

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 567 183**

51 Int. Cl.:

A01N 43/78 (2006.01)

A01P 7/04 (2006.01)

C07D 401/14 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **04.07.2009** **E 12191542 (5)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **20.01.2016** **EP 2583556**

54 Título: **Compuestos heterocíclicos como pesticidas**

30 Prioridad:

17.07.2008 EP 08012898

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

20.04.2016

73 Titular/es:

BAYER CROPSCIENCE AG (100.0%)
BCS-BPA-LP-PL, Gebäude 6100, Alfred-Nobel-
Strasse 50
40789 Monheim, DE

72 Inventor/es:

BRETSCHNEIDER, THOMAS;
FÜSSLEIN, MARTIN;
HENSE, ACHIM;
KLUTH, JOACHIM;
FRANKEN, EVA-MARIA;
GÖRGENS, ULRICH;
SCHWARZ, HANS-GEORG;
KÖHLER, ADELINE;
MALSAM, OLGA;
VOERSTE, ARND y
BECKER, ANGELA

74 Agente/Representante:

CARPINTERO LÓPEZ, Mario

ES 2 567 183 T3

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

DESCRIPCIÓN

Compuestos heterocíclicos como pesticidas

5 La presente solicitud se refiere al uso de compuestos heterocíclicos, algunos de los cuales se conocen por controlar plagas de animales, incluidos artrópodos y, en particular, insectos, además a compuestos heterocíclicos novedosos y procedimientos para su preparación.

10 Ciertos compuestos de tiazolilo ya se conocen; sin embargo no se ha descrito un uso para controlar plagas de animales (cf. el documento WO 2003/015776).

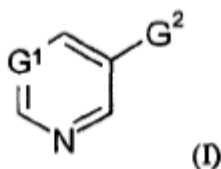
15 También se conocen los compuestos de tiadiazol. Los documentos CH 411 906 y EP 0 288 432 A1 describen el uso de dichos compuestos como abrillantadores ópticos. En el documento CH 409 511 se divulgan tiadiazoles adecuados para controlar nematodos. El documento DE 3641184 describe ciertos tiadiazoles sustituidos con fenilo para controlar plagas. A.S. Mane y col. describen en Orient J. Chem., 16(3) 475-478 (2000) la preparación de tiazoles sustituidos con fenilo y su ensayo sobre la actividad frente a determinados nematodos.

En los documentos WO 1998/056785 y WO 1996/032938 se divulgan compuestos de pirazol, para los cuales se establecen aplicaciones farmacéuticas.

20 Los agentes de protección de cultivos modernos tienen que satisfacer muchas demandas, por ejemplo con respecto a la eficacia, persistencia y espectro de su acción y uso posible. Las cuestiones de toxicidad, la combinación con otros principios activos o auxiliares de formulación juegan un rol, así como la cuestión del gasto que requiere la síntesis de un compuesto activo. Además, se pueden presentar resistencias. Por todas estas razones, la búsqueda de agentes de protección de cultivo novedosos no se puede considerar terminada, y hay una necesidad constante de compuestos novedosos con propiedades mejoradas, comparadas con los compuestos conocidos, al menos en relación con los aspectos individuales.

25 Era un objetivo de la presente invención proporcionar compuestos que aumentasen el espectro de pesticidas en varios aspectos.

30 Este objetivo y otros objetivos, que no están explícitamente mencionados, que se pueden derivar o deducir de los contextos explicados en este documento, se logran, en parte, mediante compuestos novedosos de la fórmula (I),

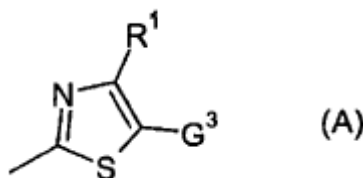


35 en la que

(Ia)

40 G¹ representa C-halógeno

G² representa



en la que

45 R¹ representa hidrógeno o alquilo y

G³ representa heterociclilo dado el caso sustituido, heteroarilo dado el caso sustituido o arilo dado el caso sustituido,

50 así como sales, complejos de metales y N-óxidos de los compuestos de la fórmula (I), que se pueden usar para controlar plagas.

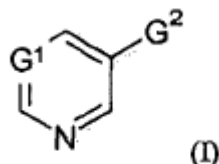
Se descubrió que los compuestos de la fórmula I poseen propiedades biológicas muy marcadas y son adecuados

sobre todo para controlar plagas de animales, en particular, insectos, arácnidos y nematodos, que se encuentran en la agricultura, en bosques, en la protección de productos y materiales almacenados, y en el sector de la higiene.

5 Los compuestos conocidos de la fórmula (I) se consiguen según los procedimientos de preparación que se describen en las publicaciones mencionadas anteriormente.

Los sustituyentes y las zonas preferentes de los radicales enumerados en los compuestos (I) mencionados anteriormente se explican a continuación.

10 Se da preferencia particular al uso de compuestos de la fórmula (I),



en la que

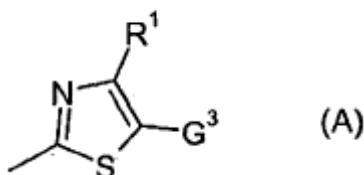
15

(Ia)

G¹ representa C-halógeno

20

G² representa



en la que

25

R¹ representa hidrógeno o alquilo y

G³ representa oxazolínilo, dihidrooxadiazínilo, dihidrodioxanínilo o hidroxipiridínilo dado el caso sustituidos con halógeno, ciano, nitro, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, haloalquiltio, alquilsulfínilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfínilo, haloalquilsulfonilo, amino, alquilamino, dialquilamino, alquilcarbonilamino, alcoxycarbonilamino, alcoxialquilo, haloalcoxialquilo, alquenilo, alquenilo, alquilocicloalquilo, alquilcarbonilo, alcoxycarbonilo, aminocarbonilo, piridilo o pirimidilo,

30

representa hetarilo del grupo constituido por pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, benzofurilo, bencisofurilo, benzotienilo, bencisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, bencisotiazolilo, benzoxazolilo, bencisoxazolilo, bencimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazol, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo e indolizínilo, en particular, piridilo, pirimidilo, imidazolilo, pirazolilo, triazinilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxadiazolilo u oxazolilo, dado el caso sustituido con halógeno, nitro, amino, alquilamino, dialquilamino, alquilo, haloalquilo, cicloalquilalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, alcoxialquilo, bis(alcoxi)alquilo, alcoxycarbonilo, alfa-hidroxiiminoalcoxycarbonilmetilo, alfa-alcoxiiminoalcoxycarbonilmetilo, C(X)NR²R³, (en el que X representa oxígeno o azufre, R² representa hidrógeno o alquilo y R³ representa alquilo, haloalquilo, alcoxi, cianoalquilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, alcoxialquilo, alquiltioalquilo o arilalquilo), alquilsulfínilo, alquilsulfonilo, los radicales heterocíclico morfolínilo, triazolinonilo, dihidrodioxazinilo, dihidrooxadiazínilo, dioxolanilo, dioxanilo, piperidinonilo, pirrolidinonilo y pirazolinonilo (que por su parte pueden estar sustituidos con alquilo o haloalquilo), fenilo (que por su parte puede estar sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo o haloalquilo), los radicales heteroarilo pirrolilo, piridilo, piridilo N-óxido, pirimidilo, imidazolilo, pirazolilo, oxazolilo, tiazolilo, furanilo, tienilo, triazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, pirazinilo, triazinilo, tetrazinilo e isoquinolinilo (que por su parte pueden estar sustituidos con halógeno, nitro, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alcoxialquilo, alquiltio, alquiltioalquilo y cicloalquilo), los radicales heteroarilalquilo triazolilalquilo, piridilalquilo, pirimidilalquilo u oxadiazolilalquilo (que por su parte pueden estar sustituidos con alquilo) o

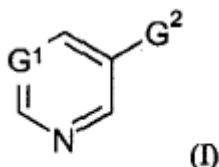
50

representa fenilo dado el caso sustituido con halógeno, ciano, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, piperidinonilo, pirrolidinonilo, dioxolanilo o dihidrodioxazinilo,

así como sales y N-óxidos de los compuestos de la fórmula (I).

5

Se da preferencia particular al uso de compuestos de la fórmula (I),

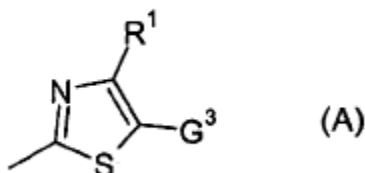


10 en la que

(Ia)

15 G^1 representa C-halógeno

G^2 representa



20 en la que

R^1 representa hidrógeno o alquilo C_1-C_6 y

25 G^3 representa en cada caso oxazolinilo, dihidrooxadiazinilo, dihidrodioxazinilo o hidroxipiridilo dado el caso sustituidos con halógeno, ciano, nitro, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , alquil C_1-C_6 -tio, haloalquil C_1-C_6 -tio, alquil C_1-C_6 -sufinilo, alquil C_1-C_6 -sulfonilo, haloalquil C_1-C_6 -sufinilo, haloalquil C_1-C_6 -sulfonilo, amino, alquil C_1-C_6 -amino, di(alquil C_1-C_6)amino, alquil C_1-C_6 -carbonilamino, alcoxi C_1-C_6 -carbonilamino, alcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , alquil C_1-C_6 -cicloalquilo C_3-C_6 , alquil C_1-C_6 -carbonilo, alcoxi C_1-C_6 -carbonilo, aminocarbonilo, piridilo o pirimidilo,

30

representa en cada caso pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, benzofurilo, bencisofurilo, benzotienilo, bencisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, bencisotiazolilo, benzoxazolilo, bencisoxazolilo, bencimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazol, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo e indolizininilo (en particular, piridilo, pirimidilo, imidazolilo, pirazolilo, triazinilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxadiazolilo u oxazolilo), dado el caso sustituidos con halógeno, nitro, amino, alquil C_1-C_6 -amino, di(alquil C_1-C_6)amino, alquilo C_1-C_6 , halógenoalquilo C_1-C_6 , cicloalquil C_3-C_6 -alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , alquil C_1-C_6 -tio, alcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 , bis(alcoxi C_1-C_6)-alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 -carbonilo, alfa-hidroxiimino-alcoxi C_1-C_6 -carbonilmetilo, alfa-alcoxi C_1-C_6 -iminoalcoxi C_1-C_6 -carbonilmetilo, $C(X)NR^2R^3$, (en el que X representa oxígeno o azufre, R^2 representa hidrógeno o alquilo C_1-C_6 y R^3 representa alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , ciano-alquilo C_1-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 -alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 , alquil C_1-C_6 -tioalquilo C_1-C_6 o fenilalquilo C_1-C_6), alquil C_1-C_6 -sufinilo, alquil C_1-C_6 -sulfonilo, los radicales heterocíclico morfolinilo, triazolinonilo, dihidrodioxazinilo, dihidrooxadiazinilo, dioxolanilo, dioxanilo, piperidinonilo, pirrolidinonilo y pirazolinonilo (que por su parte pueden estar sustituidos con alquilo C_1-C_6 o haloalquilo C_1-C_6), fenilo (que por su parte puede estar sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo C_1-C_6 o haloalquilo C_1-C_6), los radicales heteroarilo pirrolilo, piridilo, piridilo N-óxido, pirimidilo, imidazolilo, pirazolilo, oxazolilo, tiazolilo, furanilo, tienilo, triazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, pirazinilo, triazinilo, tetrazinilo e isoquinolinilo (que por su parte pueden estar sustituidos con halógeno, nitro, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 , alquil C_1-C_6 -tio, alquil

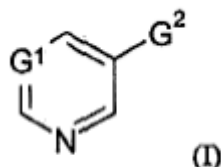
50

C₁-C₆-tioalquilo C₁-C₆ y cicloalquilo C₃-C₆), los radicales heteroarilalquilo triazolil-alquilo C₁-C₆, piridil-alquilo C₁-C₆, pirimidil-alquilo C₁-C₆ o oxadiazolil-alquilo C₁-C₆ (que por su parte pueden estar sustituidos con alquilo C₁-C₆) o

5 representa fenilo dado el caso sustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, dioxolanilo, piperidinonilo, pirrolidinonilo o dihidrodioxazinilo,

así como sales y N-óxidos de los compuestos de fórmula (I).

10 Se da preferencia muy particular al uso de los compuestos de fórmula (I),

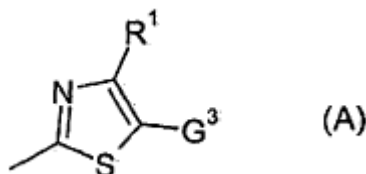


en la que

(Ia)

15 G¹ representa C-halógeno

G² representa



20 en la que

R¹ representa hidrógeno o alquilo C₁-C₄ (en especial metilo y)

25 G³ representa en cada caso oxazolinilo, dihidrooxadiazinilo, dihidrodioxazinilo o hidroxipiridilo dado el caso sustituidos con halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio, haloalquil C₁-C₄-tio, alquil C₁-C₄-sufinilo, alquil C₁-C₄-sulfonilo, haloalquil C₁-C₄-sufinilo, haloalquil C₁-C₄-sulfonilo, amino, alquil C₁-C₄-amino, di(alquil C₁-C₄)amino, alquil C₁-C₄-carbonilamino, alcoxi C₁-C₄-carbonilamino, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, alquil C₁-C₄-cicloalquilo C₃-C₆, aquil C₁-C₄-carbonilo, alcoxi C₁-C₄-carbonilo, aminocarbonilo, piridilo o pirimidilo,

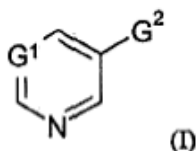
30 representa en cada caso pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, benzofurilo, bencisofurilo, benzotienilo, bencisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, bencisotiazolilo, benzoxazolilo, bencisoxazolilo, bencimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazol, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo e indolizininilo (en particular, piridilo, pirimidilo, imidazolilo, pirazolilo, triazinilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxadiazolilo u oxazolilo), dado el caso sustituidos con halógeno, nitro, amino, alquil C₁-C₄-amino, di(alquilo C₁-C₄)amino, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, bis(alcoxi C₁-C₄)alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-carbonilo, alfa-hidroxiimino-alcoxi C₁-C₄-carbonilmetilo, alfa-alcoxi C₁-C₄-iminoalcoxi C₁-C₄-carbonilmetilo, C(X)NR²R³, (en el que X representa oxígeno o azufre, R² representa hidrógeno o alquilo C₁-C₄ y R³ representa alquilo C₁-C₅, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆, ciano-alquilo C₁-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio-alquilo C₁-C₄ o fenil-alquilo C₁-C₄), alquil C₁-C₄-sufinilo, alquil C₁-C₄-sulfonilo, los radicales heterocíclico morfolinilo, triazolinonilo, dihidrodioxazinilo, dihidrooxadiazinilo, dioxolanilo, dioxanilo, piperidinonilo, pirrolidinonilo y pirazolinonilo (que por su parte pueden estar sustituidos con alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄), fenilo (que por su parte puede estar sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄), los radicales heteroarilo pirrolilo, piridilo, piridilo N-óxido, pirimidilo, imidazolilo, pirazolilo, oxazolilo, tiazolilo, furanilo, tienilo, triazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, pirazinilo, triazinilo, tetrazinilo e isoquinolinilo (que por su parte pueden estar sustituidos con halógeno, nitro, alquilo

C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio, alquil C₁-C₄-tioalquilo C₁-C₄ y cicloalquilo C₃-C₆), los radicales heteroarilalquilo triazolil-alquilo C₁-C₄, piridil-alquilo C₁-C₄, pirimidil-alquilo C₁-C₄ u oxadiazolil-alquilo C₁-C₄ (que por su parte pueden estar sustituidos con alquilo C₁-C₄) o

5 representa fenilo dado el caso sustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, dioxolanilo, piperidinonilo, pirrolidinonilo o dihidrodioxazinilo,

asi como sales y N-óxidos de los compuestos de fórmula (I).

10 Se usan con muy especial preferencia compuestos de fórmula (I),

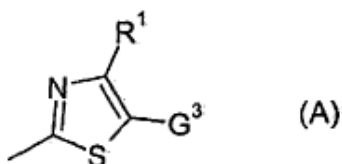


en la que

(Ia)

15 G¹ representa C-halógeno (en particular CF),

G² representa



en la que

R¹ representa hidrógeno o metilo y

20 G³ representa en cada caso oxazolinilo, dihidrooxadiazinilo o hidroxipiridilo dado el caso sustituidos con piridilo o pirimidinilo,

representa en cada caso pirazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, 1,3,5-triazinilo, triazinilo u oxadiazolilo, dado el caso sustituidos con halógeno (en particular, cloro, bromo), nitro, amino, haloalquilo C₁-C₄ (en particular, CF₃, CF₃CH₂, CF₃CF₂, CF₂Cl, CF₃CF₂CF₂, CH₃CHF), cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ (en particular, ciclopropilmetilo), alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ (en particular, metoximetilo), bis(alcoxi C₁-C₄)-alquilo C₁-C₄ (en particular, (CH₃O)₂CH), alcoxi C₁-C₄-carbonilo (en particular, metoxicarbonilo), alfa-hidroxiimino-alcoxi C₁-C₄-carbonilmetilo, C(X)NR²R³, (en el que X representa oxígeno o azufre, R² representa hidrógeno y R³ representa alquilo C₁-C₅ (en particular, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, isobutilo, terc-butilo, (CH₃)₂C(CH₃)₂), haloalquilo C₁-C₄ (en particular, CF₃CH₂), alcoxi C₁-C₄ (en particular, metoxi, etoxi, propiloxi) ciano-alquilo C₁-C₄ (en particular, NCCH₂CH(C₂H₅)), cicloalquilo C₃-C₆ (en particular, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo), cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ (en particular ciclopropilmetilo), alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ (en particular, CH₃OCH₂, CH₃OCH₂CH(CH₃), CH₃CH₂CH₂OCH₂CH(CH₃), CH₃CH₂OCH₂CH₂, CH₃OCH₂CH₂CH₂, CH₃OCH₂CHC₂H₅, CH₃CH₂OCH₂CH(CH₃), CH₃CH₂OCH₂CH₂CH₂, CH₃OC(CH₃)₂), alquil C₁-C₄-tioalquilo C₁-C₄ (en particular, CH₃SCH₂CH₂) o fenil-alquilo C₁-C₄ (en particular, C₆H₅CH(CH₃)), alquil C₁-C₄-tio (en particular, metiltio), alquil C₁-C₄-sulfonilo (en particular, CH₃SO₂), los radicales heterociclilo morfolinilo, triazolinonilo, dihidrodioxazinilo, dihidrooxadiazinilo, piperidinonilo, pirrolidinonilo y pirazolinonilo (que por su parte pueden estar sustituidos con alquilo C₁-C₄ (en particular, metilo) o haloalquilo C₁-C₄ (en particular, CF₃)), fenilo (que por su parte pueden estar sustituidos con halógeno (en particular, flúor, cloro)), los radicales heteroarilo pirrolilo, piridilo, piridilo N-óxido, pirimidinilo, pirazolilo, tiazolilo, furanilo, tienilo, triazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, pirazinilo, triazinilo e isoquinolinilo (que por su parte pueden estar sustituidos con halógeno (en particular, flúor, cloro), nitro, alquilo C₁-C₄ (en particular, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, terc-butilo), haloalquilo C₁-C₄ (en particular, CF₃, CHF₂, CFCIH), alcanodiilo C₃-C₄, (en particular, CH₂CH₂CH₂), alcoxi C₁-C₄ (en particular, metoxi, etoxi), cicloalquilo C₃-C₆ (en particular, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo)), los radicales heteroarilalquilo triazolil-alquilo C₁-C₄ (en particular triazolilmetilo), piridil-alquilo C₁-C₄ (en particular piridilmetilo), pirimidinil-alquilo C₁-C₄ (en particular pirimidinilmetilo) o

oxadiazolil–alquilo C₁–C₄ (en particular, oxadiazolilmetilo (que por su parte pueden estar sustituidos con
alquilo C₁–C₄ (en particular, metilo)) o

5 representa fenilo dado el caso sustituido con halógeno (especialmente cloro), haloalquilo C₁–C₄
(especialmente CF₃), dioxolanilo, piperidinonilo, pirrolidinonilo o dihidrodioxazinilo,

asi como sales y N–óxidos de los compuestos de fórmula (I).

