilamonio, tetrametilamonio, tetraetilamonio, tetrabutilamonio, 2-hidroxietilamonio, 2-(2-hidroxietoxi)etil-amonio, bis(2-hidroxietil)amonio, benciltrimetilamonio y benciltrietilamonio, adicionalmente iones fosfonio, iones sulfonio, preferiblemente tri(alquil-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)sulfonio, e iones sulfoxonio, preferiblemente tri(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)sulfoxonio.

[0017] Los aniones de sales de adición de ácido útiles son principalmente cloruro, bromuro, fluoruro, hidrogenosulfato, sulfato, dihidrogenofosfato, hidrogenofosfato, fosfato, nitrato, bicarbonato, carbonato, hexafluorosilicato, hexafluorofosfato, benzoato, y los aniones de ácidos alcanóicos C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, preferiblemente formiato, acetato, propionato y butirato. Se pueden formar por reacción de los compuestos de fórmula I con un ácido del anión correspondiente, preferiblemente de ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico o ácido nítrico.

[0018] Los restos orgánicos mencionados en las definiciones anteriores de las variables son, como el término halógeno, términos colectivos para listados individuales de los miembros individuales del grupo. El prefijo C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub> indica en cada caso el número posible de átomos de carbono en el grupo.

[0019] "Halógeno" se tomará en el sentido de flúor, cloro, bromo y yodo.

[0020] El término "parcialmente o totalmente halogenado" se tomará que significa que 1 o más, por ejemplo 1, 2, 3, 4 o 5 o todos los átomos de hidrógeno de un radical determinado han sido reemplazados por un átomo de halógeno, en particular por flúor o cloro.

[0021] El término "alquilo C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub>", tal como se usa en este documento (y también en alquil C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub>-amino, di-alquil C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub>-amino, alquil C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub>-aminocarbonilo, di-(alquil C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub>-amino)carbonilo, alquil C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub>-tio, alquil C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub>-sulfinilo y alquil C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub>-sulfonilo) se refiere a un grupo hidrocarburo saturado ramificado o no ramificado que tiene de n a m, por ejemplo 1 a 10 átomos de carbono, preferiblemente de 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metilpropilo, 2-metilpropilo, 1,1-dimetiletilo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, hexilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo,

1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo, 1-etil-2-metilpropilo, heptilo, octilo, 2-etilhexilo, nonilo y decilo y sus isómeros. Alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> significa, por ejemplo metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metilpropilo, 2-metilpropilo o 1,1-dimetiletilo.

5 **[0022]** El término "haloalquilo C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub>" tal como se usa en el presente documento (y también en haloalquil C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub>-sulfínico y haloalquil C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub>-sulfónico) se refiere a un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de n a m átomos de carbono, por ejemplo de 1 a 10, en particular de 1 a 6 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente), donde algunos o todos los átomos de hidrógeno en estos grupos pueden estar reemplazados por átomos de halógeno como se mencionó anteriormente, por ejemplo haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, tal como clorometilo, bromometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorodifluorometilo, 1-cloroetilo, 1-bromoetilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-cloro-2-fluoroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, pentafluoroetilo.

15 **[0023]** El término haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, en particular, comprende fluoroalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, que es sinónimo con metilo o etilo, en donde 1, 2, 3, 4 ó 5 átomos de hidrógeno están sustituidos por átomos de flúor, tales como fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo y pentafluorometilo.

20 **[0024]** Del mismo modo, "alcoxi C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub>" y "alquil C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub>-tio" (o alquil C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub>-sulfénico, respectivamente) se refieren a grupos alquilo de cadena lineal o ramificada que tienen de n a m átomos de carbono, por ejemplo 1 a 10, en particular de 1 a 6 o de 1 a 4 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente) enlazados a través de enlaces de oxígeno o azufre, respectivamente, en cualquier enlace en el grupo alquilo. Los ejemplos incluyen alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, tal como metoxi, etoxi, propoxi, isopropoxi, butoxi, sec-butoxi, isobutoxi y terc-butoxi, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio adicionales, tales como metiltio, etiltio, propiltio, isopropiltio, y n-butiltio.

25 **[0025]** Por consiguiente, los términos "haloalcoxi C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub>" y "haloalquil C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub>-tio" (o haloalquil C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub>-sulfénico, respectivamente) se refieren a grupos alquilo de cadena lineal o ramificada que tienen de n a m átomos de carbono, por ejemplo de 1 a 10, en particular de 1 a 6 o de 1 a 4 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente) unidos a través de enlaces de oxígeno o de azufre, respectivamente, en cualquier enlace en el grupo alquilo, donde algunos o todos los átomos de hidrógeno en estos grupos pueden estar reemplazados por átomos de halógeno como se mencionó anteriormente, por ejemplo haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, tal como clorometoxi, bromometoxi, diclorometoxi, triclorometoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, clorofluorometoxi, diclorofluorometoxi, clorodifluorometoxi, 1-cloroetoxi, 1-bromoetoxi, 1-fluoroetoxi, 2-fluoroetoxi, 2,2-difluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2-fluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, 2,2-dicloro-2-fluoroetoxi, 2,2,2-tricloroetoxi y pentafluoroetoxi, haloalquil C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-tio adicionales, tales como clorometiltio, bromometiltio, diclorometiltio, triclorometiltio, fluorometiltio, difluorometiltio, trifluorometiltio, clorofluorometiltio, diclorofluorometiltio, clorodifluorometiltio, 1-cloroetiltio, 1-bromoetiltio, 1-fluoroetiltio, 2-fluoroetiltio, 2,2-difluoroetiltio, 2,2,2-trifluoroetiltio, 2-cloro-2-fluoroetiltio, 2-cloro-2,2-difluoroetiltio, 2,2-dicloro-2-fluoroetiltio, 2,2,2-tricloroetiltio y pentafluoroetiltio.

40 **[0026]** Análogamente, los términos fluoralcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> y fluoroalquil C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-tio se refieren a fluoroalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> que está unido al resto de la molécula mediante un átomo de oxígeno o un átomo de azufre, respectivamente.

45 **[0027]** El término "alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>m</sub>", tal como se usa en el presente documento, pretende indicar un grupo hidrocarburo insaturado ramificado o no ramificado que tiene de 2 a m, por ejemplo de 2 a 10 o de 2 a 6 átomos de carbono y un doble enlace en cualquier posición, tal como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metil-etenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-2-propenilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-metil-1-butenilo, 2-metil-1-butenilo, 3-metil-1-butenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1,2-dimetil-1-propenilo, 1,2-dimetil-2-propenilo, 1-etil-1-propenilo, 1-etil-2-propenilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1-metil-1-pentenilo, 2-metil-1-pentenilo, 3-metil-1-pentenilo, 4-metil-1-pentenilo, 1-metil-2-pentenilo, 2-metil-2-pentenilo, 3-metil-2-pentenilo, 4-metil-2-pentenilo, 1-metil-3-pentenilo, 2-metil-3-pentenilo, 3-metil-3-pentenilo, 4-metil-3-pentenilo, 1-metil-4-pentenilo, 2-metil-4-pentenilo, 3-metil-4-pentenilo, 4-metil-4-pentenilo, 1,1-dimetil-2-butenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, 1,2-dimetil-1-butenilo, 1,2-dimetil-2-butenilo, 1,2-dimetil-3-butenilo, 1,3-dimetil-1-butenilo, 1,3-dimetil-2-butenilo, 1,3-dimetil-3-butenilo, 2,2-dimetil-3-butenilo, 2,3-dimetil-1-butenilo, 2,3-dimetil-2-butenilo, 2,3-dimetil-3-butenilo, 3,3-dimetil-1-butenilo, 3,3-dimetil-2-butenilo, 1-etil-1-butenilo, 1-etil-2-butenilo, 1-etil-3-butenilo, 2-etil-1-butenilo, 2-etil-2-butenilo, 2-etil-3-butenilo, 1,1,2-trimetil-2-propenilo, 1-etil-1-metil-2-propenilo, 1-etil-2-metil-1-propenilo y 1-etil-2-metil-2-propenilo.

60 **[0028]** El término "alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>m</sub>" tal como se utiliza en este documento se refiere a un grupo hidrocarburo insaturado ramificado o no ramificado que tiene de 2 a m, por ejemplo de 2 a 10 o de 2 a 6 átomos de carbono y que contiene al menos un triple enlace, tal como etinilo, propinilo, 1-butinilo, 2-butinilo.

**[0029]** El término alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, tal como se utiliza en este documento, se refiere a un alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, como los ejemplos específicos mencionados anteriormente, en el que uno o más átomos de hidrógeno del radical alquilo están sustituidos por un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>.

65

[0030] Con respecto a los diferentes procedimientos de uso de acuerdo con la invención, se da preferencia particular a los siguientes significados de los sustituyentes y variables de los compuestos de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]pirimidina de fórmula I, en cada caso por sí solo o en combinación:

Se prefieren compuestos de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]pirimidina de fórmula I, en los que A es A1.

Se prefieren compuestos de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]pirimidina de fórmula I, en los que A es A2.

[0031] Especialmente preferidos son compuestos de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]pirimidina de fórmula I, según la reivindicación 1, en los que A es A2 y representa un S-enantiómero. Se prefieren compuestos de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]pirimidina de fórmula I, en los que A es A3.

[0032] Se prefieren compuestos de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]pirimidina de fórmula I, en los que R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> se seleccionan independientemente entre sí entre hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>.

[0033] Se prefieren compuestos de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]pirimidina de fórmula I, en los que R<sup>5</sup> o R<sup>7</sup> es hidrógeno.

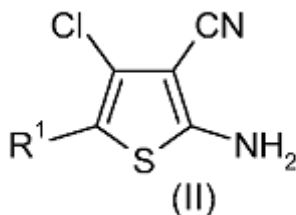
[0034] Se prefieren compuestos de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]pirimidina de fórmula I, en los que R<sup>10</sup> es un alquilo C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> ramificado.

[0035] Especialmente preferidos son los compuestos de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]pirimidina de Fórmula I, en los que R<sup>10</sup> es isopropilo, sec-butilo o terc-butilo.

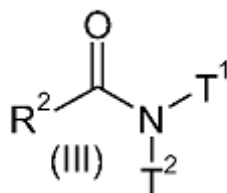
#### Procedimientos de preparación

[0036] Los compuestos de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]pirimidina de fórmula I de acuerdo con la presente invención se pueden preparar a partir de compuestos de tieno (II) tal como se describe en el documento EP 0 447 891 B.

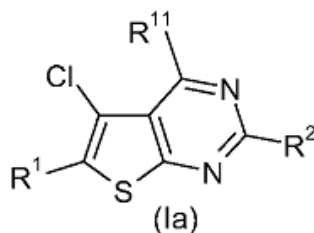
[0037] Un derivado de tieno de fórmula (II)



en la que R<sup>1</sup> se define como anteriormente, se hace reaccionar con una dialquil amida (III)



en la que T<sup>1</sup> y T<sup>2</sup> son independientemente entre sí otro alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o forman junto con el nitrógeno un heterociclo saturado de 5 a 7 miembros y R<sup>2</sup> se define como anteriormente, en presencia de un exceso de un halogenuro de fosforilo como, por ejemplo, de 2 a 20 moles de cloruro de fosforilo o bromuro de fosforilo en comparación con 1 mol de (II) con el fin de proporcionar un derivado de tieno-(2,3-d)pirimidina de fórmula (Ia)



en el que R<sup>11</sup> es cloro o bromo.

[0038] Los compuestos de fórmula (Ia) obtenidos como se describió anteriormente se pueden convertir por sustitución del átomo de halógeno en la posición 4 por otro resto nucleófilo de acuerdo con procedimientos conocidos tal como se describe en "The Chemistry of Heterocyclic compounds", "The pyrimidines", ed. D.J. Brown, J. Wiley & Sony, Nueva York, Londres, Vol. 16, (1962); Vol. 16, Suppl. 1, Vol. 16, Suppl. 2 (1985).

[0039] Se convierten en los correspondientes compuestos de fórmula I mediante la sustitución de R<sup>11</sup> por NR<sup>3</sup>A como se describe en el documento EP-A 447891.

[0040] Los ejemplos de dialquil amidas (III) adecuadas son N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N,N-dietilformamida, N,N-dietilacetamida, N,N-dimetilpropionamida y N,N-dimetilamida del ácido benzoico.

[0041] Como se ha mencionado anteriormente, la reacción tiene que ser llevada a cabo en presencia de un exceso de cloruro de fosforilo o bromuro de fosforilo en comparación con el derivado de tiofeno (II). Ventajosamente, la reacción puede tener lugar con el halogenuro de fosforilo como disolvente. Preferiblemente, se utilizan de 2 a 6 moles de halogenuro de fosforilo por mol del derivado de tiofeno (II).

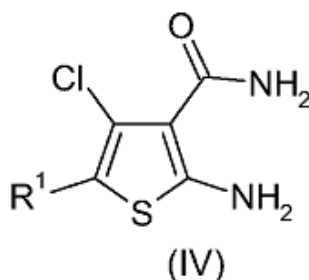
[0042] En general, la relación molar del derivado de tiofeno (II) con respecto a la N, N-dialquilamida (III) es de 1:1 a 1:5.

[0043] La reacción se lleva a cabo normalmente en un disolvente inerte, tal como clorobenzol, nitrobenzol, éster metílico del ácido benzoico, cloruro de metileno, diclorobenzol, triclorobenzol, éster etílico del ácido benzoico, cloroformo, tetraclorocarbono, una de las N,N-dialquilamidas indicadas anteriormente, tricloroetano, triamida hexametilfosfórica (HMPT) o tetracloroetileno. El disolvente preferido son cloruro de fosforilo y bromuro de fosforilo o una de las N,N-dialquilamidas mencionadas anteriormente.

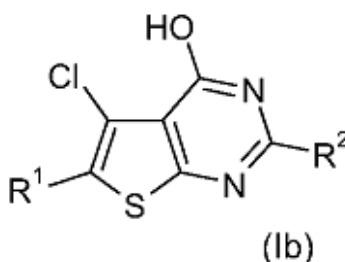
[0044] La reacción tiene una velocidad de reacción suficiente por encima de 20°C. A temperaturas superiores a 150°C la especificidad de la reacción disminuye. Preferiblemente la reacción se lleva a cabo en un intervalo de temperaturas de 50 a 110°C.

[0045] Mediante el uso de cantidades catalíticas de un ácido de Lewis como el cloruro de potasio, cloruro de sodio, cloruro de hierro (III), cloruro de aluminio, cloruro de zinc, cloruro de estaño, pentafluoruro de antimonio, trifluoruro de boro o tetracloruro de titanio o de un catalizador básico, tal como N,N-dimetil anilina o N,N-dietil-anilina, se puede lograr un aumento del rendimiento y una mejora de la velocidad de reacción.

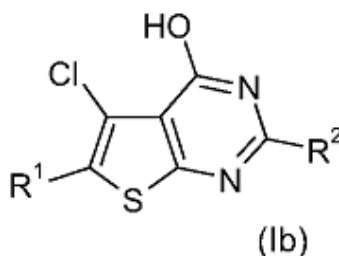
[0046] Otro proceso de preparación de compuestos de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]pirimidina de fórmula I se proporciona mediante la reacción de compuestos de práctica común de fórmula (IV)



en la que R<sup>1</sup> se define como anteriormente, con un anhídrido de ácido, que contiene al menos un resto R<sup>2</sup>-CO-, o un ácido carbónico R<sup>2</sup>-COOH, o un aducto de un ácido carbónico y un ácido de Lewis, en el que R<sup>2</sup> tiene el significado correspondiente descrito anteriormente, a los compuestos de fórmula (Ib):



[0047] Los compuestos de fórmula (Ib) se convierten con un halogenuro de fosforilo en compuestos de fórmula (Ia) como se define anteriormente. Es adecuado, en ciertos casos, llevar a cabo esta conversión en dos etapas, aislando así los compuestos intermedios de fórmula (VI):



15 [0048] En general, el anhídrido de ácido o el aducto se utiliza en cantidades de 100 a 500% molar, preferiblemente de 100 a 300% molar, con respecto a los compuestos (VI).

20 [0049] Los anhídridos de ácido carbónico que contienen al menos un resto R<sup>2</sup>-CO- se pueden proporcionar a partir de dos ácidos carbónicos R<sup>2</sup>-COOH, como ácido píválico, ácido propiónico o ácido acético; o a partir de un ácido carbónico R<sup>2</sup>-COOH y un oxoácido, como ácido fosfórico o ácido sulfúrico.

25 [0050] Los ácidos carbónicos preferidos R<sup>2</sup>-COOH son aquellos con 1 a 4 átomos de carbono, especialmente ácido fórmico y ácido acético.

30 [0051] Además, los aductos de un ácido carbónico R<sup>2</sup>-COOH y un ácido de Lewis, como cloruro de zinc, trifluoruro de boro y tetracloruro de titanio son también adecuados.

35 [0052] La conversión de (IV) a (Ib) se lleva a cabo ventajosamente en un disolvente inerte, tal como N,N-dialquilamidas, preferiblemente N,N-dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida, N-metil-pirrolidona, N,N-dimetilpropilenurea o triamida hexametilfosfórica, a temperaturas de (-10) a 150°C, preferiblemente de 20 a 120°C, más preferiblemente de 80 a 120°C.

40 [0053] Con el fin de aislar los compuestos intermedios (VI), la temperatura de reacción debe elegirse de (-10) a 80°C.

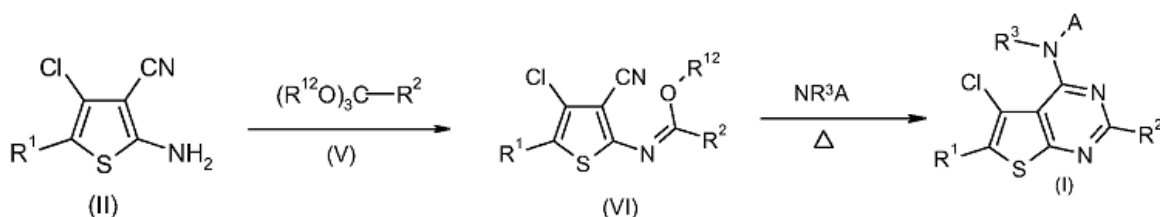
45 [0054] En general, debe añadirse una base como trietilamina, N-metil-pirrolidona o N,N-dimetilanilina en un exceso de 1 a 10 veces, preferiblemente en un exceso de 1 a 5 veces, en comparación con el anhídrido de ácido carbónico, el ácido carbónico o el aducto de ácido carbónico-ácido de Lewis.

