

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 573 149**

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 12191540 (9)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **13.01.2016 EP 2591674**

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:

06.06.2016

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, DR.;
FÜSSLEIN, MARTIN, DR.;
HENSE, ACHIM, DR.;
KLUTH, JOACHIM, DR.;
FRANKEN, EVA-MARIA, DR.;
GÖRGENS, ULRICH, D.I.;
SCHWARZ, HANS-GEORG, DR.;
KÖHLER, ADELINE, DR.;
MALSAM, OLGA, DR.;
VOERSTE, ARND, DR. y
BECKER, ANGELA, DR.**

74 Agente/Representante:

CARPINTERO LÓPEZ, Mario

ES 2 573 149 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.

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).

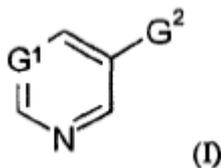
10 También se conocen los compuestos de tiadiazol. Los documentos CH 411 906 y EP 0 288 432 A1 describen el uso de dichos compuestos como abrillantadores ópticos. En el documento CH 409 511 se divulgan tiadiazoles adecuados para controlar nematodos. El documento DE 3641184 describe ciertos tiadiazoles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

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

15 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.

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

25 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),

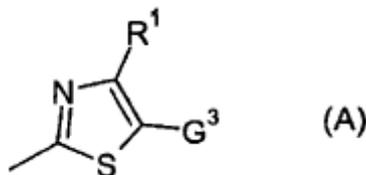


en la que

(Ia)

G¹ representa CH,

30 G² representa



en la que

R¹ representa hidrógeno o alquilo y

35 G³ representa en cada caso 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, alcocarbonilamino, alcocalquilo, haloalcoxialquilo, alquenilo, alquínilo, alquícicloalquilo, alquilcarbonilo, alcocarbonilo, 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, benzisofurilo, benzotienilo, benzisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, benzisotiazolilo, benzoxazolilo, benzisoxazolilo, benzimidazolilo, 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 y oxazolilo, dado el caso sustituidos con halógeno, nitro, amino, alquilamino, dialquilamino, alquilo, haloalquilo, cicloalquilalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, alcoxialquilo, bis(alcoxi)alquilo, alcoxicarbonilo, alfa-hidroxiiminoalcoxicarbonilmetilo, alfa-alcoxiiminoalcoxicarbonilmetilo, 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 o R² y R³ junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo), alquiltio, alquilsulfonilo, alquilsulfonilo, los radicales heterociclico 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, alcanediilo, 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, piperidinonilo, pirrolidinonilo, dioxolanilo o dihidrodioxazinilo,

y también sales, complejos de metal y N-óxidos de los compuestos de la fórmula (I) que pueden usarse 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.

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.

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

R¹ representa hidrógeno o alquilo-C₁-C₆ 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, alquiltio-C₁-C₆, haloalquiltio-C₁-C₆, alquilsulfonilo-C₁-C₆, alquilsulfonilo-C₁-C₆, haloalquilsulfonilo-C₁-C₆, haloalquilsulfonilo-C₁-C₆, amino, alquilamino-C₁-C₆, di(alquil-C₁-C₆)amino, alquicarbonilamino-C₁-C₆, alcoxicarbonilamino-C₁-C₆, alcoxí-C₁-C₆-alquilo-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆-alquilo-C₁-C₆, alquenilo-C₂-C₆, alquinilo-C₂-C₆, alquilo-C₁-C₆- cicloalquilo-C₃-C₆, alquicarbonilo-C₁-C₆, alcoxicarbonilo-C₁-C₆, 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, benzisofurilo, benzotienilo, benzisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, benzisotiazolilo, benzoxazolilo, benzisoxazolilo, benzimidazolilo, 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, alquilamino-C₁-C₆, di(alquilo-C₁-C₆)amino, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, cicloalquilo-C₃-C₆-alquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆, alcoxí-C₁-C₆-alquilo-C₁-C₆, bis(alcoxi-C₁-C₆)-alquilo-C₁-C₆, alcoxicarbonilo-C₁-C₆, alfa-hidroxiimino-alcoxicarbonilmetilo-C₁-C₆, alfa-alcoxiimino-C₁-C₆-alcoxicarbonilmetilo-C₁-C₆, 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, cicloalquil-C₃-C₆-alquilo-C₁-C₆, alcoxí-C₁-C₆-alquilo-C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆-alquilo-C₁-C₆ o fenil-alquilo-C₁-C₆), alquilsulfonilo-C₁-C₆, alquilsulfonilo-C₁-C₆, los radicales heterociclico morfolinilo, triazolinonilo, dihidrodioxazinilo,

- 5 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, alcanediilo-C₃-C₅, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆-alquilo-C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆-alquilo-C₁-C₆ o 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
- 10 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 preferencia particular al uso de compuestos de la fórmula (I), en la que

- R¹ representa hidrógeno o alquilo-C₁-C₄ y
- 15 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, alquiltio-C₁-C₄, haloalquiltio-C₁-C₄, alquilsufinilo-C₁-C₄, alquilsulfonilo-C₁-C₄, haloalquilsufinilo-C₁-C₄, haloalquilsulfonilo-C₁-C₄, amino, alquilamino-C₁-C₄, di(alquil-C₁-C₄)amino, alquilcarbonilamino-C₁-C₄, alcoxycarbonilamino-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄, haloalcoxi-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄, alquenilo-C₂-C₄, alquinilo-C₂-C₄, alquil-C₁-C₄-cicloalquilo-C₃-C₆, alquilcarbonilo-C₁-C₄, alcoxycarbonilo-C₁-C₄, aminocarbonilo, piridilo o pirimidilo,
- 20 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, benzisofurilo, benzotienilo, benzisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, benzisotiazolilo, benzoxazolilo, benzisoxazolilo, benzimidazolilo, 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
- 30 halógeno, nitro, amino, alquilamino-C₁-C₄, di(alquil-C₁-C₄)amino, alquilo-C₁-C₄, haloalquilo-C₁-C₄, cicloalquilo-C₃-C₆-alquilo-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄, haloalcoxi-C₁-C₄, alquiltio-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄, bis(alcoxi-C₁-C₄)-alquilo-C₁-C₄, alcoxycarbonilo-C₁-C₄, alfa-hidroxiimino-alcoxycarbonilmetilo-C₁-C₄, alfa-alcoxiimino-C₁-C₄-alcoxycarbonilmetilo-C₁-C₄, 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, alquiltio-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄ o fenil-alquilo-C₁-C₄), alquilsufinilo-C₁-C₄, alquilsulfonilo-C₁-C₄, 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
- 40 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, alcanediilo-C₃-C₄, alcoxi-C₁-C₄, haloalcoxi-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄, alquiltio-C₁-C₄, alquiltio-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄ o 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
- 45 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 preferencia muy particular al uso de los compuestos de fórmula (I),

- 50 en la que
- R¹ representa hidrógeno o metilo y
- G³ representa en cada caso oxazolinilo, dihidrooxadiazinilo o hidroxipiridilo dado el caso sustituidos con piridilo o pirimidinilo,
- 55 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, alcoxycarbonilo-C₁-C₄, alfa-hidroxiimino-alcoxycarbonilmetilo-C₁-C₄, C(X)NR²R³, (en el que X representa oxígeno o azufre, R²

5 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, alquiltio-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄ o fenilo-alquilo-C₁-C₄, alquiltio-C₁-C₄, alquilsulfonilo-C₁-C₄, 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, alcanediilo-C₃-C₄, ,

10 alcoxi-C₁-C₄, cicloalquilo-C₃-C₆, los radicales heteroarilalquilo triazolil-alquilo-C₁-C₄, piridil-alquilo-C₁-C₄, pirimidinil-alquilo-C₁-C₄ o oxadiazolil-alquilo-C₁-C₄ (en particular, oxadiazolilmetilo (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,

15 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.

También se denomina al radical "pirimidilo" como "pirimidinilo".

20 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.

Los radicales de hidrocarburo saturados o no saturados, como alquilo o alquenilo, 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.

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.

35 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.

En un grupo enfatizado de compuestos para usarse de acuerdo con la invención, G¹ representa C-halógeno y R¹ representa hidrógeno.

En otro grupo enfatizado de compuestos (Ia) para usarse de acuerdo con la invención, G¹ representa CH y R¹ representa metilo.

40 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.

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

benzisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, benzisotiazolilo, benzoxazolilo, benzisoxazolilo, benzimidazolilo, 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, alquilamino-C₁-C₆, di(alquil-C₁-C₆)amino, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, cicloalquilo-C₃-C₆-alquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆-alquilo-C₁-C₆, bis(alcoxi-C₁-C₆)-alquilo-C₁-C₆, alcoxycarbonilmetilo-C₁-C₆, alfa-hidroxiimino-alcoxycarbonilmetilo-C₁-C₆, alfa-alcoxiimino-C₁-C₆-alcoxycarbonilmetilo-C₁-C₆, 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, cicloalquil-C₃-C₆-alquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆-alquilo-C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆-alquilo-C₁-C₆ o fenil-alquilo-C₁-C₆), alquilsulfínilo-C₁-C₆, alquilsulfonilo-C₁-C₆, 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, alquiltio-C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆-alquilo-C₁-C₆ o cicloalquilo-C₃-C₆), los radicales heteroarilalquilo triazolil-alquilo-C₁-C₆, piridil-alquilo-C₁-C₆, pirimidil-alquilo-C₁-C₆ u 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 CH,

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, alquiltio-C₁-C₄, haloalquiltio-C₁-C₄, alquilsulfínilo-C₁-C₄, alquilsulfonilo-C₁-C₄, haloalquilsulfínilo-C₁-C₄, haloalquilsulfonilo-C₁-C₄, amino, alquilamino-C₁-C₄, di(alquil-C₁-C₄)amino, alquylcarbonilamino-C₁-C₄, alcoxycarbonilamino-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄, haloalcoxi-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄, alquenilo-C₂-C₄, alquinilo-C₂-C₄, alquilo-C₁-C₄-cicloalquilo-C₃-C₆, alquylcarbonilo-C₁-C₄, alcoxycarbonilo-C₁-C₄, 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, pirimidilo, piridazolinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, benzofurilo, benzisofurilo, benzisotienilo, benzisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, benzisotiazolilo, benzoxazolilo, benzisoxazolilo, benzimidazolilo, 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, alquilamino-C₁-C₄, di(alquil-C₁-C₄)amino, alquilo-C₁-C₄, haloalquilo-C₁-C₄, cicloalquil-C₃-C₆-alquilo-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄, haloalcoxi-C₁-C₄, alquiltio-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄, bis(alcoxi-C₁-C₄)-alquilo-C₁-C₄, alcoxycarbonilo-C₁-C₄, alfa-hidroxiimino-alcoxycarbonilmetilo-C₁-C₄, alfa-alcoxiimino-C₁-C₄-alcoxycarbonilmetilo-C₁-C₄, 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-C₄, ciano-alquilo-C₁-C₄, alquinilo-C₂-C₄, cicloalquilo-C₃-C₆, cicloalquil-C₃-C₆-alquilo-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄, alquiltio-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄ o fenil-alquilo-C₁-C₄), alquilsulfínilo-C₁-C₄, alquilsulfonilo-C₁-C₄, 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, alquiltio-C₁-C₄, alquiltio-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄ o 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 CH,

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, alcoxycarbonilo-C₁-C₄, alfa-hidroxiimino-alcoxycarbonilmetilo-C₁-C₄, 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, alquiltio-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄ o fenil-alquilo-C₁-C₄, alquiltio-C₁-C₄, alquilsulfonilo-C₁-C₄, 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, alcanediilo-C₃-C₄, , alcoxi-C₁-C₄, cicloalquilo-C₃-C₆, los radicales heteroarilalquilo triazolil-alquilo-C₁-C₄, piridil-alquilo-C₁-C₄, pirimidinil-alquilo-C₁-C₄ o oxadiazolil-alquilo-C₁-C₄ (que por su parte pueden estar sustituidos con alquilo-C₁-C₄) o

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

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.

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.

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.

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.

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.

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.

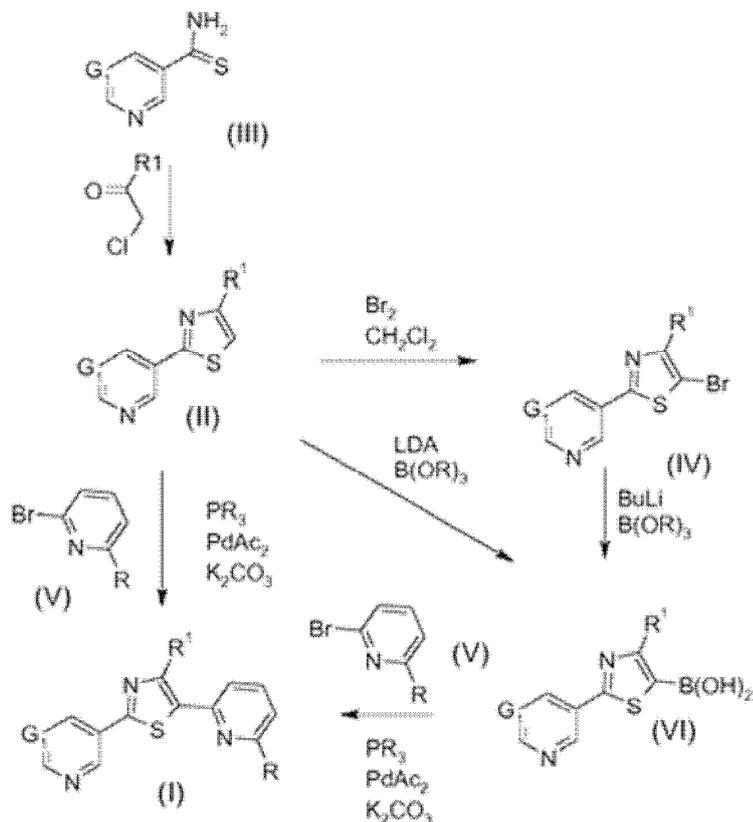
En un grupo enfatizado de compuestos de la fórmula (IA), G¹ representa CH y R¹ representa hidrógeno.

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.

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 G¹ como G₁.

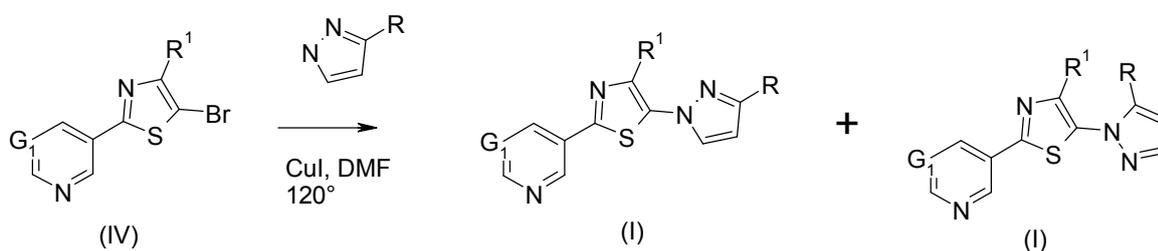
En los esquemas de fórmula a continuación, el radical R puede tener diferentes significados; sin embargo, si no se indica nada más estos significados se pueden derivar del contexto correspondiente.

Esquema de fórmula 1



La preparación de los compuestos de la fórmula (II) con R¹=alquilo se lleva a cabo usando procedimientos conocidos en principio, partiendo de tioamidas de la fórmula (III) mediante reacción con compuestos de α -halocarbonilo; por ejemplo, en forma análoga a *Helvetica Chimica Acta* 1945, 820 y DE 2221647. Los compuestos con R¹=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, PR₃, 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.