10 Los radicales sustituidos con halógeno (también se abrevian como “halo”), por ejemplo, haloalquilo, son mono– o
polihalogenados hasta el número máximo posible de sustituyentes. En caso de polihalogenación, los átomos de
halógeno pueden ser idénticos o diferentes. Además halógeno representa flúor cloro, bromo y yodo, en particular,
flúor, cloro y bromo, con énfasis en flúor y cloro.

15 También se denomina al radical “pirimidilo” como “pirimidinilo”.

Se da preferencia, preferencia particular o preferencia muy particular al uso de compuestos que tienen los
sustituyentes enumerados en cada caso como preferentes, particularmente preferentes o muy particularmente
preferentes.

20 Los radicales de hidrocarburo saturados o no saturados, como alquilo o alqueno, pueden en cada caso ser de
cadena recta o ramificados en la medida que sea posible, incluido en combinación con heteroátomos, como por
ejemplo en alcoxi.

25 Los radicales dado el caso sustituidos pueden ser mono– o polisustituidos, por lo que en el caso de polisustitución
los sustituyentes pueden ser idénticos o diferentes.

Las definiciones de radical preferentes o generales o ilustraciones enumeradas anteriormente se aplican a los
productos finales y, por consiguiente, a los materiales de partida e intermediarios. Estas definiciones de radical se
pueden combinar unas con otras como se desee, es decir, también entre los rangos preferentes respectivos.

30 Se da preferencia de acuerdo con la invención al uso de compuestos de la fórmula (I) que contiene una combinación
de los significados enumerados anteriormente como preferentes.

35 Se da particular preferencia de acuerdo con la invención al uso de compuestos de la fórmula (I) que contiene una
combinación de los significados enumerados anteriormente como particularmente preferentes.

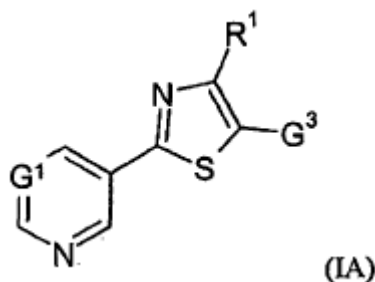
Se da preferencia muy particular de acuerdo con la invención al uso de compuestos de la fórmula (I) que contienen
una combinación de los significados enumerados anteriormente como muy particularmente preferentes.

40 En otro grupo preferido de compuestos (Ia) que se van a usar de acuerdo con la invención G¹ representa C–halógeno
y R¹ representa hidrógeno.

45 En otro grupo preferido de compuestos (Ia) que se van a usar de acuerdo con la invención G¹ representa C–halógeno
y R¹ representa metilo.

Los compuestos de la fórmula (I) pueden estar presentes, dado el caso, en diferentes formas polimórficas o como
una mezcla de diferentes formas polimórficas. Son objetivo de la invención tanto las mezclas polimórficas puras como
también las polimórficas, y ambas pueden usarse de acuerdo con la invención.

50 La presente invención se refiere, además, a compuestos novedosos de la fórmula (IA)



en la que

G¹ representa C–halógeno,

- R¹ representa hidrógeno y
- G³ representa oxazolinilo, dihidrooxadiazinilo, dihidrodioxazinilo o hidroxipiridilo dado el caso sustituidos con halógeno, ciano, nitro, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, haloalquiltio, alquilsulfino, alquilsulfonilo, haloalquilsulfino, haloalquilsulfonilo, amino, alquilamino, dialquilamino, alquilcarbonilamino, alcoxycarbonilamino, alcoxialquilo, haloalcoxialquilo, alquenilo, alquinilo, alquilocicloalquilo, alquilcarbonilo, alcoxycarbonilo, aminocarbonilo, piridilo o pirimidilo,
- representa hetarilo del grupo constituido por pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, benzofurilo, bencisofurilo, benzotienilo, bencisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, bencisotiazolilo, benzoxazolilo, bencisoxazolilo, bencimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazol, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo e indolizininilo, en particular, piridilo, pirimidilo, imidazolilo, pirazolilo, triazinilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxadiazolilo u oxazolilo, dado el caso sustituido con halógeno, nitro, amino, alquilamino, dialquilamino, alquilo, haloalquilo, cicloalquilalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, alcoxialquilo, bis(alcoxi)alquilo, alcoxycarbonilo, alfa-hidroxiiminoalcoxycarbonilmetilo, alfa-alcoxiiminoalcoxycarbonilmetilo, C(X)NR²R³, (en el que X representa oxígeno o azufre, R² representa hidrógeno o alquilo y R³ representa alquilo, haloalquilo, alcoxi, cianoalquilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, alcoxialquilo, alquiltioalquilo o arilalquilo), alquilsulfino, alquilsulfonilo, los radicales heterociclilo morfolinilo, triazolinonilo, dihidrodioxazinilo, dihidrooxadiazinilo, dioxolanilo, dioxanilo, piperidinonilo, pirrolidinonilo y pirazolinonilo (que por su parte pueden estar sustituidos con alquilo o haloalquilo), fenilo (que por su parte puede estar sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo o haloalquilo), los radicales heteroarilo pirrolilo, piridilo, piridilo N-óxido, pirimidilo, imidazolilo, pirazolilo, oxazolilo, tiazolilo, furanilo, tienilo, triazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, pirazinilo, triazinilo, tetrazinilo e isoquinolinilo (que por su parte pueden estar sustituidos con halógeno, nitro, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alcoxialquilo, alquiltio, alquiltioalquilo y cicloalquilo), los radicales heteroarilalquilo triazolilalquilo, piridilalquilo, pirimidilalquilo u oxadiazolilalquilo (que por su parte pueden estar sustituidos con alquilo) o
- representa fenilo dado el caso sustituido con halógeno, ciano, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, dioxanilo, piperidinonilo, pirrolidinonilo, o dihidrodioxazinilo.
- Se da preferencia a compuestos novedosos de la fórmula (IA) en la que
- G¹ representa C-halógeno,
- R¹ representa hidrógeno y
- G³ representa en cada caso oxazolinilo, dihidrooxadiazinilo, dihidrodioxazinilo o hidroxipiridilo dado el caso sustituidos con halógeno, ciano, nitro, alquil C₁-C₆-tio, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-tio, haloalquil C₁-C₆-tio, alquil C₁-C₆-sufino, alquil C₁-C₆-sulfonilo, haloalquil C₁-C₆-sufino, haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, amino, alquil C₁-C₆-amino, di(alquil C₁-C₆)amino, alquil C₁-C₆-carbonilamino, alcoxi C₁-C₆-carbonilamino, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alquil C₁-C₆-cicloalquilo C₃-C₆, alquil C₁-C₆-carbonilo, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, aminocarbonilo, piridilo o pirimidilo,
- representa en cada caso pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, benzofurilo, bencisofurilo, benzotienilo, bencisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, bencisotiazolilo, benzoxazolilo, bencisoxazolilo, bencimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazol, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo e indolizininilo (en particular, piridilo, pirimidilo, imidazolilo, pirazolilo, triazinilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxadiazolilo u oxazolilo), dado el caso sustituidos con halógeno, nitro, amino, alquil C₁-C₆-amino, di(alquil C₁-C₆)amino, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-tio, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, bis(alcoxi C₁-C₆)alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, alfa-hidroxiimino-alcoxi C₁-C₆-carbonilmetilo, alfa-alcoxi C₁-C₆-iminoalcoxi C₁-C₆-carbonilmetilo, C(X)NR²R³, (en el que X representa oxígeno o azufre, R² representa hidrógeno o alquilo C₁-C₆ y R³ representa alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, ciano-alquilo C₁-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquil C₁-C₆-tioalquilo C₁-C₆ o fenilalquilo C₁-C₆), alquil C₁-C₆-sufino, alquil C₁-C₆-sulfonilo, los radicales heterociclilo morfolinilo, triazolinonilo, dihidrodioxazinilo, dihidrooxadiazinilo, dioxolanilo, dioxanilo, piperidinonilo, pirrolidinonilo y pirazolinonilo (que por su parte pueden estar sustituidos con alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆), fenilo (que por su parte puede estar sustituido con halógeno, ciano,

nitro, alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆), los radicales heteroarilo pirrolilo, piridilo, piridilo N-óxido, pirimidilo, imidazolilo, pirazolilo, oxazolilo, tiazolilo, furanilo, tienilo, triazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, pirazinilo, triazinilo, tetrazinilo e isoquinolinilo (que por su parte pueden estar sustituidos con halógeno, nitro, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquil C₁-C₆-tio, alquil C₁-C₆-tioalquilo C₁-C₆ y cicloalquilo C₃-C₆), los radicales heteroarilalquilo triazolil-alquilo C₁-C₆, piridil-alquilo C₁-C₆, pirimidil-alquilo C₁-C₆ o oxadiazolil-alquilo C₁-C₆ (que por su parte pueden estar sustituidos con alquilo C₁-C₆) o

representa fenilo dado el caso sustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, dioxolanilo, piperidinonilo, pirrolidinonilo o dihidrodioxazinilo.

Se da particular preferencia a compuestos novedosos de la fórmula (IA) en la que

G¹ representa N, CH o C-halógeno,

R¹ representa hidrógeno y

G³ representa en cada caso oxazolinilo, dihidrooxadiazinilo, dihidrodioxazinilo o hidroxipiridilo dado el caso sustituidos con halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio, haloalquil C₁-C₄-tio, alquil C₁-C₄-sufinilo, alquil C₁-C₄-sulfonilo, haloalquil C₁-C₄-sufinilo, haloalquil C₁-C₄-sulfonilo, amino, alquil C₁-C₄-amino, di(alquil C₁-C₄)amino, alquil C₁-C₄-carbonilamino, alcoxi C₁-C₄-carbonilamino, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, alquil C₁-C₄-cicloalquilo C₃-C₆, alquil C₁-C₄-carbonilo, alcoxi C₁-C₄-carbonilo, aminocarbonilo, piridilo o pirimidilo,

representa en cada caso pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, benzofurilo, bencisofurilo, benzotienilo, bencisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, bencisotiazolilo, benzoxazolilo, bencisoxazolilo, bencimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazol, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo e indolizininilo (en particular, piridilo, pirimidilo, imidazolilo, pirazolilo, triazinilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxadiazolilo u oxazolilo), dado el caso sustituidos con halógeno, nitro, amino, alquil C₁-C₄-amino, di(alquilo C₁-C₄)amino, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, bis(alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-carbonilo, alfa-hidroxiimino-alcoxi C₁-C₄-carbonilmetilo, alfa-alcoxi C₁-C₄-iminoalcoxi C₁-C₄-carbonilmetilo, C(X)NR²R³, (en el que X representa oxígeno o azufre, R² representa hidrógeno o alquilo C₁-C₄ y R³ representa alquilo C₁-C₅, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆, ciano-alquilo C₁-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio-alquilo C₁-C₄ o fenil-alquilo C₁-C₄), alquil C₁-C₄-sufinilo, alquil C₁-C₄-sulfonilo, los radicales heterociclilo morfolinilo, triazolinonilo, dihidrodioxazinilo, dihidrooxadiazinilo, dioxolanilo, dioxanilo, piperidinonilo, pirrolidinonilo y pirazolinonilo (que por su parte pueden estar sustituidos con alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄), fenilo (que por su parte puede estar sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄), los radicales heteroarilo pirrolilo, piridilo, piridilo N-óxido, pirimidilo, imidazolilo, pirazolilo, oxazolilo, tiazolilo, furanilo, tienilo, triazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, pirazinilo, triazinilo, tetrazinilo e isoquinolinilo (que por su parte pueden estar sustituidos con halógeno, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio, alquil C₁-C₄-tioalquilo C₁-C₄ y cicloalquilo C₃-C₆), los radicales heteroarilalquilo triazolil-alquilo C₁-C₄, piridil-alquilo C₁-C₄, pirimidil-alquilo C₁-C₄ u oxadiazolil-alquilo C₁-C₄ (que por su parte pueden estar sustituidos con alquilo C₁-C₄) o

representa fenilo dado el caso sustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, dioxolanilo, piperidinonilo, pirrolidinonilo o dihidrodioxazinilo.

Se da muy particular preferencia a compuestos novedosos de la fórmula (IA) en la que

G¹ representa C-halógeno (en especial CF),

R¹ representa hidrógeno y

G³ representa en cada caso oxazolinilo, dihidrooxadiazinilo o hidroxipiridilo dado el caso sustituidos con piridilo o pirimidinilo,

representa en cada caso pirazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, 1,3,5-triazinilo, triazinilo u oxadiazolilo, dado el caso sustituidos con halógeno (en particular, cloro, bromo), nitro, amino, haloalquilo

5 C₁–C₄ (en particular, CF₃, CF₃CH₂, CF₃CF₂, CF₂Cl, CF₃CF₂CF₂, CH₃CHF), cicloalquil C₃–C₆–alquilo C₁–C₄ (en particular, ciclopropilmetilo), alcoxi C₁–C₄–alquilo C₁–C₄ (en particular, metoximetilo), bis(alcoxi C₁–C₄)–alquilo C₁–C₄ (en particular, (CH₃O)₂CH), alcoxi C₁–C₄–carbonilo (en particular, metoxicarbonilo), alfa-hidroxiimino–alcoxi C₁–C₄–carbonilmetilo, C(X)NR²R³, (en el que X representa oxígeno o azufre, R² representa hidrógeno y R³ representa alquilo C₁–C₅ (en particular, metilo, etilo, n–propilo, isopropilo, isobutilo, terc–butilo, (CH₃)₂C(CH₃)₂), haloalquilo C₁–C₄ (en particular, CF₃CH₂), alcoxi C₁–C₄ (en particular, metoxi, etoxi, propiloxi) ciano–alquilo C₁–C₄ (en particular, NCCH₂CH(C₂H₅)), cicloalquilo C₃–C₆ (en particular, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo), cicloalquil C₃–C₆–alquilo C₁–C₄ (en particular, ciclopropilmetilo), alcoxi C₁–C₄–alquilo C₁–C₄ (en particular, CH₃OCH₂, CH₃OCH₂CH(CH₃), CH₃CH₂CH₂OCH₂CH(CH₃), CH₃CH₂OCH₂CH₂, CH₃OCH₂CH₂CH₂, CH₃OCH₂CH₂CH₂CH₂, CH₃CH₂OCH₂CH(CH₃), CH₃CH₂OCH₂CH₂CH₂, CH₃OC(CH₃)₂), alquil C₁–C₄–tioalquilo C₁–C₄ (en particular, CH₃SCH₂CH₂) o fenil–alquilo C₁–C₄ (en particular, C₆H₅CH(CH₃)), alquil C₁–C₄–tio (en particular, metiltio), alquil C₁–C₄–sulfonilo (en particular, CH₃SO₂), los radicales heterocíclico morfolinilo, triazolinonilo, dihidrodioxazinilo, dihidrooxadiazinilo, piperidinonilo, pirrolidinonilo y pirazolinonilo (que por su parte pueden estar sustituidos con alquilo C₁–C₄ (en particular, metilo) o haloalquilo C₁–C₄ (en particular, CF₃), fenilo (que por su parte pueden estar sustituidos con halógeno (en particular, flúor, cloro)), los radicales heteroarilo pirrolilo, piridilo, piridilo N–óxido, pirimidinilo, pirazolilo, tiazolilo, furanilo, tienilo, triazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, pirazinilo, triazinilo e isoquinolinilo (que por su parte pueden estar sustituidos con halógeno (en particular, flúor, cloro), nitro, alquilo C₁–C₄ (en particular, metilo, etilo, n–propilo, isopropilo, terc–butilo), haloalquilo C₁–C₄ (en particular, CF₃, CHF₂, CFCIH), alcanodiilo C₃–C₄, (en particular, CH₂CH₂CH₂), alcoxi C₁–C₄ (en particular, metoxi, etoxi), cicloalquilo C₃–C₆ (en particular, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo)), los radicales heteroarilalquilo triazolil–alquilo C₁–C₄ (en particular triazolilmetilo), piridil–alquilo C₁–C₄ (en particular piridilmetilo), pirimidinil–alquilo C₁–C₄ (en particular primidinilmetilo) o oxadiazolil–alquilo C₁–C₄ (en particular, oxadiazolilmetilo (que por su parte pueden estar sustituidos con alquilo C₁–C₄ (en particular, metilo)) o

representa fenilo dado el caso sustituido por halógeno (en particular cloro), haloalquilo C₁–C₄ (en particular, CF₃), dioxolanilo, piperidinonilo, pirrolidinonilo o dihidrodioxazinilo.

30 Los radicales sustituidos con halógeno (también abreviados como “halo”), por ejemplo, haloalquilo, son mono– o polihalogenados hasta el número máximo posible de sustituyentes. En el caso de polihalogenación, los átomos halógenos pueden ser idénticos o diferentes. Además halógeno representa flúor, cloro, bromo y yodo, en particular, flúor, cloro y bromo, se da énfasis a flúor y cloro.

35 También se denomina al radical “pirimidilo” como “pirimidinilo”.

Se da preferencia, preferencia particular o preferencia muy particular al uso de compuestos que tienen los sustituyentes enumerados en cada caso como preferentes, particularmente preferentes o muy particularmente preferentes.

40 Los radicales de hidrocarburo saturados o no saturados, como alquilo o alqueno, pueden en cada caso ser de cadena recta o ramificados en la medida en que sea posible, incluso en combinación con heteroátomos, como por ejemplo en alcoxi.

45 Los radicales dado el caso sustituidos pueden ser mono– o polisustituidos, por lo que en caso de polisustitución los sustituyentes pueden ser idénticos o diferentes.

Las definiciones o ilustraciones de radical preferentes o generales enumeradas anteriormente se aplican a los productos finales y, por consiguiente, a los materiales de partida e intermediarios. Estas definiciones de radical se pueden combinar unas con otras, como se desee, como también entre los rangos preferentes respectivos.