50 [0055] La adición de un agente de eliminación de agua como dicitohexil carboimida o un reactivo de Vilsmeier puede acelerar la reacción y aumentar el rendimiento de compuestos de fórmula (Ib).

55 [0056] El grupo hidroxilo en la posición 4 del compuesto de fórmula (Ib) puede ser sustituido por cloro o bromo de acuerdo con la práctica común, por ejemplo, con cloruro de fosforilo o bromuro de fosforilo.

60 [0057] Finalmente, cloro y bromo en la posición 4 se sustituye por NR<sup>3</sup>A tal como se describe, por ejemplo, en el documento EP-A 447 891.

65 [0058] Además, mediante la conversión de compuestos de tiofeno de fórmula (II) con ortoésteres (V), en los que R<sup>12</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, en los derivados de fórmula (VI), y la posterior ciclación en presencia de una amina NR<sup>3</sup>A, se pueden obtener los compuestos de tieno[2, 3-d] pirimidina de fórmula (I) de acuerdo con la presente invención.



65 [0059] El esquema de reacción descrito anteriormente se conoce por el documento DE-A 26 54 090. El derivado de tiofeno (II) y (IV) puede obtenerse de acuerdo con las instrucciones indicadas en el documento EP-A1 0 193 885.



**[0060]** A fin de obtener las sales, que son adecuadas para su uso agrícola o veterinario, los compuestos de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]pirimidina de fórmula I se pueden hacer reaccionar con los constructores de sales convencionales como ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido yodhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico, ácido fórmico, ácido acético, ácido oxálico, ácido bencenosulfónico, ácido p-tolueno-sulfónico, ácido dodecilbencenosulfónico, bromuro de metilo, sulfato de dimetilo o sulfato de dietilo en el intervalo de temperaturas de 0 a 150°C, preferiblemente de 20 a 120°C.

**[0061]** La formación de la sal se lleva a cabo normalmente en un agente disolvente o de dilución. Son adecuados, por ejemplo, los hidrocarburos alifáticos como n-pentano, n-hexano o éter de petróleo, hidrocarburos aromáticos, como benzol, toluole o xilol, bencina o éteres como dietil éter, terc-butil metil éter, tetrahidrofurano o dioxano, cetonas adicionales, tal como acetona, metil etil cetona o metil isopropil cetona, así como hidrocarburos halogenados como clorobenzol, cloruro de metileno, cloruro de etileno, cloroformo o tetracloroetileno. Se pueden usar también mezclas de estos disolventes.

**[0062]** Para la preparación de sales de compuestos de fórmula I los eductos se emplean generalmente en una relación estequiométrica. El exceso de uno u otro componente puede ser útil.

**[0063]** En los procedimientos de preparación descritos, las variables R1, R2, y R3 tienen los significados definidos anteriormente, en particular los significados mencionados como preferidos.

**[0064]** Si los compuestos individuales no se pueden preparar a través de las rutas anteriormente descritas, se pueden preparar por derivatización de otros compuestos I o por modificaciones habituales de las rutas de síntesis descritas.

**[0065]** Las mezclas de reacción se tratan de la manera habitual, por ejemplo, mediante mezcla con agua, separación de las fases, y, si es apropiado, purificación de los productos impuros mediante cromatografía, por ejemplo sobre alúmina o gel de sílice. Algunos de los intermedios y productos finales se pueden obtener en la forma de aceites viscosos incoloros o de color marrón pálido, que se liberan o purifican de componentes volátiles a presión reducida y temperatura moderadamente elevada. Si los intermedios y productos finales se obtienen como sólidos, pueden ser purificados por recristalización o digestión.

#### Aplicaciones

**[0066]** Los compuestos de la fórmula I, y sus sales son en particular adecuados para controlar eficientemente plagas de artrópodos, tales como arácnidos, miriápodos e insectos, así como nemátodos.

**[0067]** En particular, son adecuados para el control de plagas de insectos, tales como los insectos de la orden de lepidópteros: por ejemplo *Agrotis ypsilon*, *Agrotis segetum*, *Alabama argillacea*, *Anticarsia gemmatalis*, *Argyresthia conjugella*, *Autographa gamma*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia murinana*, *Capua reticulana*, *Cheimatobia brumata*, *Choristoneura fumiferana*, *Choristoneura occidentalis*, *Cirphis unipuncta*, *Cydia pomonella*, *Dendrolimus pini*, *Diaphania nitidalis*, *Diatraea grandiosella*, *Earias insulana*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Eupoecilia ambiguella*, *Evetria bouliana*, *Feltia subterranea*, *Galleria mellonella*, *Grapholitha funebrana*, *Grapholitha molesta*, *Heliothis armigera*, *Heliothis virescens*, *Heliothis zea*, *Hellula undalis*, *Hibernia defoliaria*, *Hyphantria cunea*, *Hyponomeuta malinellus*, *Keiferia lycopersicella*, *Lambdina fiscellaria*, *Laphygma exigua*, *Leucoptera coffeella*, *Leucoptera scitella*, *Lithocolletis blancardella*, *Lobesia botrana*, *Loxostege sticticalis*, *Lymantria dispar*, *Lymantria monacha*, *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*, *Mamestra brassicae*, *Orgyia pseudotsugata*, *Ostrinia nubilalis*, *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Peridroma saucia*, *Phalera bucephala*, *Phthorimaea operculella*, *Phyllocnistis citrella*, *Pieris brassicae*, *Plathypena scabra*, *Plutella xylostella*, *Pseudoplusia includens*, *Rhyacionia frustrana*, *Scrobipalpula absoluta*, *Sitotroga cerealella*, *Sparganothis pilleriana*, *Spodoptera eridania*, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera littoralis*, *Spodoptera litura*, *Thaumatopeoa pityocampa*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia ni* y *Zeiraphera canadensis*, coleópteros (escarabajos), por ejemplo, *Agrilus sinuatus*, *Agriotes lineatus*, *Agriotes obscurus*, *Amphimallus solstitialis*, *Anisandrus dispar*, *Anthonomus grandis*, *Anthonomus pomorum*, *Atomaria linearis*, *Blastophagus piniperda*, *Blitophaga undata*, *Bruchus rufimanus*, *Bruchus pisorum*, *Bruchus lentis*, *Byctiscus betulae*, *Cassida nebulosa*, *Ceratomya trifurcata*, *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Ceuthorrhynchus napi*, *Chaetocnema tibialis*, *Conoderus vespertinus*, *Crioceris asparagi*, *Diabrotica longicornis*, *Diabrotica 12-punctata*, *Diabrotica virgifera*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix hirtipennis*, *Eutinobothrus brasiliensis*, *Hyllobius abietis*, *Hypera brunneipennis*, *Hypera postica*, *Ips typographus*, *Lema bilineata*, *Lema melanopus*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Limonius californicus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Melanotus communis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha hippocastani*, *Melolontha melolontha*, *Oulema oryzae*, *Ortiorrhynchus sulcatus*, *Otiorrhynchus ovatus*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllotreta chrysocephala*, *Phyllophaga sp.*, *Phyllopertha horticola*, *Phyllotreta nemorum*, *Phyllotreta striolata*, *Popillia japonica*, *Sitona lineatus* y *Sitophilus granaria*, dípteros, por ejemplo, *Aedes aegypti*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Contarinia sorghicola*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culex pipiens*, *Dacus curcurbitae*, *Dacus oleae*, *Dasineura brassicae*, *Fannia canicularis*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hylemyia platyura*, *Hypoderma lineata*, *Liriomyza sativae*, *Liriomyza trifolii*, *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Lycoria*

pectoralis, Mayetiola destructor, Musca autumnalis, Musca domestica, Muscina stabulans, Oestrus ovis, Oscinella frit, Pegomya hysocyami, Phorbia antiqua, Phorbia brassicae, Phorbia coarctata, Rhagoletis cerasi, Rhagoletis pomonella, Tabanus bovinus, Tipula oleracea y Tipula paludosa, tisanópteros (trips), por ejemplo, Dichromothrips spp., Frankliniella fusca, Frankliniella occidentalis, Frankliniella tritici, Scirtothrips citri, Thrips oryzae, Thrips palmi y Thrips tabaci, himenópteros, por ejemplo, Athalia rosae, Atta cephalotes, Atta sexdens, Atta texana, Hoplocampa minuta, Hoplocampa testudinea, Lasius niger, Monomorium pharaonis, Solenopsis geminata y Solenopsis invicta, Heterópteros, por ejemplo, Acrosternum hilare, Blissus leucopterus, Cyrtopeltis notatus, Dysdercus cingulatus, Dysdercus intermedius, Eurygaster integriceps, Euschistus impictiventris, Leptoglossus phyllopus, Lygus lineolaris, Lygus pratensis, Nezara viridula, Piesma quadrata, Solubea insularis y Thyanta perditor, homópteros (en particular, áfidos), por ejemplo, Acyrthosiphon onobrychis, Adelges laricis, Aphidula nasturtii, Aphis craccivora, Aphis fabae, Aphis forbesi, Aphis pomi, Aphis gossypii, Aphis grossulariae, Aphis schneideri, Aphis spiraeicola, Aphis sambuci, Acyrthosiphon pisum, Aulacorthum solani, Bemisa tabaci, Bemisa argentifolii, Brachycaudus cardui, Brachycaudus helichrysi, Brachycaudus persicae, Brachycaudus prunicola, Brevicoryne brassicae, Capitophorus horni, Cerosiphia gossypii, Chaetosiphon fragaefolii, Cryptomyzus ribis, Dreyfusia nordmanniana, Dreyfusia piceae, Dysaphis radicola, Dysaulacorthum pseudosolani, Dysaphis plantaginea, Dysaphis pyri, Empoasca fabae, Hyalopterus pruni, Hyperomyzus lactucae, Macrosiphum avenae, Macrosiphum euphorbiae, Macrosiphum rosae, Megoura viciae, Melanaphis pyraeius, Metopolophium dirhodum, Myzodes persicae, Myzus ascalonicus, Myzus cerasi, Myzus varians, Nasonovia ribis-nigri, Nilaparvata lugens, Pemphigus bursarius, Perkinsiella saccharicida, Phorodon humuli, Psylla mali, Psylla piri, Rhopalomyzus ascalonicus, Rhopalosiphum maidis, Rhopalosiphum padi, Rhopalosiphum insertum, Sappaphis mala, Sappaphis mali, Schizaphis graminum, Schizoneura lanuginosa, Sitobion avenae, Trialeurodes vaporariorum, Toxoptera aurantiand, y Viteus vitifolii, isópteros (termitas), por ejemplo, Calotermes flavicollis, Leucotermes flavipes, Reticulitermes grassei, Reticulitermes lucifugus, Reticulitermes santonensis y Termes natalensis, ortópteros, por ejemplo, Acheta domestica, Blatta orientalis, Blattella germanica, Forficula auricularia, Gryllotalpa gryllotalpa, Locusta migratoria, Melanoplus bivittatus, Melanoplus femur-rubrum, Melanoplus mexicanus, Melanoplus sanguinipes, Melanoplus spretus, Nomadacris septemfasciata, Periplaneta americana, Schistocerca americana, Schistocerca peregrina, Stauronotus maroccanus y Tachycines asynamorius, y colémbolos ("springtails"), por ejemplo, Onychiurus spp.

**[0068]** También son adecuados para controla nematodos: nematodos parasitarios de plantales, tales como los nematodos del nudo de la raíz, Meloidogyne hapla, Meloidogyne incognita, Meloidogyne javanica, y otras especies de Meloidogyne; nematodos formadores de quistes, Globodera rostochiensis y otras especies de Globodera; Heterodera avenae, Heterodera glycines, Heterodera schachtii, Heterodera trifolii, y otras especies de Heterodera; nematodos de la agalla de la seminall, especies de Anguina; nematodos de tallo y hojas, especies de Aphelenchoides; nematodo de agujóns, Belonolaimus longicaudatus y otras especies de Belonolaimus; Pine Belonolaimus longicaudatus y otras especies de Belonolaimus; nematodos de pino, Bursaphelenchus xylophilus y otras especies de Bursaphelenchus; nematodos de anillo, especies de Criconema, especies de Criconemella, especies de Criconemoides, especies de Mesocriconema; nematodos de tallos y bulbos, Ditylenchus destructor, Ditylenchus dipsaci y otras especies de Ditylenchus; nematodos de punzón, especies de Dolichodorus; nematodos espirales, Helicotylenchus multicinctus y otras especies de Helicotylenchus; nematodos envainados y "vainoides", especies de Hemicycliophora y especies de Hemicriconemoides; especies de Hirshmanniella; nematodos lanceolados, especies de Hoploaimus; falsos nematodos de los nudos de las raíces, especies de Nacobbus; nematodos aciculares, Longidorus elongatus y otras especies de Longidorus; nematodos lesivos, Pratylenchus neglectus, Pratylenchus penetrans, Pratylenchus curvatus, Pratylenchus goodeyi y otras especies de Pratylenchus; nematodos perforadores, Radopholus similis y otras especies de Radopholus; nematodos reniformes, Rotylenchus robustus y otras especies de Rotylenchus; especies de Scutellonema; nematodos de las raíces cortas, Trichodorus primitivus y otras especies de Trichodorus, especies de Paratrichodorus; nematodos del raquitismo, Tylenchorhynchus claytoni, Tylenchorhynchus dubius y otras especies de Tylenchorhynchus; nematodos de los cítricos, especies de Tylenchulus; nematodos daga, especies de Xiphinema; y otras especies de nematodos parásitos de plantas.

**[0069]** Los compuestos de la formula I y sus sales también son útiles para el control de arácnidos (Arachnoidea), tales como arácnidos (Acarina), por ejemplo de las familias Argasidae, Ixodidae y Sarcoptidae, tales como Amblyomma americanum, Amblyomma variegatum, Argas persicus, Boophilus annulatus, Boophilus decoloratus, Boophilus microplus, Dermacentor silvarum, Hyalomma truncatum, Ixodes ricinus, Ixodes rubicundus, Omithodorus moubata, Otobius megnini, Dermanyssus gallinae, Psoroptes ovis, Rhipicephalus appendiculatus, Rhipicephalus evertsi, Sarcoptes scabiei, y especies de Eriophyidae, tales como Aculus schlechtendali, Phyllocoptata oleivora y Eriophyes sheldoni; especies de Tarsonemidae, tales como Phytonemus pallidus y Polyphagotarsonemus latus; especies de Tenuipalpidae, tales como Brevipalpus phoenicis; especies de Tetranychidae, tales como Tetranychus cinnabarinus, Tetranychus kanzawai, Tetranychus pacificus, Tetranychus telarius y Tetranychus urticae, Panonychus ulmi, Panonychus citri y Oligonychus pratensis;

Los compuestos de la formula I son particularmente útiles para el control de insectos, preferiblemente insectos chupadores o penetradores, tales como insectos del género tisanópteros, himenópteros, ortópteros y homópteros, en particular las siguientes especies:

Tisanópteros (trips): *Frankliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella tritici*, *Scirtothrips citri*, *Thrips oryzae*, *Thrips palmi* y *Thrips tabaci*,

Himenópteros: *Athalia rosae*, *Atta cephalotes*, *Atta sexdens*, *Atta texana*, *Hoplocampa minuta*, *Hoplocampa testudinea*, *Monomorium pharaonis*, *Solenopsis geminata* y *Solenopsis invicta*,

5 Ortópteros: *Acheta domestica*, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Forficula auricularia*, *Grylotalpa grylotalpa*, *Locusta migratoria*, *Melanoplus bivittatus*, *Melanoplus femur-rubrum*, *Melanoplus mexicanus*, *Melanoplus sanguinipes*, *Melanoplus spretus*, *Nomadacris septemfasciata*, *Periplaneta americana*, *Schistocerca americana*, *Schistocerca peregrina*, *Stauronotus maroccanus* y *Tachycines asynamorus*;

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

20 En los procedimientos de acuerdo con la invención las plagas se controlan poniendo en contacto el parásito/plaga diana, su suministro de alimento, hábitat, sitio de reproducción o su locus con una cantidad plaguicida eficaz de los compuestos de fórmula I o con una sal de los mismos o con una composición, que contiene una cantidad plaguicida eficaz de un compuesto de fórmula I o una sal del mismo.

25 "Locus" significa un hábitat, sitio de reproducción, planta, semilla, suelo, área, materia o el entorno en el que una plaga o parásito está creciendo o pueden crecer.

30 **[0070]** En general, "cantidad pesticid eficaz" significa la cantidad de principio activo necesaria para lograr un efecto observable sobre el crecimiento, incluyendo los efectos de necrosis, muerte, retardo, prevención, y eliminación, destrucción, o en cualquier caso, la disminución de la aparición y actividad del organismo diana. La cantidad plaguicida eficaz puede variar para los diversos compuestos/composiciones utilizados en la invención. Una cantidad plaguicida eficaz de las composiciones variará también de acuerdo con las condiciones dominantes, tales como el efecto y la duración deseadas del plaguicida, el clima, la especie diana, el locus, y el modo de aplicación.

35 **[0071]** Los compuestos de la invención también pueden aplicarse preventivamente a sitios en los que se espera la aparición de las plagas.

40 **[0072]** Los compuestos de fórmula I también pueden utilizarse para proteger plantas en crecimiento del ataque o infestación por plagas por contacto de la planta con una cantidad plaguicida eficaz de compuestos de fórmula I. Por tanto, "contacto" incluye tanto el contacto directo (aplicar los compuestos/composiciones directamente sobre la plaga y/o planta, habitualmente al follaje, tallo o raíces de la planta) y contacto indirecto (aplicación de los compuestos/composiciones al locus de la plaga y/o planta).