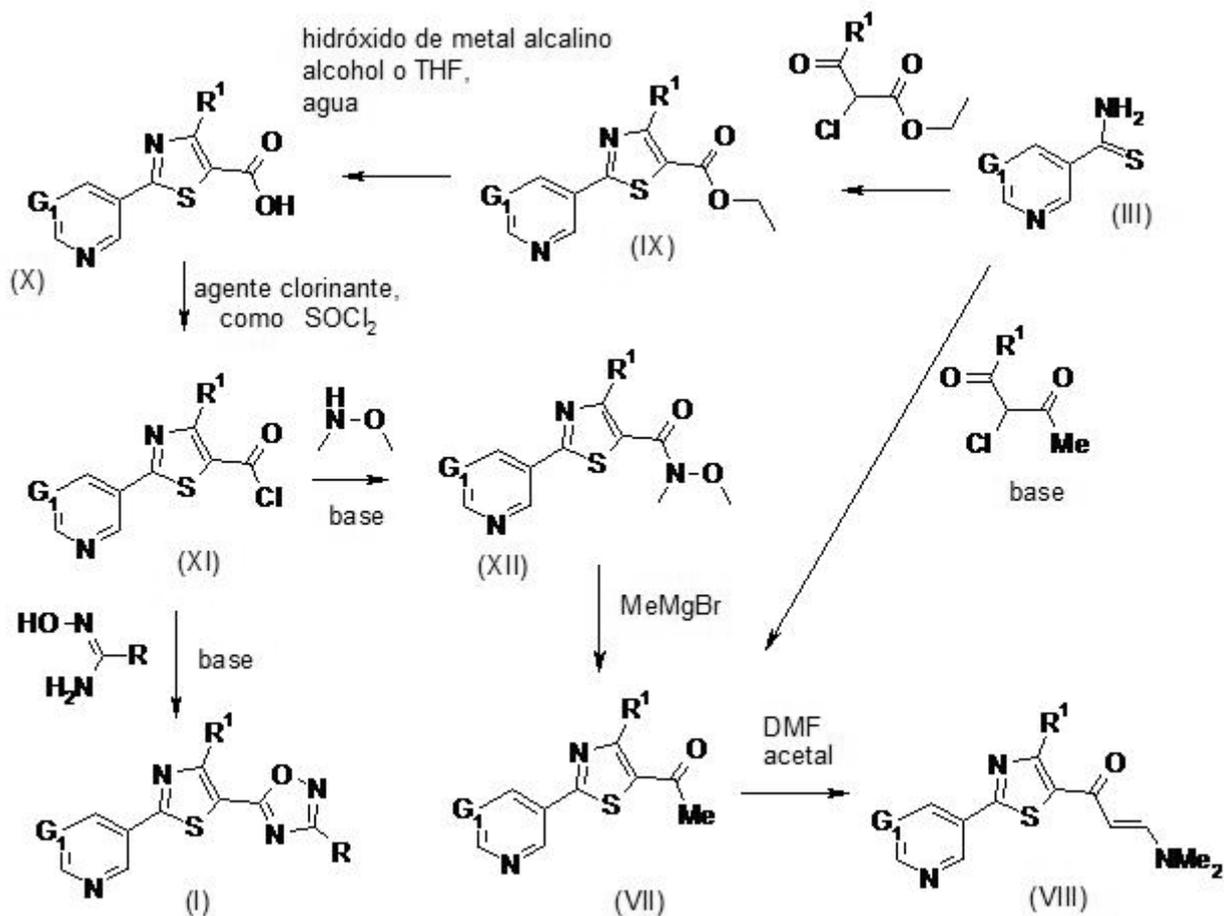
Esquema de fórmula 2



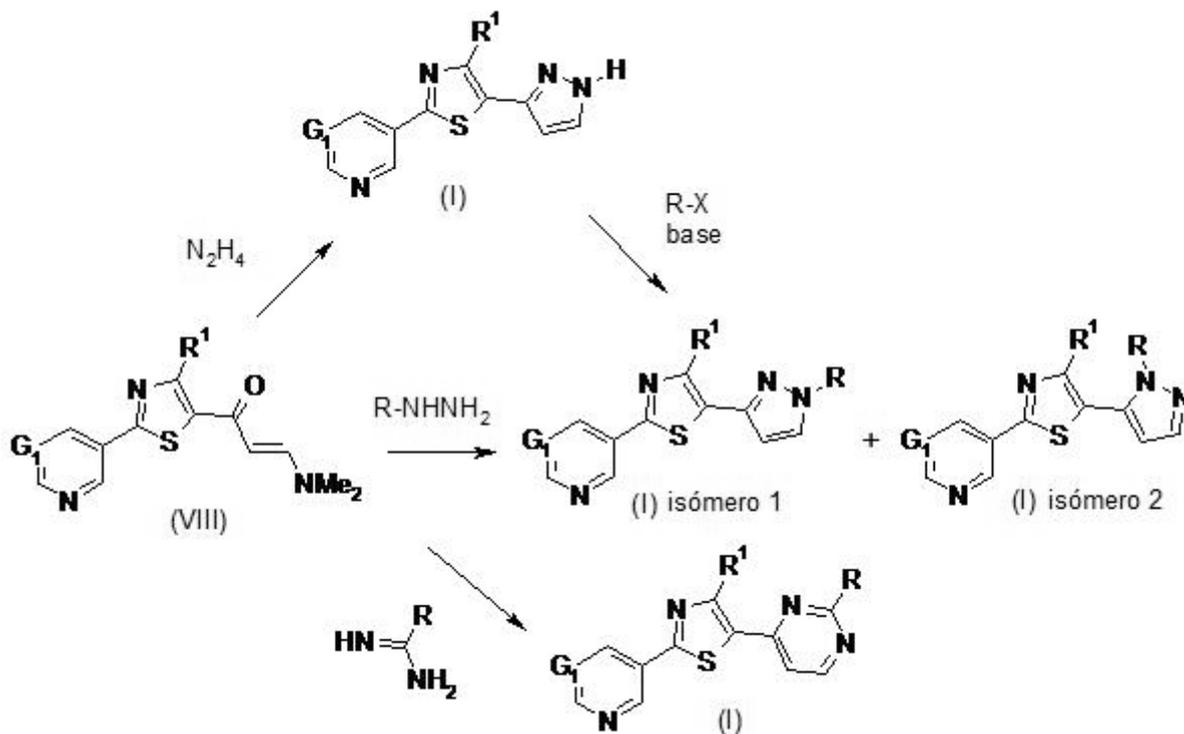
40

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 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.

Esquema de fórmula 3

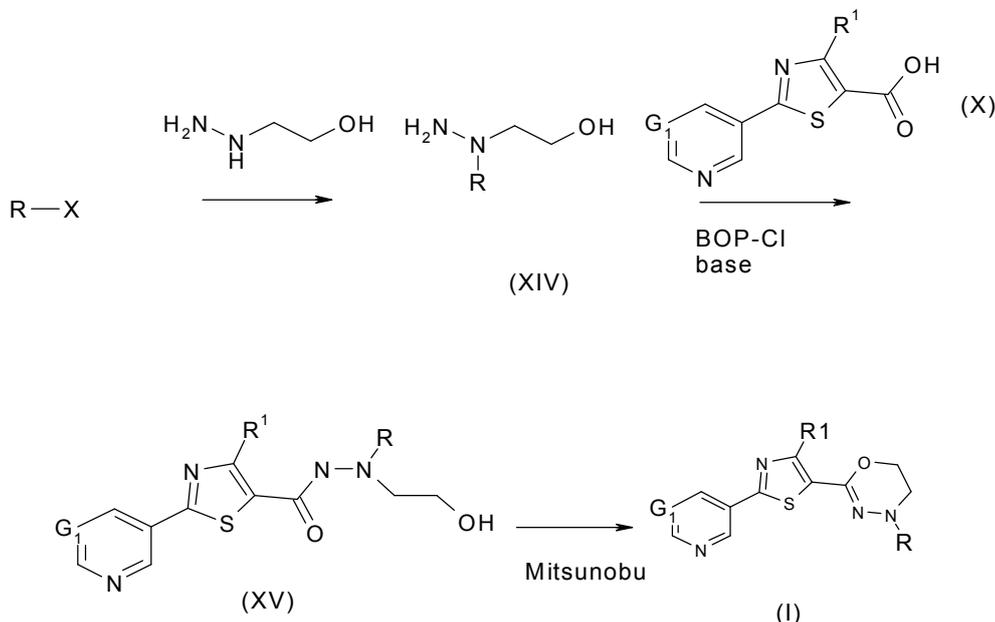


La preparación de los compuestos de la fórmula (VII) con R^1 =alquilo se lleva a cabo mediante la reacción de tioamidas de la fórmula (III) con compuestos α -halocarbonilo para dar compuestos acetilo de la fórmula (VII), de acuerdo con el documento DE2221647. Los compuestos de la fórmula (VII) en la que R^1 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 tetrahydrofurano y en presencia de una base, como por ejemplo trietilamina o diisopropilamina 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.

15

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, *Damalinea* 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., *Epitrimerus 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., *Ceuthorrhynchus* 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*, *Hilamorpha 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*, *Philophaga* spp., *Popillia japonica*, *Premnotypes* spp., *Psylliodes chrysocephala*, *Ptinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus* spp.,

Sphenophorus spp., Sternechus spp., Symphiletes 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.

5 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..

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

15 De la clase de los helmintos, por ejemplo, Ancilostoma duodenale, Ancilostoma ceilanicum, Acilostoma 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 gránulosus, Echinococcus multilocularis, Enterobius vermicularis, Faciola spp., Haemonchus spp., Heterakis spp., Hymenolepis nana, Hyostrogulus 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, Trichostrongulus spp., Trichuris trichuria, Wuchereria bancrofti.

20

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

25 Del orden de los Heteroptera, por ejemplo, Anasa tristis, Antestiopsis spp., Blissus spp., Calocoris spp., Campilomma livida, Cavelerius spp., Cimex spp., Creontiades dilutus, Dasynus piperis, Dichelops furcatus, Diconocoris hewetti, Dysdercus spp., Euschistus spp., Eurygaster spp., Heliopeltis spp., Horcias nobilellus, Leptocorisca 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..

30 Del orden de los Homoptera, por ejemplo, Acyrthosipon spp., Aeneolamia spp., Agonoscaena 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, Carnecephala fulgida, Ceratovacuna lanigera, Cercopidae, Ceroplastes spp., Chaetosiphon fragaefolii, Chionaspis tegalensis, Chlorita onukii, Chromaphis juglycolica, Chrysomphalus ficus, Cicadulina mbila, Coccoxymytilus 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., Protopulvinaria 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, Sogata spp., Sogatella furcifera, Sogatodes spp., Stictocephala festina, Tenalaphara malayensis, Tinocallis caryaefoliae, Tomaspis spp., Toxoptera spp., Trialeurodes vaporariorum, Trioza spp., Typhlocyba spp., Unaspis spp., Viteus vitifolii.

35

40

45

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

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

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

55 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 chrysoorrhoea, Euxoa spp., Feltia spp., Galleria

- mellonella, *Helicoverpa* spp., *Heliothis* spp., *Hofmannophila pseudospretella*, *Homona magnanima*, *Hyponomeuta padella*, *Laphygma* spp., *Lithocolletis blancardella*, *Lithophane antennata*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria* spp., *Malacosoma neustria*, *Mamestra brassicae*, *Mocis repya*, *Mythimna separata*, *Oria* spp., *Oulema oryzae*, *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Philocnistis citrella*, *Pieris* spp., *Plutella xilostella*, *Prodenia* spp., *Pseudaletia* spp., *Pseudoplusia includens*, *Pyrausta nubilalis*, *Spodoptera* spp., *Thermesia gemmatalis*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia* spp..
- 5 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., *Xenopsilla cheopis*.
- 10 Del orden de los Symphyla, por ejemplo, *Scutigereilla 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..
- Del orden de los Thysanura, por ejemplo, *Lepisma saccharina*.
- 15 Los nematodos fitoparásitos incluyen, por ejemplo, *Anguina* spp., *Aphelenchoides* spp., *Belonoaimus* spp., *Bursaphelenchus* spp., *Ditilenchus dipsaci*, *Globodera* spp., *Heliocotilenchus* spp., *Heterodera* spp., *Longidorus* spp., *Meloidogyne* spp., *Pratilenchus* spp., *Radopholus similis*, *Rotilenchus* spp., *Trichodorus* spp., *Tilenchorhynchus* spp., *Tilenchulus* spp., *Tilenchulus semipenetrans*, *Xiphinema* spp..
- 20 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.
- 25 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.
- 30 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.
- 35 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.
- 40 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).
- 45 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.
- 50 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.
- 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 %.
- 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.
- 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.
- 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.
- 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.
- 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.
- Los compuestos se emplean de una manera habitual apropiada para estas formas de uso.
- 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.

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.

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.

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 fitopatogénicos, 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 los rasgo deseados 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..
- 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., *Philipomyia* spp., *Braula* spp., *Musca* spp., *Hidrotaea* spp., *Stomoxys* spp., *Haematobia* spp., *Morellia* spp., *Fannia* spp., *Glossina* spp., *Calliphora* spp., *Lucilia* spp., *Chrysomyia* spp., *Wohlfahrtia* spp., *Sarcophaga* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Gasterophilus* spp., *Hippobosca* spp., *Lipoptena* spp., *Melophagus* spp..
- Del orden de los Siphonaptera, por ejemplo, *Pulex* spp., *Ctenocephalides* spp. (*Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*), *Xenopsilla* spp., *Ceratophilus* 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..
- 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..
- Del orden de los Actiniedida (Prostigmata) y Acaridida (Astigmata), por ejemplo, *Acarapis* spp., *Cheiletiella* spp., *Ornithocheiletia* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Listrophorus* spp., *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp., *Laminosioptes* spp..
- Los principios activos de 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.
- 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.
- 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.
- Asimismo, se ha determinado que los compuestos de acuerdo con la invención también poseen una fuerte acción insecticida contra insectos que destruyen materiales industriales.

Los siguientes insectos se pueden mencionar como ejemplos y como preferentes a título ilustrativo:

5 Escarabajos, tales como *Hilotrupes bajulus*, *Cloro phorus pilosis*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinus pecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Ernobium mollis*, *Priobium carpini*, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*, *Lyctus planicollis*, *Lyctus linearis*, *Lyctus pubescens*, *Trogoxilon aequale*, *Minthes rugicollis*, *Xileborus spec.*, *Tryptodendron spec.*, *Apate monachus*, *Bostrychus capucins*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxilon spec.*, *Dinoderus minutus*;

Himenópteros, tales como *Sirex juvencus*, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus*, *Urocerus augur*;

10 Termitas, tales como *Kaloterme flavicollis*, *Cryptoterme brevis*, *Heteroterme indicola*, *Reticuliterme flavipes*, *Reticuliterme santonensis*, *Reticuliterme lucifugus*, *Mastoterme darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis*, *Coptoterme formosanus*;

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.

15 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.

20 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.

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

25 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:

30 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*.

Del orden de los Araneae, por ejemplo, *Aviculariidae*, *Araneidae*.

35 Del orden de los Opiliones, por ejemplo, *Pseudoscorpiones chelifer*, *Pseudoscorpiones cheiridium*, *Opiliones phalangium*.

Del orden de los Isopoda, por ejemplo, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*.

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

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

40 Del orden de los Zygentoma, por ejemplo, *Ctenolepisma spp.*, *Lepisma saccharina*, *Lepismodes inquilinus*.

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*.

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

Del orden de los Isoptera, por ejemplo, *Kaloterme spp.*, *Reticuliterme spp.*

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*.

- 5 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*.

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

- 10 Del orden de los Siphonaptera, por ejemplo, *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsilla cheopis*.

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

- 15 Del orden de los Anoplura, por ejemplo, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pemphigus* spp., *Philloera vastatrix*, *Phthirus pubis*.

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

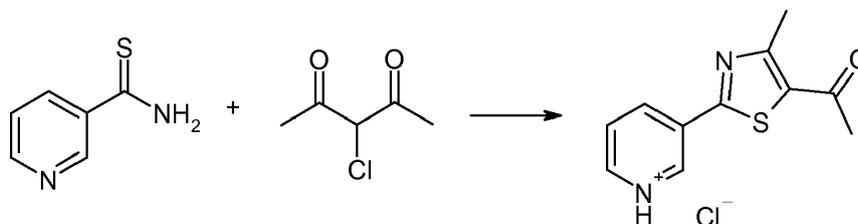
- 20 En el ámbito de los insecticidas domésticos se usan solos o en combinación con otros principios activos adecuados, tales como esteres fosfóricos, carbamatos, piretroides, neonicotinoides, reguladores del crecimiento o principios activos de otras clases de insecticidas conocidos.

- 25 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.