50 Se da preferencia, de acuerdo a la invención a los compuestos de la fórmula (I) que contienen una combinación de los significados enumerados anteriormente como preferentes.

55 Se da preferencia particular, de acuerdo con la invención, a los compuestos de la fórmula (I) que contienen una combinación de los significados enumerados anteriormente como particularmente preferentes.

Se da preferencia muy particular, de acuerdo con la invención, a los compuestos de la fórmula (I) que contienen una combinación de los significados enumerados anteriormente como muy particularmente preferentes.

60 Dependiendo de la naturaleza de los sustituyentes, los compuestos de las fórmulas (I) y (IA), dado el caso, pueden estar presentes como isómeros geométricos y/o ópticamente activos o las mezclas de isómeros correspondientes de composición variable. La invención se refiere tanto a isómeros puros como a mezclas de isómeros.

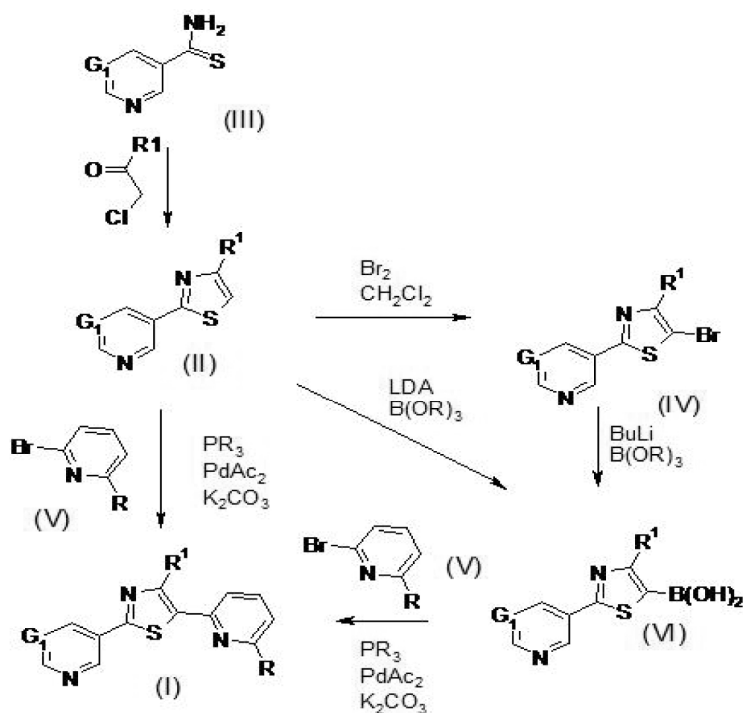
65 A modo de ejemplo y de manera complementaria, la preparación de los compuestos de la fórmula (I) se ilustra en los esquemas de fórmula a continuación. También se hace referencia a los ejemplos de preparación. En los esquemas,

también se denomina al radical G^1 como G_1 .

En los esquemas de fórmula a continuación, el radical R puede tener diferentes significados; sin embargo, si no se indica nada más estos significados se pueden derivar del contexto correspondiente.

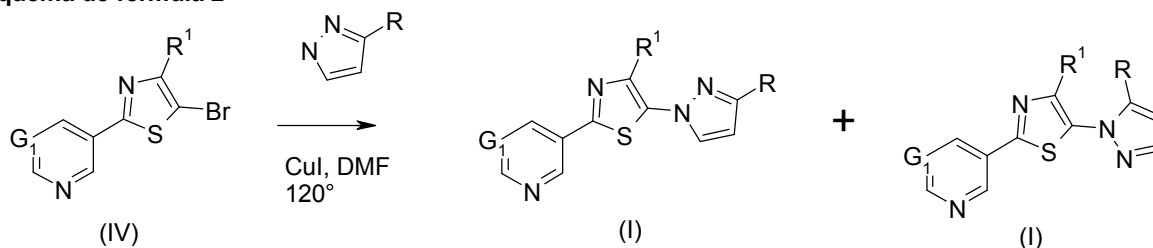
5

Esquema de fórmula 1



La preparación de los compuestos de la fórmula (II) con R^1 =alquilo se lleva a cabo usando procedimientos conocidos en principio, partiendo de tioamidas de la fórmula (III) mediante reacción con compuestos de alfa-halocarbonilo; por ejemplo, en forma análoga a *Helvetica Chimica Acta* 1945, 820 y DE 2221647. Los compuestos con R^1 =H se pueden sintetizar usando procedimientos conocidos, por ejemplo, en forma análoga a *Helvetica Chimica Acta* 1957, 554, pero preferentemente como se describe en el ejemplo de preparación 5. Los compuestos de la fórmula (IV) se pueden obtener de los compuestos de la fórmula (II) mediante una reacción con bromo en un diluyente como diclorometano. Los ácidos borónicos de la fórmula (VI) se pueden obtener, o bien por la desprotonación de los compuestos de la fórmula (II) con una base fuerte, como LDA (diisopropilamida de litio), o por metalación de bromuros (IV), reacción posterior con un éster borónico (R=alquilo), seguida de hidrólisis. Los compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la invención, conforme al esquema de fórmula 1, se obtienen de ácidos borónicos de la fórmula (VI) mediante reacción Suzuki o directamente de los tiazoles de la fórmula (II) mediante reacción de Heck por acoplamiento de transición mediada por metal en la presencia de ligandos complejos (por ejemplo, PR_3 , R=, por ejemplo, o-tolilo) y una base auxiliar en un diluyente, por ejemplo, acetato de paladio(II), tri-o-tolilfosfano, carbonato de potasio y DMF. Los bromuros de la fórmula (V) se conocen o se pueden obtener mediante los procedimientos conocidos en principio. La preparación del bromuro de la fórmula (V) donde se describe R=2-pirimidilo, por ejemplo, en *Tetrahedron Letters*, 2000, 1653; un procedimiento mejorado de preparación resulta al tener en cuenta las observaciones descriptas en *Tetrahedron Letters* 1996, 2537, ver ejemplo de preparación 5.

Esquema de fórmula 2



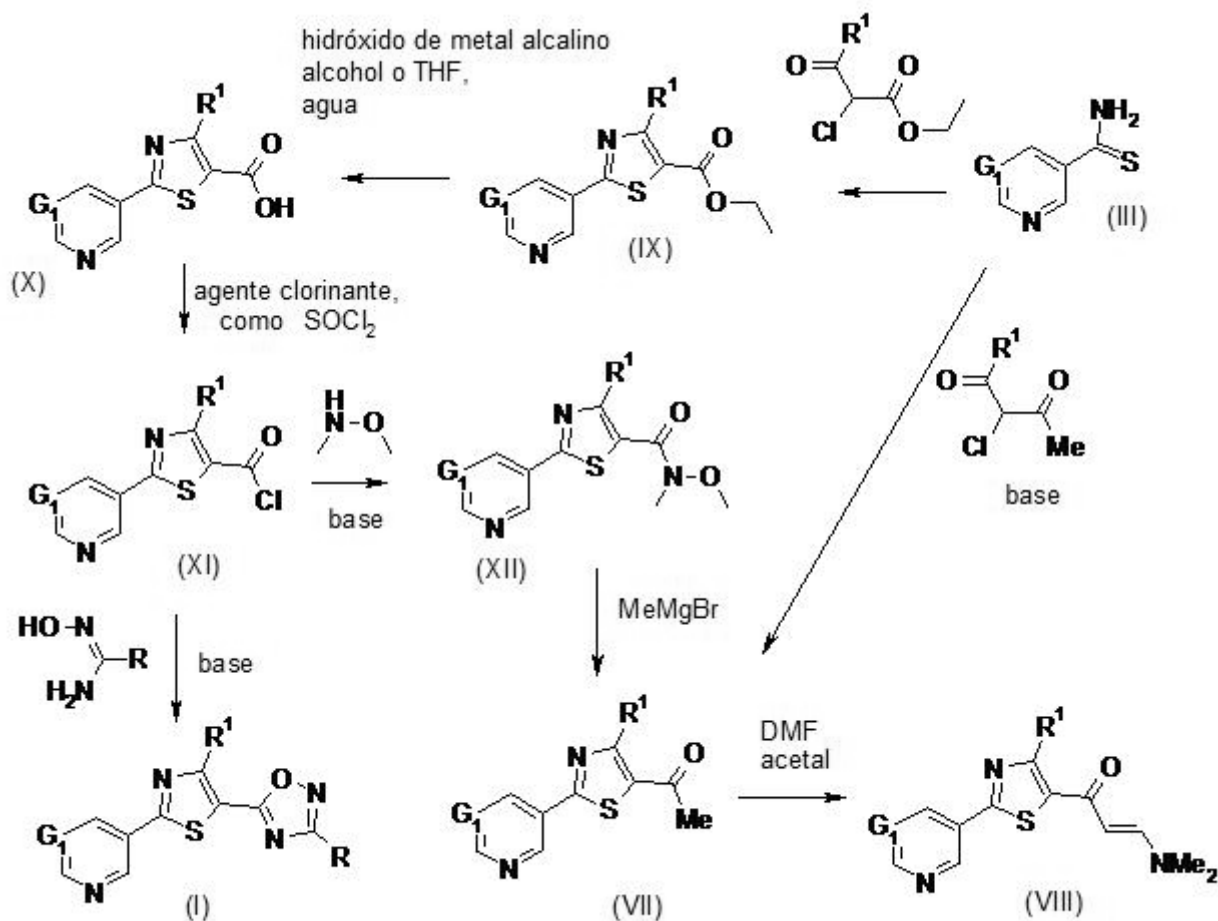
Los compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la invención con G^3 = pirazol N-unido se pueden preparar de los bromuros de la fórmula (IV) mediante reacción de transición mediada por metal con pirazoles en presencia de una

30

base auxiliar en un diluyente, como yoduro de cobre(I), carbonato de potasio y DMF, ver *Journal of Organic Chemistry* 2004, 5578. Los pirazoles apropiados se conocen o se pueden preparar mediante procedimientos conocidos en principio, por ejemplo, en forma análoga a *Chemische Berichte*, 125, 3, 1992, *Chemical Communications*, 24, 1994, 2751, *Tetrahedron Letters*, 1999, 4779.

5

Esquema de fórmula 3



10

15

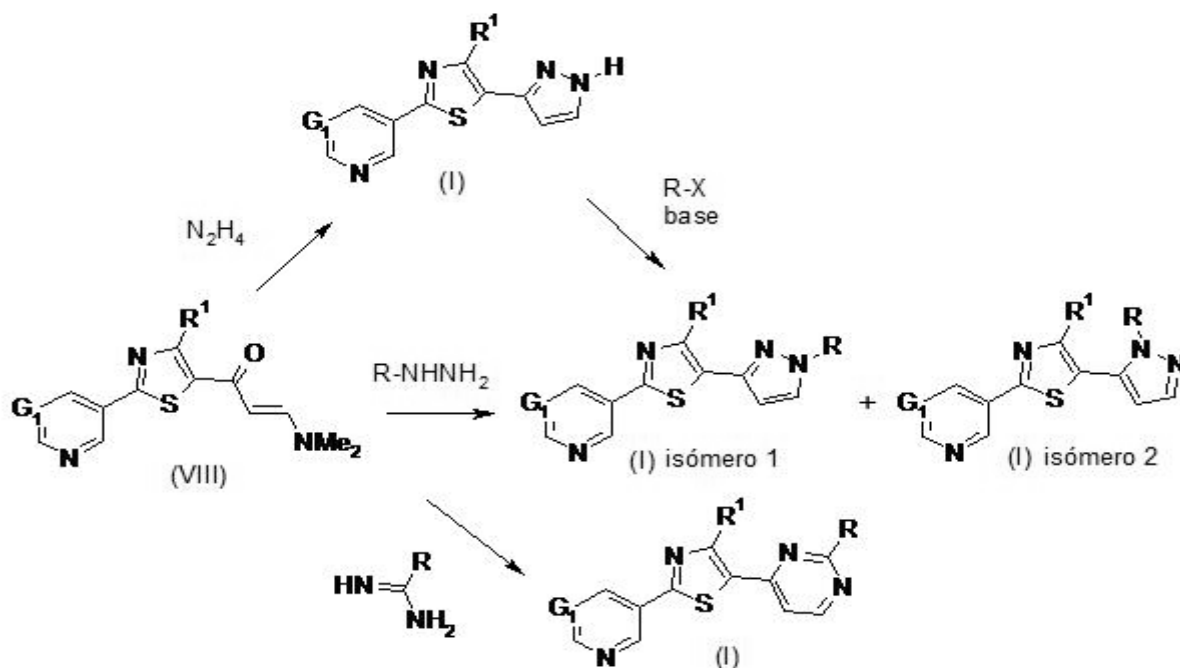
20

25

30

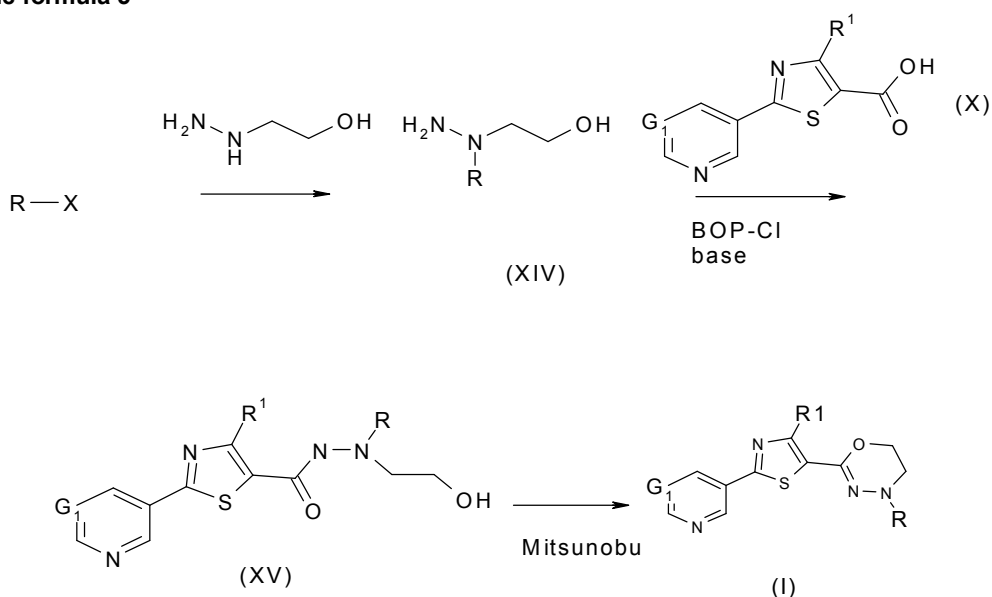
La preparación de los compuestos de la fórmula (VII) con R¹=alquilo se lleva a cabo mediante la reacción de tioamidas de la fórmula (III) con compuestos α-halocarbonilo para dar compuestos acetilo de la fórmula (VII), de acuerdo con el documento DE2221647. Los compuestos de la fórmula (VII) en la que R¹ representa hidrógeno se pueden preparar basándose en los procedimientos descritos en *Helvetica Chimica Acta* 1944, 1432–1436. El éster de cloroformilo usado en esta referencia se puede preparar como se describe en *Chemische Berichte*, 1910, 3528–3533. Sin embargo, preferentemente, la sal de sodio, que se puede preparar en forma análoga a la sal de potasio descrita en esta referencia, del éster de cloroformilo se usa directamente para la reacción con una tioamida de la fórmula (III), sin el agregado de una base, lo que da ésteres de la fórmula (IX). Mediante el uso de los procedimientos estándar indicados en el esquema de reacción 3, cf. El documento DE 2221647, el éster de la fórmula (IX) se puede convertir inicialmente en el ácido de la fórmula (X) y luego en el cloruro de ácido de la fórmula (XI). Otra reacción con *O,N*-dimetilhidroxilamina en un diluyente, como por ejemplo diclorometano o tetrahidrofurano y en presencia de una base, como por ejemplo trietilamina o diisopropiltilamina da compuestos de la fórmula (XII) que se pueden convertir, mediante reacción con un compuesto de metálico de metilo, como bromuro de metilmagnesio, en la cetona de la fórmula (VII). Mediante la reacción de los compuestos de la fórmula (VII) con acetal de dimetil dimetilformamida, se obtienen las enminonas de la fórmula (VIII), ver *Heterocycles*, 43, 1, 1996, 221 y *Journal of Heterocyclic Chemistry* 24, 1987, 837, ver también ejemplo de preparación 1. Mediante la reacción con una hidroxiamidina en presencia de una base auxiliar como trietilamina en un diluyente como dioxano, los oxadiazoles de la fórmula (I), de acuerdo con la invención, se pueden obtener del cloruro de ácido de la fórmula (XI).

Esquema de fórmula 4



Mediante la reacción con hidrato de hidrazina en un diluyente como etanol, las enaminonas de la fórmula (VIII) dan los NH-pirazoles de la fórmula (I). Mediante la reacción con un agente alquilante o (het-)arilante y una base auxiliar como hidruro de sodio en un diluyente como DMF, estos pirazoles se pueden convertir en pirazoles N-sustituídos de la fórmula (I) de acuerdo con la invención. Mediante la reacción de enaminonas de la fórmula (VIII) con hidrazinas sustituidas, es también posible obtener los pirazoles N-sustituídos de la fórmula (I). Las hidrazinas sustituidas se conocen o se pueden preparar por procedimientos conocidos en principio, ver, por ejemplo, *Journal of Medicinal Chemistry* 2005, 141. Los pirazoles N-sustituídos de la fórmula (I) de acuerdo con la invención se forman en las formas isoméricas isómero 1 e isómero 2, la vía preferente al isómero 1 es a través de los NH-pirazoles de la fórmula (I). Mediante la reacción de las enaminonas de la fórmula (VIII) en la presencia de una base auxiliar, como etóxido de sodio en un diluyente como etanol con amidinas, se pueden obtener las pirimidinas de la fórmula (I) de acuerdo con la invención. Las amidinas requeridas en teoría se conocen o se pueden preparar mediante procedimientos conocidos en principio, ver también ejemplo de preparación 1.

Esquema de fórmula 5



De acuerdo con el esquema de fórmula 5 (ver también ejemplo de preparación 7), los compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la invención se obtienen mediante la reacción inicial de 2-hidrazinoetanol con un agente alquilante o

(het-)arilante R-X para dar compuestos de la fórmula (XIV); una reacción de este tipo se describe en *Khim. Geterosikl. Soedin* 1990, 8, 1065. De estos compuestos es posible obtener con ácidos de la fórmula (X) y con la ayuda del agente activo como BOP-Cl en la presencia de una base auxiliar como trietilamina en un diluyente como DMF, las hidrazidas de la fórmula (XV) que, por ejemplo, mediante una reacción Mitsunobu como se describe en *Heterocycles* 37, 3, 1994, 1645, pueden convertirse en los compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la invención.