45 **[0073]** Las composiciones mencionadas anteriormente son particularmente útiles para proteger plantas de cultivo contra la infestación de dichas plagas o para combatir estas plagas en plantas infestadas.

**[0074]** Para el uso en el tratamiento de plantas de cultivo, la tasa de aplicación de los principios activos de esta invención puede estar en el intervalo de 0,1 g a 4000 g por hectárea, deseablemente de 25 g a 600 g por hectárea, más deseablemente de 50 g a 500 g por hectárea.

50 **[0075]** De acuerdo con una variante de la presente invención, una materia adicional de la invención es un procedimiento de tratamiento del suelo mediante la aplicación, en particular en la sembradora, por ejemplo en forma de una formulación granular que contiene compuestos de fórmula I solos o en mezcla con otros principios activos. Este procedimiento se emplea de manera ventajosa en semilleros de cereal, maíz, algodón y girasol. Para los cereales y el maíz, las tasas de aplicación pueden depender de los principios activos utilizados, y pueden oscilar entre 50 y 500 por hectárea para un principio activo y entre 50 y 200 g por hectárea para el otro principio activo.

55 **[0076]** En el caso de tratamiento del suelo o de aplicación al lugar o nido donde se encuentran las plagas, la cantidad de principio activo varía de 0.0001 a 500 g por 100 m<sup>2</sup>, preferiblemente de 0,001 a 20 g por 100 m<sup>2</sup>.

60 **[0077]** Los compuestos de la invención también se pueden aplicar contra plagas de insectos no agrícolas, tales como hormigas, termitas, avispas, moscas, mosquitos, grillos, o cucarachas. Para el uso contra dicho plagas no agrícolas, los compuestos de fórmula I se usan preferiblemente en una composición de cebo.

65 **[0078]** El cebo puede ser una preparación líquida, sólida o semisólida (por ejemplo un gel). Los cebos sólidos se pueden formar en varias formas adecuadas para las respectivas aplicaciones, por ejemplo gránulos, bloques, barras,

discos. Los cebos líquidos se pueden llenar en diversos dispositivos para asegurar la aplicación apropiada, por ejemplo recipientes abiertos, dispositivos de pulverización, fuentes de gotas, o fuentes de evaporación. Los geles pueden basarse en matrices acuosas u oleosas y pueden formularse para necesidades particulares en términos de pegajosidad, retención de humedad o características de envejecimiento.

**[0079]** El cebo empleado en la composición es un producto, que es lo suficientemente atractiva para incitar a los insectos, tales como las hormigas, termitas, avispas, moscas, mosquitos, grillos etc. o cucarachas a comerlo. El atractivo se puede manipular mediante el uso de estimulantes de la alimentación o feromonas sexuales. Los estimulantes de alimentos se eligen, por ejemplo, pero no exclusivamente, de proteínas de animales y/o plantas (carne, pescado o sangre, partes de insectos, yema de huevo), de grasas y aceites de origen animal y/o vegetal, o mono-, oligo- o poliorganosacáridos, especialmente de sacarosa, lactosa, fructosa, dextrosa, glucosa, almidón, pectina o incluso melaza o miel. Las partes frescas o en descomposición de frutas, cultivos, plantas, animales, insectos o partes específicas de los mismos también pueden servir como un estimulante de la alimentación. Las feromonas sexuales son conocidas por ser más específicas para insectos. Las feromonas específicas se describen en la literatura y son conocidas por los expertos en la materia.

**[0080]** Para el uso en composiciones de cebo, el contenido habitual de principio activo es del 0,001% en peso al 15% en peso, deseablemente del 0,001% en peso al 5%% en peso de compuesto activo.

**[0081]** En el procedimiento de esta invención, los compuestos I se pueden aplicar con otros principios activos, por ejemplo, con otros plaguicidas, insecticidas, herbicidas, fertilizantes, tales como nitrato de amonio, urea, potasa, y superfosfato, fitotóxicos y reguladores del crecimiento de plantas, protectores y nematocidas. Estos ingredientes adicionales se pueden utilizar secuencialmente o en combinación con las composiciones anteriormente descritas, si es apropiado también pueden añadirse solo inmediatamente antes de su uso (mezcla en tanque). Por ejemplo, la planta o plantas se pueden pulverizar con una composición de esta invención ya sea antes o después de ser tratadas con otros principios activos.

**[0082]** La siguiente lista M de plaguicidas junto con los compuestos de acuerdo con la invención que se pueden utilizar y con los que pueden producirse potenciales efectos sinérgicos, pretende ilustrar las posibles combinaciones:

M.1. Organo(tio)fosfatos: acefato, azametifos, azinfos-etilo, azinfosmetilo, cloretoxifos, clorfenvinfos, clormefos, clorpirifos, clorpirifos-metilo, cumafos, cianofos, demeton-S-metilo, diazinon, diclorvos/DDVP, dicrotofos, dimetoato, dimetilvinfos, disulfoton, EPN, etion, etoprofos, famfur, fenamifos, fenitrotrion, fention, flupirazofos, fostiazato, heptenofos, isoxation, malation, mecarbam, metamidofos, metidation, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemetón-metilo, paration, paration metilo, fentoato, forato, fosalona, fosmet, fosfamidón, foxim, pirimifos-metilo, profenofos, propetamfos, protiofos, piraclofos, piridafentión, quinalfos, sulfotep, tebupirimfos, temefos, terbufos, tetraclorvinfos, tiometón, triazofos, triclofón, vamidotion;

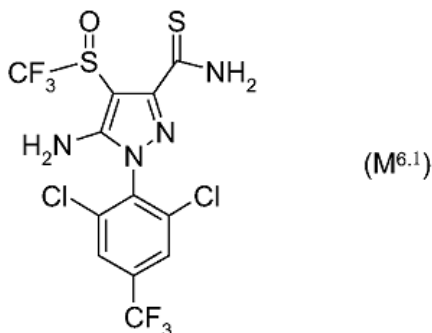
M.2. Carbamatos: aldicarb, alanicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbarilo, carbofuran, carbosulfan, etiofencarb, fenobucarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, trimetacarb, XMC, xililcarb, triazamato;

M.3. Piretroides: acrinatrina, aletrina, d-cis-trans aletrina, d-trans aletrina, bifentrina, bioaletrina, bioaletrina S-cilclopentenilo, bioesmetrina, cicloprotrina, ciflutrina, betaciflutrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, gamma-cihalotrina, cipermetrina, alfacipermetrina, beta-cipermetrina, theta-cipermetrina, zeta-cipermetrina, cifenotrina, deltametrina, empentrina, esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flumetrina, tau-fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, permetrina, fenotrina, pralettrina, resmetrina, RU15525, silafluofeno, teflutrina, tetrametrina, tralometrina, transflutrina, ZXI 8901;

M.4. Miméticos de la hormona juvenil: hidropreno, kinopreno, metopreno, fenoxicarb, piriproxifeno;

M.5. Compuestos agonistas/antagonistas de receptores nicotínicos: acetamiprid, bensultap, clorhidrato de cartap, clotianidina, dinotefurano, imidacloprid, tiametoxam, nitenpiram, nicotina, spinosad (agonista alostérico), tiacloprid, tiociclam, tiosultap de sodio y AKD1022.

M.6. Compuestos antagonistas de los canales de cloruro regulados por GABA: clordano, endosulfán, gamma-HCH (lindano); acetoprol, etiprol, fipronilo, pirafuprol, piriprol, vaniliprol, el compuesto de fenilpirazol de fórmula M<sup>6.1</sup>



M.7. Activadores de los canales de cloruro: abamectina, benzoato de emamectina, milbemectina, lepimectina;

M.8. Compuestos METI I: fenazaquina, fenpiroximato, pirimidifen, piridaben, tebufenpirad, tolfenpirad, flufenerim, rotenona;

M.9. Compuestos METI II y III: acequinocilo, fluaciprim, hidrametilnon;

M.10. Desacopladores de la fosforilación oxidativa: clorfenapir, DNOC;

5 M.11. Inhibidores de la fosforilación oxidativa: azociclotina, cihexatina, diafentiurón, óxido de fenbutatin, propargita, tetradifón;

M.12. Agentes alteradores de muda: ciromazina, cromafenozida, halofenozida, metoxifenoza, tebufenozida;

M.13. Sinérgicos: butóxido de piperonilo, tribufos;

M.14. Compuestos bloqueadores de canales de sodio: indoxacarb, metaflumizona;

10 M.15. Fumigantes: bromuro de metilo, fluoruro de cloropicrin sulfurilo;

M.16. Bloqueadores de alimentación selectiva: crilotie, pimetrozina, flonicamid;

M.17. Inhibidores del crecimiento de ácaros: clofentezina, hexitiazox, etoxazol;

M.18. Inhibidores de la síntesis de quitina: buprofezin, bistrifluron, clorfluaazuron, diflubenzuron, flucicloxuron,

flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron, triflumuron;

15 M.19. Inhibidores de la biosíntesis de lípidos: espirodiclofeno, espiromesifeno, espirotetramat;

M.20. Agonistas octapaminérgicos: amitraz;

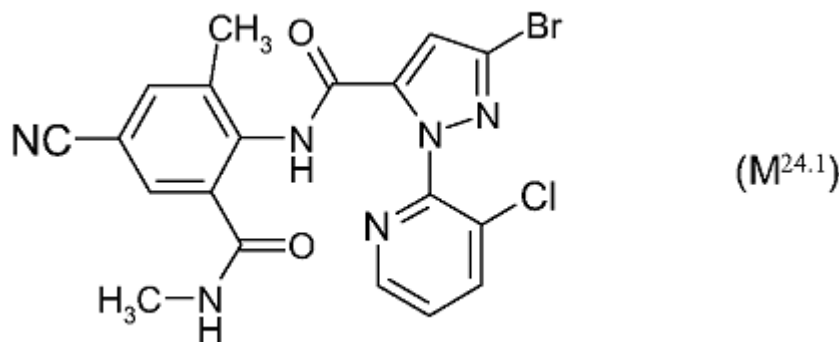
M.21. Moduladores del receptor de rianodina: flubendiamida;

M.22. Varios: fosfuro de aluminio, amidoflumet, benclotiaz, benzoximato, bifenazato, bórax, bromopropilato, cianuro, cienopirafen, ciflumetofeno, quinometionato, dicofol, fluoroacetato, fosfina, piridail, pirifluquinazon, azufre, tártaro emético;

20 M.23. N-R'-2,2-dihalo-1-R"ciclo-propancarboxamida-2-(2,6-dicloro- $\alpha,\alpha,\alpha$ -tri-fluoro-p-tolil)hidrazona o N-R'-2,2-di(R''')propionamida-2-(2,6-dicloro- $\alpha,\alpha,\alpha$ -trifluoro-p-tolil)hidrazona, donde R' es metilo o etilo, halo es cloro o bromo, R'' es hidrógeno o metilo y R''' es metilo o etilo;

M.24. Antranilamidas: clorantraniliprol, el compuesto de fórmula M<sup>24.1</sup>

25



40

A.25. Compuestos de malononitrilo: CF<sub>3</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>C(CN)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(CF<sub>2</sub>)<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>H, CF<sub>3</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>C(CN)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(CF<sub>2</sub>)<sub>5</sub>CF<sub>2</sub>H, CF<sub>3</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>C(CN)<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>C(CF<sub>3</sub>)<sub>2</sub>F, CF<sub>3</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>C(CN)<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>(CF<sub>2</sub>)<sub>3</sub>CF<sub>3</sub>, CF<sub>2</sub>H(CF<sub>2</sub>)<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>C(CN)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(CF<sub>2</sub>)<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>H, CF<sub>3</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>C(CN)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(CF<sub>2</sub>)<sub>3</sub>CF<sub>3</sub>, CF<sub>3</sub>(CF<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(CN)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(CF<sub>2</sub>)<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>H, CF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(CN)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(CF<sub>2</sub>)<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>H, 2-(2,2,3,3,4,4,5,5-octafluoropentil)-2-(3,3,4,4,4-pentafluorobutil)-malonodinitrilo, y CF<sub>2</sub>HCF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(CN)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>;

45

A.26. Agentes alteradores microbianos: Bacillus thuringiensis subespecie Israelensi, Bacillus sphaericus, Bacillus thuringiensis subespecie Aizawai, Bacillus thuringiensis subespecie Kurstaki, Bacillus thuringiensis subespecie Tenebrionis;

50

**[0083]** Los compuestos disponibles en el mercado del grupo A se pueden encontrar en The Pesticide Manual, 13<sup>a</sup> edición, British Crop Protection Council (2003), entre otras publicaciones.

55

**[0084]** Las tioamidas de fórmula M<sup>6.1</sup> y su preparación se han descrito en el documento WO98/28279. La lepimectina es conocida de Agro Project, PJB Publications Ltd, Noviembre de 2004. Benclotiaz y su preparación se han descrito en EP-A1 454621. Metidation y Paraoxon y su preparación se han descrito en Farm Chemicals Handbook, Volumen 88, Meister Publishing Company, 2001. El acetoprol y su preparación se han descrito en el documento WO 98/28277. La metaflumizona y su preparación se han descrito en el documento EP-A1462456. El flupirazofos se ha descrito en Pesticide Science 54, 1988, p. 237-243 y en el documento US 4822779. El pirafluprol y su preparación se han descrito en JP 2002193709 y en WO 01/00614. El piriprol y su preparación se han descrito en el documento WO 98/45274 y en el documento US 6335357. El amidoflumet y su preparación se han descrito en el documento US 6221890 y en JP 21010907. El flufenerim y su preparación se han descrito en el documento WO 03/007717 y en el documento WO 03/007718. AKD 1022 y su preparación se han descrito en el documento US 6300348. El Clorantraniliprol se ha descrito en el documento WO 01/70671, WO 03/015519 y WO 05/118552. Los derivados de antranilamida de fórmula M<sup>24.1</sup> se han descrito en el documento WO 01/70671, WO 04/067528 y WO 05/118552. El ciflumetofeno y su preparación se han descrito en el documento WO 04/080180. El compuesto de aminoquinazolinona pirifluquinazon se ha descrito en el documento EP A 109 7932. Los compuestos de

65

malononitrilo  $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$ ,  $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_5\text{CF}_2\text{H}$ ,  $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CF}_3)_2\text{F}$ ,  $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2(\text{CH}_2)_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$ ,  $\text{CF}_2\text{H}(\text{CF}_2)_3\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$ ,  $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$ ,  $\text{CF}_3(\text{CF}_2)_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$ ,  $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$ , 2-(2,2,3,3,4,4,5,5-octafluoropentil)-2-(3,3,4,4,4-pentafluorobutilo)-malonodinitrilo, y  $\text{CF}_2\text{HCF}_2\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$  se han descrito en el documento WO 05/63694.

#### Formulaciones

**[0085]** Para su uso en un procedimiento o uso de acuerdo con la presente invención, los compuestos I pueden convertirse en las formulaciones habituales, por ejemplo soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, polvos, pastas, gránulos y soluciones directamente pulverizables. La forma de uso depende del propósito particular y el procedimiento de aplicación. Las formulaciones y procedimientos de aplicación se escogen para garantizar en cada caso una distribución fina y uniforme del compuesto de la fórmula I de acuerdo con la presente invención.

**[0086]** Las formulaciones se preparan de una manera conocida (véase, por ejemplo la revisión de US 3.060.084, EP-A 707 445 (para concentrados líquidos), Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, 4 de diciembre 1967, 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4ª ed., McGraw-Hill, Nueva York, 1963, páginas 8-57 y siguientes. WO 91/13546, US 4.172.714, US 4.144.050, US 3.920.442, US 5.180.587, US 5.232.701, US 5.208.030, GB 2.095.558, US 3.299.566, Klingman, Weed control as a science, John Wiley and Sons, Inc., Nueva York, 1961, Hance et al., Weed Control Handbook, octavo Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989 y Mollet, H., Grubemann, A., Formulation technology, Wiley VCH Verlag GmbH, Weinheim (Alemania), 2001, 2. D.A. Knowles, Chemistry and Technology of Agrochemical formulations, Kluwer Academic Publishers, Dordrecht, 1998 (ISBN 0-7514-0443-8), por ejemplo mediante la extensión del compuesto activo con agentes auxiliares adecuados para la formulación de agroquímicos, tales como disolventes y/o portadores, si se desean emulsionantes, tensoactivos y dispersantes, conservantes, agentes antiespumantes, agentes anticongelantes, para la formulación de tratamiento de semillas, también opcionalmente colorantes y/o aglutinantes y/o agentes gelificantes.

**[0087]** Los disolventes/portadores, que son adecuados, son por ejemplo:

- disolventes, tales como agua, disolventes aromáticos (por ejemplo productos Solvesso, xileno y similares), parafinas (por ejemplo fracciones minerales), alcoholes (por ejemplo metanol, butanol, pentanol, alcohol bencílico), cetonas (por ejemplo ciclohexanona, gamma-butirolactona), pirrolidonas (N-metil-pirrolidona (NMP), N-octilpirrolidona NOP), acetatos (diacetato de glicol), lactatos de alquilo, lactonas, tales como g-butirolactona, glicoles, dimetilamidas de ácidos grasos, ácidos grasos y ésteres de ácidos grasos, triglicéridos, aceites de origen vegetal o animal y aceites modificados, tales como aceites vegetales alquilados. En principio, también se pueden utilizar mezclas de disolventes.

- portadores, tales como minerales naturales molidos y minerales sintéticos molidos, tales como geles de sílice, ácido silícico finamente dividido, silicatos, talco, caolín, arcilla de atapulgita, piedra caliza, cal, tiza, bole, loess, arcilla, dolomita, tierra de diatomeas, sulfato de calcio y sulfato de magnesio, óxido de magnesio, materiales sintéticos molidos, fertilizantes, tales como, por ejemplo, sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, ureas y productos de origen vegetal, tales como harina de cereales, harina de corteza de árbol, harina de madera y harina de cáscara de nuez, polvos de celulosa.