Ejemplos de preparación

Ejemplo 1:

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

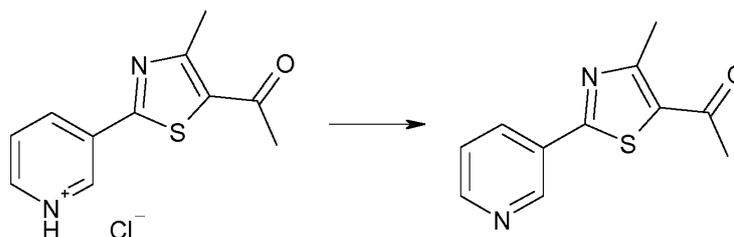


- 30 Se calentaron a reflujo 65 g (470,3 mmol) de tionicotinamida y 140 ml (1174,6 mmol) de cloroacetilacetona en 0,5 l de etanol usando un agitador de varilla durante 8 h. Tras la refrigeración, se aspiró el precipitado formado, se lavó con éter etílico y se secó en el evaporador rotativo.

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

RMN de ¹H (D6-DMSO): 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 **Etapa 2:** 1-(4-metil-2-piridin-3-il-tiazol-5-il)-etanon



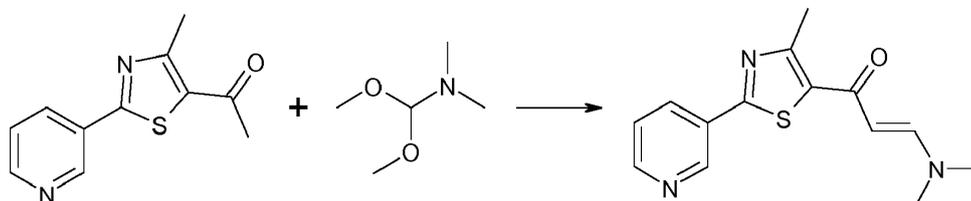
Se disolvieron con agitación 109,2 g (428,6 mmol) de cloruro de 3-(5-acetil-4-metil-tiazol-2-il)-piridinio en aproximadamente 0,5 l de agua y se mezclaron lentamente con 70 ml (936,7 mmol) del 25 % de amoníaco ac. Se

separó un aceite que se solidificó después de agitar algún tiempo. Se agitó otros 10 min en un baño de hielo, se aspiró, se lavó el precipitado con amoníaco diluido ac. y se secó.

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

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

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

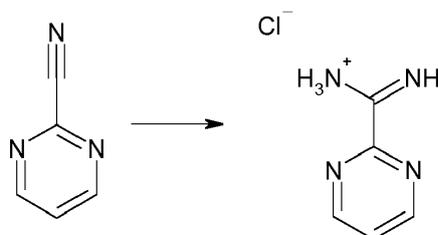


Se agitaron 33,53 g (153,6 mmol) de 1-(4-metil-2-piridin-3-il-tiazol-5-il)-etanona y 35 ml (261,4 mol) de DMF-DMA en un puente de destilación muy corto a 95 °C durante 1 h; a este respecto, se transformó algo del destilado. El residuo se evaporó, se cristalizó en la refrigeración. Se recrystalizó de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

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

RMN de 1H (D6-DMSO): 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

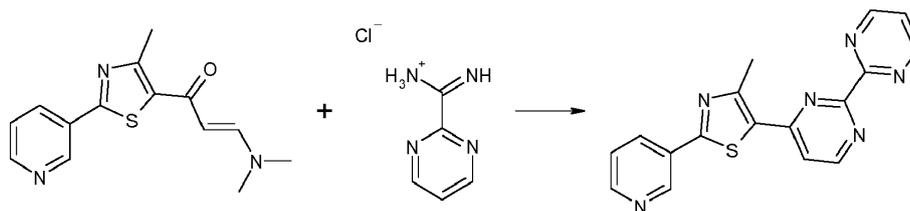


15 Se mezclaron 15,76 g (150 mmol) de 2-piridin-carbonitrilo en 80 ml de metanol con 2,8 ml (15 mol) de una solución al 30 % de metanolato de sodio en metanol. Después de 2 días, se mezcló con 8 g (150 mmol) de cloruro de amonio y se agitó durante 1 día más. La mezcla se filtró, el filtrado se evaporó, el residuo se removió con 80 ml de éter etílico, se aspiró y se secó.

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

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

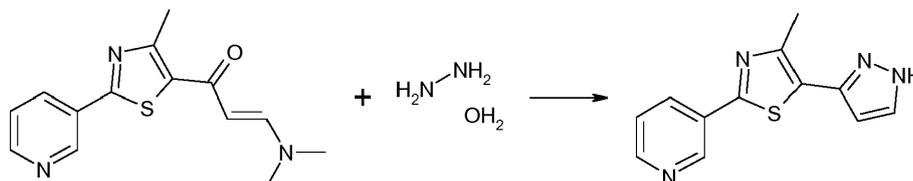
Etapas 5: 4-(4-metil-2-piridin-3-il-tiazol-5-il)-[2,2']bipirimidinilo



25 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 metanolato de sodio en etanol en 20 ml de etanol durante 16 h. Se evaporó, se mezcló con ácido cítrico ac., cloruro de sodio ac., sosa cáustica diluida hasta pH = 12, se extrajo 4 veces con cloroformo/isopropanol, las fases orgánicas combinadas se secaron con sulfato de sodio y se evaporó. El residuo se purificó por recrystalización de benzo-trifluoruro; a este respecto, se llevó a ebullición brevemente con carbón activo y se filtró en caliente.

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

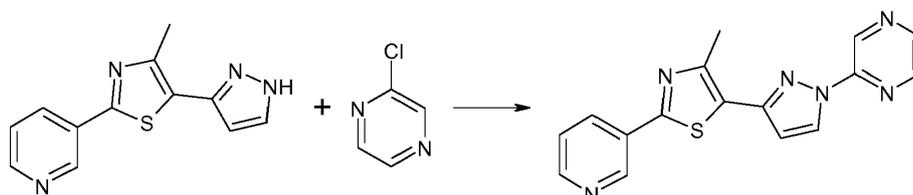
30 RMN de 1H (D6-DMSO): 2,75 (s, 3H), 7,55 (m, 1H), 7,65 (m, 1H), 7,95 (d, 1H), 8,75 (m, 1H), 8,7 (m, 1H), 9,15 (m, 3H), 9,2 (s, 1H)

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

5 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 hidrato de hidrazina durante 0,5 h. Se evaporó, el residuo se recristalizó de dioxano.

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

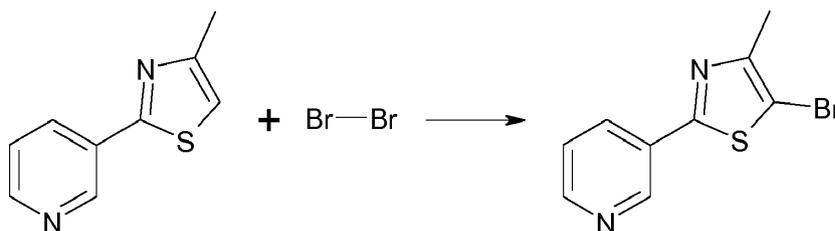
RMN de 1H (D6-DMSO): 2,6 (s, 3H), 6,6 (s, 1H), 7,5 (dd, 1H), 7,8 (s, 1H), 8,25 (d, 1H), 8,65 (m, 1H), 9,1 (s, 1H), 13 (s, 1H)

10 **Etapas 2:** 2-[3-(4-metil-2-piridin-3-il-tiazol-5-il)-pirazol-1-il]-pirazina

15 Se mezclaron 0,85 g (3,5 mmol) de 3-[4-metil-5-(1*H*-pirazol-3-il)-tiazol-2-il]-piridino y 1,2 g (10,4 mmol) de 2-cloropirazina en 50 ml de DMF con 0,5 ml de 15-corona-5 y aproximadamente 0,5 g de hidruro de sodio, la mezcla se agitó a 75 °C durante 1,5 h, tras la refrigeración se mezcló con ácido fosfórico diluido y se evaporó. El residuo se mezcló con cloruro de sodio ac., acetato de etilo, sosa cáustica diluida hasta pH = 7, se extrajo tres veces con acetato de etilo y dos veces más con isopropanol. Las fases orgánicas combinadas se secaron con MgSO₄ y se evaporaron, el residuo se cristalizó de dioxano; a este respecto, se filtró en caliente.

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

20 RMN de 1H (D6-DMSO): 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)

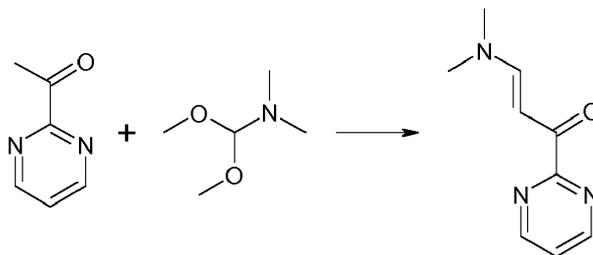
Ejemplo 3:**Etapas 1:** 3-(5-bromo-4-metil-tiazol-2-il)-piridina

25 Se mezclaron 16,8 g (95,5 mmol) de 3-(4-metil-tiazol-2-il)-piridina en 200 ml de diclorometano en refrigeración de baño de hielo con 15 ml (292 mmol) de bromo. El precipitado se aspiró, se lavó con diclorometano, se suspendió en agua, después se mezcló con carbonato de potasio acuoso, sosa cáustica diluida, bisulfito de sodio acuoso y MTBE (metil tert-butil éter) y se extrajo tres veces con MTBE. Las fases orgánicas combinadas se secaron con sulfato de sodio y se evaporó.

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

30 RMN de 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



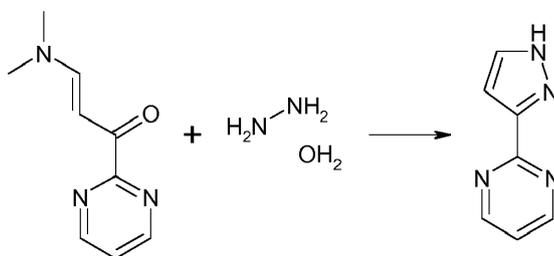
5

Se agitaron 11 g (90 mmol) de 2-acetilpirimidina con 23 g (193 mmol) de DMF-DMA en un puente de destilación muy corto a 100 °C durante 1 h; a este respecto, se transformó algo del destilado. Se evaporó, el residuo se recrystalizó de benzotrifluoruro.

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

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

Etapa 3: 2-(1H-pirazol-3-il)-pirimidina



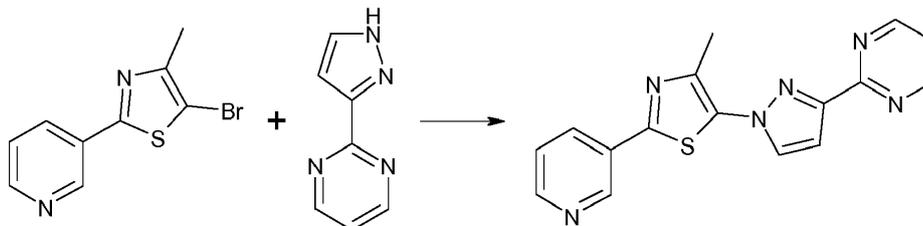
10

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

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

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

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



15

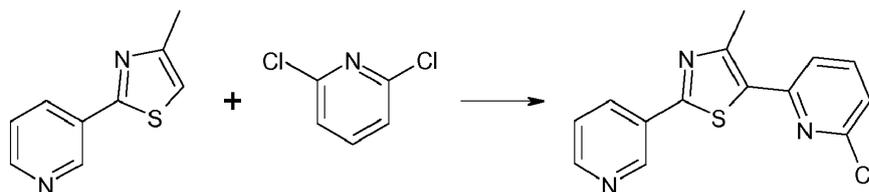
Se agitaron 1,96 g (7,6 mmol) de 3-(5-bromo-4-metil-tiazol-2-il)-piridina, 0,96 g (6,5 mmol) de 2-(1H-pirazol-3-il)-pirimidina, 0,15 g (0,78 mmol) de yoduro de cobre(I), 0,15 g (1 mmol) de 8-hidroxiquinolina, 3 g (21 mmol) de carbonato de potasio bajo argón en 20 ml de DMF y algunas gotas de agua a 120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

20

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

RMN de 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)

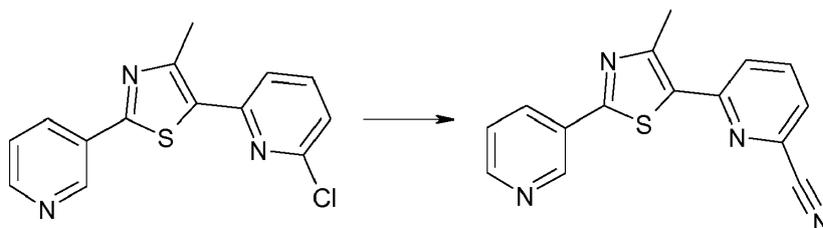
25

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

5 Se disolvieron 45 mg (0,2 mmol) de acetato de paladio(II) en 10 ml de DMF bajo argón y se mezclaron con 2 ml (0,7 mmol) de una solución al 10 % de tri-*tert*-butilfosfina en hexano. Se eliminó el hexano de la mezcla al vacío, y se mezcló con 2 g (13,6 mmol) 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 a 135 °C durante 1 h. La mezcla se evaporó, el residuo se mezcló con 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. Las fases orgánicas combinadas se secaron con sulfato de sodio y se evaporó, el residuo se purificó por cromatografía en gel de sílice (ciclohexano/acetona).

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

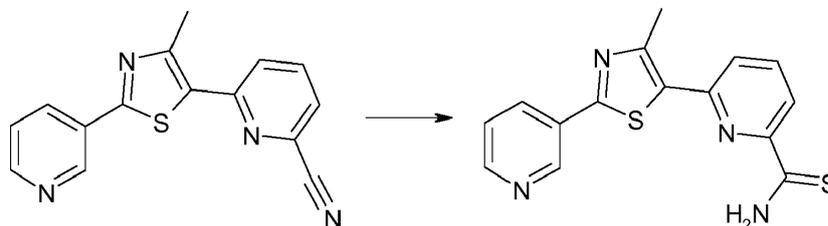
10 RMN de 1H (D6-DMSO) 2,7 (s, 3H), 7,45 (d, 1H), 7,55 (m, 1H), 7,75 (d, 1H), 7,95 (t, 1H), 8,3 (d, 1H), 8,65 (m 1H), 9,15 (s, 1H)

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

20 Se agitaron 0,5 g (3 mmol) de cloruro de paladio(II) en 25 ml de DMF bajo argón con 1,6 g (6,1 mmol) de trifenilfosfano durante 10 min a 100 °C, después esta mezcla se mezcló con 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 a 125 °C durante 16 h; después, se aspiró de lo no disuelto, el filtrado se evaporó, el residuo se disolvió en acetato de etilo/agua, se aspiró de nuevo de lo no disuelto, la fase acuosa se extrajo tres veces con acetato de etilo, las fases orgánicas combinadas se secaron con sulfato de sodio y se evaporó. El residuo se purificó por cromatografía en gel de sílice (ciclohexano/acetona).

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

25 RMN de 1H (D6-DMSO) 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)

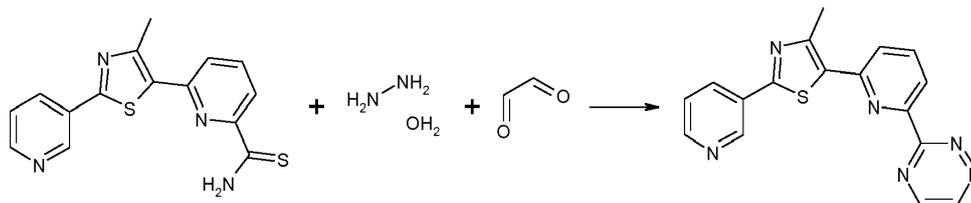
Etapas 3: 6-(4-metil-2-piridin-3-il-tiazol-5-il)-piridin-2-carbotioamida

30 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 a 50 °C durante 3 h, después la mezcla se evaporó, se removió con agua helada, el precipitado se aspiró, se secó, se hirvió con acetato de etilo, tras la refrigeración se aspiró se secó.