Los principios activos de acuerdo con la invención, en combinación con buena tolerancia de la planta y toxicidad favorable a animales de sangre caliente y ser bien tolerada por el ambiente, son adecuados para proteger plantas y órganos de plantas, para aumentar los rendimientos de las cosechas, para mejorar la calidad del material cosechado y para controlar plagas de animales, en particular, insectos, arácnidos, helmintos, nematodos y moluscos, que se encuentran en la agricultura, en la horticultura, en la conservación de animales, en bosques, en jardines e instalaciones de tiempo libre, en la protección de productos y materiales almacenados, y en el sector de la higiene. Se pueden emplear preferentemente como agentes de protección de plantas. Son activos contra especies normalmente sensibles y resistentes y contra todas o algunas de las etapas del desarrollo. Las plagas anteriormente mencionadas incluyen:

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

De la clase de los Arachnida, por ejemplo, *Acarus siro*, *Aceria sheldoni*, *Aculops* spp., *Aculus* spp., *Amblyomma* spp., *Argas* spp., *Boophilus* spp., *Brevipalpus* spp., *Bryobia praetiosa*, *Chorioptes* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Eotetranychus* spp., *Eptrimerus pyri*, *Eutetranychus* spp., *Eriophyes* spp., *Hemitarsonemus* spp., *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Latrodectus mactans*, *Metatetranychus* spp., *Oligonychus* spp., *Ornithodoros* spp., *Panonychus* spp., *Phillocopturta oleivora*, *Poliphagotarsonemus latus*, *Psoroptes* spp., *Rhipicephalus* spp., *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., *Scorpio maurus*, *Stenotarsonemus* spp., *Tarsonemus* spp., *Tetranychus* spp., *Vasates lycopersici*.

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

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

Del orden de los Coleoptera, por ejemplo, *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus* spp., *Agelastica alni*, *Agriotes* spp., *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora* spp., *Anthonomus* spp., *Anthrenus* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp., *Attagenus* spp., *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., *Ceuthorhynchus* spp., *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp., *Costelytra zealyica*, *Curculio* spp., *Cryptorhynchus lapathi*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., *Epilachna* spp., *Faustinus cubae*, *Gibbium psilloides*, *Heteronychus arator*, *Hilamorphia elegans*, *Hilotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypothenemus* spp., *Lachnosterna consanguinea*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lixus* spp., *Lyctus* spp., *Meligethes aeneus*, *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp., *Naupactus xanthographus*, *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phillophaga* spp., *Popillia japonica*, *Premnotypes* spp., *Psilliodes chrysocephala*, *Ptinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus* spp., *Sphenophorus* spp., *Sternechus* spp., *Symphyletes* spp., *Tenebrio molitor*, *Tribolium* spp., *Trogoderma* spp., *Tychius* spp., *Xilotrechus* spp., *Zabrus* spp..

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

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

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

Del orden de los Diptera, por ejemplo, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Bibio hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomyia* spp., *Cochliomyia* spp., *Cordilobia anthropophaga*, *Culex* spp., *Cuterebra* spp., *Dacus oleae*, *Dermatobia hominis*, *Drosophila* spp., *Fannia* spp., *Gastrophilus* spp., *Hilemyia* spp., *Hyppobosca* spp., *Hypoderma* spp., *Liriomyza* spp., *Lucilia* spp., *Musca* spp., *Nezara* spp., *Oestrus* spp., *Oscinella frit*, *Pegomyia hyoscyami*, *Phorbia* spp., *Stomoxys* spp., *Tabanus* spp., *Tannia* spp., *Tipula paludosa*, *Wohlfahrtia* spp..

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

De la clase de los helmintos, por ejemplo, *Ancilostoma duodenale*, *Ancilostoma ceilanicum*, *Ancilostoma braziliensis*, *Ancilostoma* spp., *Ascaris lubricoides*, *Ascaris* spp., *Brugia malayi*, *Brugia timori*, *Bunostomum* spp., *Chabertia* spp., *Clonorchis* spp., *Cooperia* spp., *Dicrocoelium* spp., *Dictyocaulus filaria*, *Diphilobothrium latum*, *Dracunculus medinensis*, *Echinococcus granulosus*, *Echinococcus multilocularis*, *Enterobius vermicularis*, *Faciola* spp., *Haemonchus* spp., *Heterakis* spp., *Hymenolepis nana*, *Hyostrogylus* spp., *Loa Loa*, *Nematodirus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Opisthorchis* spp., *Onchocerca volvulus*, *Ostertagia* spp., *Paragonimus* spp., *Schistosomen* spp., *Strongiloides fuelleborni*, *Strongiloides stercoralis*, *Stroniloides* spp., *Taenia saginata*, *Taenia solium*, *Trichinella spiralis*, *Trichinella nativa*, *Trichinella britovi*, *Trichinella nelsoni*, *Trichinella pseudopsiralis*, *Trichostrongylus* spp.,

Trichuris trichuria, Wuchereria bancrofti.

Además, es posible controlar los protozoos, tal como la Eimeria.

5 Del orden de los Heteroptera, por ejemplo, Anasa tristis, Antestiopsis spp., Blissus spp., Calocoris spp., Campilomma livida, Cavalerius spp., Cimex spp., Creontiades dilutus, Dasynus piperis, Dichelops furcatus, Diconocoris hewetti, Dysdercus spp., Euschistus spp., Eurygaster spp., Heliopeltis spp., Horcias nobilellus, Leptocoris spp., Leptoglossus phillopus, Lygus spp., Macropes excavatus, Miridae, Nezara spp., Oebalus spp., Pentomidae, Piesma quadrata, Piezodorus spp., Psallus seriatus, Pseudacysta perseae, Rhodnius spp., Sahlbergella singularis, Scotinophora spp., Pasohanitis nashi, Tibraca spp., Triatoma spp..

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

Del orden de los Hymenoptera, por ejemplo, Diprion spp., Hoplocampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Vespa spp..

35 Del orden de los Isopoda, por ejemplo, Armadillidium vulgare, Oniscus asellus, Porcellio scaber.

Del orden de los Isoptera, por ejemplo, Reticulitermes spp., Odontotermes spp..

40 Del orden de los Lepidoptera, por ejemplo, Acronicta major, Aedia leucomelas, Agrotis spp., Alabama argillacea, Anticarsia spp., Barathra brassicae, Bucculatrix thurberiella, Bupalus piniarius, Cacoecia podana, Capua reticulana, Carpocapsa pomonella, Cheimantobia brumata, Chilo spp., Choristoneura fumiferana, Clysia ambiguella, Cnaphalocerus spp., Earias insulana, Ephestia kuehniella, Euproctis chryorrhoea, Euxoa spp., Feltia spp., Galleria mellonella, Helioverpa spp., Heliothis spp., Hofmannophila pseudopretella, Homona magnanima, Hyponomeuta padella, Laphygma spp., Lithocolletis blancardella, Lithophane antennata, Loxagrotis albicosta, Lymantria spp., Malacosoma neustria, Mamestra brassicae, Mocis repya, Mythimna separata, Oria spp., Oulema oryzae, Panolis flammea, Pectinophora gossypiella, Phillocnistis citrella, Pieris spp., Plutella xilostella, Prodenia spp., Pseudaletia spp., Pseudoplusia includens, Pyrausta nubilalis, Spodoptera spp., Thermesia gemmatilis, Tinea pellionella, Tineola bisselliella, Tortrix viridana, Trichoplusia spp..

50 Del orden de los Orthoptera, por ejemplo, Acheta domesticus, Blatta orientalis, Blattella germanica, Grillotalpa spp., Leucophaea maderae, Locusta spp., Melanoplus spp., Periplaneta americana, Schistocerca gregaria.

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

55 Del orden de los Symphyla, por ejemplo, Scutigera immaculata.

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

60 Del orden de los Thysanura, por ejemplo, Lepisma saccharina.

65 Los nematodos fitoparásitos incluyen, por ejemplo, Anguina spp., Aphelenchoides spp., Belonoaimus spp., Bursaphelenchus spp., Ditylenchus dipsaci, Globodera spp., Helicotylenchus spp., Heterodera spp., Longidorus spp., Meloidogyne spp., Pratylenchus spp., Radopholus similis, Rotylenchus spp., Trichodorus spp., Tilenchorhynchus spp., Tilenchulus spp., Tilenchulus semipenetrans, Xiphinema spp..

Los compuestos de acuerdo con la invención se pueden, en ciertas concentraciones o velocidades de aplicación, usar también como herbicidas, protectores, reguladores del crecimiento o agentes que mejoren las propiedades de la planta, o como microbicidas, por ejemplo como los fungicidas, antimicóticos, bactericidas, viricidas (incluyendo agentes contra los viroides) o como agentes contra MLO (organismos como el micoplasma) y RLO (organismos como la rickettsia). También se pueden emplear como intermedios o precursores para la síntesis de otros principios activos.

Los principios activos se pueden convertir en las fórmulas de costumbre, tales como soluciones, emulsiones, polvos humectables, suspensiones a base de agua y aceite, sólidos pulverizados, polvos, pastas, polvos solubles, gránulos solubles, gránulos de transmisión, concentrados de emulsión-suspensión, materiales naturales impregnados con compuesto activo, materiales sintéticos impregnados con compuesto activo, fertilizantes y microencapsulaciones en sustancias poliméricas.

Estas formulaciones se producen de un modo conocido, por ejemplo, por medio de la mezcla de principios activos con diluyentes, es decir, solventes líquidos y/o transportadores sólidos, dado el caso con el uso de surfactantes, es decir, emulsionantes y/o dispersantes y/o formadores de espuma. Se preparan las formulaciones, ya sea en plantas adecuadas, o bien antes o durante la aplicación.

Son adecuadas para el uso como auxiliares aquellas sustancias que sean adecuadas para impartir a la propia composición y/o a preparaciones derivadas de ellas (por ejemplo licores en aerosol, decapado de semillas) propiedades particulares, tales como ciertas propiedades técnicas y/o también propiedades biológicas particulares.

Auxiliares típicos adecuados son: diluyentes, solventes y transportadores.

Diluyentes adecuados son, por ejemplo, agua, líquidos químicos orgánicos polares y no polares, por ejemplo, de la clase de los hidrocarburos aromáticos y no aromáticos (tales como parafina, alquilbencenos, alquilnaftalenos, clorobencenos), los alcoholes y polioles (que dado el caso se pueden sustituir, eterificar y/o esterificar), las cetonas (tales como la acetona, ciclohexanona), ésteres (incluyendo grasas y aceites) y (poli)éteres, las aminas no sustituidas y sustituidas, amidas, lactamas (tales como N-alquilpirrolidonas) y lactonas, las sulfonas y sulfóxidos (tales como sulfóxido de dimetilo).

Si se usa agua como diluyente, también es posible emplear, por ejemplo, solventes orgánicos como solventes auxiliares. Esencialmente, los solventes líquidos adecuados son: aromáticos tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, aromáticos clorinados e hidrocarburos alifáticos clorinados tales como clorobencenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos tales como ciclohexano o parafinas, por ejemplo, fracciones de petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoholes tales como butanol o glicol y también sus éteres y ésteres, cetonas tales como acetona, cetona etílica de metilo, cetona isobutílica de metilo o ciclohexanona, solventes polares fuertes tales como sulfóxido de dimetilo y también el agua.

Portadores adecuados son:

por ejemplo, las sales de amonio y minerales naturales del suelo tales como caolines, arcillas, talco, tiza, cuarzo, atapulgita, montmorillonita o tierra de infusorios, y minerales sintéticos del suelo, tales como sílice, alumina y silicatos divididos finamente; los portadores sólidos adecuados de gránulos son: por ejemplo, rocas naturales trituradas y fraccionadas tales como calcita, mármol, pómez, sepiolita y dolomita, y también gránulos sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas, y gránulos de materiales orgánicos tales como el papel, aserrín, cáscara de coco, marlo de maíz y tallos de tabaco; los emulsionadores y/o formadores de espuma adecuados son: por ejemplo, emulsionadores no iónicos y aniónicos, tales como ésteres de ácidos grasos de polioxietileno, éteres de alcoholes grasos de polioxietileno, por ejemplo poliglicol éteres de alquilarilo, alquilsulfonatos, sulfatos de alquilo, arilsulfonatos y también hidrolizados de proteína; dispersantes adecuados son sustancias iónicas y/o no iónicas, por ejemplo, de las clases de alcohol-POE- y/o -POP-éteres, ácido y/o ésteres POP-POE, alquilarilo y/o éteres POP-POE, grasa-y/o aductos POP-POE, derivados de POE- y/o POP-poliol, POE- y/o POP-sorbitan- o -aductos de azúcar, sulfatos de alquilo o arilo, alquilo- o arilsulfonatos y alquil o aril fosfatos o los aductos PO-éter correspondientes. Asimismo, los oligo- o polímeros adecuados, por ejemplo, aquellos derivados de monómeros de vinílico, de ácido acrílico, de EO y/o PO solo o en combinación con, por ejemplo, (poli)alcoholes o (poli)aminas. También es posible emplear ligninas y sus derivados de ácido sulfónico, celulosas modificadas y no modificadas, ácidos sulfónicos alifáticos y/o aromáticos y sus aductos con formaldehído.

Se pueden usar en las formulaciones fijadores tales como carboximetilcelulosa, polímeros sintéticos y naturales en forma de polvo, gránulos o látex, tales como goma arábiga, alcohol de polivinilo y acetato de polivinilo, así como también fosfolípidos naturales tales como cefalinas y lecitinas, y fosfolípidos sintéticos.

Es posible usar colorantes tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo óxido de hierro, óxido de titanio y Azul Prusiano, y colorantes orgánicos, tales como colorantes de alizarina, colorantes azoicos y colorantes de ftalocianina metálica, y nutrientes traza tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y zinc.

Otros aditivos posibles son perfumes, aceites modificadas dado el caso, minerales o vegetales, ceras y nutrientes (incluidos nutrientes traza), tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y zinc.

5 Estabilizantes, tales como estabilizantes de baja temperatura, conservantes, antioxidantes, estabilizantes livianos u otros agentes que mejoran la estabilidad química y/o física también pueden estar presentes.

Las formulaciones generalmente comprenden entre el 0,01 y el 98 % en peso de compuesto activo, preferentemente entre el 0,5 y el 90 %.

10 El compuesto activo de acuerdo con la invención se puede usar en sus formulaciones disponibles comercialmente y en sus formas de uso, preparadas de éstas formulaciones, como una mezcla con otros principios activos, tales como insecticidas, atrayentes, agentes esterilizantes, bactericidas, acaricidas, nematocidas, fungicidas, sustancias reguladoras del crecimiento, herbicidas, protectores, fertilizantes o semioquímicos.

15 También es posible usar una mezcla de otros principios activos conocidos, tales como herbicidas, fertilizantes, reguladores del crecimiento, protectores, semioquímicos, u otros con agentes para mejorar las propiedades de la planta.

20 Cuando se usan como insecticidas, los principios activos de acuerdo con la invención también pueden estar presentes en sus formulaciones disponibles comercialmente y en sus formas de uso, preparados de estas formulaciones, como una mezcla con sinergistas. Los sinergistas son compuestos que aumentan la acción de principios activos, sin que sea necesario que se agregue el agente sinérgico para que sea activo en sí mismo.

25 Cuando se usan como insecticidas, los principios activos de acuerdo con la invención también pueden estar presentes en sus formulaciones disponibles comercialmente y en sus formas de uso, preparados de estas formulaciones, como mezclas con inhibidores que reducen la degradación del compuesto activo luego de su uso en el medioambiente de la planta, en superficies de partes de plantas o en tejidos de plantas.

30 El contenido del compuesto activo de las formas de uso preparadas de las formulaciones disponibles comercialmente puede variar dentro de límites amplios. La concentración de compuesto activo de las formas de uso puede ser desde el 0,00000001 al 95 % en peso del compuesto activo, preferentemente entre el 0,00001 y el 1 % en peso.

35 Los compuestos se emplean de una manera habitual apropiada para estas formas de uso.

40 Todas las plantas y las partes de plantas se pueden tratar de acuerdo con la invención. Se entenderá que las plantas harán referencia en este contexto a todas las plantas y poblaciones de plantas, tales como plantas salvajes deseadas y no deseadas y plantas de cultivo (incluyendo plantas de cultivo que nazcan naturalmente). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que se puedan obtener mediante cría convencional de plantas y procedimientos de optimización o mediante procedimientos de ingeniería biotecnológica y genética o mediante combinaciones de éstos procedimientos, incluyendo las plantas transgénicas e incluyendo cultivares protegibles o no protegibles por los derechos de criadores de plantas. Se entenderá que "partes de plantas" hará referencia a todas las partes y órganos de plantas que se encuentren sobre y bajo el suelo, tales como tallo, hoja, flor y raíz, ejemplos que se pueden mencionar como hojas, agujas, cepas, vástagos, flores, cuerpos frutales, frutas, semillas, raíces, tubérculos y rizomas. Las partes de plantas también incluyen material cosechado y material de propagación generativo y vegetativo, por ejemplo cortes, tubérculos, rizomas, brotes y semillas.

50 El tratamiento de acuerdo con la invención de las plantas y de partes de plantas con los principios activos se lleva a cabo directamente o al permitir que los compuestos actúen en su medio, hábitat o espacio de almacenamiento mediante los procedimientos de tratamiento de costumbre, por ejemplo por inmersión, atomización, evaporación, condensación, dispersión, pintado, inyección y, en el caso de material de propagación, en particular en el caso de semillas, también mediante la aplicación de una o más capas.

55 Tal como se mencionó anteriormente, es posible tratar a todas las plantas y a sus partes de acuerdo con la invención. En una realización preferente, se tratan las especies de plantas salvajes y los cultivares, o aquellas obtenidas mediante procedimientos de cría biológica convencional, tales como el cruzamiento o la fusión de protoplasto y de sus partes. En otra realización preferente, las plantas transgénicas y los cultivares obtenidos mediante procedimientos de ingeniería genética, dado el caso, en combinación con procedimientos convencionales (Organismos Modificados Genéticamente), y las partes de ellas se tratarán como los términos teóricos "partes", "partes de plantas" explicados anteriormente.

65 De un modo particularmente preferente, las plantas de cultivares de plantas que en cada caso se encuentran disponibles comercialmente o en uso se tratan de acuerdo con la invención. Debe entenderse que cultivares son plantas que tienen propiedades novedosas ("rasgos") que han sido obtenidas por medio de la cría convencional, por medio de la mutagénesis o por medio de técnicas de ADN recombinante. Estos pueden ser cultivares, biotipos o genotipos.

Dependiendo de las especies de plantas y de los cultivares de plantas, la ubicación y las condiciones de crecimiento (suelos, clima, período de vegetación, dieta), el tratamiento conforme a la invención también puede resultar en efectos superaditivos (“sinérgicos”). Entonces, por ejemplo, las velocidades de aplicación reducida y/o un espectro de actividad más amplio y/o un incremento en la actividad de las sustancias y composiciones que se pueden usar de acuerdo con la invención, resultó posible el mejor crecimiento de la planta, el aumento de la tolerancia a altas o bajas temperaturas, el aumento de la tolerancia a sequías o a agua o suelo con contenido de sal, el aumento en el rendimiento del florecimiento, la cosecha más fácil, la maduración acelerada, los rendimientos más altos en la cosecha, la mayor calidad y/o un valor nutricional más alto de los productos cosechados, la mejor estabilidad de almacenado y/o procesamiento de los productos cosechados, que exceden los efectos esperados.