**[0088]** Los emulsionantes adecuados son emulsionantes no iónicos y aniónicos (por ejemplo, éteres de alcoholes grasos de polioxietileno, alquilsulfonatos y arilsulfonatos).

**[0089]** Ejemplos de dispersantes son licores residuales de sulfito de lignina y metilcelulosa.

**[0090]** Los tensoactivos adecuados son sales de metales alcalinos, metales y amonio de ácido lignosulfónico, ácido naftalenosulfónico, ácido fenolsulfónico, ácido dibutilnaftalenosulfónico, alquilarilsulfonatos, sulfatos de alquilo, sulfonatos de alquilo, sulfatos de alcoholes grasos, ácidos grasos y éteres glicólicos de alcoholes grasos sulfatados, condensados adicionales de naftaleno sulfonado y derivados de naftaleno con formaldehído, condensados de naftaleno o de ácido naftalenosulfónico con fenol y formaldehído, polioxietileno octilfenil éter, isoctilfenol etoxilado, octilfenol, nonilfenol, alquilfenol poliglicol éter, tributilfenol poliglicol éter, triestearilfenil poliglicol éter, alcoholes de alquilaril poliéter, condensados de alcohol y alcohol graso/óxido de etileno, aceite de ricino etoxilado, polioxietileno alquil éteres, polioxipropileno etoxilado, acetal de lauril alcohol poliglicol éter, ésteres de sorbitol,

**[0091]** También se pueden añadir a la formulación agentes anticongelantes, tales como glicerina, etilenglicol, propilenglicol y bactericidas.

**[0092]** Los agentes antiespumantes adecuados son, por ejemplo, agentes antiespumantes basados en silicio o estearato de magnesio.

Los conservantes adecuados son por ejemplo diclorofeno y alcohol bencílico hemiformal

**[0093]** Los espesantes adecuados son compuestos que confieren un comportamiento de flujo pseudoplástico a la formulación, es decir alta viscosidad en reposo y baja viscosidad en la fase agitada. Se pueden citar, en este

contexto, por ejemplo, espesantes comerciales basados en polisacáridos, tales como goma xantana® (Kelzan® de Kelco), Rhodopol® 23 (Rhone Poulenc) o Veegum® (de R.T. Vanderbilt), o filosilicatos orgánicos, tales como Attaclay® (de Engelhardt). Los agentes antiespumantes adecuados para las dispersiones según la invención son, por ejemplo, emulsiones de silicona (tales como, por ejemplo, Silikon® SRE, Wacker o Rhodorsil® de Rhodia),  
 5 alcoholes de cadena larga, ácidos grasos, compuestos organofluorados y sus mezclas. Los biocidas se pueden añadir para estabilizar las composiciones de acuerdo con la invención contra el ataque por microorganismos. Los biocidas adecuados se basan, por ejemplo, en isotiazolonas, tales como los compuestos comercializados bajo la  
 10 marcas Proxel® de Avecia (o Arch) o Acticide® RS de Thor Chemie y Kathon® MK de Rohm & Haas. Los agentes anticongelantes adecuados son polioles orgánicos, por ejemplo etilenglicol, propilenglicol o glicerol. Estos se emplean habitualmente en cantidades de no más del 10% en peso, basado en el peso total de la composición de compuesto activo. Si es apropiado, las composiciones de compuestos activos según la invención pueden comprender de 1 a 5% en peso de tampón, basado en la cantidad total de la formulación preparada, para regular el  
 15 pH, dependiendo la cantidad y el tipo de tampón usado de las propiedades químicas del compuesto activo o los compuestos activos. Ejemplos de tampones son las sales de metales alcalinos de ácidos inorgánicos u orgánicos débiles, tales como, por ejemplo, ácido fosfórico, ácido bórico, ácido acético, ácido propiónico, ácido cítrico, ácido fumárico, ácido tartárico, ácido oxálico y ácido succínico.

**[0094]** Las sustancias que son adecuadas para la preparación de soluciones directamente pulverizables, emulsiones, pastas o dispersiones en aceite son fracciones de aceite mineral de punto de ebullición medio a alto, tales como queroseno o aceite de diesel, adicionalmente aceites de alquitrán de hulla y aceites de origen vegetal o animal, hidrocarburos alifáticos, cíclicos y aromáticos, por ejemplo tolueno, xileno, parafina, tetrahidronaftaleno, naftaleno alquilados o sus derivados, metanol, etanol, propanol, butanol, ciclohexanol, ciclohexanona, isoforona, disolventes fuertemente polares, por ejemplo dimetilsulfóxido, N-metilpirrolidona y agua.

**[0095]** Los polvos, materiales para esparcir y partículas pueden prepararse mezclando o moliendo concomitantemente las sustancias activas con un portador sólido.

**[0096]** Los gránulos, por ejemplo gránulos recubiertos, gránulos impregnados y gránulos homogéneos, pueden prepararse mediante la unión de los principios activos a portadores sólidos. Ejemplos de portadores sólidos son  
 30 tierras minerales, tales como geles de sílice, silicatos, talco, caolín, arcilla de atapulgita, piedra caliza, cal, tiza, bole, loess, arcilla, dolomita, tierra de diatomeas, sulfato de calcio, sulfato de magnesio, óxido de magnesio, materiales sintéticos molidos, fertilizantes, tales como, por ejemplo, sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, ureas, y productos de origen vegetal, tales como harina de cereales, harina de corteza de árbol, harina de madera y harina de cáscara de nuez, polvos de celulosa y otros portadores sólidos.

**[0097]** En general, las formulaciones comprenden del 0,01 al 95% en peso, preferiblemente de 0,1 a 90% en peso, del principio activo. Los principios activos se emplean en una pureza de un 90% a 100%, preferiblemente de 95% a 100% (según espectro de RMN). Para propósitos de tratamiento de semilla, las formulaciones se pueden diluir 2-10 veces llevando a concentraciones en las preparaciones listas para usar de 0,01 a 60% en peso de compuesto activo en peso, preferiblemente de 0,1 a 40% en peso.

**[0098]** El compuesto de fórmula I se puede utilizar como tal, en forma de sus formulaciones o las formas de uso preparadas a partir de las mismas, por ejemplo, en la forma de soluciones directamente pulverizables, polvos, suspensiones o dispersiones, emulsiones, dispersiones en aceite, pastas, productos espolvoreables, materiales para  
 45 esparcir, o gránulos, por medio de pulverización, atomización, esparcimiento, dispersión o riego. Las formas de uso dependen completamente de los fines previstos; tienen por objetivo garantizar en cada caso la distribución más fina posible de los productos activos según la invención.

**[0099]** Los siguientes son ejemplos de formulaciones:

1. Productos para dilución con agua. Para propósitos de tratamiento de semilla, dichos productos se pueden aplicar a la semilla diluida o no diluida.

A) Concentrados solubles en agua (SL, LS)

**[0100]** Se disuelven 10 partes en peso del compuesto activo en 90 partes en peso de agua o un disolvente soluble en agua. Como alternativa, se añaden humectantes u otros agentes auxiliares. El compuesto activo se disuelve tras la dilución con agua, mediante lo cual se obtiene una formulación con 10% (p/p) de compuesto activo.

B) Concentrados dispersables (DC)

**[0101]** Se disuelven 20 partes en peso del compuesto activo en 70 partes en peso de ciclohexanona con adición de un dispersante, por ejemplo, polivinilpirrolidona. La dilución con agua produce una dispersión, mediante la cual se obtiene una formulación con 15% (p/p) de compuesto activo.

C) Concentrados emulsionables (EC)

**[0102]** Se disuelven 15 partes en peso de los compuestos activos en 7 partes en peso de xileno con adición de dodecibencenosulfonato de calcio y etoxilato de aceite de ricino (en cada caso 5 partes en peso). La dilución con agua produce una emulsión, mediante la cual se obtiene una formulación con 15% (p/p) de los compuestos activos.

5

D) Emulsiones (EW, EO, ES)

**[0103]** Se disuelven 25 partes en peso del compuesto activo en 35 partes en peso de xileno con adición de dodecibencenosulfonato de calcio y etoxilato de aceite de ricino (en cada caso 5 partes en peso). Esta mezcla se introduce en 30 partes en peso de agua por medio de una máquina emulsionante (por ejemplo, Ultraturax) y se convierte en una emulsión homogénea. La dilución con agua produce una emulsión, mediante la cual se obtiene una formulación con 25% (p/p) de compuesto activo.

10

E) Suspensiones (SC, OD, FS)

15

**[0104]** En un molino de bolas agitado, se trituran 20 partes en peso del compuesto activo con la adición de 10 partes en peso de dispersantes, humectantes y 70 partes en peso de agua o de un disolvente orgánico para producir una suspensión fina de compuesto activo. La dilución con agua produce una suspensión estable del compuesto activo, mediante la cual se obtiene una formulación con 20% (p/p) de compuesto activo.

20

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

**[0105]** Se muelen finamente 50 partes en peso del compuesto activo con adición de 50 partes en peso de dispersantes y humectantes y se forman gránulos dispersables en agua o solubles en agua por medio de aparatos técnicos (por ejemplo extrusión, torre de pulverización, lecho fluidizado). La dilución con agua produce una dispersión o solución estable del compuesto activo, mediante la cual se obtiene una formulación con 50% (p/p) de compuesto activo.

25

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

30

**[0106]** Se muelen 75 partes en peso del compuesto activo en un molino de rotor-estator con adición de 25 partes en peso de dispersantes, humectantes y gel de sílice. La dilución con agua produce una dispersión o solución estable del compuesto activo, mediante la cual se obtiene una formulación con 75% (p/p) de compuesto activo.

35

H) Formulación en gel (GF)

**[0107]** En un molino de bolas agitado, se trituran 20 partes en peso del compuesto activo con adición de 10 partes en peso de dispersantes, 1 parte en peso de humectantes con agente gelificante y 70 partes en peso de agua o de un disolvente orgánico para producir una suspensión fina de compuesto activo. La dilución con agua produce una suspensión estable del compuesto activo, mediante la cual se obtiene una formulación con 20% (p/p) de compuesto activo.

40

2. Los productos que han de aplicarse sin diluir para aplicaciones foliares. Para el propósito de tratamiento de semillas, dichos productos se pueden aplicar a la semilla diluida o no diluida.

45

I) Polvos espolvoreables (PS, DS)

**[0108]** Se muelen finamente 5 partes en peso del compuesto activo y se mezclan íntimamente con 95 partes en peso de caolín finamente dividido. Esto produce un producto espolvoreable que tiene 5% (p/p) de compuesto activo.

50

J) Gránulos (GR, FG, GG, MG)

**[0109]** Se muelen finamente 0,5 partes en peso del compuesto activo y se asocian con 95,5 partes en peso de portadores, mediante lo cual se obtiene una formulación con 0,5% (p/p) de compuesto activo. Los procedimientos actuales son extrusión, secado por pulverización o el lecho fluidizado. Esto produce gránulos que han de aplicarse sin diluir para uso foliar.

55

K) Soluciones ULV (UL)

**[0110]** Se disuelven 10 partes en peso del compuesto activo en 90 partes en peso de un disolvente orgánico, por ejemplo xileno. Esto produce un producto que tiene un 10% (p/p) de compuesto activo, que se aplica sin diluir para uso foliar.

60

**[0111]** Las formas de uso acuosas pueden prepararse a partir de concentrados en emulsión, pastas o polvos humectables (polverizables, dispersiones en aceite) mediante adición de agua. Para preparar emulsiones, pastas o dispersiones en aceite, las sustancias, como tales o disueltas en un aceite o disolvente, se pueden

65



homogenizar en agua por medio de un humectante, adherente, dispersante o emulsionante. Alternativamente, es posible preparar concentrados compuestos de sustancia activa, humectante, adherente, dispersante o emulsionante y, si es apropiado, disolvente o aceite, y tales concentrados son adecuados para la dilución con agua.

5 **[0112]** Las formulaciones de compuestos de fórmula I como aerosoles (por ejemplo, en botes pulverizadores), aerosoles de aceite o aerosoles de bomba son muy adecuados para el usuario no profesional para el control de plagas, tales como moscas, pulgas, garrapatas, mosquitos o cucarachas. La fórmula de aerosol está compuesta preferiblemente por el compuesto activo, disolventes, tales como alcoholes inferiores (por ejemplo, metanol, etanol, propanol, butanol), cetonas (por ejemplo acetona, metil etil cetona), hidrocarburos parafínicos (por ejemplo, querosenos) que tienen intervalos de ebullición de aproximadamente 50 a 250°C, dimetilformamida, N-metilpirrolidona, sulfóxido de dimetilo, hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno, xileno, agua, agentes auxiliares adiconales, tales como emulsionantes, tales como monooleato de sorbitol, etoxilato de oleilo que tiene 3-7 moles de óxido de etileno, etoxilato de alcohol graso, aceites de perfumes, tales como aceites etéreos, ésteres de ácidos grasos medios con alcoholes inferiores, compuestos carbonílicos aromáticos, si es apropiado, estabilizantes, tales como benzoato sódico, tensioactivos anfóteros, epóxidos inferiores, ortoformiato de trietilo y, si se requiere, propelentes, tales como propano, butano, nitrógeno, aire comprimido, dimetil éter, dióxido de carbono, óxido nitroso, o mezclas de estos gases.

20 **[0113]** Las formulaciones de aerosol de aceite difieren de las fórmulas de aerosol en que no se utilizan propelentes.

**[0114]** Para usar en composiciones de pulverización o aerosol, el contenido de principio activo es de 0,001 a 80% en peso, preferiblemente de 0,01 a 50% en peso y lo más preferiblemente de 0,01 a 15% en peso.

25 **[0115]** Los compuestos de fórmula I y sus respectivas composiciones también se pueden utilizar en mosquitos y bobinas de fumigación, cartuchos de humo, placas de vaporizador o vaporizadores a largo plazo y también en papeles contra las polillas, almohadillas para polillas u otros sistemas de vaporizador independientes del calor.

30 **[0116]** Las concentraciones de principio activo en los productos listos para su uso pueden variar dentro de intervalos relativamente amplios. En general, son de 0,0001 a 10%, preferiblemente de 0,01 a 1%.

**[0117]** Los principios activos también pueden utilizarse con éxito en el proceso de volumen ultra-bajo (ULV), siendo posible aplicar formulaciones que comprenden más del 95% en peso de principio activo, o incluso aplicar el principio activo sin aditivos.

35 Salud en animales

**[0118]** La actividad de los compuestos contra plagas agrícolas no sugiere su idoneidad para el control de endo- y ectoparásitos en y sobre animales que requiere, por ejemplo, dosis bajas, no eméticas, en el caso de la aplicación oral, la compatibilidad metabólica con el animal, baja toxicidad, y una manipulación segura.

40 **[0119]** Sorprendentemente, se ha encontrado ahora que los compuestos de fórmula I son adecuados para combatir endo- y ectoparásitos en y sobre animales.

45 **[0120]** Los compuestos de fórmula I o los enantiómeros o sales veterinariamente aceptables de los mismos y composiciones que los comprenden se usan preferiblemente para controlar y prevenir infestaciones e infecciones de animales incluidos los animales de sangre caliente (incluyendo humanos) y peces. Son, por ejemplo, adecuados para controlar y prevenir las infestaciones e infecciones en mamíferos, tales como vacas, ovejas, cerdos, camellos, ciervos, caballos, cerdos, aves de corral, conejos, cabras, perros y gatos, búfalo de agua, burros, gamos y renos, y también en animales con pelaje, tales como visón, chinchilla, mapaches, aves, tales como gallinas, gansos, pavos y patos y peces, tales como el pescado de agua dulce y de agua salada, tales como la trucha, la carpa y anguilas.

50 **[0121]** Los compuestos de fórmula I o los enantiómeros o sales veterinariamente aceptables de los mismos y composiciones que los comprenden se usan preferiblemente para controlar y prevenir infestaciones e infecciones en animales domésticos, tales como perros o gatos.

55 **[0122]** Las infestaciones en animales de sangre caliente y peces incluyen, piojos, piojos masticadores, garrapatas, larvas nasales, keds, moscas que pican, moscas muscoides, moscas, larvas de mosca miasítica, niguas, jejenes, mosquitos y pulgas.

60 **[0123]** Los compuestos de fórmula I o los enantiómeros o las sales veterinariamente aceptables de los mismos y composiciones que los comprenden son adecuados para control sistémico y/o no sistémico de ecto- y/o endoparásitos. Son activos contra todas o algunas etapas de desarrollo.

65 **[0124]** Los compuestos de fórmula I son especialmente útiles para combatir ectoparásitos.