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

35 RMN de 1H (D6-DMSO): 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 (br, 1H), 10,5 (s, 1H)

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



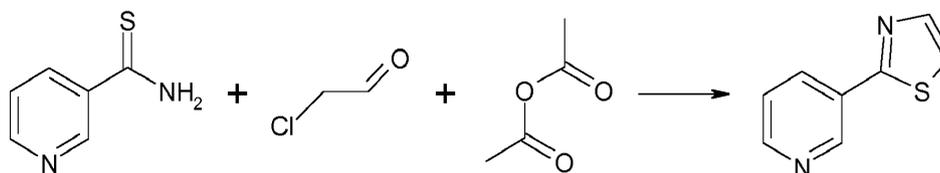
Se agitaron a reflujo 0,23 g (0,7 mmol) de 6-(4-metil-2-piridin-3-il-tiazol-5-il)-piridin-2-carbotioamida en 65 ml de etanol caliente con 0,1 ml (2,9 mmol) de hidrato de hidrazina durante 1,5 h, después se mezclaron con 0,3 ml de una solución acuosa al 40 % de glicoxal y se calentaron a reflujo durante 15 min más. La mezcla se evaporó y el residuo se purificó por cromatografía en gel de sílice RP-18 (agua/acetonitrilo).

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

RMN de 1H (D6-DMSO): 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:

Etapa 1: 3-tiazol-2-il-piridina

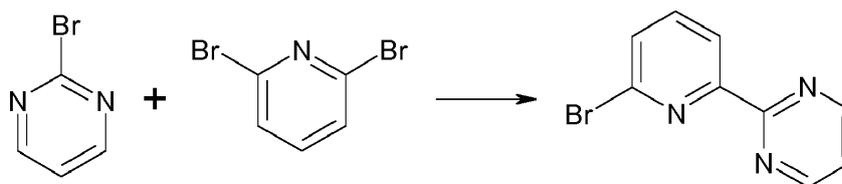


Se disolvieron 31,4 g (227 mmol) de tionicotinamida en 150 ml de ácido acético y se mezclaron con 28 ml (238 mmol) de cloroacetaldehído 55 % en agua y 110 ml (1171 mmol) de anhídrido del ácido acético. Se agitó a 70 °C durante aproximadamente 16 h y la mezcla refrigerada se vertió en hielo/amoniaco acuoso, se saturó con NaCl y se agitó durante 3 h. Se decantó de lo no disuelto, se filtró con lana de vidrio y la mezcla se extrajo 4 veces con metil tert-butil éter. Las fases orgánicas combinadas se secaron con MgSO₄ y se evaporó. El residuo se destiló al vacío en el tubo de bolas.

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

RMN de 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)

Etapa 2: 2-(6-bromo-piridin-2-il)-pirimidina

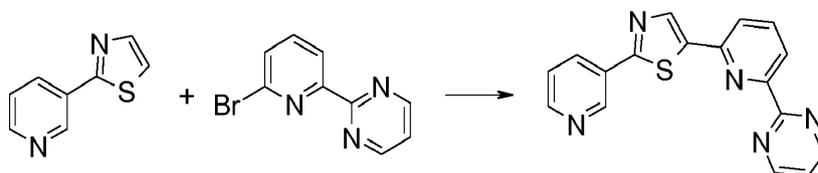


Se diluyeron 54,5 ml (137,1 mmol) de una solución a 2,5 molar de n-buli en 70 ml de THF bajo argón con 70 ml de THF. Se disolvieron gota a gota a <-70 °C 32,5 g (137,1 mmol) de 2,6-dibromopiridina en 150 ml de THF. Se agitó durante 15 min y se mezcló después, todavía a <-70 °C, con 19,2 ml (107 mmol) de una solución a 5,6 molar de cloruro de zinc en éter etílico. Se dejó descongelar, se mezcló con una solución de 17,4 g (109 mmol) de bromopiridina en 50 ml de THF y de una suspensión de 3,9 g (3,4 mmol) de tetraquis(trifenilfosfina)paladio en 50 ml de THF. La mezcla se llevó a ebullición a reflujo durante 4 h, tras la refrigeración se mezcló con Na-EDTA en agua y sosa cáustica diluida hasta pH = 10. Se aspiró para eliminar lo no disuelto, la fase acuosa se extrajo tres veces con éster acético y las fases orgánicas combinadas se secaron con MgSO₄ y se evaporó. El residuo se recrystalizó de 60 ml de benzotrifluoruro; a este respecto, se llevó a ebullición brevemente con carbón activo y se filtró en caliente.

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

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

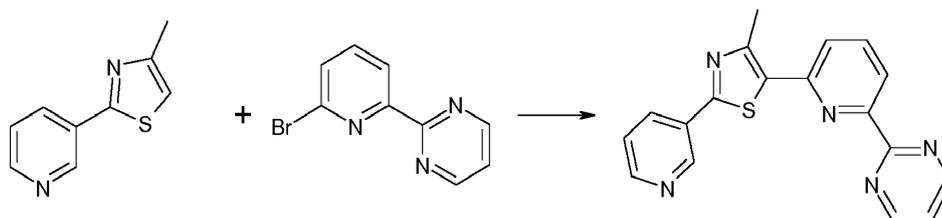
Etapa 3: 2-[6-(2-piridin-3-il-tiazol-5-il)-piridin-2-il]-pirimidina



Se agitaron 0,53 g (3 mmol) de cloruro de paladio(II) y 1,88 g (6 mmol) de tri-*o*-tolilfosfina y 1,87 g de cloruro de tetrabutilamonio bajo argón con 55 ml de DMF a 95 °C durante 5 min, después se mezcló con 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 (116 mmol) de carbonato de potasio y se agitó a 130 °C durante 4 h. La mezcla se evaporó, se mezcló con acetato de etilo, cloruro de sodio ac., ácido cítrico ac., sosa cáustica diluida a pH = 10, se removió con cloroformo/isopropanol 10 %, se aspiró de lo no disuelto, la fase acuosa se extrajo dos veces más con cloroformo/isopropanol 10 %, las fases orgánicas combinadas se secaron con sulfato de sodio y se evaporó. El residuo se purificó por cromatografía en gel de sílice (ciclohexano/acetona). El producto obtenido puede purificarse aún más por recristalización de benzotrifluoruro/dioxano.

Rendimiento: 9 g (44 % del valor teórico), logP (HCOOH) 1,53
 RMN de 1H (D6-DMSO) 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

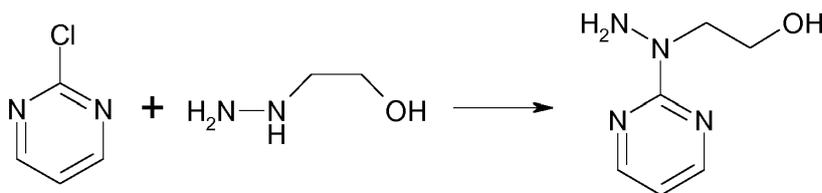


Se disolvieron 13 mg (0,059 mmol) de acetato de paladio en 5 ml de DMF bajo argón y se mezclaron con 0,6 ml (0,23 mmol) de una solución al 10 % de tri-*tert*-butilfosfano en hexano. Se hizo evaporar al vacío el hexano y se mezcló con 0,26 g (1,45 mmol) de 3-(4-metil-tiazol-2-il)-piridina, 0,38 g (1,62 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 la mezcla resultante se agitó a 130 °C durante 48 h bajo argón. Después se evaporó, se disolvió en acetato de etilo, NaCl ac., ácido cítrico ac., sosa cáustica diluida hasta pH = 8. Se extrajo 3 veces con acetato de etilo, las fases orgánicas combinadas se secaron con sulfato de sodio y se evaporó, el residuo se purificó por cromatografía en gel de sílice (ciclohexano/acetona). Para una purificación adicional, la sustancia se recristalizó de benzotrifluoruro.

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

Ejemplo 7:

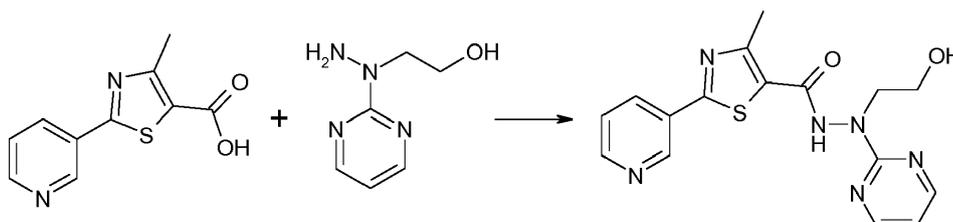
Etapa 1: 2-(*N*-pirimidin-2-il-hidrazino)-etanol



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. La mezcla se aspiró y el filtrado se evaporó.

Rendimiento: 5,98 g (87 % del valor teórico)
 RMN de 1H (D6-DMSO) 3,65 (m 2H), 3,75 (t, 2H), 4,35 (a, 1H), 4,65 (a, 2H), 6,55 (t, 1H), 8,3 (d, 2H)

Etapa 2: 4-metil-2-piridin-3-il-tiazol-5-ácido hidroxicarboxílico-etil)-*N'*-pirimidin-2-il-hidrazida



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 mezclaron con 6 ml de trietilamina y 0,4 ml (4 mmol) de clorocarbonato de etilo. Se agitó durante 10 min, se mezcló con 0,6 g (4 mmol) de 2-(*N*-pirimidin-2-il-hidrazino)-etanol, se agitó durante 20 min y se evaporó. El residuo se mezcló con acetato de etilo, ácido cítrico ac., sosa cáustica diluida hasta pH = 8 y cloruro de sodio, se extrajo tres

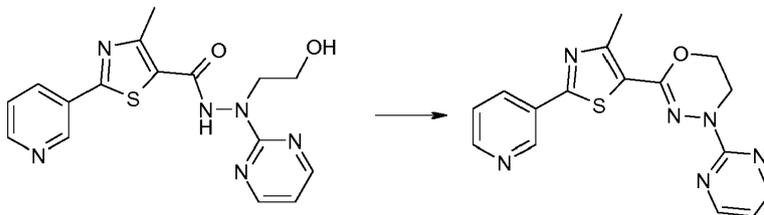
veces con acetato de etilo; las fases orgánicas combinadas se secaron con sulfato de sodio y se evaporó. El residuo se purificó por cromatografía en gel de sílice (ciclohexano/acetona).

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

RMN de ¹H (D6-DMSO) 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)

5

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



Se agitaron 0,46 g (1,3 mmol) de 4-metil-2-piridin-3-il-tiazol-5-ácido hidroxicarboxílico-etil)-N'-pirimidin-2-il-hidrazida con 0,4 g (1,5 mmol) de trifetilfosfano y 0,3 ml de DIAD en 5 ml de acetonitrilo durante 16 h, después la mezcla se evaporó y el residuo se cromatografió en gel de sílice (ciclohexano/acetona).

10

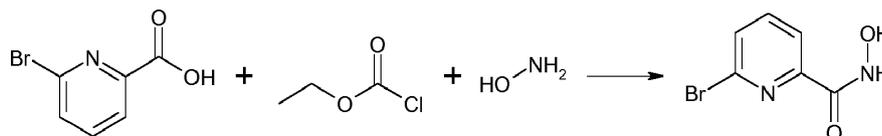
Rendimiento: 0,1 g (23 % del valor teórico), logP (HCOOH) 1,56

RMN de ¹H (D6-DMSO) 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:

15

Etapa 1: hidroxiamida del ácido 6-bromo-piridin-2-carboxílico

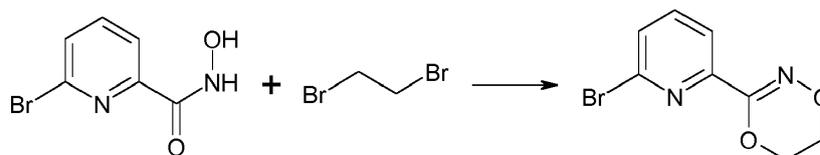


Se mezclaron 10,2 g (50,5 mmol) de ácido bromopicolínico en 100 ml de diclorometano con 40 ml de trietilamina y después en refrigeración de baño de hielo con 6 ml (63 mol) de clorocarbonato de etilo y tras 10 min de agitación con 6 ml (101 mmol) de una solución acuosa al 50 % de hidroxilamina. Se agitó durante 1 h a temperatura ambiente, se evaporó, el residuo se mezcló con ácido cítrico ac. y acetato de etilo y se extrajo repetidas veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se secaron con sulfato de sodio y se evaporó.

20

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



Se calentaron a reflujo 11,8 g (producto bruto de la etapa previa) de hidroxiamida del 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. Se aspiró, se evaporó, el residuo se disolvió en diclorometano/etanol, se aspiró sobre gel de sílice con MTBE y el filtrado de evaporó.

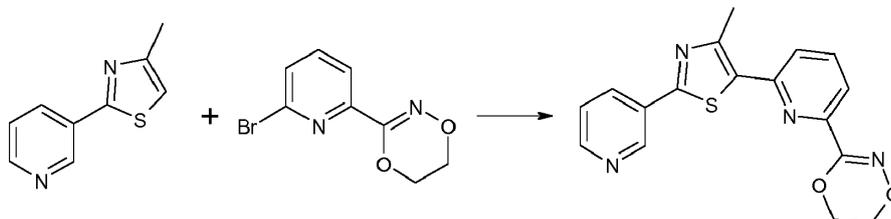
25

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

30

RMN de 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

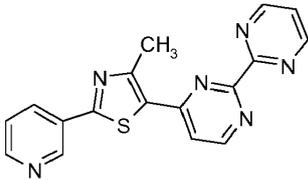
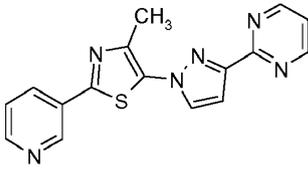
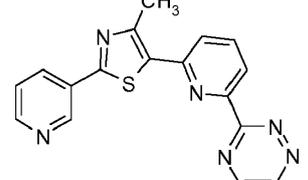
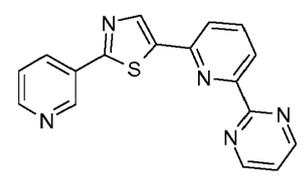
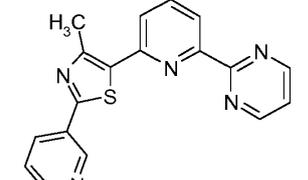


Se disolvieron 23 mg (0,1 mmol) de acetato de paladio(II) en 15 ml de DMF bajo argón, se mezclaron con 0,25 ml (0,25 mmol) de una solución a 1 molar de tri-terc-butilfosfano, después con 0,18 g (1 mmol) de 3-(4-metil-tiazol-2-il)-piridina, 0,24 g (1 mmol) de 3-(6-bromo-piridin-2-il)-5,6-dihidro-[1,4,2]dioxazina,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

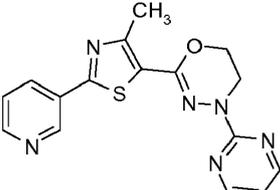
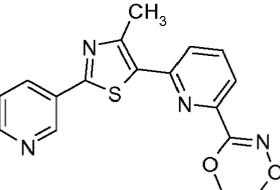
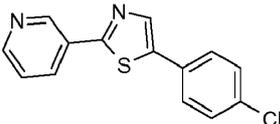
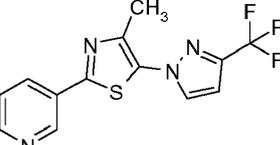
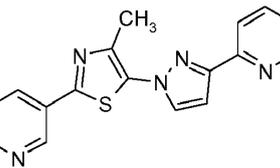
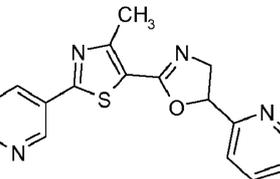
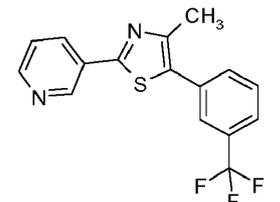
Rendimiento: 0,06 g (17 % del valor teórico), logP (HCOOH) 1,81

RMN de 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)

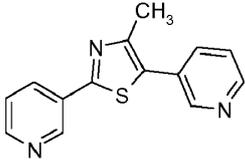
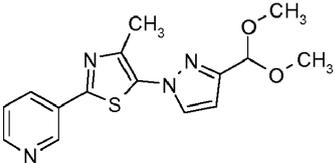
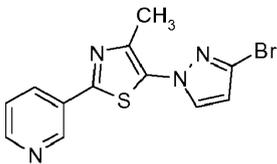
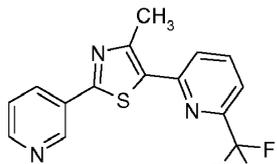
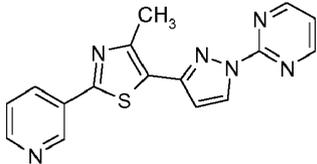
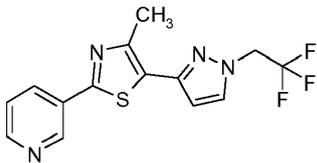
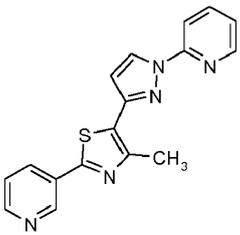
En la siguiente tabla están enumerados otros nuevos compuestos de acuerdo con la invención.