Las plantas transgénicas o los cultivares de plantas (obtenidos por medio de ingeniería genética) que preferentemente se deben tratar de acuerdo con la invención incluyen a todas las plantas que, por medio de la modificación genética, recibieron material genético que imparte rasgos útiles y particularmente ventajosos a estas plantas. Los siguientes son algunos ejemplos de dichos rasgos: mejor crecimiento de la planta, aumento de la tolerancia a altas o bajas temperaturas, aumento de la tolerancia a sequías o a agua o suelo con contenido de sal, aumento en el rendimiento del florecimiento, cosecha más fácil, maduración acelerada, rendimientos más altos en la cosecha, mayor calidad y/o valor nutricional más alto de los productos cosechados, mejor estabilidad de almacenado y/o procesamiento de los productos cosechados. Otros ejemplos particularmente enfatizados de dichos rasgos son una mejor defensa de las plantas contra plagas animales y microbiales, tales como contra insectos, ácaros, hongos fitopatógenicos, bacterias y/o virus, y también una mayor tolerancia de plantas a ciertos compuesto activos de herbicidas. Algunos ejemplos de plantas transgénicas que se pueden mencionar son las plantas de cultivo importantes, tales como cereales (trigo, arroz), maíz, soja, patatas, remolacha azucarera, tomates, arvejas, y otras variedades vegetales, algodón, tabaco, oleaginosas y plantas frutales (con frutos como manzanas, peras, frutos cítricos y uvas), y se da particular énfasis al maíz, a la soja, a las patatas, al algodón, al abaco y a las oleaginosas.

Los rasgos particularmente enfatizados son una mayor defensa de las plantas contra los insectos, arácnidos, nematodos y babosas y caracoles por medio de toxinas formadas en la planta, en particular aquellas formadas en las plantas por medio del material genético de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo mediante los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF y combinaciones de ellos) (a los que se hará referencia más abajo como “plantas Bt”). Los rasgos particularmente enfatizados son un aumento en la defensa de las plantas contra los hongos, las bacterias y los virus por medio de resistencia sistémica adquirida (SAR, según sus siglas en inglés), genes sistémicos, fitoalexinos, inductores y de resistencia y las proteínas y toxinas expresadas correspondientemente. Los rasgos que además se enfatizan particularmente son el aumento en la tolerancia de las plantas a ciertos principios activos de herbicidas, por ejemplo imidazolinonas, sulfonilureas, glifosato o fosfinotricina (por ejemplo el gen “PAT”). Los genes que imparten el rasgo deseado en cuestión también pueden estar presentes en combinación con otros en plantas transgénicas. Los ejemplos de “plantas Bt” que se pueden mencionar son las variedades de maíz, de algodón, de soja y de patata que se venden bajo las marcas RENDIMIENTO GARD® (por ejemplo maíz, algodón, soja), KnockOut® (por ejemplo maíz), StarLink® (por ejemplo maíz), Bollgard® (algodón), NucoIn® (algodón) y NewLeaf® (patata). Los ejemplos de plantas tolerantes de herbicidas que se pueden mencionar son las variedades de maíz, algodón y soja que se venden bajo las marcas Roundup Ready® (tolerancia al glifosato, por ejemplo maíz, algodón, soja), Liberty Link® (tolerancia a la fosfinotricina, por ejemplo oleaginosa), IMI® (tolerancia a las imidazolinonas) y STS® (tolerancia a sulfonilureas, por ejemplo maíz). Las plantas resistentes a herbicidas (plantas criadas de un modo convencional para la tolerancia al herbicida) que se pueden mencionar incluyen las variedades vendidas bajo la marca Clearfield® (por ejemplo maíz). Por supuesto, estas afirmaciones también se aplican a los cultivares que tengan estos rasgos genéticos o puedan desarrollar estos rasgos genéticos, que desarrollarán y/o comercializarán en el futuro.

Las plantas enumeradas se pueden tratar de acuerdo con la invención de un modo particularmente ventajoso con los compuestos de la fórmula general (I) y/o las mezclas de compuesto activo de acuerdo con la invención. Los rangos preferentes mencionados anteriormente de los principios activos o de las mezclas también se pueden aplicar al tratamiento de estas plantas. Se da un énfasis particular al tratamiento de las plantas con los compuestos o mezclas específicamente mencionados en el presente texto.

Los principios activos de acuerdo con la invención actúan no sólo contra la planta, la higiene y plagas de productos almacenados, sino también en el sector de medicina veterinaria contra parásitos de animales (ecto y endoparásitos), tales como garrapatas duras, garrapatas blandas, ácaros de la sarna, ácaros de hojas, moscas (mordedoras y lamedoras), larvas de las moscas parasíticas, piojos, piojos de cabello, piojos de plumas y pulgas.

Estos parásitos incluyen:

Del orden de los Anoplurida, por ejemplo, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp., *Solenopotes* spp..

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

- 5 Del orden de los Diptera y los subórdenes Nematocera y Brachycera, por ejemplo, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp., *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides* spp., *Chrysops* spp., *Hybomitra* spp., *Atilotus* spp., *Tabanus* spp., *Haematopota* spp., *Philomyia* spp., *Braula* spp., *Musca* spp., *Hidrotæa* spp., *Stomoxys* spp., *Haematobia* spp., *Morellia* spp., *Fannia* spp., *Glossina* spp., *Calliphora* spp., *Lucilia* spp., *Chrysomya* spp., *Wohlfahrtia* spp., *Sarcophaga* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Gasterophilus* spp., *Hippobosca* spp., *Lipoptena* spp., *Melophagus* spp..
- 10 Del orden de los Siphonaptera, por ejemplo, *Pulex* spp., *Ctenocephalides* spp. (*Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*), *Xenopsilla* spp., *Ceratophyllus* spp..
- Del orden de los Heteroptera, por ejemplo, *Cimex* spp., *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongilus* spp..
- Del orden de los Blattaria, por ejemplo, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blattella germanica*, *Supella* spp..
- 15 De la subclase de los Acari (Acarina) y los órdenes de la Meta y Mesostigmata, por ejemplo, *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., *Ixodes* spp., *Amblyomma* spp., *Boophilus* spp., *Dermacentor* spp., *Haemophysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Rhipicephalus* spp., *Dermanyssus* spp., *Raillietia* spp., *Pneumonyssus* spp., *Sternostoma* spp., *Varroa* spp..
- 20 Del orden de los Actiniedida (Prostigmata) y Acaridida (Astigmata), por ejemplo, *Acarapis* spp., *Cheiletiella* spp., *Ornithocheiletiella* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Listrophorus* spp., *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp., *Laminosioptes* spp..
- 25 Los principios activos de la fórmula (I) de acuerdo con la invención son también adecuados para controlar los artrópodos que infectan el ganado productivo agrícola, tal como, por ejemplo, vacas, ovejas, cabras, caballos, cerdos, burros, camellos, búfalos, conejos, gallinas, pavos, patos, gansos y abejas, otras mascotas, tales como, por ejemplo, perros, gatos, pájaros enjaulados, peces de acuario, y los llamados animales de prueba, tales como, por ejemplo, hamsters, conejos de Indias, ratas y ratones. Por medio del control de estos artrópodos, deberían disminuir los casos de muerte y de reducción en la productividad (de carne, leche, lana, cueros, huevos, miel, etc.), de modo tal que se logre una ganadería más económica y fácil por medio del uso de los principios activos de acuerdo con la invención.
- 30 Los principios activos de acuerdo con la invención se usan en el sector veterinario y en la ganadería de un modo conocido por medio de la administración enteral en la forma de, por ejemplo, tabletas, capsulas, pociones, soluciones orales, gránulos, pastas, bolos, el procedimiento por medio de la alimentación y supositorios, por medio de administración parenteral, tal como, por ejemplo, por medio de inyecciones (intramuscular, subcutánea, intravenosa, intraperitoneal y semejantes), implantes, por aplicación nasal, por uso dérmico, por ejemplo, baño, rociamiento, unción continua y unción dorsal, lavado y empolvado, y también con la ayuda de artículos moldeados que contengan el compuesto activo, tales como collares, marcadores de oreja, marcadores de cola, bandas de miembros, cabestro, dispositivos de marcamiento y semejantes.
- 35 Cuando se usan para el ganado, aves de corral, mascotas y semejantes, los principios activos de la fórmula (I) se pueden usar como formulaciones (por ejemplo polvos, emulsiones, composiciones de flujo libre), que comprenden los principios activos en una cantidad que varía entre el 1 y el 80 % en peso, directamente o luego de diluirse de 100 a 10 000 veces, o se pueden usar como baños químicos.
- 40 Asimismo, se ha determinado que los compuestos de acuerdo con la invención también poseen una fuerte acción insecticida contra insectos que destruyen materiales industriales.
- 45 Los siguientes insectos se pueden mencionar como ejemplos y como preferentes a título ilustrativo:
- 50 Escarabajos, tales como *Hilotrupes bajulus*, *Clorophorus pilosus*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinus pecticornis*, *Dendrobium pertinax*, *Ernobius mollis*, *Priobium carpini*, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*, *Lyctus planicollis*, *Lyctus linearis*, *Lyctus pubescens*, *Trogloxylon aequale*, *Minthes rugicollis*, *Xileborus spec.*, *Tryptodendron spec.*, *Apatë monachus*, *Bostrychus capucinus*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxylon spec.*, *Dinoderus minutus*;
- 55 Himenópteros, tales como *Sirex juvencus*, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus*, *Urocerus augur*;
- 60 Termitas, tales como *Kaloterme flavicollis*, *Cryptotermes brevis*, *Heterotermes indicola*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes santonensis*, *Reticulitermes lucifugus*, *Mastotermes darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis*, *Coptotermes formosanus*;
- 65 Colémbolos, tales como *Lepisma saccharina*.

Se deberá entender que los materiales industriales en la presente relación harán referencia a materiales no vivientes, tales como, preferentemente, plásticos, adhesivos, contenedores, papeles y cartones, cuero, madera y productos de madera procesada y composiciones de cobertura.

- 5 Las composiciones listas para usar pueden, dado el caso, comprender más insecticidas y, dado el caso, uno o más fungicidas.

Con respecto a aditivos adicionales posibles, se puede hacer referencia a los insecticidas y fungicidas mencionados anteriormente.

- 10 Los compuestos de acuerdo con la invención se pueden emplear de igual modo para proteger objetos que toman contacto con agua salada o salobre contra los residuos, en particular los cascos de los barcos, las pantallas, las redes, los edificios, los sistemas de amarre y de señalización.

- 15 Asimismo, los compuestos de acuerdo con la invención, solos o en combinación con otros principios activos, se pueden emplear como agentes antisuciedad.

En la protección doméstica, de higiene y de productos almacenados, los principios activos también son adecuados para controlar plagas animales, en particular insectos, arácnidos y ácaros, que se encuentran en espacios cercados tales como, por ejemplo, viviendas, halls de fábricas, oficinas, cabinas de vehículos y semejantes.

Se pueden emplear solos o en combinación con otros principios activos y auxiliares en productos insecticidas domésticos para controlar estas plagas. Son activos contra especies sensibles y resistentes y contra todos los estadios de desarrollo. Estas plagas incluyen:

- 25 Del orden de los Scorpionidea, por ejemplo, *Buthus occitanus*.
- Del orden de los Acarina, por ejemplo, *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Bryobia* ssp., *Dermanyssus gallinae*, *Glyciphagus domesticus*, *Ornithodoros moubat*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Trombicula alfreddugesi*, *Neutrombicula autumnalis*, *Dermatophagoides pteronissimus*, *Dermatophagoides forinae*.
- 30 Del orden de los Araneae, por ejemplo, *Aviculariidae*, *Araneidae*.
- Del orden de los Opiliones, por ejemplo, *Pseudoscorpiones chelifer*, *Pseudoscorpiones cheiridium*, *Opiliones phalangium*.
- 35 Del orden de los Isopoda, por ejemplo, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*.
- Del orden de los Diplopoda, por ejemplo, *Blaniulus guttulatus*, *Polidesmus* spp.
- 40 Del orden de los Chilopoda, por ejemplo, *Geophilus* spp.
- Del orden de los Zygentoma, por ejemplo, *Ctenolepisma* spp., *Lepisma saccharina*, *Lepismodes inquilinus*.
- 45 Del orden de los Blattaria, por ejemplo, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Blattella asahinai*, *Leucophaea maderae*, *Panchlora* spp., *Parcoblatta* spp., *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Supella longipalpa*.
- Del orden de los Saltatoria, por ejemplo, *Acheta domesticus*.
- 50 Del orden de los Dermaptera, por ejemplo, *Forficula auricularia*.
- Del orden de los Isoptera, por ejemplo, *Kaloterme* spp., *Reticuliterme* spp..
- 55 Del orden de los Psocoptera, por ejemplo, *Lepinatus* spp., *Liposcelis* spp..
- Del orden de los Coleoptera, por ejemplo, *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp., *Dermestes* spp., *Latheticus oryzae*, *Necrobia* spp., *Ptinus* spp., *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus granarius*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Stegobium paniceum*.
- 60 Del orden de los Diptera, por ejemplo, *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes taeniorhynchus*, *Anopheles* spp., *Calliphora erythrocephala*, *Chrysozona pluvialis*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*, *Drosophila* spp., *Fannia canicularis*, *Musca domestica*, *Phlebotomus* spp., *Sarcophaga carnaria*, *Simulium* spp., *Stomoxys calcitrans*, *Tipula paludosa*.
- 65 Del orden de los Lepidoptera, por ejemplo, *Achroia grisella*, *Galleria mellonella*, *Plodia interpunctella*, *Tinea cloacella*,

Tinea pellionella, Tineola bisselliella.

Del orden de los Siphonaptera, por ejemplo, Ctenocephalides canis, Ctenocephalides felis, Pulex irritans, Tunga penetrans, Xenopsylla cheopis.

5 Del orden de los Hymenoptera, por ejemplo, Camponotus herculeanus, Lasius fuliginosus, Lasius niger, Lasius umbratus, Monomorium pharaonis, Paravespula spp., Tetramorium caespitum.

10 Del orden de los Anoplura, por ejemplo, Pediculus humanus capitis, Pediculus humanus corporis, Pempfigus spp., Philloera vastatrix, Phthirus pubis.

Del orden de los Heteroptera, por ejemplo, Cimex hemipterus, Cimex lectularius, Rhodinus prolixus, Triatoma infestans.

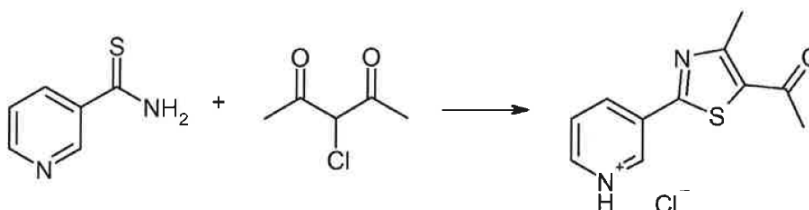
15 En el ámbito de los insecticidas domésticos se usan solos o en combinación con otros principios activos adecuados, tales como esteres fosfóricos, carbamatos, piretroides, neonicotinoides, reguladores del crecimiento o principios activos de otras clases de insecticidas conocidos.

20 Se usan en aerosoles, productos de aerosol libres de presión, por ejemplo aerosoles atomizadores y de bomba, sistemas de nebulización automático, nebulizadores, espumas, geles, productos evaporadores con tabletas de evaporador hechas con celulosa o polímeros, evaporadores líquidos, evaporadores en gel y membrana, evaporadores hélice, libre de energía o pasivos, sistemas de evaporación, papeles, bolsas y geles contra polillas, como gránulos o polvos, en cebos para el esparcimiento o en estaciones de cebo.

25 Ejemplos de Preparación

Ejemplo 1:

Etapas 1: cloruro de 3-(5-acetil-4-metil-tiazol-2-il)-piridinio

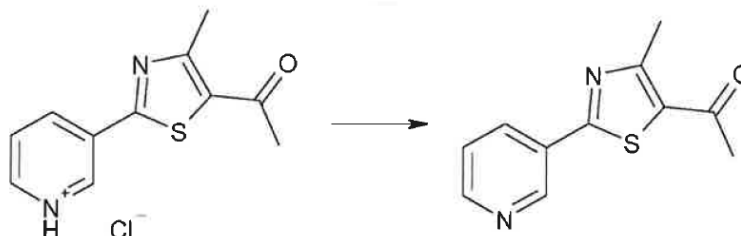


30 Se calentaron 65 g (470,3 mmol) de tionicotinamida y 140 ml (1174,6 mol) cloroacetilacetona en 0,5 l de etanol con uso de un agitador suspendido durante 8 h a reflujo. Tras enfriamiento se succionó el precipitado formado, se lavó con dietiléter y se secó en el evaporador rotativo.

Rendimiento: 109,2 g (91% del valor teórico), logP (HCOOH) 1,48

RMN ¹H (DMSO-D₆): 2,6 (s, 3H), 2,75 (s, 3H), 7,65 (dd, 1H), 8,45 (d, 1H), 8,75 (d, 1H), 9,2 (s, 1H)

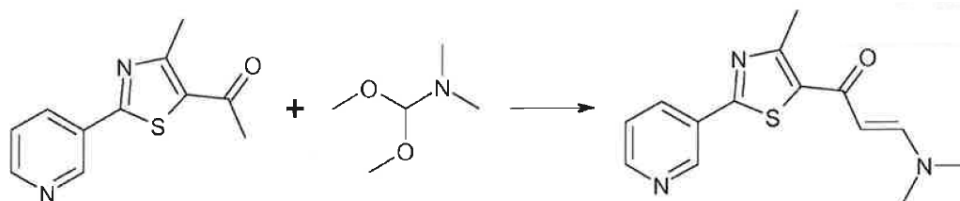
35 **Etapas 2:** 1-(4-Metil-2-piridin-3-il-tiazol-5-il)-etanaona



40 Se disolvieron 109,2g (428,6 mmol) de cloruro de 3-(5-acetil-4-metil-tiazol-2-il)-piridinio en aproximadamente 0,5 l de agua con agitación y se adicionaron lentamente 70 ml (936,7 mmol) de amoniaco ac. al 25%. Se separa el aceite que se solidificó tras algún tiempo de agitación. Se agitó otros 10 min en un baño helado, se succionó, se lavó el precipitado con amoniaco ac. dil. y se secó.