**[0125]** Los compuestos de fórmula I son especialmente útiles para combatir parásitos de las siguientes órdenes y especies, respectivamente:

- pulgas (Siphonaptera), por ejemplo, *Ctenocephalides felis*, *Ctenocephalides canis*, *Xenopsylla cheopis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans* y *Noeopeyllus fasciatus*,
- 5 cucarachas (Blattaria - Blattodea), por ejemplo, *Blattella germanica*, *Blattella asahinae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta japonica*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta australasiae* y *Blatta orientalis*,  
moscas, mosquitos (Diptera), por ejemplo, *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*,  
10 *Anopheles maculipennis*, *Anopheles crucians*, *Anopheles albimanus*, *Anopheles gambiae*, *Anopheles freeborni*,  
*Anopheles leucosphyrus*, *Anopheles minimus*, *Anopheles quadrimaculatus*, *Calliphora vicina*, *Chrysomya bezziana*,  
*Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Chrysops discalis*, *Chrysops silacea*, *Chrysops atlanticus*,  
15 *Cochliomyia hominivorax*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culicoides furens*, *Culex pipiens*, *Culex nigripalpus*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex tarsalis*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Dermatobia hominis*, *Fannia canicularis*,  
*Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Glossina palpalis*, *Glossina fuscipes*, *Glossina tachinoides*,  
*Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, especie *Hippelates*, *Hypoderma lineata*, *Leptoconops torrens*, *Lucilia caprina*,  
20 *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Lycoria pectoralis*, especie *Mansonia*, *Musca domestica*, *Muscina stabulans*,  
*Oestrus ovis*, *Phlebotomus argentipes*, *Psorophora columbiae*, *Psorophora discolor*, *Prosimulium mixtum*,  
*Sarcophaga haemorrhoidalis*, especie *Sarcophaga*, *Simulium vittatum*, *Stomoxys calcitrans*, *Tabanus bovinus*,  
*Tabanus atratus*, *Tabanus lineola*, y *Tabanus similis*,  
piojos (Phthiraptera), por ejemplo, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pthirus pubis*,  
25 *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus suis*, *Linognathus vituli*, *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*, *Menacanthus stramineus* y *Solenopotes capillatus*.  
garrapatas y ácaros parasíticos (Parasitiformes): garrapatas (Ixodida), por ejemplo, *Ixodes scapularis*, *Ixodes holocyclus*,  
*Ixodes pacificus*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor variabilis*,  
30 *Amblyomma americanum*, *Amblyomma maculatum*, *Ornithodoros hermsi*, *Ornithodoros turicata* y ácaros parasíticos  
(Mesostigmata), por ejemplo, *Ornithonyssus bacoti* y *Dermanyssus gallinae*,  
Actiniedida (Prostigmata) y Acaridida (Astigmata) por ejemplo, especie *Acarapis*, especie *Cheyletiella*, especie  
*Ornithocheyletia*, especie *Myobia*, especie *Psorergates*, especie *Demodex*, especie *Trombicula*, especie  
40 *Listrophorus*, especie *Acarus*, especie *Tyrophagus*, especie *Caloglyphus*, especie *Hypodectes*, especie *Pterolichus*,  
especie *Psoroptes*, especie *Choriopetes*, especie *Otodectes*, especie *Sarcoptes*, especie *Notoedres*, especie  
35 *Knemidocoptes*, especie *Cytodites*, y especie and *Laminosioptes*,  
Insector (Heteroptera): *Cimex lectularius*, *Cimex hemipterus*, *Reduvius senilis*, especie *Triatoma*, especie  
*Rhodnius*, especie *Panstrongylus* y *Arilus critatus*,  
Anoplurida, por ejemplo, especie *Haematopinus*, especie *Linognathus*, especie *Pediculus*, especie *Pthirus*, y especie  
45 *Solenopotes*,  
Mallophagida (subórdenes *Armblycerina* e *Ischnocerina*), por ejemplo, especie *Trimenopon*, especie *Menopon*,  
especie *Trinoton*, especie *Bovicola*, especie *Werneckiella*, especie *Lepikentron*, especie *Trichodectes*, y especie  
50 *Felicola*.

**[0126]** Nematodos ascáridos:

- 40 Gusanos látigos y triquinosis (Trichosyringida), por ejemplo *Trichinellidae* (especie *Trichinella*), (*Trichuridae*) especie  
*Trichuris*, especie *Capillaria*,  
*Rhabditida*, por ejemplo especie *Rhabditis*, especie *Strongyloides*, especie *Helicephalobus*,  
*Strongylida*, por ejemplo, especie *Strongylus*, especie *Ancylostoma*. *Necator americanus*, especie *Bunostomum*  
45 (*Anquilostoma*), especie *Trichostrongylus*, *Haemonchus contortus*, especie *Ostertagia*, especie *Cooper*, especie  
*Nematodirus*, especie *Dictyocaulus*, especie *Cyathostoma*, especie *Oesophagostomum*, *Stephanurus dentatus*,  
especie *Ollulanus*, especie *Chabertia*, *Stephanurus dentatus*, *Syngamus trachea*, especie *Ancylostoma*, especie  
50 *Uncinaria*, especie *Globocephalus*, especie *Necator*, especie *Metastrongylus*, *Muellerius capillaris*, especie  
*Protostrongylus*, especie *Angiostrongylus*, especie *Parelaphostrongylus*, *Aleurostrongylus abstrusus*, y *Dioctophyma*  
*renale*,  
*Lombrices* intestinales (*Ascaridida*), por ejemplo, *Ascaris lumbricoides*, *Ascaris suum*, *Ascaridia galli*, *Parascaris*  
*equorum*, *Enterobius vermicularis* (oxiuro), *Toxocara canis*, *Toxascaris leoninos*, especie *Skrjabinema*, y *Oxyuris*  
*equi*  
60 *Camallanida*, por ejemplo, *Dracunculus medinensis* (gusano de Guinea)  
*Spirurida*, por ejemplo, especie *Thelazia*, especie *Wuchereria*, especie *Brugia*, especie *Onchocerca*, especie  
55 *Dirofilaria*, especie *Dipetalonema*, especie *Setaria*, especie *Elaeophora*, *Spirocerca lupi*, y especie *Habronema*,  
Gusanos de cabeza espinosa (acantocéfalos), por ejemplo especie *Acanthocephalus*, *Macracanthorhynchus*  
*hirudinaceus* y especie *Oncicola*.

**[0127]** Planarias (Platelmintos):

- 60 Trematodos (Trematoda), por ejemplo especie *Faciola*, *Fascioloides magna*, especie *Paragonimus*, especie  
*Dicrocoelium*, *Fasciolopsis buski*, *Clonorchis sinensis*, especie *Schistosoma*, especie *Trichobilharzia*, *Alaria alata*,  
especie *Paragonimus*, y especie *Nanocyetes*,  
*Cercomeromorpha*, en particular, *Cestoda* (tenias), por ejemplo, especie *Diphyllobothrium*, especie *Tenia*, especie  
65 *Echinococcus*, *Dipylidium caninum*, especie *Multiceps*, especie *Hymenolepis*, especie *Mesocestoides*, especie  
*Vampirolepis*, especie *Moniezia*, especie *Anoplocephala*, especie *Sirometra*, especie *Anoplocephala*, y especie  
*Hymenolepis*.

- [0128] Los compuestos de fórmula I, y composiciones que los contienen son particularmente útiles para el control de plagas de los órdenes Diptera, Siphonaptera e Ixodida.
- 5 [0129] Además, se prefiere especialmente el uso de los compuestos de fórmula I, y composiciones que los contienen para combatir mosquitos.
- [0130] El uso de los compuestos de fórmula I, y composiciones que los contienen para combatir moscas es una realización preferida adicional de la presente invención.
- 10 [0131] Además, se prefiere especialmente el uso de los compuestos de fórmula I, y composiciones que los contienen para combatir pulgas.
- [0132] El uso de los compuestos de fórmula I, y composiciones que los contienen para combatir garrapatas es una realización preferida adicional de la presente invención.
- 15 [0133] Los compuestos de fórmula I también son especialmente útiles para combatir endoparásitos (gusanos redondos nematodos, gusanos de cabeza espinosa y planarias).
- 20 [0134] La administración puede llevarse a cabo tanto profiláctica como terapéuticamente.
- [0135] La administración de los compuestos activos se lleva a cabo directamente o en forma de preparaciones adecuadas, por vía oral, tópica/dérmica o parenteral.
- 25 [0136] Para la administración oral a animales de sangre caliente, los compuestos de fórmula I se pueden formular como alimento para animales, premezclas de alimentos para animales, concentrados de alimentos para animales, pastillas, soluciones, pastas, suspensiones, pociones, geles, comprimidos, bolos y cápsulas. Además, los compuestos de fórmula I se pueden administrar a los animales en su agua para beber. Para la administración oral, la forma de dosificación elegida debe proporcionar al animal de 0,01 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal del animal por día del compuesto de fórmula I, preferiblemente de 0,5 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal del animal por día.
- 30 [0137] Alternativamente, los compuestos de fórmula I pueden administrarse a los animales parenteralmente, por ejemplo, mediante inyección intrarruminal, intramuscular, intravenosa o subcutánea. Los compuestos de fórmula I se pueden dispersar o disolver en un vehículo fisiológicamente aceptable para inyección subcutánea. Alternativamente, los compuestos de fórmula I se pueden formular en un implante para administración subcutánea. Además, el compuesto de fórmula I se puede administrar por vía transdérmica a los animales. Para la administración parenteral, la forma de dosificación elegida debe proporcionar al animal de 0,01 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal del animal por día del compuesto de fórmula I.
- 35 [0138] Los compuestos de fórmula I también se pueden aplicar tópicamente a los animales en forma de salsas, partículas, polvos, collares, medallones, pulverizaciones, champús, formulaciones spot-on y formulaciones para verter ("pour-on") y en ungüentos o emulsiones de aceite en agua o agua en aceite. Para la aplicación tópica, las salsas y pulverizaciones contienen generalmente de 0,5 ppm a 5000 ppm y preferiblemente de 1 ppm a 3000 ppm del compuesto de fórmula I. Además, los compuestos de fórmula I se pueden formular como etiquetas para oreja en animales, particularmente cuadrúpedos, tales como vacas y ovejas.
- 40 [0139] Las preparaciones adecuadas son:
- Soluciones, tales como soluciones orales, concentrados para administración oral tras dilución, soluciones para el uso sobre la piel o en las cavidades corporales, formulaciones "pour-on", geles;
  - Emulsiones y suspensiones para administración oral o dérmica; preparaciones semisólidas;
  - Formulaciones en las que el compuesto activo es procesado en una base de pomada o en una base de emulsión de aceite en agua o agua en aceite;
  - Preparaciones sólidas, tales como polvos, premezclas o concentrados, granulados, pélets, comprimidos, bolos, cápsulas; aerosoles e inhalantes, y artículos moldeados que contienen el compuesto activo.
- 45 [0140] Las composiciones adecuadas para inyección se preparan disolviendo el principio activo en un disolvente adecuado y opcionalmente añadiendo ingredientes adicionales, tales como ácidos, bases, sales de tampón, conservantes y solubilizantes. Las soluciones se filtran y se llenan de forma estéril.
- 50 [0141] Los disolventes adecuados son disolventes fisiológicamente tolerables, tales como agua, alcanoles, tales como etanol, butanol, alcohol bencílico, glicerol, propilenglicol, polietilenglicoles, N-metil-pirrolidona, 2-pirrolidona, y mezclas de los mismos.
- 55 [0142] Los compuestos activos se pueden disolver opcionalmente en aceites vegetales o sintéticos fisiológicamente tolerables, que son adecuados para la inyección.
- 60 [0141] Los disolventes adecuados son disolventes fisiológicamente tolerables, tales como agua, alcanoles, tales como etanol, butanol, alcohol bencílico, glicerol, propilenglicol, polietilenglicoles, N-metil-pirrolidona, 2-pirrolidona, y mezclas de los mismos.
- 65 [0142] Los compuestos activos se pueden disolver opcionalmente en aceites vegetales o sintéticos fisiológicamente tolerables, que son adecuados para la inyección.

- [0143] Los solubilizantes adecuados son disolventes que promueven la disolución del compuesto activo en el disolvente principal o que impiden su precipitación. Ejemplos son polivinilpirrolidona, alcohol polivinílico, aceite de ricino polioxiethylado y éster de sorbitán polioxiethylado.
- 5 [0144] Los conservantes adecuados son alcohol bencílico, trichlorobutanol, ésteres del ácido p-hidroxibenzoico, y n-butanol.
- [0145] Las soluciones orales se administran directamente. Los concentrados se administran por vía oral tras dilución previa hasta la concentración de uso. Las soluciones orales y los concentrados se preparan de acuerdo con el estado de la técnica y como se describió anteriormente para soluciones inyectables, no siendo necesarios los procedimientos estériles.
- 10 [0146] Las soluciones para el uso en la piel se gotean, se extienden, frotan, rocían o pulverizan sobre la misma.
- 15 [0147] Las soluciones para uso sobre la piel se preparan de acuerdo con el estado de la técnica y de acuerdo a lo que se ha descrito anteriormente para soluciones inyectables, no siendo necesarios los procedimientos estériles.
- [0148] Los disolventes adecuados adicionales son el polipropilenglicol, fenil etanol, fenoxi etanol, éster, tal como acetato de etilo o butilo, benzoato de bencilo, éteres, tales como alquilenglicol alquileter, por ejemplo dipropilenglicol monometiléter, cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, hidrocarburos aromáticos, aceites vegetales y sintéticos, dimetilformamida, dimetilacetamida, transcutool, solcetal, propilencarbonato, y mezclas de los mismos.
- 20 [0149] Puede ser ventajoso añadir espesantes durante la preparación. Los espesantes adecuados son espesantes inorgánicos, tales como bentonitas, ácido silícico coloidal, monoestearato de aluminio, espesantes orgánicos, tales como derivados de celulosa, alcoholes polivinílicos y sus copolímeros, acrilatos y metacrilatos.
- 25 [0150] Los geles se aplican o extienden sobre la piel o se introducen en cavidades corporales. Los geles se preparan mediante el tratamiento de soluciones, que han sido preparadas como se describe en el caso de las soluciones inyectables con suficiente espesante que resulta un material transparente que tiene una consistencia como una pomada. Los espesantes empleados son los espesantes indicados anteriormente. Las formulaciones "pour-on" se vierten o pulverizan sobre zonas limitadas de la piel, penetrando el compuesto activo en la piel y actuando de forma sistémica.
- 30 [0151] Las formulaciones "pour-on" se preparan disolviendo, suspendiendo o emulsionando el compuesto activo en disolventes o mezclas de disolventes adecuados compatibles con la piel. Si es apropiado, se añaden otros agentes auxiliares, tales como colorantes, sustancias que promueven la bioabsorción, antioxidantes, estabilizadores de la luz adhesivos.
- 35 [0152] Los disolventes adecuados que son: agua, alcoholes, glicoles, polietilenglicoles, polipropilenglicoles, glicerina, alcoholes aromáticos, tales como alcohol bencílico, feniletanol, fenoxietanol, ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de butilo, benzoato de bencilo, éteres, tales como alquilen glicol alquileter, tales como dipropilenglicol monometil éter, dietilenglicol mono-butil éter, cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, carbonatos cíclicos, tales como carbonato de propileno, carbonato de etileno, hidrocarburos aromáticos y/o alifáticos, aceites vegetales o sintéticos, DMF, dimetilacetamida, n-alquilpirrolidonas tales como metilpirrolidona, n-butilpirrolidona o n-octilpirrolidona, N-metilpirrolidona, 2-pirrolidona, 2,2-dimetil-4-oxi-metilen-1,3-dioxolano y glicerol formal.
- 40 [0153] Los colorantes adecuados son todos los colorantes permitidos para su uso en animales y que pueden disolverse o suspenderse.
- 45 [0154] Las sustancias promotoras de la absorción adecuadas son, por ejemplo, DMSO, aceites extendedores, tales como miristato de isopropilo, pelargonato de dipropilenglicol, aceites de silicona y copolímeros de los mismos con poliéteres, ésteres de ácidos grasos, triglicéridos, alcoholes grasos.
- 50 [0155] Los antioxidantes adecuados son sulfitos o metabisulfitos, tales como metabisulfito de potasio, ácido ascórbico, butilhidroxitolueno, butilhidroxianisol, tocoferol.
- 55 [0156] Los estabilizadores de luz adecuados son, por ejemplo, ácido novantisólico.
- [0157] Los adhesivos adecuados son, por ejemplo, derivados de celulosa, derivados de almidón, poliácridatos, polímeros naturales, tales como alginatos, gelatina.
- 60 [0158] Las emulsiones se pueden administrar por vía oral, dérmica o como inyecciones.
- [0159] Las emulsiones son bien del tipo agua en aceite o del tipo aceite en agua.
- 65

**[0160]** Se preparan disolviendo el compuesto activo en la fase hidrófoba o en la fase hidrófila y homogeneizando ésta con el disolvente de la otra fase con ayuda de emulsionantes adecuados y, si es apropiado, otros agentes auxiliares, tales como colorantes, sustancias promotoras de la absorción, conservantes, antioxidantes, estabilizadores de la luz, sustancias que aumentan la viscosidad.

5 **[0161]** Las fases hidrófobas (aceites) adecuadas son:  
 parafinas líquidas, aceites de silicona, aceites vegetales naturales, tales como aceite de sésamo, aceite de almendras, aceite de ricino, triglicéridos sintéticos, tales como biglicérido caprílico/cáprico, mezcla de triglicéridos con ácidos grasos vegetales de longitud de cadena C<sub>8</sub>-C<sub>12</sub> u otros ácidos grasos naturales especialmente seleccionados, mezclas de glicéridos parciales de ácidos grasos saturados o insaturados posiblemente conteniendo también grupos hidroxilo, mono- y diglicéridos de los ácidos grasos C<sub>8</sub>-C<sub>10</sub>, ésteres de ácidos grasos, tales como estearato de etilo, adipato de di-n-butirilo, laurato de hexilo, perlargonato de dipropilenglicol, ésteres de un ácido graso ramificado de longitud de cadena media con alcoholes grasos saturados de longitud de cadena C<sub>16</sub>-C<sub>18</sub>, miristato de isopropilo, palmitato de isopropilo, ésteres de ácido caprílico/cáprico de alcoholes grasos saturados de longitud de cadena C<sub>12</sub>-C<sub>18</sub>, estearato de isopropilo, oleato de oleilo, oleato de decilo, oleato de etilo, lactato de etilo, ésteres de ácidos grasos cerosos, tales como grasa sintética de la glándula coccígea de pato, ftalato de dibutilo, adipato de diisopropilo, y mezclas de ésteres relacionados con el último, alcoholes grasos, tales como alcohol isotridecílico, 2-octildodecanol, alcohol cetilestearílico, alcohol oleico, y ácidos grasos, tales como ácido oleico y mezclas de los mismos.

20 **[0162]** Las fases hidrofílicas adecuadas son: agua, alcoholes, tales como propilenglicol, glicerol, sorbitol y mezclas de los mismos.

25 **[0163]** Los emulsionantes adecuados son:

agentes tensioactivos no iónicos, por ejemplo aceite de ricino polietoxilado, monooleato de sorbitán polietoxilado, monoestearato de sorbitán, monoestearato de glicerol, estearato de polioxietilo, alquilfenol poliglicol éter; tensioactivos anfólicos, tales como N-lauril-p-iminodipropionato de disodio o lecitina; tensioactivos aniónicos, tales como lauril sulfato de sodio, sulfatos de éter de alcohol graso, sal de monoetanolamina de ácido mono/dialquil poliglicol éter ortofosfórico; tensioactivos activos de cationes, tales como cloruro de cetiltrimetilamonio.