Ej. N.º	logP ¹⁾ (HCOOH)	Fórmula	(M+)+1 (CL/EM)
Ejemplo de preparación 1	1,17		333,1
Ejemplo de preparación 2	2,30		
Ejemplo de preparación 3	1,48		321,1
Ejemplo de preparación 4	1,58		
Ejemplo de preparación 5	1,53		318,1
Ejemplo de preparación 6	1,73		332,1

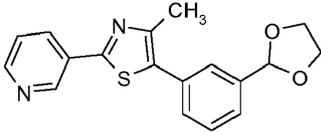
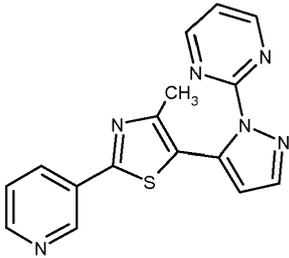
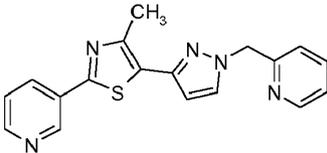
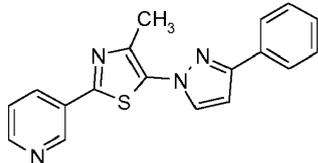
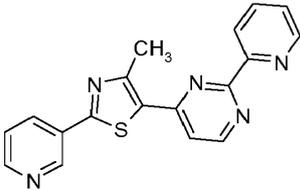
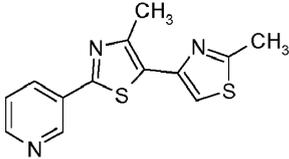
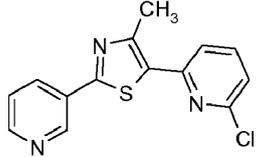
(continuación)

Ej. N.º	logP ¹⁾ (HCOOH)	Fórmula	(M ⁺)+1 (CL/EM)
Ejemplo de preparación 7	1,56		339,1
Ejemplo de preparación 8	1,82		339,1
13	3,23		
14	2,63		
15	1,67		
16	1,72		
17	3,55		

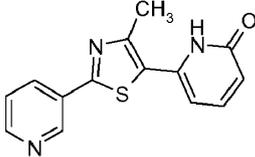
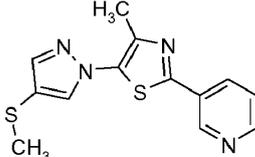
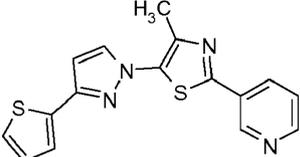
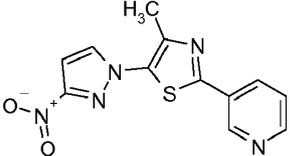
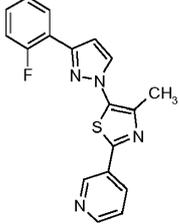
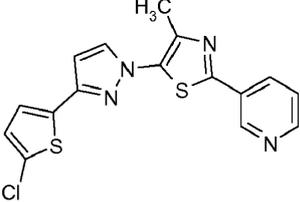
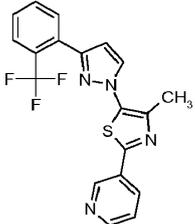
(continuación)

Ej. N.º	logP ¹⁾ (HCOOH)	Fórmula	(M ⁺)+1 (CL/EM)
18	1,10		
19	1,77		
20	2,28		
21	3,01		322,0
22	1,74		321,1
23	2,20		
24	2,94		

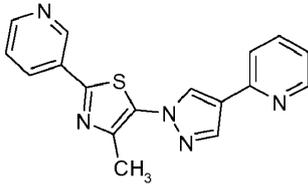
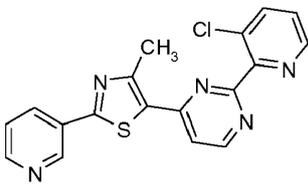
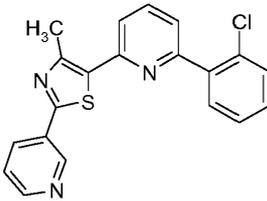
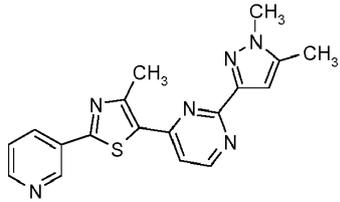
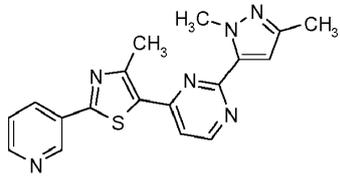
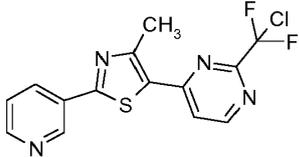
(continuación)

Ej. N.º	logP ¹⁾ (HCOOH)	Fórmula	(M ⁺)+1 (CL/EM)
25	2,39		
26	1,47		
27	1,69		
28	3,08		
29	1,47		
30	2,00		
31	2,66		

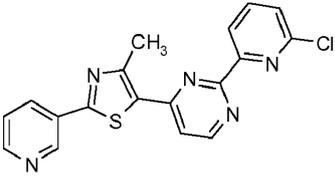
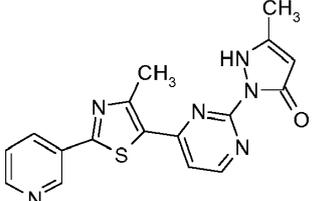
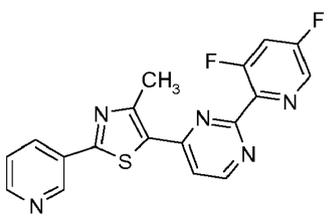
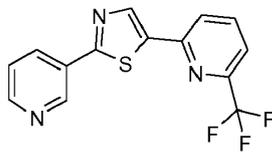
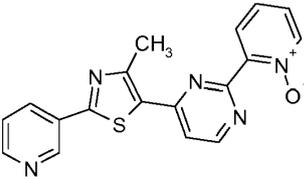
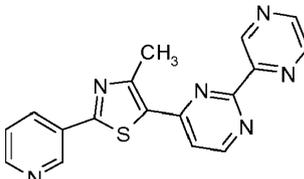
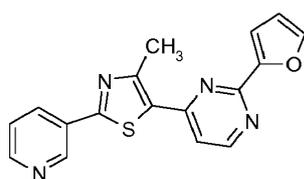
(continuación)

Ej. N.º	logP ¹⁾ (HCOOH)	Fórmula	(M ⁺)+1 (CL/EM)
32	1,23		
33	2,21		
34	2,84		
35	1,92		
36	3,33		
37	3,81		
38	3,94		

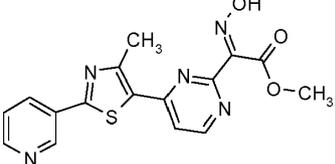
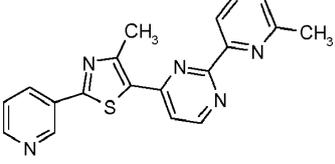
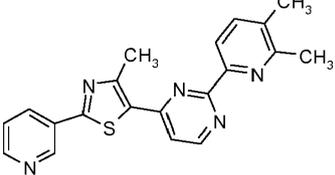
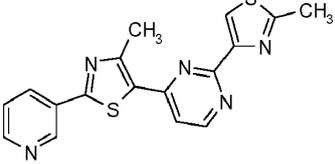
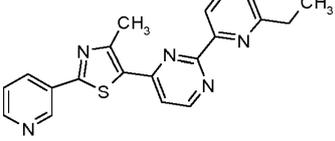
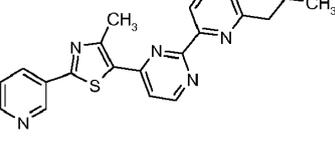
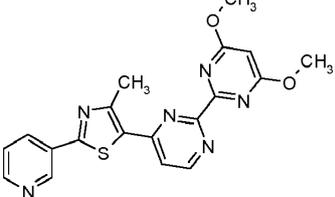
(continuación)

Ej. N.º	logP ¹⁾ (HCOOH)	Fórmula	(M ⁺)+1 (CL/EM)
39	1,55		
40	2,43		
41	2,03		
42	3,97		
43	1,86		
44	2,40		
45	2,95		

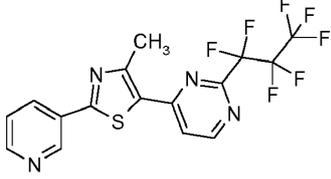
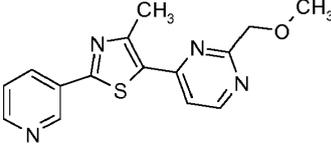
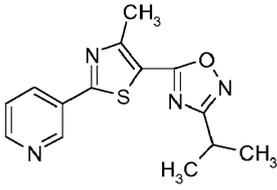
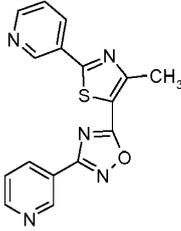
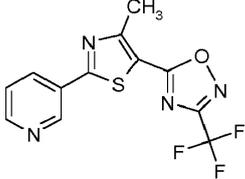
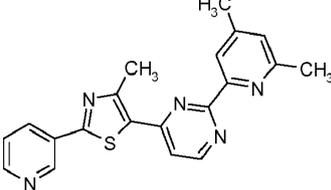
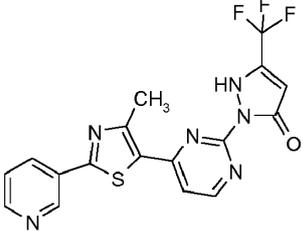
(continuación)

Ej. N.º	logP ¹⁾ (HCOOH)	Fórmula	(M ⁺)+1 (CL/EM)
46	2,47		
47	1,48		
48	2,08		
49	2,81		308,1
50	1,13		
51	1,59		
52	2,35		

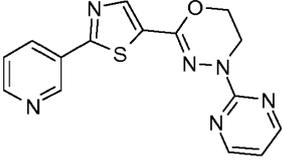
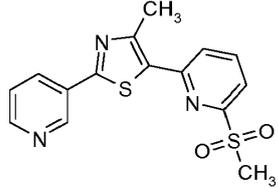
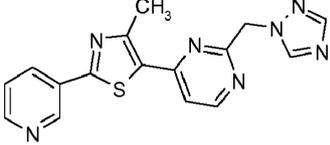
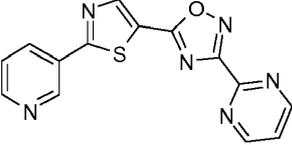
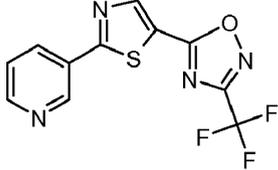
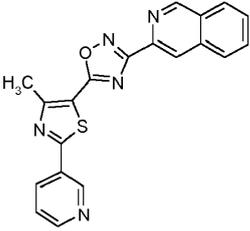
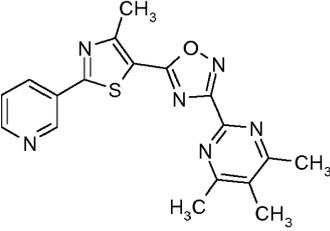
(continuación)

Ej. N.º	$\log P^{1)}$ (HCOOH)	Fórmula	(M ⁺)+1 (CL/EM)
53	1,58		
54	1,49		
55	1,49		
56	2,08		
57	1,88		
58	2,25		
59	2,12		393,1

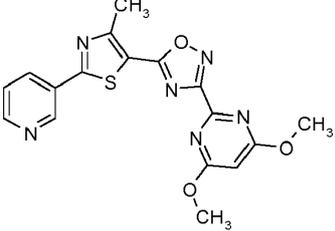
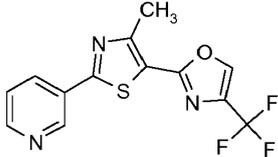
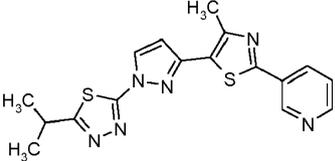
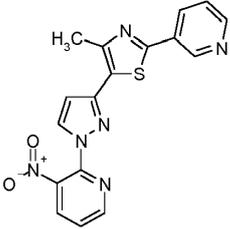
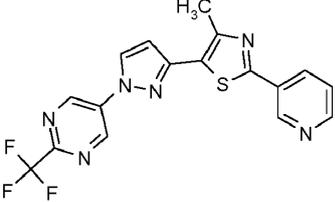
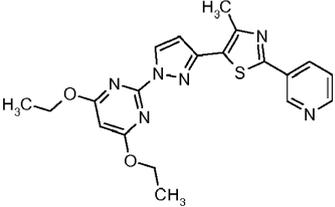
(continuación)

Ej. N.º	logP ¹⁾ (HCOOH)	Fórmula	(M ⁺)+1 (CL/EM)
60	3,84		
61	1,57		299,1
62	3,23		
63	2,51		
64	3,34		
65	1,36		
66	2,90		

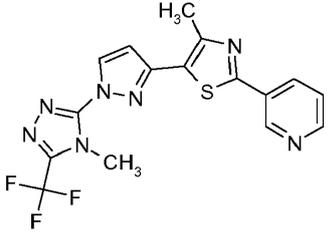
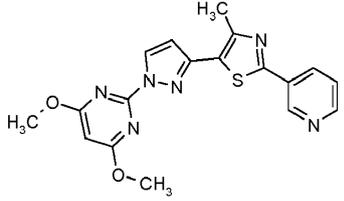
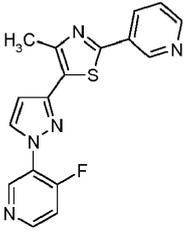
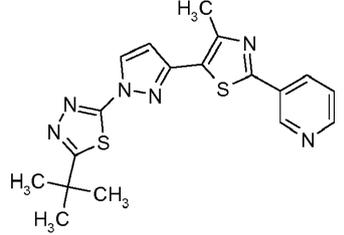
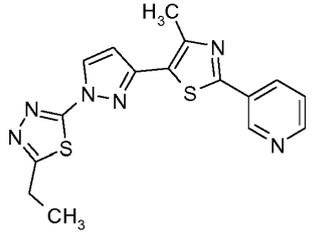
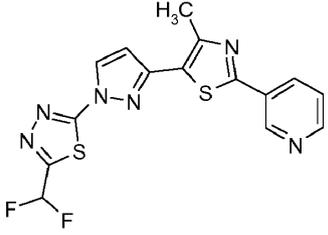
(continuación)

Ej. N.º	logP ¹⁾ (HCOOH)	Fórmula	(M ⁺)+1 (CL/EM)
67	1,90		325,1
68	1,62		
69	1,20		
70	1,40		
71	2,70		
72	3,11		
73	2,34		