Rendimiento 97,51 g (104% del valor teórico), logP (HCOOH) 1,5

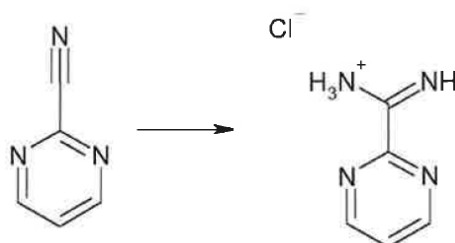
RMN ¹H (DMSO-D₆): 2,6 (s, 3H), 2,75 (s, 3H), 7,55 (dd, 1H), 8,3 (d, 1H), 8,7 (d, 1H), 9,15 (s, 1H)

Etapas 3: 3-Dimetilamino-1-(4-metil-2-piridin-3-il-tiazol-5-il)-propenona

5 Se agitaron 33,53 g (153,6 mmol) de 1-(4-metil-2-piridin-3-il-tiazol-5-il)-etanona y 35 ml (261,4 mol) de DMF-DMA en un puente de destilación muy corto a 95° C durante 1 h, a este respecto se obtuvo algo de destilado. El residuo se evaporó, se cristalizó con enfriamiento. Se cristalizó a partir de benzotrifluoruro.

Rendimiento: 30,52 g (69% del valor teórico), logP (HCOOH) 1,35

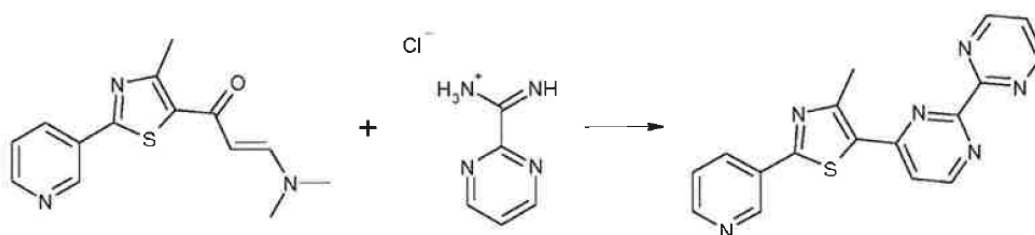
RMN ¹H (DMSO-D6): 2,65 (s, 3H), 3,2 (s, 6H), 5,45 (d, 1H), 7,5 (dd, 1H), 7,65 (d, 1H), 8,25 (d, 1H), 8,65 (d, 1H), 9,1 (s, 1H)

Etapas 4: Clorhidrato de pirimidin-2-carboxamida

10 Se adicionaron a 15,76 g (150 mmol) de 2-piridin-carbonitrilo en 80 ml de metanol, 2,8 ml (15 mol) de una solución al 30% de metanolato de sodio en metanol. Después de 2 días se adicionaron 8 g (150 mmol) de cloruro de amonio y se agitó durante 1 día. Se filtró la mezcla, se evaporó el filtrado, se agitó el residuo con 80 ml de dietiléter, se succionó y se secó.

15 Rendimiento: 20,2 g (84% del valor teórico)

RMN ¹H (DMSO-D6): 7,9 (t, 1H), 9,1 (d, 2H), 9,7 (a, 4H)

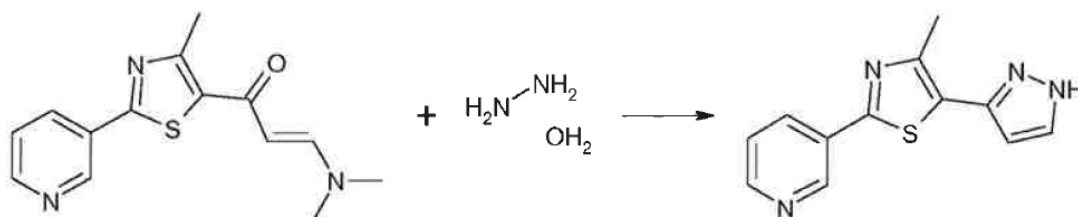
Etapas 5: 4-(4-Metil-2-piridin-3-il-tiazol-5-il)-[2,2']bipirimidinilo

20 Se calentaron a reflujo 2,04 g (7,46 mmol) de 3-dimetilamino-1-(4-metil-2-piridin-3-il-tiazol-5-il)-propenona con 1,22 g (7,69 mmol) de clorhidrato de pirimidin-2-carboxamida y 3 ml (7,96 mol) de una solución al 21% de etanolato de sodio en etanol en 20 ml de etanol durante 16 horas a reflujo. Se evaporó en cloruro de sodio ac., adicionado con ácido cítrico ac., sosa cáustica dil. hasta pH = 12, se extrajo 4 veces con cloroformo/isopropanol, se secaron las fases orgánicas reunidas con sulfato de sodio y se evaporaron. El residuo se purificó por recristalización en benzotrifluoruro, a este respecto se secó brevemente con carbono activo y se filtró en caliente.

25 Rendimiento: 1,91 g (75% del valor teórico), logP (HCOOH) 1,17

RMN ¹H (DMSO-D6): 2,75 (s, 3H), 7,55 (m, 1H), 7,65 (m, 1H), 7,95 (d, 1H), 8,75 (m, 1H), 8,7 (m, 1H), 9,15 (m, 3H), 9,2 (s, 1H)

Ejemplo 2:**Etapas 1:** 3-[4-Metil-5-(1H-pirazol-3-il)-tiazol-2-il]-piridina

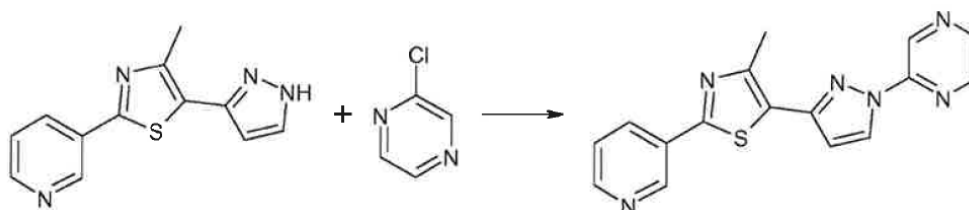


Se calentaron a reflujo 5,04 g (18,4 mmol) de 3-dimetilamino-1-(4-metil-2-piridin-3-il-tiazol-5-il)-propenona en 80 ml de etanol con 2 ml (41,1 mmol) de hidrazina hidratada durante 0,5 h. Se evaporó, se recristalizó el residuo en dioxano.

5 Rendimiento: 3,75g (83% del valor teórico), logP (HCOOH) 1,31

RMN ¹H (DMSO-D6): 2,6 (s, 3H), 6,6 (s, 1H), 7,5 (dd, 1H), 7,8 (s, 1H), 8,25 (d, 1H), 8,65 (m, 1H), 9,1 (s, 1H), 13 (s, 1H)

Etapa 2: 2-[3-(4-Metil-2-piridin-3-il-tiazol-5-il)-pirazol-1-il]-pirazina



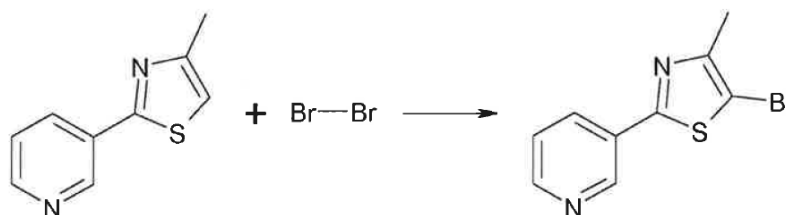
10 Se adicionaron a 0,85 g (3,5 mmol) de 3-[4-metil-5-(1H-pirazol-3-il)-tiazol-2-il]-piridina y 1,2 g (10,4 mmol) de 2-cloropirazina en 50 ml de DMF 0,5 ml de 15-corona-5 y aprox. 0,5 g de hidruro de sodio, se agitó la mezcla durante 1,5 h a 75° C, se adicionó tras enfriamiento ácido fosfórico dil. y se evaporó. Se adicionó al residuo cloruro de sodio ac., acetato de etilo, sosa cáustica diluida hasta pH = 7, se extrajo tres veces con acetato de etilo y otras dos veces con isopropanol. Se secaron las fases orgánicas reunidas con MgSO₄ y se evaporó, se recristalizó el residuo en dioxano y se filtró en caliente a este respecto.

15 Rendimiento: 0,87g (77% del valor teórico), logP (HCOOH) 2,3

RMN ¹H (DMSO-D6): 2,7 (s, 3H), 7 (s, 1H), 7,55 (dd, 1H), 8,3 (d, 1H), 8,6 (m, 1H), 8,65 (m, 2H), 8,7 (m, 1H), 9,15 (m, 1H), 9,2 (s, 1H)

Ejemplo 3:

20 **Etapa 1:** 3-(5-Bromo-4-metil-tiazol-2-il)-piridina

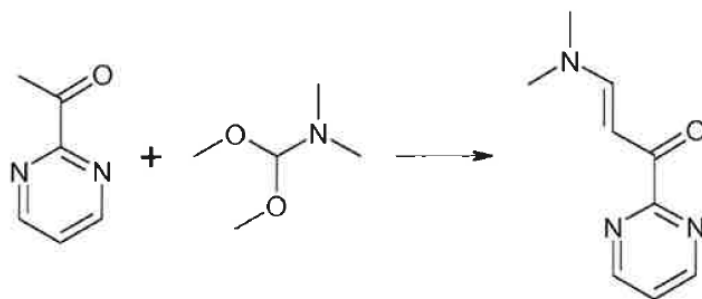


25 Se adicionaron a 16,8 g (95,5 mmol) de 3-(4-metil-tiazol-2-il)-piridina en 200 ml de diclorometano con enfriamiento en baño de hielo 15 ml (292 mol) de bromo. Se succionó el precipitado, se lavó con diclorometano, se suspendió en agua, luego se adicionó carbonato de potasio acuoso, sosa cáustica diluida, hidrogenosulfito de sodio acuoso, y MTBE (metil-terc-butil-éter) y se extrajo tres veces con MTBE. Se secaron las fases orgánicas reunidas con sulfato de sodio y se evaporó.

Rendimiento 17,35 g (71% del valor teórico), logP (HCOOH) 2,3

RMN ¹H (CD₃CN) 2,45 (s, 3H), 7,45 (dd, 1H), 8,15 (d, 1H), 8,75 (d, 1H), 9 (s, 1H)

Etapa 2: 3-Dimetilamino-1-pirimidin-2-il-propenona

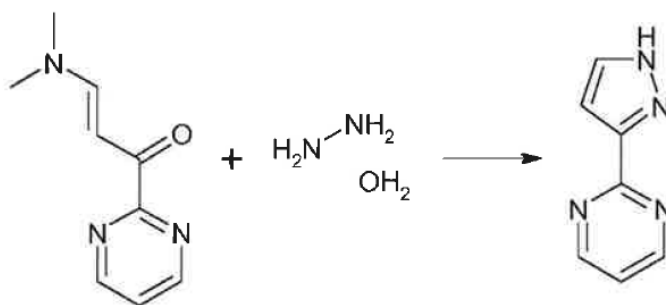


Se agitaron 11 g (90 mmol) de 2-acetilpirimidina con 23 g (193 mmol) de DMF-DMA en un puente de destilación muy corto durante 1 h a 100° C, se obtuvo aquí algo de destilado. Se evaporó, se recristalizó el residuo en benzonitrilo.

5 Rendimiento: 11,4 g (70% del valor teórico)

RMN ¹H (DMSO-D₆): 3,1 (s, 6H), 6 (d, 1H), 7,5 (t, 1H), 7,7 (d, 1H), 8,9 (d, 2H)

Etapas 3: 2-(1H-Pirazol-3-il)-pirimidina

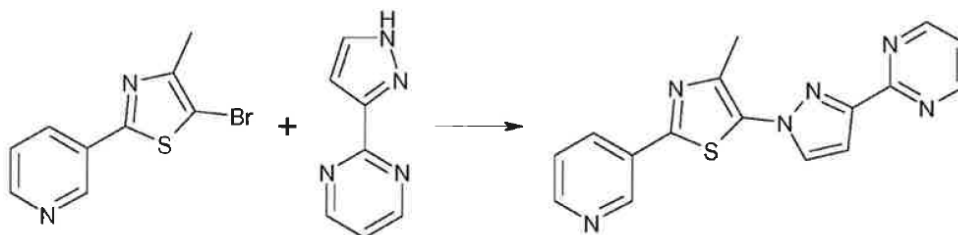


10 Se calentaron a reflujo 11,2 g (63,2 mmol) de 3-dimetilamino-1-piridin-2-il-propenona con 4,5 ml (92,5 mmol) de hidrazina hidratada en 200 ml de EtOH durante 2 h. Se evaporó y se recristalizó el residuo en benzonitrilo.

Rendimiento: 8,72g (94% del valor teórico), logP (HCOOH) 0,1,

RMN ¹H (DMSO-D₆): 9,65 (s, 1H), 7,4 (s, 1H), 7,6-7,8 (a, 1H), 8,85 (m, 2H), 13-13,5 (a, 1H)

Etapas 4: 2-[1-(4-Metil-2-piridin-3-il-tiazol-5-il)-1H-pirazol-3-il]-pirimidina

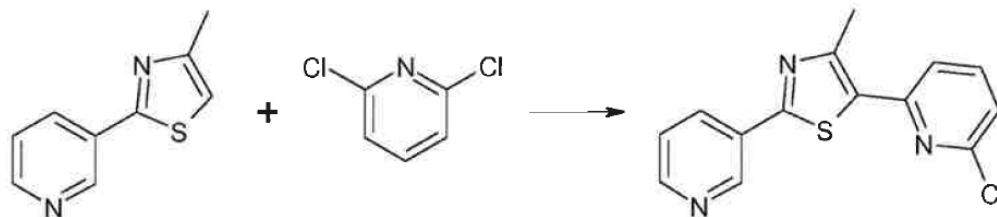


15 Se agitaron 1,96 g (7,6 mmol) de 3-(5-bromo-4-metil-tiazol-2-il)-piridina, 0,96 g (6,5 mmol) de 2-(1H-pirazol-3-il)-pirimidina, 0,15 g (0,78 mmol) de yoduro de cobre (I), 0,15 g (1mmol) de 8-hidroxiquinolina, 3 g (21 mmol) de carbonato de potasio en argón en 20 ml de DMF y unas gota de agua durante 16 h a 120° C. Se evaporó la mezcla, se adiciona ácido cítrico ac., cloruro de sodio ac., solución de tampón fosfato, EDTA sódico y acetato de etilo hasta pH = 6 y se extrajo 4 veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas reunidas se secaron con sulfato de sodio y se evaporaron. Se purificó el residuo mediante cromatografía en gel de sílice (ciclohexano/acetona), luego en gel de sílice RP-18 (agua/acetonitrilo).

Rendimiento: 0,06 g (2% del valor teórico), logP (HCOOH) 1,48,

RMN ¹H (CD₃CN): 2,5 (s, 3H), 7,15 (d, 1H), 7,3 (t, 1H), 7,45 (dd, 1H), 8 (d, 1H), 8,2 (d, 1H), 8,75 (m, 1H), 8,8 (d, 2H), 9,7 (s, 1H)

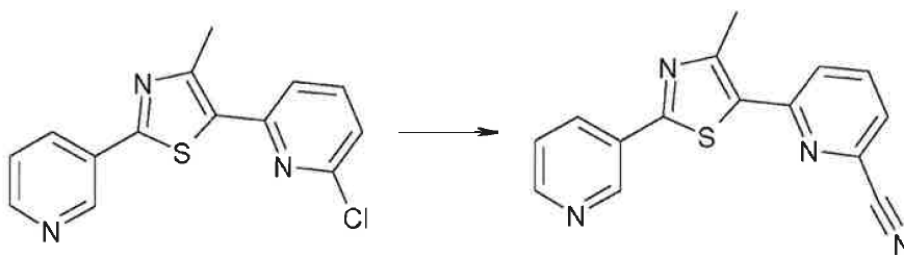
25 **Ejemplo 4:**

Etapas 1: 2-Cloro-6-(4-metil-2-piridin-3-il-tiazol-5-il)-piridina

Se disolvieron 45 mg (0,2 mmol) de acetato de paladio (II) en 10 ml de DMF en argón y se adicionaron 2 ml (0,7 mol) de una solución al 10% de tri-*tert*-butilfosfano en hexano. Se separó el hexano de la mezcla a vacío, y se adicionó 2 g (13,6 mol) de 2,6-dicloropiridina y 1,98 g (11,2 mmol) de 3-(4-metil-tiazol-2-il)-piridina y aproximadamente 1 g de bromuro de tetrabutilamonio como solución en DMF así como 3,1 g (22,5 mmol) de carbonato de potasio y se agitó durante 1 h a 135° C. Se evaporó la mezcla, se adicionó al residuo acetato de etilo, ácido cítrico ac., sosa cáustica diluida hasta pH = 9 y cloruro de sodio ac. y se extrajo tres veces con acetato de etilo. Se secaron y evaporaron las fases orgánicas reunidas con sulfato de sodio, se purificó el residuo mediante cromatografía en gel de sílice (ciclohexano/acetona).

Rendimiento: 0,93 g (22% del valor teórico), logP (HCOOH) 2,66

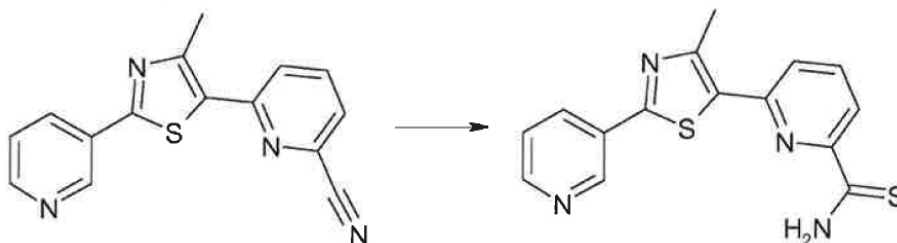
RMN ¹H (DMSO-D₆): 2,7 (s, 3H), 7,45 (d, 1H), 7,55 (m, 1H), 7,75 (d, 1H), 7,95 (t, 1H), 8,3 (d, 1H), 8,65 (m 1H), 9,15 (s, 1H)

Etapas 2: 6-(4-Metil-2-piridin-3-il-tiazol-5-il)-piridin-2-carbonitrilo

Se agitaron 0,5 g (3 mmol) de cloruro de paladio (II) en 25 ml de DMF en argón con 1,6 g (6,1 mmol) de trifetilfosfano durante 10 minutos a 100° C, luego se adicionó a esta mezcla una mezcla de 7,5 g (15,3 mol) de 2-cloro-6-(4-metil-2-piridin-3-il-tiazol-5-il)-piridina y 33,8 g (91 mmol) de hexacianoferrato (II) de potasio y se agitó durante 16 h a 125° C; luego se succionó el material no disuelto, se evaporó el filtrado, se disolvió el residuo en acetato de etilo/agua, se succionó de nuevo el material no disuelto, se extrajo la fase acuosa tres veces con acetato de etilo, se secaron las fases orgánicas reunidas con sulfato de sodio y se evaporó. Se purificó el residuo mediante cromatografía en gel de sílice (ciclohexano/acetona)

Rendimiento: 1,6 g (35% del valor teórico), logP (HCOOH) 2,11

RMN ¹H (DMSO-D₆): 2,7 (s, 3H), 7,35 (m, 1H), 7,5 (m, 1H), 7,75 (m, 1H), 7,9 (m, 1H), 8,3 (m, 1H), 8,65 (m, 1H), 9,15 (s, 1H)

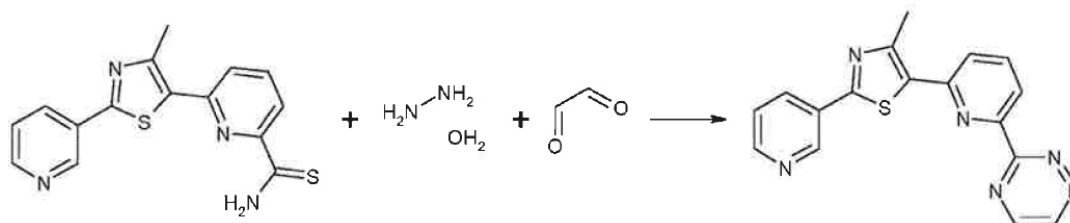
Etapas 3: 6-(4-Metil-2-piridin-3-il-tiazol-5-il)-piridin-2-carbotioamida

Se agitaron 0,36 g (1,3 mmol) de 6-(4-metil-2-piridin-3-il-tiazol-5-il)-piridin-2-carbonitrilo en 5 ml de piridina con 0,2 ml de trietilamina y 0,24 ml (1,4 mmol) de una solución acuosa al 40% de sulfuro de amonio durante 3 h a 50° C, luego se evaporó la mezcla, se agitó con 5 ml de agua enfriada con hielo, se succionó el precipitado, se secó, se hirvió con acetato de etilo, se succionó tras enfriamiento y se secó.