30 **[0164]** Otros productos auxiliares adecuados son: sustancias que mejoran la viscosidad y estabilizan la emulsión, tales como carboximetilcelulosa, metilcelulosa y otros derivados de celulosa y almidón, poliácridatos, alginatos, gelatina, goma árabe, polivinilpirrolidona, alcohol de polivinilo, copolímeros de metil vinil éter y anhídrido maleico, polietilenglicoles, ceras, ácido silícico coloidal o mezclas de las sustancias mencionadas.

35 **[0165]** Las suspensiones se pueden administrar por vía oral o tópica/dérmica. Se preparan suspendiendo el compuesto activo en un agente de suspensión, si es apropiado, con adición de otros productos auxiliares, tales como agentes humectantes, colorantes, sustancias que promueven la bioabsorción, conservantes, antioxidantes, estabilizadores de luz.

40 **[0166]** Los agentes de suspensión líquidos son todos los disolventes y mezclas de disolventes homogéneos.

**[0167]** Los agentes humectantes adecuados (dispersantes) son los emulsionantes indicados anteriormente.

45 **[0168]** Otros productos auxiliares que se pueden mencionar son los indicados anteriormente.

**[0169]** Las preparaciones semisólidas se pueden administrar vía oral o tópica/dérmica. Se diferencian de las suspensiones y emulsiones descritas anteriormente sólo por su mayor viscosidad.

50 **[0170]** Para la producción de preparaciones sólidas, el compuesto activo se mezcla con excipientes adecuados, si es apropiado con adición de productos auxiliares, y se lleva a la forma deseada.

55 **[0171]** Los excipientes adecuados son todas las sustancias inertes sólidas fisiológicamente tolerables. Los que se utilizan son sustancias inorgánicas y orgánicas. Las sustancias inorgánicas son, por ejemplo, cloruro de sodio, carbonatos, tales como carbonato de calcio, hidrogenocarbonatos, óxidos de aluminio, óxido de titanio, ácidos silícicos, tierras arcillosas, sílice coloidal o precipitado, o fosfatos. Las sustancias orgánicas son, por ejemplo, azúcar, celulosa, productos alimenticios y alimentos, tales como leche en polvo, harina animal, harinas y fragmentos de granos, almidones.

60 **[0172]** Los productos auxiliares adecuados son conservantes, antioxidantes, y/o colorantes, que se han mencionado anteriormente.

65 **[0173]** Otros productos auxiliares adecuados son lubricantes y deslizantes, tales como estearato de magnesio, ácido esteárico, talco, bentonitas, sustancias que promueven la disgregación, tales como almidón o polivinilpirrolidona reticulada, aglutinantes, tales como almidón, gelatina o polivinilpirrolidona lineal, y aglutinantes secos, tales como celulosa microcristalina.

- 5 **[0174]** En general, "cantidad eficaz como parasiticida" significa la cantidad de principio activo necesaria para lograr un efecto observable sobre el crecimiento, incluyendo los efectos de necrosis, muerte, retraso, prevención, y eliminación, destrucción, o en cualquier caso, disminución de la aparición y actividad del organismo diana. La cantidad eficaz parasiticida puede variar para los diferentes compuestos/composiciones utilizados en la invención. Una cantidad eficaz parasiticida de las composiciones variará también de acuerdo con las condiciones prevalentes, tales como el efecto parasiticida deseado y la duración, la especie diana, y modo de aplicación.
- 10 **[0175]** Las composiciones, que pueden utilizarse en la invención pueden comprender generalmente de aproximadamente 0,001 a 95% del compuesto de fórmula I.
- [0176]** Generalmente, es favorable aplicar los compuestos de fórmula I en cantidades totales de 0,5 mg/kg a 100 mg/kg por día, preferiblemente 1 mg/kg a 50 mg/kg por día.
- 15 **[0177]** Las preparaciones listas para el uso contienen los compuestos que actúan contra parásitos, preferiblemente ectoparásitos, en concentraciones de 10 ppm a 80 por ciento en peso, preferiblemente de 0,1 a 65 por ciento en peso, más preferiblemente de 1 a 50 por ciento en peso, la mayoría preferiblemente de 5 a 40 por ciento en peso.
- 20 **[0178]** Las preparaciones, que se diluyen antes de su uso, contienen los compuestos que actúan contra ectoparásitos en concentraciones de 0,5 a 90 por ciento en peso, preferiblemente de 1 al 50 por ciento en peso.
- [0179]** Además, las preparaciones comprenden los compuestos de fórmula I contra los endoparásitos en concentraciones de 10 ppm a 2 por ciento en peso, preferiblemente de 0,05 a 0,9 por ciento en peso, muy especialmente preferible del 0,005 al 0,25 por ciento en peso.
- 25 **[0180]** En una realización preferida de la presente invención, las composiciones que comprenden los compuestos de fórmula I se aplican por vía dérmica/tópica.
- 30 **[0181]** En una realización preferida adicional, la aplicación tópica no terapéutica se lleva a cabo en forma de artículos conformados que contienen compuestos, tales como collares, medallones, etiquetas de oreja, bandas para la fijación en partes del cuerpo, y tiras y láminas adhesivas.
- [0182]** Generalmente, es favorable aplicar formulaciones sólidas que liberan compuestos de fórmula I en cantidades totales de 10 mg/kg a 300 mg/kg, preferiblemente de 20 mg/kg a 200 mg/kg, lo más preferiblemente de 25 mg/kg a 35 160 mg/kg de peso corporal del animal tratado en el transcurso de tres semanas.
- 40 **[0183]** Para la preparación de artículos conformados, se utilizan plásticos termoplásticos y flexibles, así como elastómeros y elastómeros termoplásticos. Plásticos y elastómeros adecuados son resinas de polivinilo, poliuretano, poliacrilato, resinas epoxi, celulosa, derivados de celulosa, poliamidas y poliéster que sean suficientemente compatibles con los compuestos de fórmula I. Una lista detallada de plásticos y elastómeros, así como procedimientos de preparación para los artículos conformados se indica, por ejemplo, en el documento WO 03/086075.
- 45 **Tratamiento de semillas**
- [0184]** Los compuestos de fórmula I también son adecuados para el tratamiento de semillas con el fin de proteger la semilla de plagas de insectos, en particular de las plagas de insectos que viven en el suelo y las raíces y brotes de la planta resultante contra plagas del suelo e insectos foliares.
- 50 **[0185]** Los compuestos de fórmula I son particularmente útiles para la protección de la semilla de plagas del suelo y las raíces y brotes de la planta resultante contra plagas del suelo e insectos foliares. Se prefiere la protección de las raíces y los brotes de la planta resultante. Se prefiere más la protección de los brotes de la planta resultante de insectos perforadores y chupadores, en donde lo más preferido es la protección frente a los áfidos.
- 55 **[0186]** Por tanto, la presente invención comprende un procedimiento para la protección de las semillas contra insectos, en particular insectos del suelo y de las raíces y brotes de plantas de semillero de insectos, en particular de insectos del suelo y foliares, comprendiendo dicho procedimiento poner en contacto las semillas antes de la siembra y/o después de la pregerminación con un compuesto de la fórmula I general o una sal del mismo. Particularmente preferido es un procedimiento en el que las raíces y brotes de la planta están protegidos, más preferiblemente un procedimiento, en el que los brotes de la planta están protegidos de insectos perforadores y chupadores, lo más preferiblemente un procedimiento, en el que los brotes plantas están protegidos frente a los áfidos.
- 60 **[0187]** El término semilla abarca semillas y propágulos de plantas de todo tipo, incluyendo, pero no limitado a, semillas verdaderas, pedazos de semillas, retoños, cormos, bulbos, frutos, tubérculos, granos, esquejes, cortes de brotes y similares, y significa, en una realización preferida, semillas verdaderas.
- 65

**[0188]** El término tratamiento de semillas comprende todas las técnicas de tratamiento de semillas adecuadas conocidas en la técnica, tales como revestimiento de semillas, recubrimiento de semillas, espolvoreo de semillas, remojo de semillas y granulación de las semillas.

5 **[0189]** La presente invención también comprende semillas recubiertas con o que contienen el compuesto activo.

**[0190]** El término "recubierto con y/o que contiene" generalmente significa que el principio activo está en su mayor parte sobre la superficie del producto de propagación en el momento de aplicación, aunque una mayor o menor parte del principio puede penetrar en el producto de propagación, dependiendo del procedimiento de aplicación.  
10 Cuando dicho producto de propagación es (re)plantado, puede absorber el principio activo.

**[0191]** La semilla adecuada es la semilla de cereales, tubérculos, oleaginosas, hortalizas, especias, plantas ornamentales, por ejemplo, semillas de trigo duro y otras de trigo, cebada, avena, centeno, maíz (maíz forrajero y maíz de azúcar/dulce y maíz de campo), soja, oleaginosas, crucíferas, algodón, girasol, banano, arroz, colza oleaginosa, colza de nabo, remolacha azucarera, remolacha forrajera, berenjenas, patatas, hierba, césped, pasto, forraje, tomates, puerros, calabaza/calabacín, repollo, lechuga iceberg, pimienta, pepinos, melones, especies de Brassica, melones, judías, guisantes, ajos, cebollas, zanahorias, plantas tuberosas, tales como patatas, caña de azúcar, tabaco, uvas, petunias, geranios/pelargonios, pensamientos y nomeolvides.

20 **[0192]** Además, el compuesto activo también puede utilizarse para el tratamiento de semillas de plantas, que toleran la acción de herbicidas o fungicidas o insecticidas debido a la reproducción, incluyendo los procedimientos de ingeniería genética.

**[0193]** Por ejemplo, el compuesto activo puede emplearse en el tratamiento de semillas de plantas, que son resistentes a herbicidas del grupo que consiste de las sulfonilureas, imidazolinonas, glufosinato de amonio o glifosato-isopropilamonio y sustancias activas análogas (véase por ejemplo, EP-A-0242236, EP-A-242246) (WO 92/00377) (EP-A-0257993, Patente de Estados Unidos No. 5,013,659) o en plantas de cultivos transgénicos, por ejemplo algodón, con la capacidad de producir toxinas de *Bacillus thuringiensis* (toxinas Bt) que hacen que las plantas sean resistentes a ciertas plagas (EP-A-0142924, EP-A-0193259).

**[0194]** Además, el compuesto activo se puede utilizar también para el tratamiento de semillas de plantas, que presentan características modificadas en comparación con las plantas existentes, que pueden generarse mediante, por ejemplo, procedimientos tradicionales de cultivo y/o la generación de mutantes, o mediante procedimientos recombinantes). Por ejemplo, se han descrito un número de casos de modificaciones recombinantes de plantas de cultivo para el propósito de modificar el almidón sintetizado en las plantas (por ejemplo, WO 92/11376, WO 92/14827, WO 91/19806) o de plantas de cultivos transgénicos que tienen una composición de ácidos grasos modificados (WO 91/13972).

**[0195]** La aplicación del tratamiento de semillas del compuesto activo se lleva a cabo mediante pulverización o espolvoreo de las semillas antes de la siembra de las plantas y antes de la aparición de las plantas.

**[0196]** En el tratamiento de semillas, las formulaciones correspondientes se aplican tratando las semillas con una cantidad eficaz del compuesto activo. En este documento, las tasas de aplicación del compuesto activo son generalmente de 0,1 g a 10 kg por 100 kg de semilla, preferiblemente de 1 g a 5 kg por 100 kg de semilla, en particular de 1 g a 2,5 kg por 100 kg de semilla. Para cultivos específicos, tales como lechuga, la tasa puede ser superior.

**[0197]** Las composiciones, que son especialmente útiles para el tratamiento de semillas son, por ejemplo:

- A Concentrados solubles (SL, LS)
- D Emulsiones (EW, EO, ES)
- E Suspensiones (SC, OD, FS)
- F Gránulos dispersables en agua y gránulos solubles en agua (WG, SG)
- G Polvos dispersables en agua y polvos solubles en agua (WP, SP, WS)
- H Formulaciones de gel (GF)
- I Polvos espolvoreables (DP, DS)

**[0198]** Las formulaciones de tratamiento de semillas convencionales incluyen por ejemplo concentrados fluidos FS, soluciones LS, polvos para tratamiento en seco DS, polvos dispersables en agua para tratamiento en emulsión WS, polvos solubles en agua SS y emulsión ES y EC y la formulación de gel GF. Estas formulaciones se pueden aplicar a la semilla diluida o no diluida. La aplicación a las semillas se lleva a cabo antes de la siembra, ya sea directamente sobre las semillas o después de haber pregerminado éstas últimas.

**[0199]** En una realización preferida, una formulación FS se utiliza para el tratamiento de semillas. Habitualmente, una formulación FS puede comprender al 1-800 g/l de principio activo, 1-200 g/l de tensioactivo, de 0 a 200 g/l de agente anticongelante, de 0 a 400 g/l de aglutinante, de 0 a 200 g/l de un pigmento y hasta 1 litro de un disolvente, preferiblemente agua.

[0200] Las formulaciones FS preferidas de compuestos de fórmula I para el tratamiento de semillas usualmente comprenden de 0,1 a 80% en peso (de 1 a 800 g/l) de principio activo, de 0,1 a 20% en peso (de 1 a 200 g/l) de por lo menos un agente tensioactivo, por ejemplo, de 0,05 a 5% en peso de un humectante y de 0,5 a 15% en peso de un agente dispersante, hasta 20% en peso, por ejemplo, de 5 a 20%, de un agente anticongelante, de 0 a 15% en peso, por ejemplo de 1 a 15% en peso, de un pigmento y/o un colorante, de 0 a 40% en peso, por ejemplo de 1 a 40% en peso, de un aglutinante (adhesivo/agente de adhesión), opcionalmente hasta un 5% en peso, por ejemplo de 0,1 a 5% en peso, de un espesante, opcionalmente de 0,1 a 2% de un agente antiespuma, y opcionalmente un conservante, tal como un biocida, antioxidante o similar, por ejemplo, en una cantidad de 0,01 a 1% en peso y una carga/vehículo hasta 100% en peso.

[0201] Las formulaciones de tratamiento de semillas pueden comprender también adicionalmente aglutinantes y opcionalmente colorantes.

[0202] Los aglutinantes se pueden agregar para mejorar la adhesión de los materiales activos sobre las semillas después del tratamiento. Los aglutinantes adecuados son copolímeros de bloque EO/PO tensioactivos, pero también polivinilalcohol, polivinilpirrolidonas, poliacrilatos, polimetacrilatos, polibutenos, poliisobutilenos, poliestireno, polietilenaminas, polietilenamidas, polietileniminas (Lupasol®, Polymin®), poliéteres, poliuretanos, acetato de polivinilo, tilosa y copolímeros derivados de estos polímeros.

[0203] Opcionalmente, también se pueden incluir colorantes en la formulación. Los colorantes o tintes adecuados para formulaciones para tratamiento de semillas son Rodamina B, C.I. Pigmento rojo 112, C.I. Disolvente rojo 1, pigmento azul 15:4, pigmento azul 15:3, pigmento azul 15:2, pigmento azul 15:1, pigmento azul 80, pigmento amarillo 1, pigmento amarillo 13, pigmento rojo 112, pigmento rojo 48:2, pigmento rojo 48:1, pigmento rojo 57:1, pigmento rojo 53:1, pigmento naranja 43, pigmento naranja 34, pigmento naranja 5, pigmento verde 36, pigmento verde 7, pigmento blanco 6, pigmento marrón 25, violeta básico 10, violeta básico 49, rojo ácido 51, rojo ácido 52, rojo ácido 14, azul ácido 9, amarillo ácido 23, rojo básico 10, rojo básico 108.

Ejemplos de un agente gelificante es carragenina (Satiagel®)

[0204] En el tratamiento de semilla, las tasas de aplicación de los compuestos I son generalmente de 0,1 g a 10 kg por 100 kg de semilla, preferiblemente de 1 g a 5 kg por 100 kg de semilla, en particular de 1 g a 1000 g por 100 kg de semilla.

[0205] Por tanto, la invención se refiere también a semillas que comprenden un compuesto de la fórmula I, o una sal agrícolamente útil de I, tal como se define en este documento. La cantidad del compuesto I o la sal agrícolamente útil del mismo variará, en general, de 0,1 g a 10 kg por 100 kg de semilla, preferiblemente de 1 g a 5 kg por 100 kg de semilla, en particular de 1 g a 1000 g por 100 kg de semilla.

[0206] La presente invención se ilustra a continuación con más detalle mediante los siguientes ejemplos.