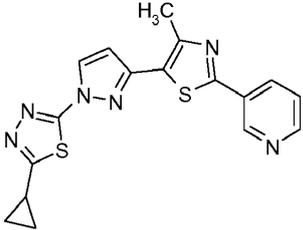
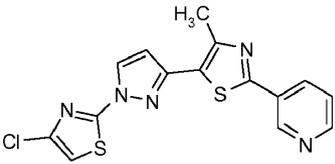
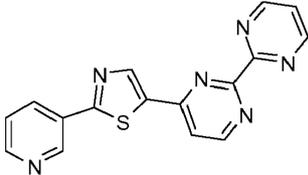
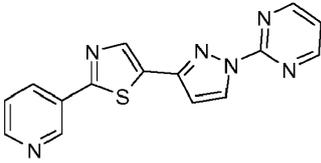
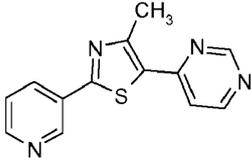
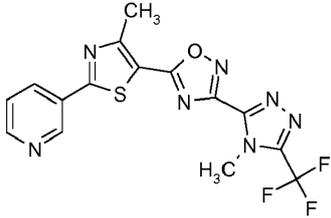
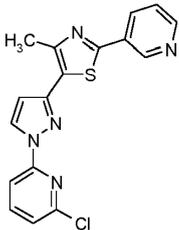
(continuación)

Ej. N.º	$\log P^{(1)}$ (HCOOH)	Fórmula	(M ⁺)+1 (CL/EM)
74	2,81		
75	2,97		
76	3,11		
77	2,50		
78	2,99		
79	3,94		

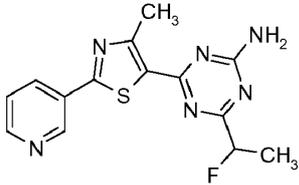
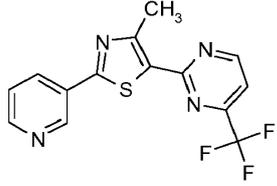
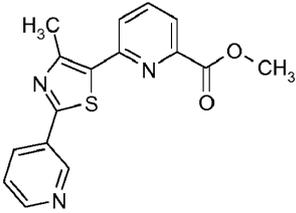
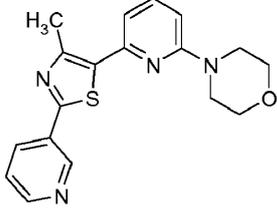
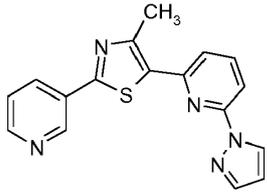
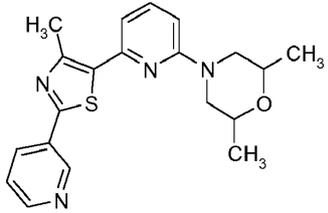
(continuación)

Ej. N.º	logP ¹⁾ (HCOOH)	Fórmula	(M ⁺)+1 (CL/EM)
80	2,27		
81	2,80		
82	2,23		
83	3,63		
84	2,61		
85	2,80		

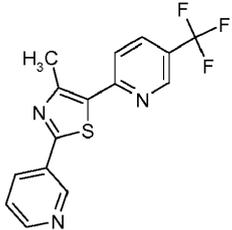
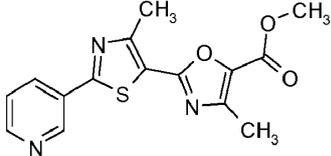
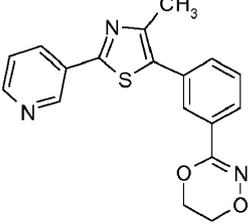
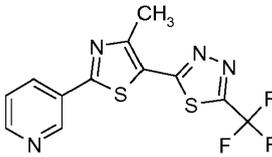
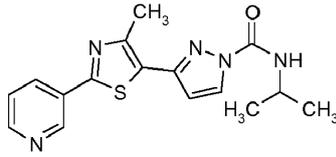
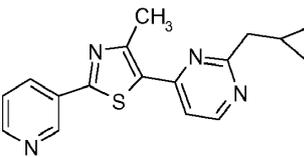
(continuación)

Ej. N.º	logP ¹⁾ (HCOOH)	Fórmula	(M ⁺)+1 (CL/EM)
86	2,72		
87	3,47		
88	1,05		319,1
89	1,48		307,1
90	1,39		
91	2,41		
92	3,84		

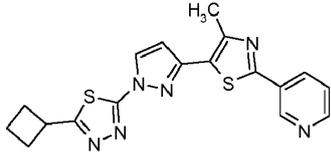
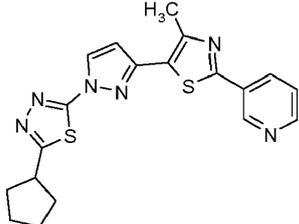
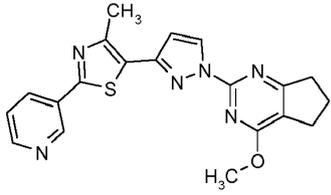
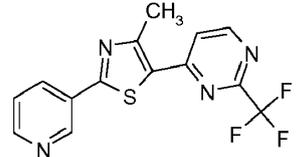
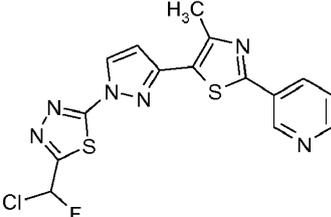
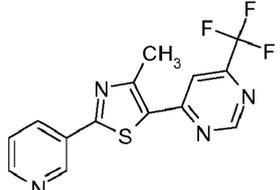
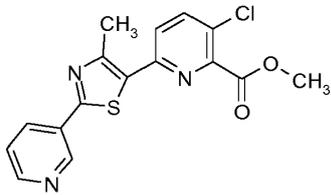
(continuación)

Ej. N.º	logP ¹⁾ (HCOOH)	Fórmula	(M ⁺)+1 (CL/EM)
93	1,86		
94	3,14		
95	2,03		
96	2,58		
97	2,93		320,1
98	3,55		

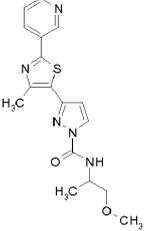
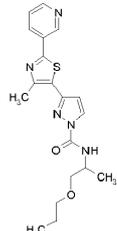
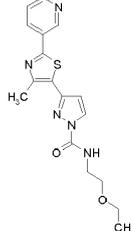
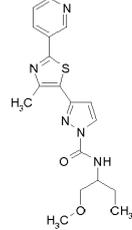
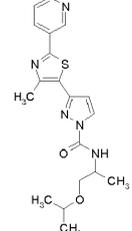
(continuación)

Ej. N.º	logP ¹⁾ (HCOOH)	Fórmula	(M ⁺)+1 (CL/EM)
99	3,14		
100	2,55		
101	2,42		
102	2,85		
103	2,55		
104	3,23		
105	2,69		

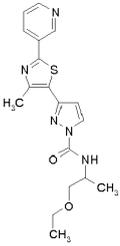
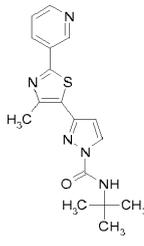
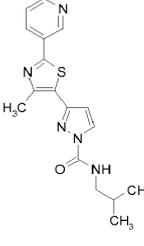
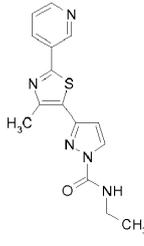
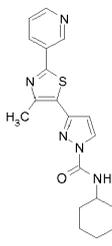
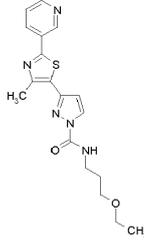
(continuación)

Ej. N.º	logP ¹⁾ (HCOOH)	Fórmula	(M ⁺)+1 (CL/EM)
106	3,42		
107	3,85		
108	3,18		
109	2,72		
110	3,24		
111	2,80		
112	2,64		

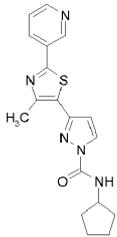
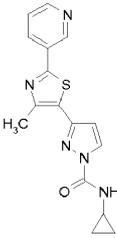
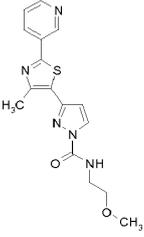
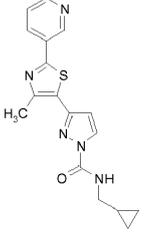
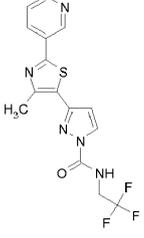
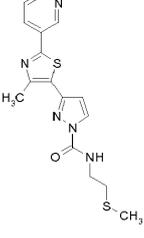
(continuación)

Ej. N.º	logP ¹⁾ (HCOOH)	Fórmula	(M ⁺)+1 (CL/EM)
113	2,23		
114	3,27		
115	2,20		
116	2,61		
117	3,18		

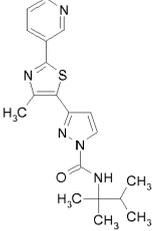
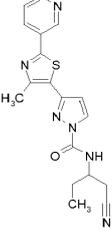
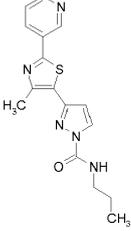
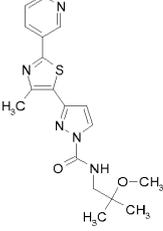
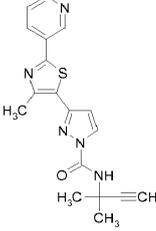
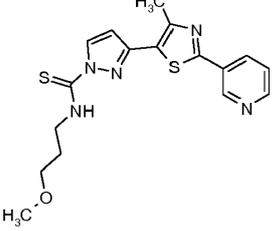
(continuación)

Ej. N.º	logP ¹⁾ (HCOOH)	Fórmula	(M ⁺)+1 (CL/EM)
118	2,69		
119	3,23		
120	2,89		
121	2,05		
122	3,56		
123	2,46		

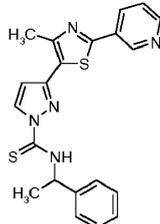
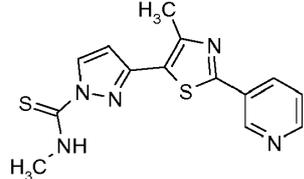
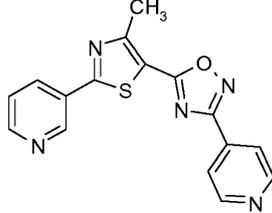
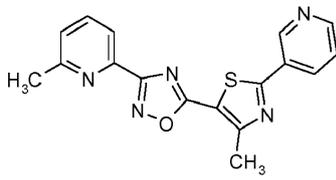
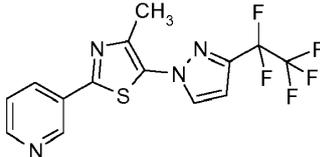
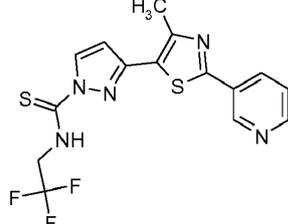
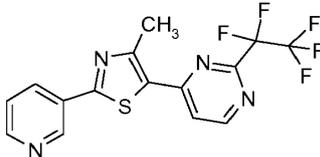
(continuación)

Ej. N.º	logP ¹⁾ (HCOOH)	Fórmula	(M ⁺)+1 (CL/EM)
124	3,09		
125	2,08		
126	1,87		
127	2,57		
128	2,38		
129	2,34		

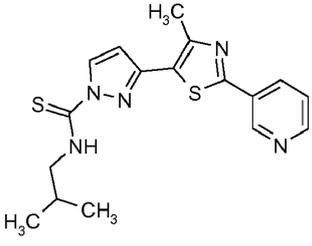
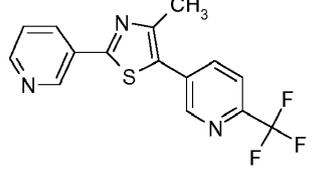
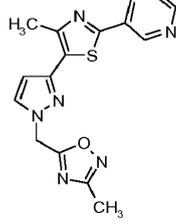
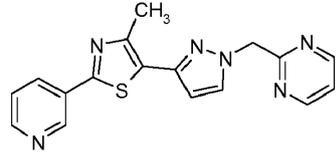
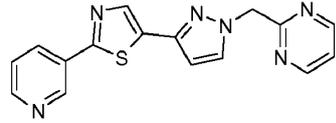
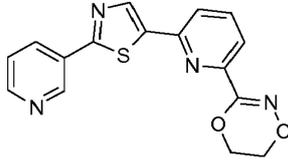
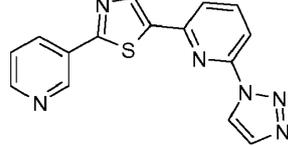
(continuación)

Ej. N.º	logP ¹⁾ (HCOOH)	Fórmula	(M ⁺)+1 (CL/EM)
130	4,17		
131	2,14		
132	2,46		
133	2,53		
134	2,69		
135	3,28		

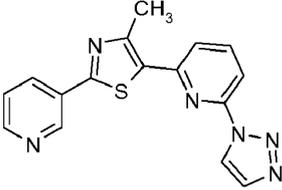
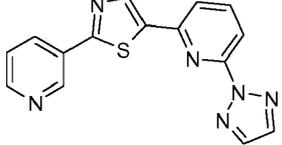
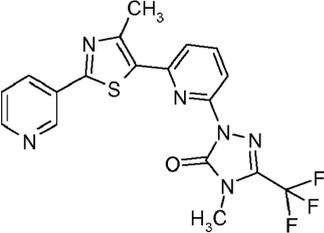
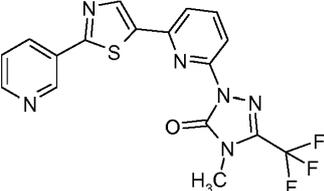
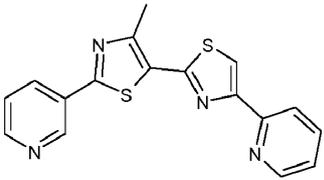
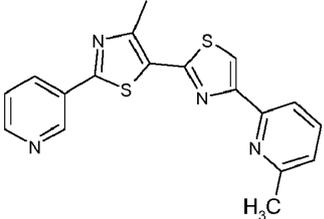
(continuación)

Ej. N.º	logP ¹⁾ (HCOOH)	Fórmula	(M ⁺)+1 (CL/EM)
136	4,41		
137	2,65		
138	2,19		
139	2,61		
140	3,31		
141	3,42		
142	3,35		

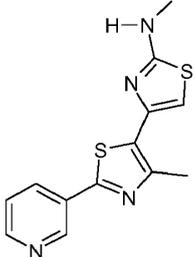
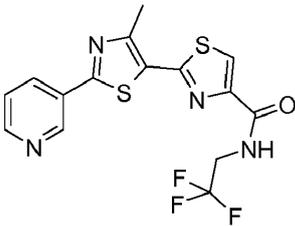
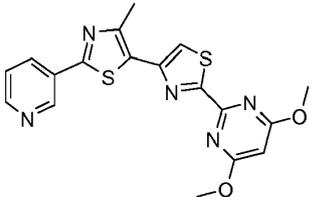
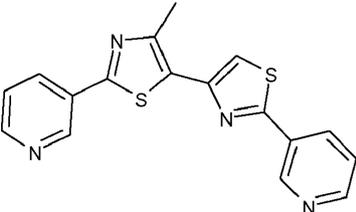
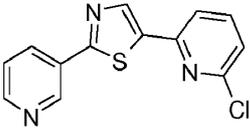
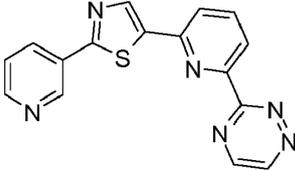
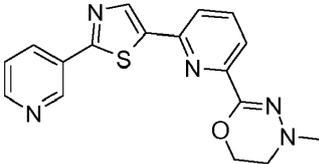
(continuación)

Ej. N.º	logP ¹⁾ (HCOOH)	Fórmula	(M ⁺)+1 (CL/EM)
143	4,28		
144	2,72		
145	1,71		
146	1,43		
147	1,24		
148	1,59		325,0
149	1,85		307,1