Rendimiento: 0,22 g (51% del valor teórico), logP (HCOOH) 2,13

RMN ¹H (DMSO-D6): 2,7 (s, 3H), 7,55 (m, 1H), 7,95 (m, 1H), 8,1 (m, 1H), 8,35 (m, 1H); 8,4 (d, 1H), 8,7 (m, 1H), 9,15 (m, 1H), 9,5 (a, 1H), 10,5 (s, 1H)

Etapas 4: 3-[6-(4-Metil-2-piridin-3-il-tiazol-5-il)-piridin-2-il]-[1,2,4]triazina



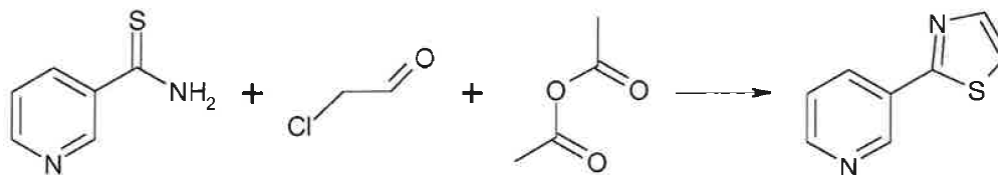
Se agitaron a reflujo 0,23 g (0,7 mol) de 6-(4-metil-2-piridin-3-il-tiazol-5-il)-piridin-2-carbotoamida en 65 ml de etanol caliente con 0,15 ml (2,9 mmol) de hidrazina hidratada durante 1,5 h, luego se adicionaron 0,3 ml de una solución acuosa al 40% de glioxal y se calentó a reflujo durante otros 15 minutos. Se evaporó la mezcla y se purificó el residuo mediante cromatografía en gel de sílice RP-18 (agua/acetronitrilo).

10 Rendimiento: 0,043 g (17% del valor teórico), logP (HCOOH) 1,58

RMN ¹H (DMSO-D6): 2,8 (s, 3H), 7,55 (m, 1H), 8,05 (d, 1H), 8,2 (t, 1H), 8,4 (m, 2H), 8,7 (d, 1H), 9,1 (m, 1H), 9,2 (m, 1H), 9,55 (m, 1H)

Ejemplo 5:

Etapas 1: 3-Tiazol-2-il-piridina

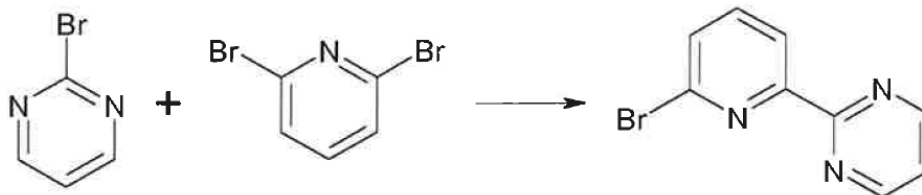


20 Se disolvieron 31,4 g (227 mmol) de tionicotinamida en 150 ml de ácido acético y se adicionaron 28 ml (238 mmol) de cloroacetaldehído al 55 en agua y 110 ml (1171 mmol) de anhídrido de ácido acético. Se agitó durante aproximadamente 16 h a 70° C y se vertió la mezcla enfriada en hielo/amoniaco acuoso, se saturó con NaCl y se agitó durante 3 h. Se decantó del material no disuelto, se filtró con lana de vidrio y se extrajo la mezcla 4 veces con metil-terc-butiléter. Se secaron las fases orgánicas reunidas con MgSO₄ y se evaporaron. Se destiló el residuo a vacío en columna de bolas.

Rendimiento (calculado proporcionalmente a partir de dos intentos) 17 g (46% del valor teórico), logP (HCOOH) 0,62

RMN ¹H (CD₃CN): 7,45 (m, 1H), 7,55 (m, 1H), 7,9 (m, 1H), 8,25 (m, 1H), 8,6 (m, 1H), 9,15 (m, 1H)

Etapas 2: 2-(6-Bromo-piridin-2-il)-pirimidina

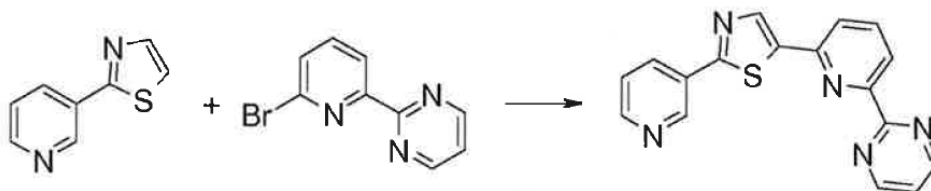


30 Se diluyeron 54,5 ml (137,1 mmol) de una solución 2,5 molar de n-BuLi en 70 ml de THF en argón con 70 ml de THF. Se gotearon a < -70° C 32,5 g (137,1 mmol) de 2,6-dibromopiridina disueltos en 150 ml de THF. Se agitó durante 15 min y se adicionó, adicionalmente a < -70° C, 19,2 ml (107 mmol) de una solución 5,6 molar de cloruro de cinc en dietiléter. Se dejó descongelar, se adicionó una solución de 17,4 g (109 mmol) de bromopirimidina en 50 ml de THF y una suspensión de 3,9 g (3,4 mmol) de tetraquis(trifenilfosfina)paladio en 50 ml de THF. Se hirvió la mezcla durante 4 h a reflujo, tras enfriamiento se adicionó Na-EDTA en agua y se sosa cáustica diluida hasta pH = 10. Se succionó para separar el material no disuelto, se extrajo la fase acuosa tres veces con éster acético, se secaron las fases orgánicas reunidas con MgSO₄ y se evaporó. Se recristalizó el residuo en 60 ml de benzotrifluoruro, a este respecto se hirvió brevemente con carbono activo y se filtró en caliente.

Rendimiento: 14,82g (52% del valor teórico), logP (HCOOH) 1,3

RMN ¹H (CD₃CN): 7,4 (t, 1H), 7,65 (d, 1H), 7,8 (dd, 1H), 8,4 (d, 1H), 8,9 (m, 2H)

Etapa 3: 2-[6-(2-Piridin-3-il-tiazol-5-il)-piridin-2-il]-pirimidina

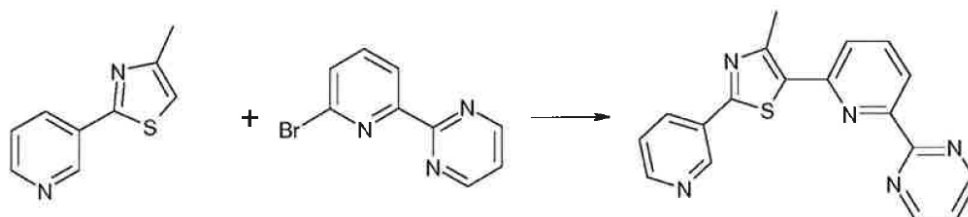


- 5 Se agitaron en argon 0,53 g (3 mmol) de cloruro de paladio (II) y 1,88 g (6 mmol) de tri-*o*-tolilfosfano y 1,87 g de cloruro de tetrabutilamonio con 55 ml de DMF durante 5 min a 95° C, luego se adicionaron 9,73 g (60 mmol) de 3-tiazol-2-il-piridina y 12,74 g (54 mmol) de 2-(6-bromo-piridin-2-il)-pirimidina como solución en DMF así como 16,28 g (116mmol) de carbonato de potasio y se agitó durante 4 h a 130° C. Se evaporó la mezcla, se adicionaron en acetato de etilo cloruro de sodio ac., ácido cítrico ac., sosa cáustica dil. a pH = 10, se agitó con cloroforno/isopropanol al 10%, se succionó del material no disuelto, se extrajo la fase acuosa otras dos veces con cloroforno/isopropanol al 10%, se secaron las fases orgánicas reunidas con sulfato de sodio y se evaporaron. Se purificó el residuo mediante cromatografía en gel de sílice (ciclohexano/acetona). El producto obtenido se puede purificar aún más mediante cristalización en benzotrifluoruro/dioxano.

Rendimiento: 9 g (44% del valor teórico), logP (HCOOH)1,53

- 15 RMN ¹H (CD₃CN): 7,55 (m, 2H), 8,1 (m 1H), 8,15 (m, 1H), 8,3 (m 1H), 8,35 (m, 1H), 8,7 (m, 2H), 9,0 (d 2H), 9,2 (s, 1H)

Ejemplo 6: 2-[6-(4-Metil-2-piridin-3-il-tiazol-5-il)-piridin-2-il]-pirimidina



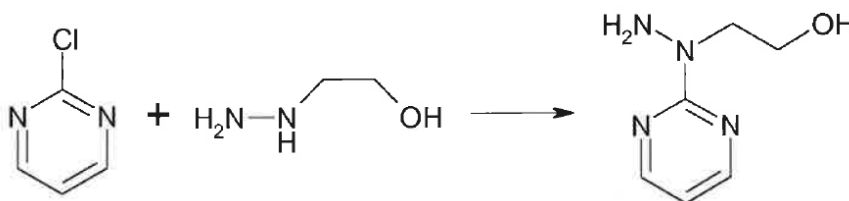
- 20 Se disolvieron 13 mg (0,059 mmol) de acetato de paladio en 5 ml de DMF en argon y se adicionaron 0,6 ml (0,23 mol) de una solución al 10% de tri-*tert*-butilfosfano en hexano. Se evaporó el hexano a vacío y se adicionaron 0,26 g (1,45 mmol) de 3-(4-metil-tiazol-2-il)-piridina, 0,38 g (1,62 mmol) de 2-(6-bromo-piridin-2-il)-pirimidina, 0,4 g (2,92 mmol) de carbonato de potasio y aproximadamente 0,5 g de cloruro de tetrabutilamonio y se agitó la mezcla resultante durante 48 horas a 130° C en argon. Luego se evaporó, se disolvió en acetato de etilo, NaCl ac., ácido cítrico ac., sosa cáustica dil. hasta pH = 8. Se extrajo 3 veces con acetato de etilo, se secaron las fases orgánicas reunidas con sulfato de sodio y se evaporaron, se purificó el residuo mediante cromatografía en gel de sílice (ciclohexano/acetona). Para una purificación adicional se recrystalizó la sustancia en benzotrifluoruro.

Rendimiento: 0,175 g (35% del valor teórico), logP (HCOOH) 1,75

RMN ¹H (CD₃CN): 2,75 (s, 3H), 7,45 (m, 2H), 7,4 (m, 1H), 8,0 (m, 1H), 8,3 (m, 2H), 8,6 (m, 1H), 8,9 (m, 2H), 9,2 (m, 1H)

30 **Ejemplo 7:**

Etapa 1: 2-(*N*-Pirimidin-2-il-hidrazino)-etanol



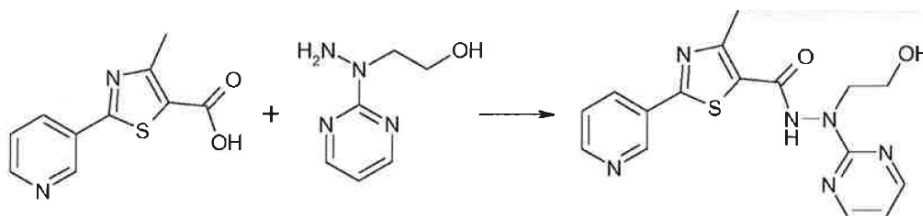
Se calentaron a reflujo 4,8 g (41,9 mmol) de 2-cloropirimidina en 100 ml de etanol con 3,6 g (47 mmol) de hidrazinoetanol y 9 g (64,2 mmol) de carbonato de potasio durante 5 h. Se succionó la mezcla y se evaporó el

filtrado.

Rendimiento: 5,98 g (87% del valor teórico)

RMN ¹H (DMSO-D6): 3,65 (m 2H), 3,75 (t, 2H), 4,35 (a, 1H), 4,65 (a, 2H), 6,55 (t, 1H), 8,3 (d, 2H)

Etapla 2: Hidroxi-etil-*N*-pirimidin-2-il-hidrazida de ácido 4-metil-2-piridin-3-il-tiazol-5-carboxílico



5

Se disolvieron 0,8 g (3,7 mmol) de ácido 4-metil-2-piridin-3-il-tiazol-5-carboxílico en 150 ml de DMF/acetonitrilo, se adicionaron 6 ml de trietilamina y 0,4 ml (4 mmol) de clorocarbonato de etilo. Se agitó durante 10 min, se adicionaron 0,6 g (4 mmol) de 2-(*N*-pirimidin-2-il-hidrazino)-etanol, se agitó durante 20 min. y se evaporó. Se adicionó al residuo con acetato de etilo, ácido cítrico ac., sosa cáustica dil. hasta pH = 8 y cloruro de sodio ac., se extrajo tres veces con acetato de etilo; se secaron las fases orgánicas reunidas con sulfato de sodio y se evaporaron. Se purificó el residuo mediante cromatografía en gel de sílice (ciclohexano/acetona).

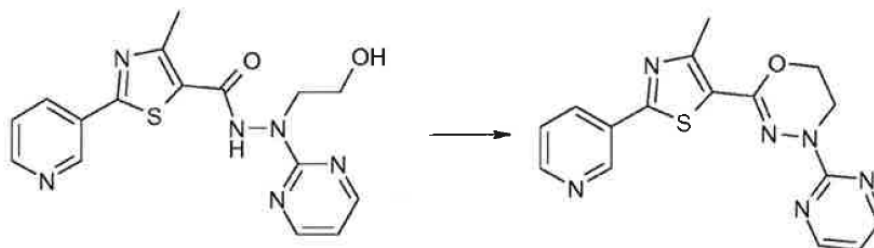
10

Rendimiento: 0,42 g (31% del valor teórico), logP (HCOOH) 1,08

RMN ¹H (DMSO-D6): 2,7 (s, 3H), 3,7 (m, 2H), 3,95 (m, 2H), 4,45 (m, 1H), 6,8 (m, 1H), 7,55 (m, 1H), 8,35 (d, 1H), 8,45 (d, 2H), 8,7 (m, 1H), 9,15 (s, 1H), 10,5 (s, 1H)

15

Etapla 3: 2-(4-Metil-2-piridin-3-il-tiazol-5-il)-4-pirimidin-2-il-5,6-dihidro-4*H*-[1,3,4]oxadiazina



Se agitaron 0,46 g (1,3 mol) de hidroxi-etil-*N*-pirimidin-2-il-hidrazida de ácido 4-metil-2-piridin-3-il-tiazol-5-carboxílico con 0,4 g (1,5 mmol) de trifetilfosfano y 0,3 ml de DIAD en 5 ml de acetonitrilo durante 16 h, luego se evaporó la mezcla y se sometió el residuo a cromatografía en gel de sílice (ciclohexano/acetona).

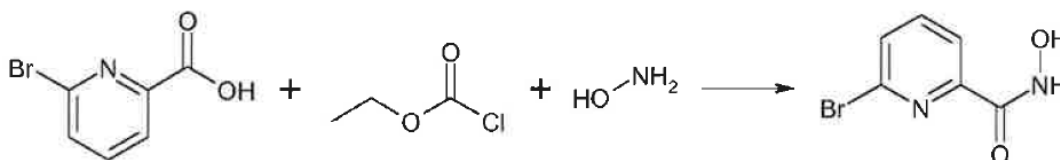
20

Rendimiento: 0,1 g (23% del valor teórico), logP (HCOOH) 1,56

RMN ¹H (DMSO-D6): 2,7 (s, 3H), 4,2 (t, 2H), 4,6 (t, 2H), 6,9 (t, 1H), 7,5 (dd, 1H), 8,3 (d, 1H), 8,55 (d, 2H), 8,65 (m, 1H), 9,1 (s, 1H)

Ejemplo 8:

Etapla 1: Hidroxiamida de ácido 6-bromo-piridin-2-carboxílico

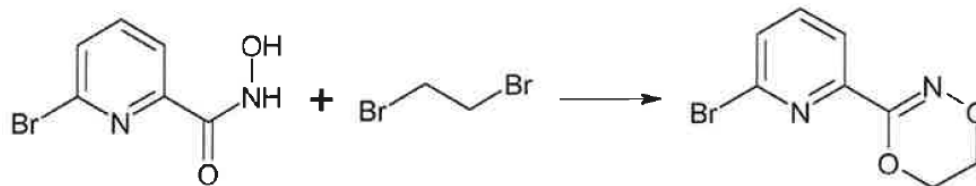


25

Se adicionaron a 10,2 g (50,5 mmol) de ácido bromopicolínico en 100 ml de diclorometano 40 ml de trietilamina y luego con enfriamiento en baño de hielo 6 ml (63 mol) de clorocarbonato de etilo y tras 10 minutos de agitación se adicionaron 6 ml (101 mmol) de una solución acuosa al 50% de hidroxilamina. Se agitó durante 1 h a temperatura ambiente, se evaporó, se adicionó al residuo ácido cítrico ac. y acetato de etilo y se extrajo varias veces con acetato de etilo. Se secaron las fases orgánicas reunidas con sulfato de sodio y se evaporó.