[0207] Algunos de los ejemplos de compuestos preferidos de fórmula I\* para su uso en los procedimientos de acuerdo con la presente invención se caracterizan por su punto de fusión en la siguiente tabla C:

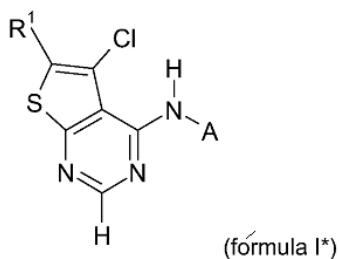




Tabla C:

Compuesto nº	R <sup>1</sup>		A1		R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	A2		R <sup>9</sup>	A3	Datos físicos: T <sub>f</sub> (punto de fusión) en [°C]
	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>8</sup>			R <sup>10</sup>				
C.1	H					H	CH <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>		R <sup>10</sup>	84-87
C.2	H					H	CH <sub>3</sub>	OCF <sub>3</sub>			79-80
C.3	H					H	CH <sub>3</sub>	OCHF <sub>2</sub>			102-103
C.4	H					H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCF <sub>2</sub> CHFCF <sub>3</sub>			Acéite
C.5	H	H			OCF <sub>3</sub>						77-79
C.6	H									cis-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	107-109
C.7	H									cis- CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	70-73
C.8	H									trans-CF <sub>3</sub>	Resina
C.9	H									trans- CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Resina
C.10	H									cis-CF <sub>3</sub>	105-109
C.11	H									CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Resina
C.12	CHO									cis-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	90-91
C.13	CHCl <sub>2</sub>									cis-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	178-185
C.14	CH <sub>3</sub>									cis-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	128-133
C.15	CH <sub>3</sub>					H	CH <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>			Resina
C.16	CH <sub>3</sub>					H	CH <sub>3</sub>	OCF <sub>3</sub>			68-72
C.17	CH <sub>3</sub>					H	CH <sub>3</sub>	OCHF <sub>2</sub>			77-81
C.18	CH <sub>3</sub>									cis-C(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Acéite
C.19	CH <sub>3</sub>	H			OCF <sub>3</sub>						73-77
C.20	CH <sub>3</sub>									transCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	130-135
C.21	CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>									cis-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	aceite
C.22	CHCH <sub>2</sub>									cis-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	114-127
C.23	CH=N-OH									cis-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	214-215
C.24	CH=N-OCH <sub>3</sub>									cis-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	Resina (isomero E)

Tabla C (Continuación)

Compuesto nº	R <sup>1</sup>	A1				A2			A3	Datos físicos: T <sub>f</sub> (punto de fusión) en [°C]
		R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R <sup>10</sup>		
C.25	CH=N-OCH <sub>3</sub>								cis-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	90-93 (isómero E/Z 2:1)
C.26	CN								cis-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	160-166
C.27	CH=N-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>								cis-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	146-157 (isómero E)
C.28	CH=N-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>								cis-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	Resina (isómero E/Z 2:1)
C.29	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>								cis-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	70-75
C.30	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>				H			CH <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	Resina
C.31	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>				H			CH <sub>3</sub>	OCF <sub>3</sub>	Resina
C.32	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>				H			CH <sub>3</sub>	OCHF <sub>2</sub>	Resina
C.33	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>								cis- CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Resina

## Ejemplos de síntesis

S.1 (5-cloro-tieno[2,3-d]pirimidin-4-il)-[1-(4-trifluorometoxi-fenil)-etil]-amina (Ejemplo Compuesto C.2)

**[0208]** Se disuelven 0,5 g (2,4 mmol) de 4,5-dicloro-tieno [2,3-d]-pirimidina en 25 ml de tolueno. Posteriormente, se añaden 0,29 g (2,7 mmol) de trietilamina, una cantidad catalítica de yoduro de tetrabutil amonio y 0,5 g (2,5 mmol) de (S)-1-(4-trifluorometoxifenil)-etilamina. La solución se calienta bajo reflujo durante 4 horas, y se agita otras 12 horas a temperatura ambiente. El disolvente se destila, el residuo se revierte en CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> y se lava con HCl 2 N y H<sub>2</sub>O. El residuo se limpia mediante cromatografía flash después de ser secado y concentrado. El rendimiento del compuesto C.3 obtenido es de 0,5 g (1,4 mmol, 56% del rendimiento teórico) y tiene un punto de fusión T<sub>f</sub> de 79-80°C.

<sup>1</sup>H-RMN (CDCl<sub>3</sub>): 8,45 (s, 1 H), 7,45 (d, 2H), 7,20 (d, 2H), 7,10 (s, 1 H), 6,80 (d, 1 H), 5,55 (t, 1 H), 1,65 (d, 3H);

S.2 cis-(4-terc-butil-ciclohexil)-(5-cloro-tieno[2,3-d]pirimidin-4-il)-amina (Ejemplo Compuesto C.6)

**[0209]** Se disuelven 2 g (9,7 mmol) de 4,5-dicloro-tieno[2,3-d]-pirimidina en 25 ml de tolueno. Posteriormente, se añaden 1,1 g (10,7 mmol) de trietilamina, una cantidad catalítica de yoduro de tetrabutil amonio y 1,6 g (10,2 mmol) de cis-4-t-butilciclohexilamina. La solución se calienta bajo reflujo durante 8 horas, y se agita otras 12 horas a temperatura ambiente. El disolvente se destila, el residuo se revierte en CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> y se lava con HCl 2 N y H<sub>2</sub>O. El residuo se limpia mediante cromatografía flash después de ser secado y concentrado. El rendimiento del compuesto C.6 obtenido es de 2,2 g (6,8 mmol, 70% del rendimiento teórico) y tiene un punto de fusión T<sub>f</sub> de 107-109°C.

<sup>1</sup>H-RMN (CDCl<sub>3</sub>): 8,45 (s, 1 H), 7,10 (s, 1 H), 6,90 (m, 1 H), 4,55 (m, 1 H), 2,05 (d, 2H), 1,75 (m, 2H), 1,60 (m, 2H), 1,30-1,10 (m, 3H), 0,90 (s, 9H)

S.3. (5-cloro-tieno [2,3-d]pirimidin-4-il)-[2-(4-trifluorometoxi-fenil)-etil]-amina (Ejemplo Compuesto C.5)

**[0210]** Se disuelven 0,5 g (2,4 mmol) de 4,5-dicloro-tieno[2,3-d]-pirimidina en 20 ml de tolueno. Posteriormente, se añaden 0,271 g (2,7 mmol) de trietilamina, una cantidad catalítica de yoduro de tetrabutil amonio y 0,55 g (2,7 mmol) de 2-(4-trifluorometoxifenil)etilamina. La solución se calienta bajo reflujo durante 6 horas, y se agita otras 12 horas a temperatura ambiente. El disolvente se destila, el residuo se revierte en CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> y se lava con HCl 2 N y H<sub>2</sub>O. El residuo se agita y se separa por succión con hexano después de ser secado y concentrado. El rendimiento del compuesto C.5 obtenido es de 0,73 g (1,9 mmol, 76% del rendimiento teórico) y tiene un punto de fusión T<sub>f</sub> de 77-79°C.

<sup>1</sup>H-RMN (CDCl<sub>3</sub>): 8,50 (s, 1 H), 7,25 (d, 2H), 7,15 (d, 2H), 7,05 (s, 1 H), 6,55 (bs, 1 H), 3,90 (t, 2H), 3,00 (t, 2H);

## Ejemplos biológicos de la acción contra las plagas

**[0211]** En las siguientes pruebas, si no se indica lo contrario, las soluciones formuladas de algunos de los ejemplos de compuestos se diluyeron a una concentración de principio activo de 300 ppm y las soluciones diluidas se aplicaron en las pruebas mencionadas a continuación.

B.1. Áfido del algodón (*Aphis gossypii*), etapas de la vida mixtas

**[0212]** Los compuestos activos se formularon en acteona/agua 50:50 y 100 ppm de tensioactivo Kinetic®.

**[0213]** Se infestaron plantas de algodón en la etapa de cotiledón antes del tratamiento colocando una hoja fuertemente infestada de la colonia principal de áfidos en la parte superior de cada cotiledón. Se dejaron transferir los áfidos durante la noche y se extrajo la hoja huésped. Los cotiledones infestados se sumergieron a continuación y se agitaron en la solución de ensayo durante 3 segundos y se dejaron secar en una campana de humos. Las plantas de prueba se mantuvieron bajo luz fluorescente en un fotoperiodo de 24 horas a 25°C y una humedad relativa del 20-40%. La mortalidad de los áfidos sobre las plantas tratadas, relativa a la mortalidad en las plantas de comprobación no tratadas, se determinó después de 5 días.

**[0214]** En esta prueba, los compuestos de ejemplo 1-7, 9, 10, 11 y 16-19 proporcionaron a 100 ppm una mortalidad de al menos el 90% de áfidos del algodón (*Aphis gossypii*, etapas de la vida mixtas) en comparación con los controles no tratados.

B.2. Áfido del melocotón verde (*Myzus persicae*), etapas de la vida mixtas

**[0215]** Se infestaron plantas de pimiento en la primera etapa de hoja verdadera antes del tratamiento colocando hojas fuertemente infestadas de la colonia principal de áfidos en la parte superior de las plantas de tratamiento. Se dejaron transferir los áfidos durante la noche para llegar a una infestación de 30-40 áfidos por planta y se extrajeron las hojas huésped. Las hojas infestadas de las plantas de prueba se sumergieron a continuación y se agitaron en la solución de ensayo durante 3 segundos y se dejaron secar en una campana de humos. Las plantas de prueba se mantuvieron bajo luz fluorescente en un fotoperiodo de 24 horas a 25°C y una humedad relativa del 20-40%. La

mortalidad de los áfidos sobre las plantas tratadas, relativa a la mortalidad en las plantas de comprobación no tratadas, se determinó después de 5 días.

5 [0216] En esta prueba, los compuestos de ejemplo 1-7, 9-11, 16-18, 30, 31 y 33 proporcionaron a 100 ppm una mortalidad de al menos el 90% de áfidos del melocotón verde en comparación con los controles no tratados.

B3. Saltamontes de la planta del arroz (*Nilaparvata lugens*)

10 [0217] Se limpiaron y lavaron plántulas de arroz 24 horas antes de la pulverización. Los compuestos activos se formularon en acetona:agua 50:50 y se añadió tensioactivo al 0,1% vol/vol (EL 620). Las plántulas de arroz en maceta se pulverizaron con 5 ml de solución de ensayo, se secaron al aire, se colocaron en jaulas y se inocularon con 10 adultos. Las plantas de arroz tratadas se mantuvieron a 28-29°C y humedad relativa de 50-60%. El porcentaje de mortalidad se registró a las 72 horas.

15 [0218] En esta prueba, los compuestos 1, 2, 5, 6, 7 y 9-11 a 100 ppm mostraron una mortalidad de al menos el 90%.

B.4. Gusano soldado del sur (*spodoptera eridania*), larvas de segundo a tercer estadio

20 [0219] Los compuestos activos se formularon como una solución de 10.000 ppm en una mezcla de acetona y agua al 35%, que se diluyó con agua, si es necesario.

25 [0220] Se sumergió follaje de judía de lima tipo sieva, ampliado a las primeras hojas verdaderas, y se agitó en la solución de ensayo durante 3 segundos y a continuación se dejó secar en una campana de humos. A continuación, la planta tratada se colocó en bolsas de plástico de cierre con cierre perforadas de 25 cm, se añadieron diez larvas del segundo estadio, y se sellaron las bolsas. Después de 4 días, se realizaron observaciones de la mortalidad, la alimentación de la planta, y de cualquier interferencia con el crecimiento de las larvas.

30 [0221] En esta prueba, los compuestos 1, 5, 7, 10, 11 y 15 a 100 ppm mostraron una mortalidad de al menos el 60% en comparación con los controles no tratados.

B.5. Mosca blanca de las hojas plateadas (*Bemisia argentifolii*)

[0222] Los compuestos activos se formularon en acetona:agua 50:50 y 100 ppm de tensioactivo Kinetic®.

35 [0223] Se hicieron crecer plantas de algodón seleccionadas hasta el estado de cotiledón (una planta por maceta). Los cotiledones se sumergieron en la solución de ensayo para proporcionar una cobertura completa del follaje y se colocaron en un lugar bien ventilado para secarse. Cada maceta con plántulas tratadas se colocó en un vaso de plástico y se introdujeron de 10 a 12 adultos de mosca blanca (de aproximadamente 3-5 días de vida). Los insectos se recogieron utilizando un aspirador y un tubo de 0,6 cm no tóxico Tygon® (R-3603) conectado a una punta de pipeta de barrera. La punta, que contenía los insectos recogidos, se insertó a continuación suavemente en el suelo que contenía la planta tratada, permitiendo que los insectos se movieran fuera de la punta para alcanzar el follaje para alimentarse. Los vasos se cubrieron con una tapa de malla reutilizable (malla de poliéster de 150 micras PeCap de Tetko Inc). Las plantas de prueba se mantuvieron en una sala de mantenimiento a aproximadamente 25°C y una humedad relativa del 20 al 40% durante 3 días, evitando la exposición directa a la luz fluorescente (fotoperiodo de 24 horas) para evitar la captura de calor en el interior del vaso. Se evaluó la mortalidad 3 días después del tratamiento de las plantas.

50 [0224] En esta prueba, los compuestos 1-7, 11, 15, 16 y 18 a 100 ppm mostraron una mortalidad de al menos el 90% en comparación con los controles no tratados.

B.6. Escarabajo de la patata de Colorado (*Leptinotarsa decemlineata*)

55 [0225] Se utilizaron plantas de patata para bioensayos. Se sumergieron hojas de las plantas escindidas en diluciones de acetona/agua 1:1 de los compuestos activos. Después de secar las hojas, se colocaron individualmente en papel de filtro humedecido con agua en el fondo de placas de Petri. Cada placa estaba infestada de 5-7 larvas y cubierta con una tapa. Cada dilución del tratamiento se repitió 4 veces. Las placas de prueba se mantuvieron a aproximadamente 27°C y 60% de humedad. El número de larvas vivas y mórbidas se evaluó en cada placa a los 5 días después de la aplicación del tratamiento, y se calculó el porcentaje de mortalidad.

60 [0226] En este ensayo, los compuestos 1-7, 9, 13-16, 18-21 y 25 a 100 ppm mostraron una mortalidad de al menos el 90% en comparación con los controles no tratados.

B.7. Cigarra verde del arroz (*Nephotettix virescens*)

65 [0227] Se limpiaron y lavaron plántulas de arroz 24 horas antes de la pulverización. Los compuestos activos se formularon en acetona:agua 50:50 y se añadió tensioactivo al 0,1% vol/vol (EL 620). Las plántulas de arroz en

maceta se pulverizaron con 5 ml de solución de ensayo, se secaron al aire, se colocaron en jaulas y se inocularon con 10 adultos. Las plantas de arroz tratadas se mantuvieron a 28-29°C y humedad relativa del 50-60%. El porcentaje de mortalidad se registró a las 72 horas.

5 [0228] En esta prueba, los compuestos 2, 7, 5, 6, 10 y 11 a 100 ppm mostraron una mortalidad de al menos el 60%.

B.8 Áfido de judía (*aphis fabae*)

10 [0229] Los compuestos activos se formularon en acetona:agua 50:50 y 100 ppm de tensioactivo Kinetic®.

15 [0230] Se infestaron plantas *Nasturtium* en mezcla Metro en la primera etapa de parejas de hojas (variedad "Mixed Jewle") con aproximadamente 2-30 áfidos criados en laboratorio mediante la colocación de las plantas cortadas infestadas en la parte superior de las plantas de prueba. Las plantas cortadas se extrajeron después de 24 horas. Cada planta se sumergió en la solución de ensayo para proporcionar un recubrimiento completo del follaje, tallo, que sobresale superficie de la semilla y que rodea la superficie del cubo y se dejó secar en la campana de humos. Las plantas tratadas se mantuvieron a aproximadamente 25°C con luz fluorescente continua. La mortalidad del áfido se determinó después de 3 días.

20 [0231] En este ensayo, los compuestos 1-3, 6 y 7 a 100 ppm mostraron una mortalidad de al menos el 60%.

B.9 Áfido de carilla (*aphis craccivora*)

25 [0232] Los compuestos activos se formularon en acetona:agua 50:50. Se pulverizaron plantas de carilla en maceta í colonizadas con 100-150 áfidos de varias etapas después de registrar la población de la plaga. La reducción de la población se registró después de 24, 72 y 120 horas.

[0233] En este ensayo, los compuestos 1-7 9-11, 14-16, 18, 20, 25, 29 y 30 a 100 ppm mostraron una mortalidad de al menos el 75%.

30 Ensayo comparativo:

35 [0234] Los compuestos de la presente invención mostraron además una actividad biológica superior inesperada en comparación con los descritos en el documento EP-A 0447891. La actividad biológica en las tablas B.1 y B.2 se evaluó sobre un intervalo de escala del 0% tal como se muestra que presenta actividad biológica hasta 100 % que tiene el control total. Las pruebas biológicas comparativas se realizaron como se describe anteriormente.