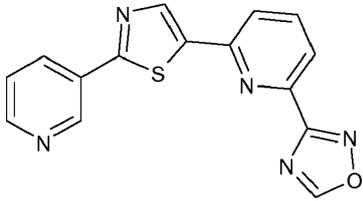
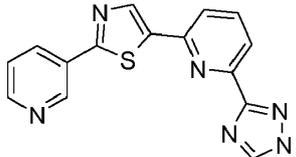
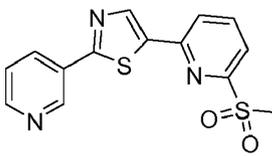
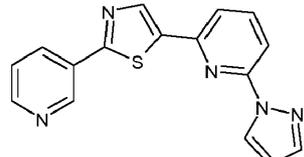
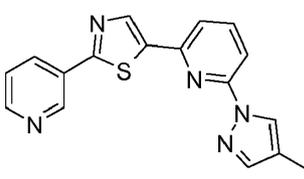
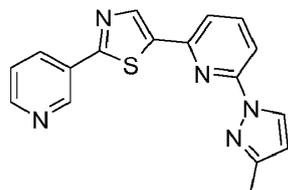
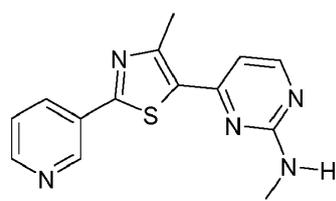
(continuación)

Ej. N.º	logP ¹⁾ (HCOOH)	Fórmula	(M ⁺)+1 (CL/EM)
154	2,13		
155	1,89		307,1
156	2,65		
157	2,35		405,1
172	2,53		
173	2,66		

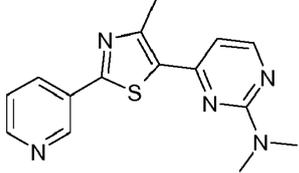
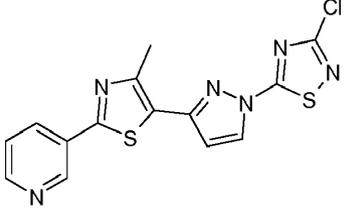
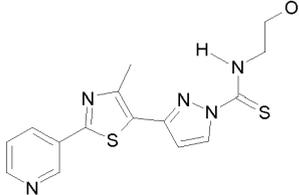
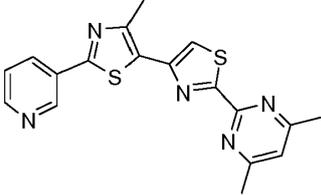
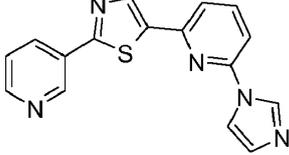
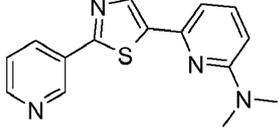
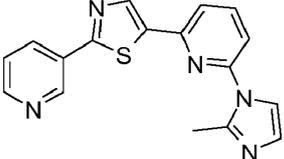
(continuación)

Ej. N.º	logP ¹⁾ (HCOOH)	Fórmula	(M ⁺)+1 (CL/EM)
174	1,76		
175	2,23		
176	3,21		
177	2,19		
178	2,43		
180	1,43		
181	1,82		338,1

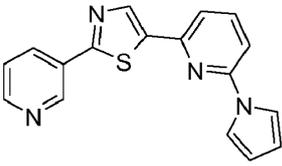
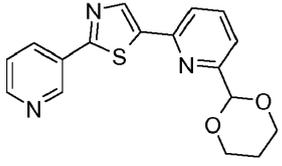
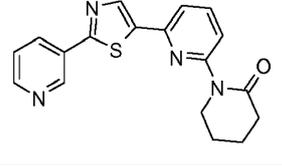
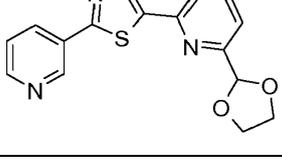
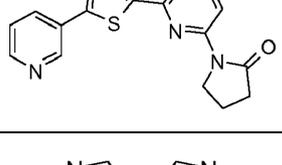
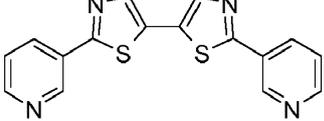
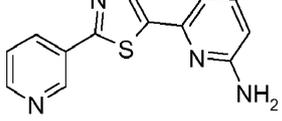
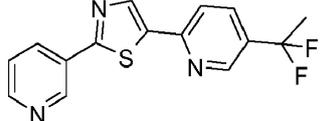
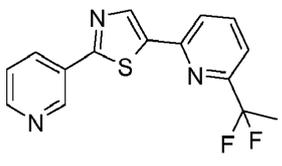
(continuación)

Ej. N.º	logP ¹⁾ (HCOOH)	Fórmula	(M ⁺)+1 (CL/EM)
182	1,74		308,1
183	1,24		307,1
184	1,44		318,0
187	2,53		306,1
188	3,08		
189	2,85		
193	1,41		

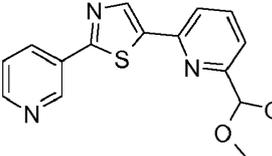
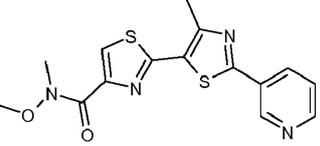
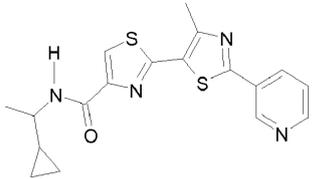
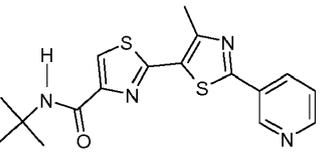
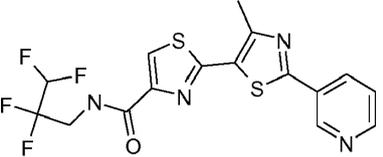
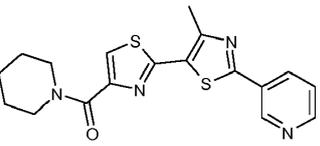
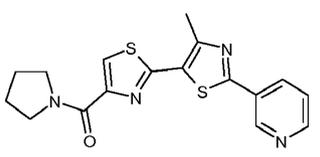
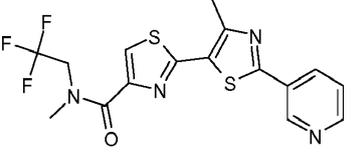
(continuación)

Ej. N.º	logP ¹⁾ (HCOOH)	Fórmula	(M ⁺)+1 (CL/EM)
194	2,15		
195	3,76		
196	3,01		
197	2,58		
199	0,93		
200	2,83		
201	0,89		

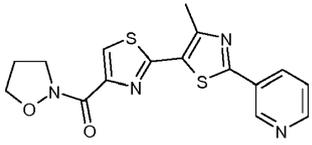
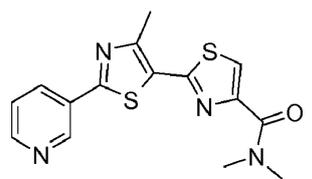
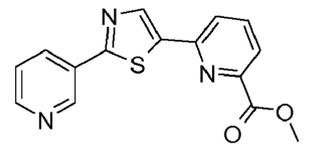
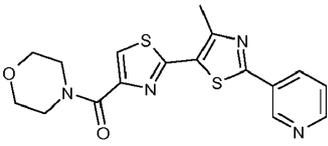
(continuación)

Ej. N.º	logP ¹⁾ (HCOOH)	Fórmula	(M ⁺)+1 (CL/EM)
202	3,13		
203	1,99		326,0
204	1,87		
205	1,82		
206	2,11		
217	1,43		
219	0,92		
223	2,46		
224	2,77		

(continuación)

Ej. N.º	$\log P^{(1)}$ (HCOOH)	Fórmula	(M ⁺)+1 (CL/EM)
225	2,08		314,1
229	1,78		
233	2,69		
234	2,93		
235	2,38		
236	2,38		
237	2,05		
238	2,53		

(continuación)

Ej. N.º	logP ¹⁾ (HCOOH)	Fórmula	(M ⁺)+1 (CL/EM)
242	1,61		
243	1,67		
244	1,77		
247	1,66		

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.

5

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.

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.

10 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. N.º	Datos de RMN (ppm)
1	D ₆ -DMSO: 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)
3	CD ₃ CN: 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)
5	D ₆ -DMSO: 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)
6	CD ₃ CN: 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)

15

ES 2 573 149 T3

(continuación)

Ej. N.º	Datos de RMN (ppm)
7	D ₆ -DMSO: 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)
8	CD ₃ CN: 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)
21	CD ₃ CN: 2,75 (s, 3H), 7,45 (m, 1H), 7,7 (d, 1H), 7,95 (d, 1H), 8,1 (m, 1H), 8,3 (m, 1H), 8,7 (m, 1H), 9,15 (s, 1H)
22	D ₆ -DMSO: 2,7 (s, 3H), 7 (s, 1H), 7,5 (t, 1H), 7,55 (m, 1H), 8,3 (d, 1H); 8,7 (m, 1H); 8,8 (s, 1H), 8,9 (m, 2H), 9,1 (s, 1H)
49	D ₆ -DMSO: 7,55 (m, 1H), 7,8 (d, 1H), 8,2 (m, 1H), 8,35 (m, 2H), 8,7 (m, 2H), 9,2 (s, 1H)
59	d ₆ -DMSO: 2,90 (s, 3H), 4,00 (s, 6H), 7,55 (m, 1H), 7,89 (m, 1H), 8,35 (m, 1H), 8,70 (m, 1H), 9,04 (m, 1H), 9,18 (m, 1H)
61	d ₆ -DMSO: 2,80 (s, 3H), 3,45 (s, 3H), 4,60 (s, 2H), 7,55 (m, 1H), 7,72 (m, 1H), 8,35 (m, 1H), 8,70 (m, 1H), 8,84 (m, 1H), 9,15 (m, 1H)
67	D ₆ -DMSO: 4,2 (m, 2H), 4,6 (m, 2H), 6,9 (m, 1H), 7,5 (m, 1H), 8,15 (s, 1H), 8,3 (d, 1H), 8,55 (m, 2H), 8,7 (m, 1H), 9,15 (s, 1H)
88	d ₆ -DMSO: 7,58 (m, 1H), 7,68 (m, 1H), 8,30 (m, 1H), 8,45 (m, 1H), 8,72 (m, 1H), 9,05 (m, 4H), 9,25 (m, 1H)
89	d ₆ -DMSO: 7,13 (m, 1H), 7,48 (m, 1H), 7,55 (m, 1H), 8,35 (m, 1H), 8,45 (m, 1H), 8,70 (m, 1H), 8,75 (m, 1H), 8,90 (m, 2H), 9,19 (m, 1H)
97	d ₆ -DMSO: 2,79 (s, 3H), 6,60 (m, 1H), 7,52 (m, 1H), 7,69 (m, 1H), 7,85 (m, 2H), 8,10 (m, 1H), 8,30 (m, 1H), 8,60 (m, 1H), 8,65 (m, 1H), 9,15 (m, 1H)
148	D ₆ -DMSO: 4,2 (m, 2H), 4,6 (m, 2H), 7,5 (m, 1H), 7,7 (d, 1H), 7,95 (t, 1H), 8,1 (d, 1H), 8,3 (m, 1H), 8,6 (s, 1H), 8,65 (m, 1H), 9,2 (s, 1H)
149	D ₆ -DMSO: 7,55 (m, 1H), 8,0-8,3 (m, 6H), 8,4 (m, 1H), 8,7 (m, 1H), 9,2 (s, 1H)
155	D ₆ -DMSO: 7,55 (m, 1H), 7,95 (m, 1H), 8,2 (m, 4H), 8,4 (m, 1H), 8,7 (m, 2H), 9,2 (s, 1H)
157	d ₆ -DMSO: 3,40 (s, 3H), 7,55 (m, 1H), 7,88 (m, 1H), 8,05 (m, 1H), 8,10 (m, 1H), 8,38 (m, 1H), 8,68 (m, 2H), 9,20 (m, 1H)
181	D ₆ -DMSO: 3,15 (m, 2H), 3,55 (s, 3H), 4,5 (m, 2H), 7,55 (m, 1H), 7,7 (d, 1H), 7,85 (m, 1H), 8 (m, 1H), 8,35 (m, 1H), 8,6 (s, 1H), 8,7 (m, 1H), 9,2 (s, 1H)
182	D ₆ -DMSO: 7,55 (m, 1H), 8,05 (m, 1H), 8,15 (m, 1H), 8,25 (d, 1H), 8,4 (m, 1H), 8,7 (m, 2H), 9,2 (s, 1H), 9,7 (s, 1H)
183	D ₆ -DMSO: 7,55 (m, 1H), 8-8,1 (m, 4H), 8,35 (m, 1H), 8,7 (m, 2H), 9,2 (s, 1H)
184	d ₆ -DMSO: 3,35 (s, 3H), 7,55 (m, 1H), 7,98 (m, 1H), 8,25-8,40 (m, 3H), 8,70 (m, 1H), 8,75 (m, 1H), 9,20 (m, 1H)
187	d ₆ -DMSO: 6,60 (m, 1H), 7,55 (m, 1H), 7,85-7,95 (m, 3H), 8,10 (m, 1H), 8,35 (m, 1H), 8,70 (m, 3H), 9,20 (m, 1H)
203	d ₆ -DMSO: 2,05 (m, 2H), 4,00 (m, 2H), 4,20 (m, 2H), 5,52 (s, 1H), 7,50 (m, 2H), 7,99 (m, 2H), 8,33 (m, 1H), 8,60 (m, 1H), 8,70 (m, 1H), 9,20 (m, 1H)
225	d ₆ -DMSO: 3,40 (s, 6H), 5,30 (s, 1H), 7,45 (m, 1H), 7,55 (m, 1H), 7,9-8,0 (m, 2H), 8,38 (m, 1H), 8,60 (m, 1H), 8,68 (m, 1H), 9,20 (m, 1H)

Ejemplos biológicos**Ejemplo N.º 1****Prueba de Myzus (tratamiento de aerosol)**

5	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

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 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21,22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 29, 30, 31,32, 33, 34, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 42, 43, 44, 45, 46, 47, 48, 49, 50, 51,52, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 60, 61,62, 63, 64, 65, 66, 67, 68, 69, 70, 71, 72, 73, 74, 75, 76, 77, 78, 79, 80, 81,82, 83, 84, 85, 86, 87, 88, 89, 90, 91,92, 93, 94, 95, 96, 97, 98, 99, 100, 101, 102,103, 104, 105, 106, 107, 108,109, 110,111, 112, 113, 114, 115, 116, 117, 118, 119, 120, 121, 122, 123, 124, 125, 126, 127, 128, 129, 130, 131, 132, 133, 134, 135, 136, 137, 138, 139, 141, 142, 143, 144, 145, 146, 147, 148, 149, 154, 155, 156, 157.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una actividad de ≥ 80 % a una velocidad de aplicación de 100 g/ha:

Ej. N.º 140

25 Ejemplo N.º 2**Prueba de *Meloidogyne* (tratamiento de aerosol)**

Solventes:	80	partes en peso de acetona
------------	----	---------------------------

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

30 Los recipientes se llenan con arena, solución de compuesto activo, suspensión de huevo-larvas de *Meloidogyne incognita* y semillas de lechuga. Las semillas de lechuga germinan y las plantitas se desarrollan. En las raíces se desarrollan las agallas.

Después del periodo de tiempo deseado, se determina el efecto nematocida en % considerando la formación de agallas. A este respecto, el 100 % significa que no se encontró ninguna agalla; el 0 % significa que el número de agallas en las plantas tratadas corresponde al control no tratado.

35 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran un efecto del ≥ 80 % en una velocidad de aplicación de 20 ppm:

Ej. N.º 5, 57, 58, 61, 104, 135

Ejemplo N.º 3**Prueba de *Tetranychus*, resistente a OP (tratamiento de aerosol)**

40	Solventes:	78,0	partes en peso de acetona
		1,5	partes en peso de dimetilformamida
	Emulsionador:	0,5	partes en peso de éter de alquilarilpoliglicol

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.

Se pulverizan discos de hoja de judía (*Phaseolus vulgaris*), que están infestados por todos los estadios de la araña roja común (*Tetranychus urticae*), con una preparación del compuesto activo de la concentración deseada.

Después del periodo de tiempo deseado, se determina el efecto en %. A este respecto, el 100 % significa que han muerto todas las arañas rojas; el 0 % significa que ninguna de las arañas rojas ha muerto.