30

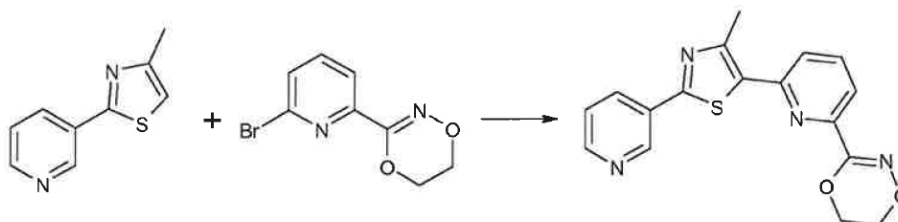
Rendimiento: 11,8 g (al 22%) logP (HCOOH) 0,69

Etapa 2: 3-(6-Bromo-piridin-2-il)-5,6-dihidro-[1,4,2]dioxazina

5 Se calentaron a reflujo 11,8 g (producto bruto de la etapa previa) de hidroxamida de ácido 6-bromo-piridin-2-carboxílico con 6 ml (69 mmol) de 1,2-dibrometano y 18 g (128 mmol) de carbonato de potasio en 100 ml de etanol durante 3 h a reflujo. Se succionó, se evaporó, se disolvió el residuo en diclorometano/etanol, se succionó en gel de sílice con MTBE y se evaporó el filtrado.

Rendimiento: 3,03 g logP (HCOOH)1,37

RMN ¹H (CD₃CN): 4,15 (m, 2H), 4,45 (m, 2H), 7,6 (d, 1H), 7,7 (t, 1H), 7,8 (d, 1H)

Etapa 3: 3-[6-(4-Metil-2-piridin-3-il-tiazol-5-il)-piridin-2-il]-5,6-dihidro-[1,4,2]dioxazina

10 Se disolvieron en argón 23 mg (0,1 mmol) de acetato de paladio (II) en 15 ml de DMF, se adicionaron 0,25 ml (0,25 mol) de una solución 1 molar de tri-terc-butilfosfano, luego 0,18 g (1mmol) de 3-(4-metil-tiazol-2-il)-piridina, 0,24 g (1 mmol) de 3-(6-bromo-piridin-2-il)-5,6-dihidro-[1,4,2]dioxazina, 0,2 g de cloruro de tetrabutilamonio como solución en DMF y 1 ml de una solución 2 molar de carbonato de potasio en agua y se agitó durante 5 h a 130° C. Se evaporó, se adicionó al residuo acetato de etilo, sosa cáustica diluida, ácido cítrico ac. hasta pH = 7, cloruro de sodio ac., se extrajo tres veces con acetato de etilo, se secaron las fases orgánicas reunidas con sulfato de sodio y se evaporó. Se purificó el residuo mediante cromatografía en gel de sílice (ciclohexano/acetona).

15 Rendimiento: 0,06 g (17% del valor teórico), logP (HCOOH) 1,81

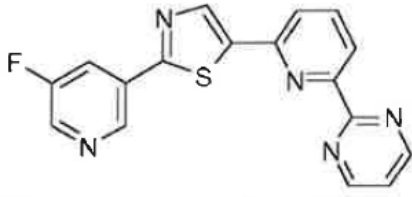
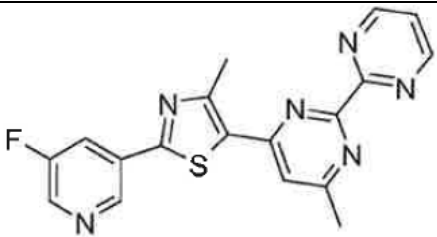

20 RMN ¹H (CD₃CN): 2,75 (s, 3H), 4,2 (dd, 2H), 4,55 (dd, 2H), 7,45 (m, 1H), 7,8 (m, 2H), 7,9 (t, 1H), 8,3 (d, 1H), 8,65 (m, 1H), 9,2 (s, 1H)

Compuestos novedosos de acuerdo con la invención se enumeran en la tabla a continuación.

Ej. n°	logP ¹⁷ (HCOOH)	Fórmula	(M ⁺)+1 (CL/EM)
152	2,43		350,1

25

(continuación)

153	2,11		336,1
185	1,68		
186	1,63		351,1

5 1) Descripción del procedimiento para determinar los valores de logP (procedimiento de ácido fórmico)

Los valores logP proporcionados en la tabla se determinaron de acuerdo con la Directiva EEC 79/831 Anexo V.A8 mediante HPLC (Cromatografía Líquida de Alta Eficacia) en una columna de fase reversa (C 18). Temperatura: 55°C.

10 Fases móviles para la determinación en el rango de ácido (pH 3,4):

Fase móvil A: Acetonitrilo + 1 ml de ácido fórmico/litro. Fase móvil B: agua+ 0,9 ml de ácido fórmico /litro.

15 Gradiente: desde 10 % de fase móvil A/90 % de fase móvil B a 95 % de fase móvil A/5 % de fase móvil B en 4,25 min.

20 La calibración se llevó a cabo usando alcan-2-onas no ramificadas (que tienen de 3 a 16 átomos de carbono) con valores logP conocidos (determinación de los valores logP mediante los tiempos de retención usando interpolación lineal entre dos alcanonas sucesivas). Los valores máx lambda se determinaron en la máxima de las señales cromatográficas usando espectros UV de 200 nm a 400 nm.

Tabla 2

Ej. nº	Datos de RMN (ppm)
152	DMSO-d6: 2,80 (s, 3H), 7,55 (m, 1H), 8,12 (m, 1H), 8,20 (m, 1H), 8,32 (m, 1H), 8,65 (m, 1H), 9,05 (m, 3H)
153	DMSO-d6: 7,58 (m, 1H), 8,10-8,30 (m, 4H), 8,70 (m, 2H), 9,00 (m, 2H), 9,10 (m, 1H), 9,00 (m, 1H)
186	DMSO-d6: 2,88 (s, 3H), 7,62 (m, 1H), 7,97 (m, 1H), 8,27 (m, 1H), 8,70 (m, 1H), 9,05 (m, 4H)

25

Ejemplos Biológicos

Ejemplo N.º 1

30

Prueba de Myzus (tratamiento de aerosol)

Solventes: 78,0 partes en peso de acetona

1,5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionador: 0,5 parte en peso de éter de poliglicol alquilarilo

5

Para producir una preparación adecuada del compuesto activo, 1 parte en peso del compuesto activo se mezcla con las cantidades establecidas de solventes y emulsionador, y el concentrado se diluye con agua con emulsionador en la concentración deseada.

10

Los discos de hojas de repollo chino (*Brassica pekinensis*), que se infectan en exceso en todas las etapas del pulgón verde del duraznero (*Myzus persicae*), se rocían con preparación de compuesto activo de la concentración deseada.

Después del periodo de tiempo deseado, se determina el efecto en %. El 100 % significa que han muerto todos los pulgones; 0 % significa que ninguno de los pulgones ha muerto.

15

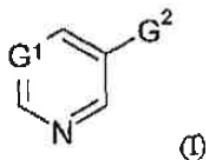
En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una actividad de ≥ 80 % a una velocidad de aplicación de 500 g/ha:

20

Ej. N.º 152, 153.

REIVINDICACIONES

1. Uso no terapéutico de compuestos de fórmula (I),

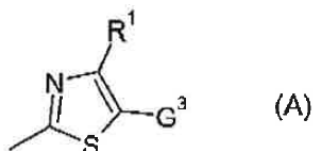


5 en la que

(Ia)

G¹ representa C-halógeno,

G² representa

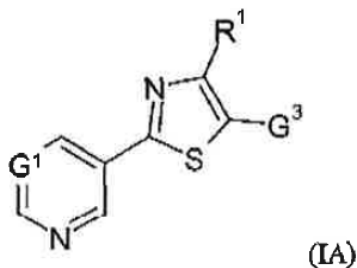


10 en la que

R¹ representa hidrógeno o alquilo y

G³ representa heterociclilo dado el caso sustituido, heteroarilo dado el caso sustituido o arilo dado el caso sustituido, así como sales, óxidos de metal y N-óxidos de los compuestos de la fórmula (I), para controlar plagas.

2. Compuestos de fórmula (IA)



15

G¹ representa halógeno,

R¹ representa hidrógeno y

20 G³ representa oxazolinilo, dihidrooxadiazinilo, dihidrodioxaninilo o hidroxipiridilo dado el caso sustituidos con halógeno, ciano, nitro, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, haloalquiltio, alquilsulfínilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfínilo, haloalquilsulfonilo, amino, alquilamino, dialquilamino, alquilcarbonilamino, alcocarbonilamino, alcóxialquilo, haloalcoxialquilo, alquenilo, alquenilo, alquilocicloalquilo, alquilcarbonilo, alcocarbonilo, aminocarbonilo, piridilo o pirimidilo,

25 representa hetarilo del grupo constituido por pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, benzofurilo, bencisofurilo, benzotienilo, bencisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, bencisotiazolilo, benzoxazolilo, bencisoxazolilo, bencimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazol, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo e indolizínilo, en particular, piridilo, pirimidilo, imidazolilo, pirazolilo, triazinilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxadiazolilo u oxazolilo, dado el caso sustituido con halógeno, nitro, amino, alquilamino, dialquilamino, alquilo, haloalquilo, cicloalquilalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, alcóxialquilo, bis(alcoxi)alquilo, alcocarbonilo, alfa-hidroxiiminoalcoxycarbonilmetilo, alfa-alcóxiiminoalcoxycarbonilmetilo, C(X)NR²R³, (en el que X representa oxígeno o azufre, R² representa hidrógeno o alquilo y R³ representa alquilo, haloalquilo, alcoxi, cianoalquilo, alquinilo,

30

cicloalquilo, cicloalquilalquilo, alcoxialquilo, alquiltioalquilo o arilalquilo), alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, los radicales heterocíclico morfolinilo, triazolinonilo, dihidrodioxazinilo, dihidrooxadiazinilo, dioxolanilo, dioxanilo, piperidinonilo, pirrolidinonilo y pirazolinonilo (que por su parte pueden estar sustituidos con alquilo o haloalquilo), fenilo (que por su parte puede estar sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo o haloalquilo), los radicales heteroarilo pirrolilo, piridilo, piridilo N-óxido, pirimidilo, imidazolilo, pirazolilo, oxazolilo, tiazolilo, furanilo, tienilo, triazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, pirazinilo, triazinilo, tetrazinilo e isoquinolinilo (que por su parte pueden estar sustituidos con halógeno, nitro, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alcoxialquilo, alquiltio, alquiltioalquilo y cicloalquilo), los radicales heteroarilalquilo triazolilalquilo, piridilalquilo, pirimidilalquilo u oxadiazolilalquilo (que por su parte pueden estar sustituidos con alquilo) o

representa fenilo dado el caso sustituido con halógeno, ciano, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, dioxolanilo, piperidinonilo, pirrolidinonilo o dihidrodioxazinilo.

3. Compuestos de fórmula (IA) según la reivindicación 2, en la que

G¹ representa C-halógeno,

R¹ representa hidrógeno y

G³ representa en cada caso oxazolinilo, dihidrooxadiazinilo, dihidrodioxazinilo o hidroxipiridilo dado el caso sustituidos con halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-tio, haloalquil C₁-C₆-tio, alquil C₁-C₆-sufinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, haloalquil C₁-C₆-sufinilo, haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, amino, alquil C₁-C₆-amino, di(alquil C₁-C₆)amino, alquil C₁-C₆-carbonilamino, alcoxi C₁-C₆-carbonilamino, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alquil C₁-C₆-cicloalquilo C₃-C₆, alquil C₁-C₆-carbonilo, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, aminocarbonilo, piridilo o pirimidilo,

representa en cada caso pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, benzofurilo, bencisofurilo, benzotienilo, benzotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, bencisotiazolilo, benzoxazolilo, bencisoxazolilo, bencimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazol, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo e indolizínilo (en particular, piridilo, pirimidilo, imidazolilo, pirazolilo, triazinilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxadiazolilo u oxazolilo), dado el caso sustituidos con halógeno, nitro, amino, alquil C₁-C₆-amino, di(alquil C₁-C₆)amino, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-tio, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, bis(alcoxi C₁-C₆)-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, alfa-hidroxiimino-alcoxi C₁-C₆-carbonilmetilo, alfa-alcoxi C₁-C₆-iminoalcoxi C₁-C₆-carbonilmetilo, C(X)NR²R³, (en el que X representa oxígeno o azufre, R² representa hidrógeno o alquilo C₁-C₆ y R³ representa alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, ciano-alquilo C₁-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquil C₁-C₆-tioalquilo C₁-C₆ o fenilalquilo C₁-C₆), alquil C₁-C₆-sufinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, los radicales heterocíclico morfolinilo, triazolinonilo, dihidrodioxazinilo, dihidrooxadiazinilo, dioxolanilo, dioxanilo, piperidinonilo, pirrolidinonilo y pirazolinonilo (que por su parte pueden estar sustituidos con alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆), fenilo (que por su parte puede estar sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆), los radicales heteroarilo pirrolilo, piridilo, piridilo N-óxido, pirimidilo, imidazolilo, pirazolilo, oxazolilo, tiazolilo, furanilo, tienilo, triazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, pirazinilo, triazinilo, tetrazinilo e isoquinolinilo (que por su parte pueden estar sustituidos con halógeno, nitro, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquil C₁-C₆-tio, alquil C₁-C₆-tioalquilo C₁-C₆ y cicloalquilo C₃-C₆), los radicales heteroarilalquilo triazolil-alquilo C₁-C₆, piridil-alquilo C₁-C₆, pirimidil-alquilo C₁-C₆ o oxadiazolil-alquilo C₁-C₆ (que por su parte pueden estar sustituidos con alquilo C₁-C₆) o

representa fenilo dado el caso sustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, dioxolanilo, piperidinonilo, pirrolidinonilo o dihidrodioxazinilo.

4. Compuestos de fórmula (IA) según la reivindicación 2, en la que

G¹ representa C-halógeno,

R¹ representa hidrógeno y

G³ representa en cada caso oxazolinilo, dihidrooxadiazinilo, dihidrodioxazinilo o hidroxipiridilo dado el caso sustituidos con halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio, haloalquil C₁-C₄-tio, alquil C₁-C₄-sufinilo, alquil C₁-C₄-sulfonilo, haloalquil C₁-C₄-sufinilo, haloalquil C₁-C₄-sulfonilo, amino, alquil C₁-C₄-amino, di(alquil C₁-C₄)amino, alquil C₁-C₄-carbonilamino, alcoxi C₁-C₄-carbonilamino, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, alquil C₁-C₄-cicloalquilo C₃-C₆, alquil C₁-C₄-carbonilo, alcoxi C₁-C₄-carbonilo, aminocarbonilo, piridilo o pirimidilo,

representa en cada caso pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo,

1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, benzofurilo, bencisofurilo, benzotienilo, bencisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, bencisotiazolilo, benzoxazolilo, bencisoxazolilo, bencimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazol, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo e indolizino (en particular, piridilo, pirimidilo, imidazolilo, pirazolilo, triazinilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxadiazolilo u oxazolilo), dado el caso sustituidos con halógeno, nitro, amino, alquil C₁-C₄-amino, di(alquilo C₁-C₄)amino, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, bis(alcoxi C₁-C₄)-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-carbonilo, alfa-hidroxiimino-alcoxi C₁-C₄-carbonilmetilo, alfa-alcoxi C₁-C₄-iminoalcoxi C₁-C₄-carbonilmetilo, C(X)NR²R³, (en el que X representa oxígeno o azufre, R² representa hidrógeno o alquilo C₁-C₄ y R³ representa alquilo C₁-C₅, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆, ciano-alquilo C₁-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio-alquilo C₁-C₄ o fenil-alquilo C₁-C₄), alquil C₁-C₄-sulfino, alquil C₁-C₄-sulfonilo, los radicales heterocíclico morfolinilo, triazolinonilo, dihidrodioxazinilo, dihidrooxadiazinilo, dioxolanilo, dioxanilo, piperidinonilo, pirrolidinonilo y pirazolinonilo (que por su parte pueden estar sustituidos con alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄), fenilo (que por su parte puede estar sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄), los radicales heteroarilo pirrolilo, piridilo, piridilo N-óxido, pirimidilo, imidazolilo, pirazolilo, oxazolilo, tiazolilo, furanilo, tienilo, triazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, pirazinilo, triazinilo, tetrazinilo e isoquinolinilo (que por su parte pueden estar sustituidos con halógeno, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio, alquil C₁-C₄-tioalquilo C₁-C₄ y cicloalquilo C₃-C₆), los radicales heteroarilalquilo triazolil-alquilo C₁-C₄, piridil-alquilo C₁-C₄, pirimidil-alquilo C₁-C₄ u oxadiazolil-alquilo C₁-C₄ (que por su parte pueden estar sustituidos con alquilo C₁-C₄) o

representa fenilo dado el caso sustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, dioxolanilo, piperidinonilo, pirrolidinonilo o dihidrodioxazinilo.

5. Compuestos de fórmula (IA) según la reivindicación 2, en la que

G¹ representa C-halógeno,

R¹ representa hidrógeno y

G³ representa en cada caso oxazolinilo, dihidrooxadiazinilo o hidroxipiridilo dado el caso sustituidos con piridilo o pirimidinilo,

representa en cada caso pirazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, 1,3,5-triazinilo, triazinilo u oxadiazolilo, dado el caso sustituidos con halógeno, nitro, amino, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, bis(alcoxi C₁-C₄)-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-carbonilo, alfa-hidroxiimino-alcoxi C₁-C₄-carbonilmetilo, C(X)NR²R³, (en el que X representa oxígeno o azufre, R² representa hidrógeno y R³ representa alquilo C₁-C₅, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ ciano-alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio-alquilo C₁-C₄ o fenil-alquilo C₁-C₄), alquil C₁-C₄-tio, alquil C₁-C₄-sulfonilo, los radicales heterocíclico morfolinilo, triazolinonilo, dihidrodioxazinilo, dihidrooxadiazinilo, piperidinonilo, pirrolidinonilo y pirazolinonilo (que por su parte pueden estar sustituidos con alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄), fenilo (que por su parte pueden estar sustituidos con halógeno), los radicales heteroarilo pirrolilo, piridilo, piridilo N-óxido, pirimidinilo, pirazolilo, tiazolilo, furanilo, tienilo, triazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, pirazinilo, triazinilo e isoquinolinilo (que por su parte pueden estar sustituidos con halógeno, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcanodifilo C₃-C₄, , alcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆), los radicales heteroarilalquilo triazolil-alquilo C₁-C₄, piridil-alquilo C₁-C₄, pirimidil-alquilo C₁-C₄ u oxadiazolil-alquilo C₁-C₄ (que por su parte pueden estar sustituidos con alquilo C₁-C₄) o

representa fenilo dado el caso sustituido con halógeno, haloalquilo C₁-C₄, dioxolanilo, piperidinonilo, pirrolidinonilo o dihidrodioxazinilo.

6. Medio, **caracterizado por** un contenido de al menos un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 2 a 5.

7. Procedimiento no terapéutico para controlar plagas, **caracterizado porque** un compuesto de la fórmula (I), de acuerdo con las reivindicaciones 2 a 5, o un medio de acuerdo con la reivindicación 6 se dejan actuar sobre las plagas y/o su hábitat.