Tabla B.1:

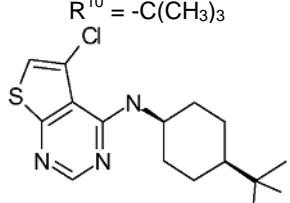
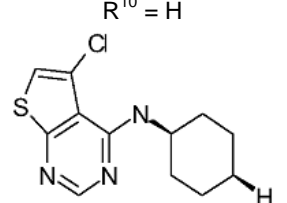
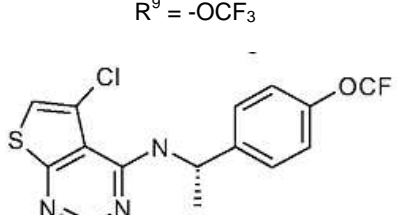
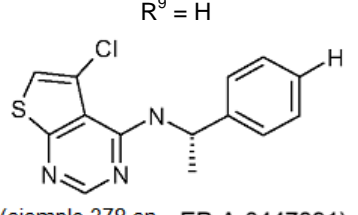
Organismo	Concentración (ppm)	$R^{10} = -C(CH_3)_3$  ejemplo compuesto C.6	$R^{10} = H$  (ejemplo 288 en EP-A 0447891)
<i>Nilaparvata lugens</i>	300	100	0
<i>Aphis gossypii</i>	300	100	75
<i>Myzus persicae</i>	300	100	50
<i>Spodoptera eridania</i>	300	100	0
<i>Bemisia argentifolia</i>	300	100	0

Tabla B.2:

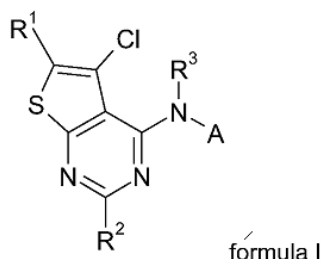
Organismo	Concentración (ppm)	$R^9 = -OCF_3$  ejemplo compuesto C.2	$R^9 = H$  (ejemplo 378 en EP-A-0447891)
-----------	---------------------	---	---

ES 2 565 684 T3

Nilaparvata lugens	300	100	0
Aphis gossypii	300	100	100
Myzus persicae	300	100	100
Bemesia argentifolia	300	100	0

## REIVINDICACIONES

1. Procedimiento no terapéutico para combatir o controlar insectos, arácnidos o nematodos, que comprende poner en contacto un insecto, arácnido o nematodo o su suministro de alimentos, hábitat o sitio de reproducción con una cantidad plaguicida eficaz de al menos un compuesto de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]-pirimidina de fórmula I o una composición que comprende al menos un compuesto de fórmula I



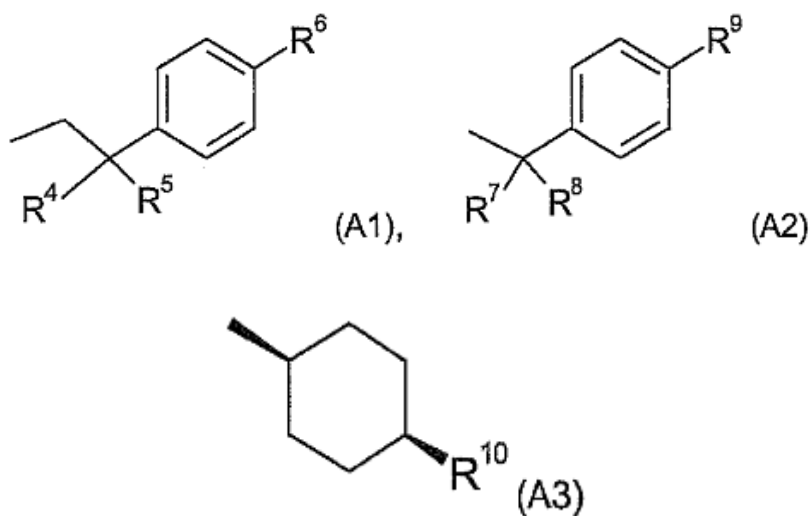
en la que

R<sup>1</sup> se selecciona entre hidrógeno, halógeno, formilo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquenoilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquinilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquenoilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquinilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-tio, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-sulfinilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-sulfonilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-amino, di(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)amino, CN, CNOH, CNOCH<sub>3</sub> o CNOC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>;

R<sup>2</sup> se selecciona entre hidrógeno, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-tio, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-sulfinilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-sulfonilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-amino o di(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)amino;

R<sup>3</sup> es hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>;

A es



en la que

R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>7</sup> se seleccionan independientemente el uno del otro de hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>;

R<sup>8</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>;

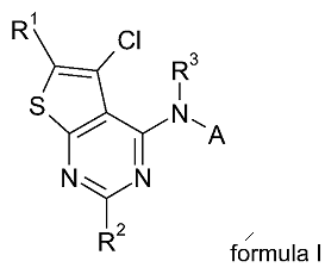
R<sup>6</sup>, R<sup>9</sup> se seleccionan de halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> o haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>;

R<sup>10</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>;

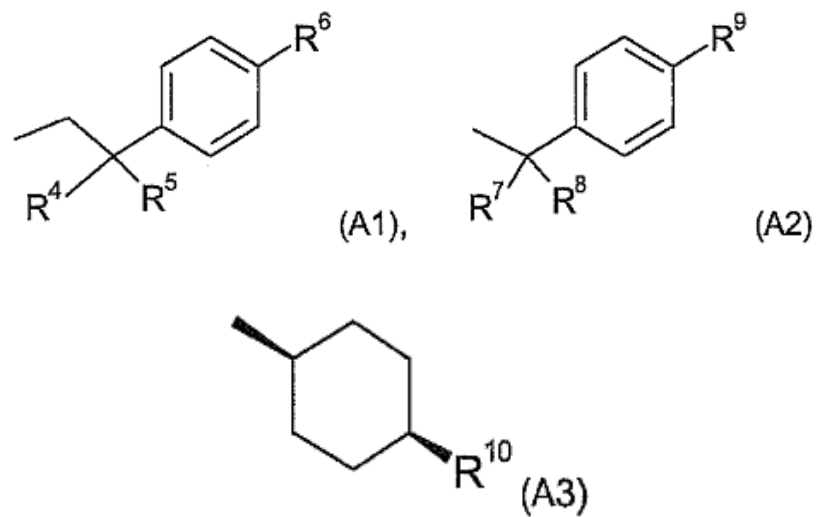
y/o al menos una sal agrícolamente aceptable del mismo.

2. Procedimiento para proteger cultivos y plantas en crecimiento del ataque o infestación por insectos, arácnidos o nematodos, que comprende poner en contacto una planta, o suelo o agua en los que la planta crece, con una cantidad plaguicida eficaz de al menos un compuesto de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]-pirimidina de fórmula I o una composición que comprende al menos un compuesto de fórmula I

5  
10  
15  
20  
25  
30  
35  
40  
45  
50  
55  
60  
65



en la que  
 $R^1$  se selecciona entre hidrógeno, halógeno, formilo, alquilo  $C_1-C_{10}$ , alquenilo  $C_1-C_{10}$ , alquinilo  $C_1-C_{10}$ , haloalquilo  $C_1-C_{10}$ , haloalquenilo  $C_1-C_{10}$ , haloalquinilo  $C_1-C_{10}$ , alcoxi  $C_1-C_{10}$ , alcoxi  $C_1-C_6$ -alquilo  $C_1-C_6$ , haloalcoxi  $C_1-C_{10}$ , alquil  $C_1-C_{10}$ -tio, alquil  $C_1-C_{10}$ -sulfinilo, alquil  $C_1-C_{10}$ -sulfonilo, alquil  $C_1-C_{10}$ -amino, di(alquil  $C_1-C_{10}$ )amino, CN, CNOH, CNOCH<sub>3</sub> o CNOC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>;  
 $R^2$  se selecciona entre hidrógeno, halógeno, alquilo  $C_1-C_{10}$ , haloalquilo  $C_1-C_{10}$ , alcoxi  $C_1-C_{10}$ , alcoxi  $C_1-C_6$ -alquilo  $C_1-C_6$ , haloalcoxi  $C_1-C_{10}$ , alquil  $C_1-C_{10}$ -tio, alquil  $C_1-C_{10}$ -sulfinilo, alquil  $C_1-C_{10}$ -sulfonilo, alquil  $C_1-C_{10}$ -amino o di(alquil  $C_1-C_{10}$ )amino;  
 $R^3$  es hidrógeno o alquilo  $C_1-C_{10}$ ;  
 A es



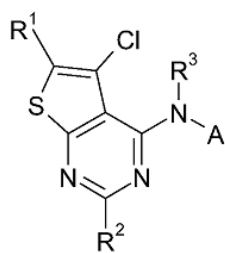
en la que  
 $R^4, R^5, R^7$  se seleccionan independientemente el uno del otro de hidrógeno o alquilo  $C_1-C_{10}$ ;  
 $R^8$  es alquilo  $C_1-C_{10}$ ;  
 $R^6, R^9$  se seleccionan de halógeno, alquilo  $C_1-C_{10}$ , haloalquilo  $C_1-C_{10}$ , alcoxi  $C_1-C_{10}$  o haloalcoxi  $C_1-C_{10}$ ;  
 $R^{10}$  es alquilo  $C_1-C_{10}$  o haloalquilo  $C_1-C_{10}$ ;  
 y/o al menos una sal agrícolamente aceptable del mismo.

3. Procedimiento para proteger semillas de insectos del suelo, y raíces y brotes de plántulas de insectos del suelo y foliares, que comprende poner en contacto las semillas antes de la siembra y/o después de la pregerminación con al menos un compuesto de 4-amino-5-cloro- tieno[2,3-d] pirimidina de fórmula I o una composición que comprende al menos un compuesto de fórmula I:



5

10



fórmula I

15 en la que

R<sup>1</sup> se selecciona entre hidrógeno, halógeno, formilo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alqueno C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquino C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalqueno C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquino C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-tio, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-sulfinilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-sulfonilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-amino, di(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)amino, CN, CNOH, CNOCH<sub>3</sub> o CNOC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>;

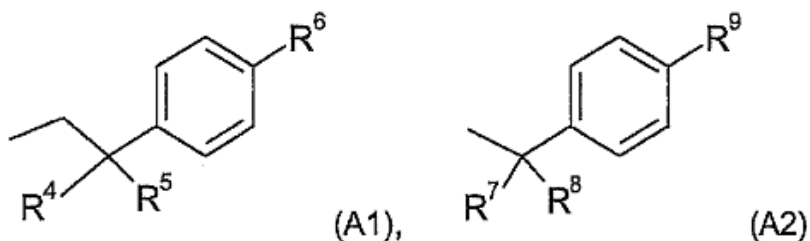
20 R<sup>2</sup> se selecciona entre hidrógeno, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-tio, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-sulfinilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-sulfonilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-amino o di(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)amino;

R<sup>3</sup> es hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>;

A es

25

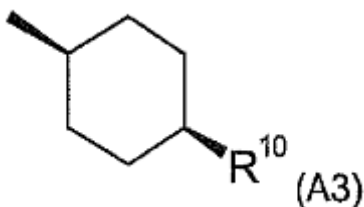
30



35

o

40



45

50 en la que

R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>7</sup> se seleccionan independientemente el uno del otro de hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>;

R<sup>8</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>;

R<sup>6</sup>, R<sup>9</sup> se seleccionan de halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> o haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>;

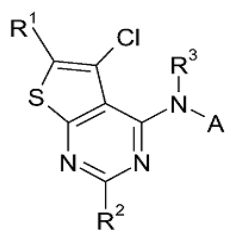
R<sup>10</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>;

y/o al menos una sal agrícolamente aceptable del mismo.

55

4. Compuesto de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]-pirimidina de fórmula I o una composición que comprende al menos un compuesto de fórmula I:

60



fórmula I

65

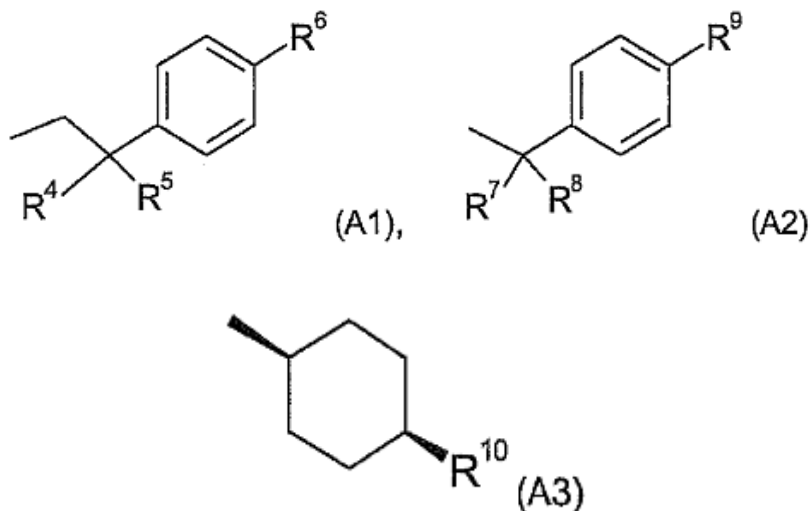
en la que

R<sup>1</sup> se selecciona entre hidrógeno, halógeno, formilo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alqueno C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquino C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalqueno C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquino C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-tio, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-sulfinilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-sulfonilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-amino, di(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)amino, CN, CNOH, CNOCH<sub>3</sub> o CNOC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>;

R<sup>2</sup> se selecciona entre hidrógeno, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-tio, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-sulfinilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-sulfonilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-amino o di(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)amino;

R<sup>3</sup> es hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>;

A es



en la que

R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>7</sup> se seleccionan independientemente el uno del otro de hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>;

R<sup>8</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>;

R<sup>6</sup>, R<sup>9</sup> se seleccionan de halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> o haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>;

R<sup>10</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>;

y/o al menos una sal veterinariamente aceptable del mismo para usar en el tratamiento, control, prevención o protección de animales contra la infestación o infección por parásitos.

5. Procedimiento, según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, o el compuesto o composición para usar, según la reivindicación 4, **caracterizados porque** A del compuesto de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]-pirimidina de fórmula I se define como A1.

6. Procedimiento, según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, o el compuesto o composición para usar, según la reivindicación 4, **caracterizados porque** A del compuesto de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]-pirimidina de fórmula I se define como A2.

7. Procedimiento, según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, o el compuesto o composición para usar, según la reivindicación 4, **caracterizados porque** A del compuesto de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]-pirimidina de fórmula I se define como A2 y representa un enantiómero S.

8. Procedimiento, según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, o el compuesto o composición para usar, según la reivindicación 4, **caracterizados porque** A del compuesto de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]-pirimidina de fórmula I se define como A3.

9. Procedimiento, según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, o el compuesto o composición para usar, según la reivindicación 4, **caracterizados porque** R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> del compuesto de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]-pirimidina de fórmula I se seleccionan independientemente uno del otro de hidrógeno y alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>.

10. Procedimiento, según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, o el compuesto o composición para usar, según la reivindicación 4, **caracterizados porque** R<sup>5</sup> o R<sup>7</sup> del compuesto de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]-pirimidina de fórmula I es hidrógeno.

11. Procedimiento, según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, o el compuesto o composición para usar, según la reivindicación 4, **caracterizados porque** R<sup>10</sup> del compuesto de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]-pirimidina de fórmula I es un alquilo C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>.

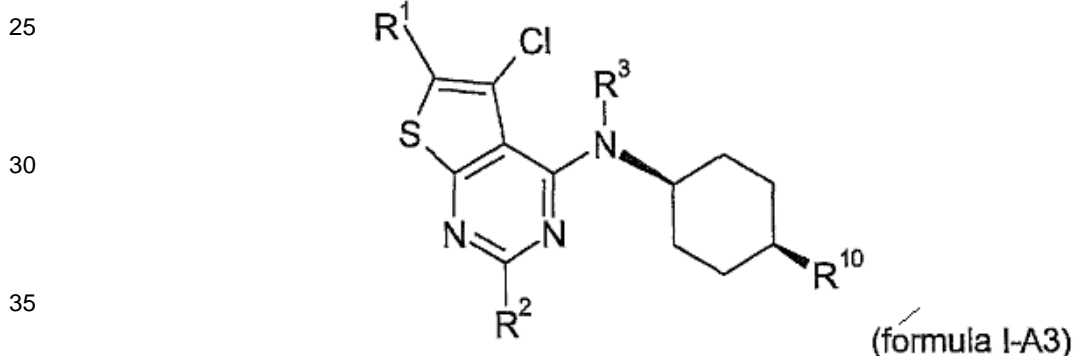
5 12. Procedimiento, según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, o el compuesto o composición para usar, según la reivindicación 4, **caracterizados porque** R<sup>10</sup> del compuesto de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]-pirimidina de fórmula I es isopropilo, sec-butilo o terc-butilo.

10 13. Procedimiento, según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, o el compuesto o composición para usar, según la reivindicación 4, **caracterizados porque** el compuesto de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]-pirimidina de fórmula I es (5-cloro-tieno[2,3-d]pirimidin-4-il)-[1-S-(4-trifluorometoxi-fenil)-etil]-amina.

15 14. Procedimiento, según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, o el compuesto o composición para usar, según la reivindicación 4, **caracterizados porque** R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> del compuesto de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]-pirimidina de fórmula I es cis-(4-terc-butil-ciclohexil)-(5-cloro-tieno[2,3-d]pirimidin-4-il)-amina.

20 15. Procedimiento, según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, o el compuesto o composición para usar, según la reivindicación 4, **caracterizados porque** R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> del compuesto de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]-pirimidina de fórmula I es (5-cloro-tieno[2,3-d]pirimidin-4-il)-[2-(4-trifluorometoxi-fenil)-etil]-amina.

16. Un compuesto de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]-pirimidina de fórmula I-A3:



40 en la que  
R<sup>1</sup> se selecciona entre hidrógeno, halógeno, formilo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquenilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquinilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquenilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquinilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-tio, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-sulfínilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-sulfonilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-amino, di(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)amino, CN, CNOH, CNOCH<sub>3</sub> O CNOC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>;

45 R<sup>2</sup> se selecciona entre hidrógeno, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-tio, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-sulfínilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-sulfonilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-amino, di(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)amino;

R<sup>3</sup> es hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>;

R<sup>10</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>,

50 y/o al menos una sal agrícola o veterinariamente aceptable del mismo.

17. Compuestos de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]-pirimidina de fórmula I-A3, según la reivindicación 16, en los que R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> se seleccionan independientemente el uno del otro de hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>.

55 18. Compuestos de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]-pirimidina de fórmula I-A3, según la reivindicación 16, en los que R<sup>10</sup> es un alquilo C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> ramificado.

19. Compuestos de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]-pirimidina de fórmula I-A3, según la reivindicación 16, en los que R<sup>10</sup> es isopropilo, sec-butilo o terc-butilo.

60 20. cis-(4-terc-butil-ciclohexil)-(5-cloro-tieno[2,3-d]pirimidin-4-il)-amina.

21. Compuesto de fórmula I que es (5-cloro-tieno[2,3-d]pirimidin-4-il)-[1-S-(4-trifluorometoxi-fenil)-etil]-amina.

22. Composición agrícola o veterinaria que comprende al menos un compuesto de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]-pirimidina de fórmula I, según cualquiera de las reivindicaciones 16 a 20, o el enantiómero, diastereómero o sal del mismo, y al menos un portador líquido y/o sólido inerte.
- 5 23. Compuesto o composición para usar, según la reivindicación 4, en los que el compuesto de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]-pirimidina de fórmula I, tal como se define en cualquiera de la reivindicación 4 o las reivindicaciones 5 a 15, o sal veterinariamente aceptable del mismo, para la administración o aplicación oral, tópica o parenteral a los animales.
- 10 24. Procedimiento, según la reivindicación 3, en el que el compuesto de 4-amino-5-cloro-tieno[2,3-d]-pirimidina de fórmula I, se aplica en una cantidad de 100 mg a 10 kg por 100 kg de semillas.
25. Procedimiento, según la reivindicación 3, en el que se protegen las raíces y brotes de la planta resultante.
- 15 26. Semilla que comprende un compuesto de fórmula I o una sal agrícolamente útil de I, tal como se define en cualquiera de las reivindicaciones 3 ó 5 a 17, en una cantidad de 0,1 g a 10 kg por 100 kg de semilla.
- 20