- 5 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran un efecto del ≥ 80 % en una velocidad de aplicación de 100 g/ha:

Ej. N.º 27

Ejemplo N.º 4

Prueba de *Boophilus microplus* (inyección)

Solventes: dimetilsulfóxido

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

La solución de compuesto activo se inyecta en el abdomen (*Boophilus microplus*), los animales se llevan a platillos y se conservan en una habitación climatizada. El control del efecto se realiza en la deposición de huevos fértiles.

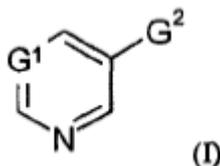
- 15 Después del periodo de tiempo deseado, se determina el efecto en %. A este respecto, el 100 % significa que ninguna garrapata ha puesto huevos fértiles.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran un efecto del ≥ 80 % en una velocidad de aplicación de 20 $\mu\text{g}/\text{animal}$:

Ej. N.º 49

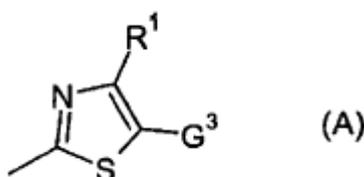
REIVINDICACIONES

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



en la que
(Ia)

G¹ representa CH,



G² representa
en la que

R¹ representa hidrógeno o alquilo y

G³ representa en cada caso oxazolínico, dihidrooxadiazínico, dihidrodioxazínico o hidroxipiridínico, dado el caso sustituidos con halógeno, ciano, nitro, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, haloalquiltio, alquilsulfínico, alquilsulfonilo, haloalquilsulfínico, haloalquilsulfonilo, amino, alquilamino, dialquilamino, alquilcarbonilamino, alcocarbonilamino, alcóxialquilo, haloalcoxialquilo, alqueno, alquínico, alquilocicloalquilo, alquilcarbonilo, alcocarbonilo, aminocarbonilo, piridilo o pirimidilo,

representa hetero 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, pirimidínico, piridazínico, pirazínico, 1,2,3-triazínico, 1,2,4-triazínico, 1,3,5-triazínico, benzofurilo, benzisofurilo, benzotienilo, benzisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, benzisotiazolilo, benzoxazolilo, benzisoxazolilo, benzimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazol, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, ftalazínico, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazínico, purínico, pteridinilo e indolizínico, dado el caso sustituido con halógeno, nitro, amino, alquilamino, dialquilamino, alquilo, haloalquilo, cicloalquilalquilo, alcoxi, haloalcoxi, C(X)NR²R³, (en donde X representa oxígeno o azufre, R² representa hidrógeno o alquilo y R³ representa alquilo, haloalquilo, alcoxi, cianoalquilo, alquínico, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, alcóxialquilo, alquiltioalquilo o arilalquilo o R² y R³ junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo), alquiltio, alquilsulfínico, alquilsulfonilo, los radicales heterocíclico morfolínico, triazolinónico, dihidrodioxazínico, dihidrooxadiazínico, dioxolanilo, dioxanilo, piperidinónico, pirrolidinónico y pirazolinónico (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, pirazínico, triazínico, tetrazínico e isoquinolinilo (que por su parte pueden estar sustituidos con halógeno, nitro, alquilo, haloalquilo, alcanediilo, alcoxi, haloalcoxi, alcóxialquilo, 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, piperidinónico, pirrolidinónico, dioxolanilo o dihidrodioxazínico,

así como sales, complejos de metal y N-óxidos de los compuestos de la fórmula (I), para controlar plagas.

2. Uso de compuestos de la fórmula (I), de acuerdo con la reivindicación 1, en la que

R¹ representa hidrógeno o alquilo-C₁-C₆ y

G³ representa en cada caso oxazolínico, dihidrooxadiazínico, dihidrodioxazínico o hidroxipiridínico dado el caso sustituidos con halógeno, ciano, nitro, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, cicloalquilo-C₃-C₆, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆, haloalquiltio-C₁-C₆, alquilsulfínico-C₁-C₆, alquilsulfonilo-C₁-C₆, haloalquilsulfínico-C₁-C₆, haloalquilsulfonilo-C₁-C₆, amino, alquilamino-C₁-C₆, di(alquilo-C₁-C₆)amino, alquilcarbonilamino-C₁-C₆, alcocarbonilamino-C₁-C₆, alcóxio-C₁-C₆-alquilo-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆-alquilo-C₁-C₆, alqueno-C₂-C₆, alquínico-C₂-C₆, alquilo-C₁-C₆-cicloalquilo-C₃-C₆, alquilcarbonilo-C₁-C₆, alcocarbonilo-C₁-C₆, 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, benzisofurilo, benzotienilo, benzisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, benzisotiazolilo, benzoxazolilo, benzisoxazolilo, benzimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazol, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo e indolizínulo dado el caso sustituidos con halógeno, nitro, amino, alquilamino-C₁-C₆, di(alquilo-C₁-C₆)amino, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, cicloalquilo-C₃-C₆-alquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆-alquilo-C₁-C₆, bis(alcoxi-C₁-C₆)-alquilo-C₁-C₆, alcocarbonilo-C₁-C₆, alfa-hidroxiimino-alcocarbonilmetilo-C₁-C₆, alfa-alcoxiimino-C₁-C₆-alcocarbonilmetilo-C₁-C₆, C(X)NR²R³, (en donde 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, alquiltio-C₁-C₆-alquilo-C₁-C₆ o fenilo-alquilo-C₁-C₆), alquilsufinilo-C₁-C₆, alquilsulfonilo-C₁-C₆, 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, alcanediilo-C₃-C₅, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆-alquilo-C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆-alquilo-C₁-C₆ y cicloalquilo-C₃-C₆), los radicales heteroarilalquilo triazolil-alquilo-C₁-C₆, piridil-alquilo-C₁-C₆, pirimidil-alquilo-C₁-C₆ u 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.

3. Uso de compuestos de la fórmula (I), de acuerdo con la reivindicación 1, en la que

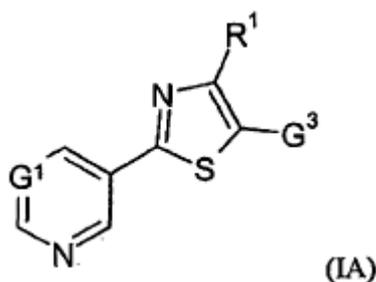
R¹ representa hidrógeno o alquilo-C₁-C₄ y G³ representa en cada caso oxazolinilo, dihidrooxadiazinilo, dihidrodioxazinilo o hidroxipiridilo dado el caso sustituidos con halógeno, ciano, nitro, alquilo-C₁-C₄, haloalquilo-C₁-C₄, cicloalquilo-C₃-C₆, alcoxi-C₁-C₄, haloalcoxi-C₁-C₄, alquiltio-C₁-C₄, haloalquiltio-C₁-C₄, alquilsufinilo-C₁-C₄, alquilsulfonilo-C₁-C₄, haloalquilsufinilo-C₁-C₄, haloalquilsulfonilo-C₁-C₄, amino, alquilamino-C₁-C₄, di(alquil-C₁-C₄)amino, alquilcarbonilamino-C₁-C₄, alcocarbonilamino-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄, haloalcoxi-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄, alquenilo-C₂-C₄, alquinilo-C₂-C₄, alquil-C₁-C₄-cicloalquilo-C₃-C₆, alquilcarbonilo-C₁-C₄, alcocarbonilo-C₁-C₄, 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, benzisofurilo, benzotienilo, benzisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, benzisotiazolilo, benzoxazolilo, benzisoxazolilo, benzimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazol, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo e indolizínulo dado el caso sustituidos con halógeno, nitro, amino, alquilamino-C₁-C₄, di(alquilo-C₁-C₄)amino, alquilo-C₁-C₄, haloalquilo-C₁-C₄, cicloalquilo-C₃-C₆-alquilo-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄, haloalcoxi-C₁-C₄, alquiltio-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄, bis(alcoxi-C₁-C₄)-alquilo-C₁-C₄, alcocarbonilo-C₁-C₄, alfa-hidroxiimino-alcocarbonilmetilo-C₁-C₄, alfa-alcoxiimino-C₁-C₄-alcocarbonilmetilo-C₁-C₄, C(X)NR²R³, (en donde 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, alquiltio-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄ o fenil-alquilo-C₁-C₄), alquilsufinilo-C₁-C₄, alquilsulfonilo-C₁-C₄, 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, alcanediilo-C₃-C₄, alcoxi-C₁-C₄, haloalcoxi-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄, alquiltio-C₁-C₄, alquiltio-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄ o 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.

4. Uso de compuestos de la fórmula (I), de acuerdo con la reivindicación 1, en la que

R¹ representa hidrógeno o metilo 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-

C_1-C_4 -alquilo- C_1-C_4 , bis(alcoxi- C_1-C_4)-alquilo- C_1-C_4 , alcoxicarbonilo- C_1-C_4 , alfa-hidroxiimino-
 alcoxicarbonilmetilo- C_1-C_4 , $C(X)NR^2R^3$, (en donde X representa oxígeno o azufre, R^2 representa hidrógeno y R^3
 5 representa alquilo- C_1-C_5 , haloalquilo- C_1-C_4 , alcoxi- C_1-C_4 ciano-alquilo- C_1-C_4 , cicloalquilo- C_3-C_6 , cicloalquil-
 C_3-C_6 -alquilo- C_1-C_4 , alcoxi- C_1-C_4 -alquilo- C_1-C_4 , alquiltio- C_1-C_4 -alquilo- C_1-C_4 o fenilo-alquilo- C_1-C_4),
 alquiltio- C_1-C_4 , alquilsulfonilo- C_1-C_4 , los radicales heterociclilo morfolinilo, triazolinonilo, dihidrodioxazinilo,
 dihidrooxadiazinilo, piperidinonilo, pirrolidinonilo y pirazolinonilo (que por su parte pueden estar sustituidos con
 10 alquilo- C_1-C_4 o haloalquilo- C_1-C_4), fenilo (que por su parte puede estar sustituido 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- C_1-C_4 , haloalquilo- C_1-C_4 , alcanedilo- C_3-C_4 , , alcoxi- C_1-C_4 , cicloalquilo- C_3-C_6), los radicales
 heteroarilalquilo triazolil-alquilo- C_1-C_4 , piridil-alquilo- C_1-C_4 , pirimidinil-alquilo- C_1-C_4 u oxadiazolil-alquilo- C_1-
 C_4 (que por su parte pueden estar sustituidos con alquilo- C_1-C_4) o
 representa fenilo dado el caso sustituido con halógeno, haloalquilo- C_1-C_4 , dioxolanilo, piperidinonilo,
 pirrolidinonilo o dihidrodioxazinilo.

15 5. Compuestos de la fórmula (IA)



en la que

G^1 representa CH,
 R^1 representa hidrógeno y
 20 G^3 representa en cada caso oxazolinilo, dihidrooxadiazinilo, dihidrodioxazinilo o hidroxipiridilo dado el caso
 sustituidos con halógeno, ciano, nitro, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, haloalquiltio,
 alquilsulfonilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, amino, alquilamino, dialquilamino,
 alquilcarbonilamino, alcoxicarbonilamino, alcoxialquilo, haloalcoxialquilo, alqueno, alquinilo, alquilcicloalquilo,
 alquilcarbonilo, alcoxicarbonilo, 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, benzisofurilo, benzotienilo,
 30 benzisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, benzisotiazolilo, benzoxazolilo, benzisoxazolilo,
 benzimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazol, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo,
 naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo e indolizino dado el caso sustituidos con halógeno, nitro, amino,
 alquilamino, dialquilamino, alquilo, haloalquilo, cicloalquilalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, alcoxialquilo,
 bis(alcoxi)alquilo, alcoxicarbonilo, alfa-hidroxiiminoalcoxicarbonilmetilo, alfa-alcoxiiminoalcoxicarbonilmetilo,
 35 $C(X)NR^2R^3$, (en donde X representa oxígeno o azufre, R^2 representa hidrógeno o alquilo y R^3 representa alquilo,
 haloalquilo, alcoxi, cianoalquilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, alcoxialquilo, alquiltioalquilo o arilalquilo),
 alquilsulfonilo, 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,
 40 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 o cicloalquilo), los radicales heteroarilalquilo triazolilalquilo,
 piridilalquilo, pirimidilalquilo u oxadiazolilalquilo (que por su parte pueden estar sustituidos con alquilo) o
 representa fenilo sustituido con halógeno, ciano, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, dioxolanilo, piperidinonilo,
 45 pirrolidinonilo o dihidrodioxazinilo.

6. Compuestos de la fórmula (IA) de acuerdo con la reivindicación 5, en la que

G^1 representa CH,

R^1 representa hidrógeno y

- 5 G^3 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, alquiltio-C₁-C₆, haloalquiltio-C₁-C₆, alquilsufinilo-C₁-C₆, alquilsulfonilo-C₁-C₆, haloalquilsufinilo-C₁-C₆, haloalquilsulfonilo-C₁-C₆, amino, alquilamino-C₁-C₆, di(alquil-C₁-C₆)amino, alquilcarbonilamino-C₁-C₆, alcoxycarbonilamino-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆-alquilo-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆-alquilo-C₁-C₆, alquenilo-C₂-C₆, alquinilo-C₂-C₆, alquilo-C₁-C₆-cicloalquilo-C₃-C₆, aquilcarbonilo-C₁-C₆,
 10 alcoxycarbonilo-C₁-C₆, 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, benzisofurilo, benzotienilo, benzisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, benzisotiazolilo, benzoxazolilo, benzisoxazolilo, benzimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazol, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, flazazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo e indolizínilo, dado el caso sustituidos con halógeno, nitro, amino, alquilamino-C₁-C₆, di(alquil-C₁-C₆)amino, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, cicloalquil-C₃-C₆-alquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆, alcoxycarbonilo-C₁-C₆, alcoxycarbonilmetilo-C₁-C₆, alcoxycarbonilmetilo-C₁-C₆, $C(X)NR^2R^3$, (en donde X representa oxígeno o azufre, R^2 representa hidrógeno o alquilo-C₁-C₆ y R^3 representa alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆, ciano-alquilo-C₁-C₆, alquinilo-C₂-C₆, cicloalquilo-C₃-C₆, cicloalquil-C₃-C₆-alquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆-alquilo-C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆-alquilo-C₁-C₆ o fenil-alquilo-C₁-C₆), alquilsufinilo-C₁-C₆, alquilsulfonilo-C₁-C₆, los radicales heterocíclico
 20 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, alquiltio-C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆-alquilo-C₁-C₆ o cicloalquilo-C₃-C₆), los radicales heteroarilalquilo triazolil-alquilo-C₁-C₆, piridil-alquilo-C₁-C₆, pirimidil-alquilo-C₁-C₆ u oxadiazolil-alquilo-C₁-C₆ (que por su parte pueden estar sustituidos con alquilo-C₁-C₆) o
 25 representa fenilo sustituido con halógeno, ciano, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆, dioxolanilo, piperidinonilo, pirrolidinonilo o dihidrodioxazinilo.

7. Compuestos de la fórmula (IA) de acuerdo con la reivindicación 5, en la que

G^1 representa CH,

R^1 representa hidrógeno y

- 40 G^3 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, alquiltio-C₁-C₄, haloalquiltio-C₁-C₄, alquilsufinilo-C₁-C₄, alquilsulfonilo-C₁-C₄, haloalquilsufinilo-C₁-C₄, haloalquilsulfonilo-C₁-C₄, amino, alquilamino-C₁-C₄, di(alquil-C₁-C₄)amino, alquilcarbonilamino-C₁-C₄, alcoxycarbonilamino-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄, haloalcoxi-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄, alquenilo-C₂-C₄, alquinilo-C₂-C₄, alquil-C₁-C₄-cicloalquilo-C₃-C₆, aquilcarbonilo-C₁-C₄,
 45 alcoxycarbonilo-C₁-C₄, 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, benzisofurilo, benzotienilo, benzisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, benzisotiazolilo, benzoxazolilo, benzisoxazolilo, benzimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazol, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, flazazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo e indolizínilo, dado el caso sustituidos con halógeno, nitro, amino, alquilamino-C₁-C₄, di(alquil-C₁-C₄)amino, alquilo-C₁-C₄, haloalquilo-C₁-C₄, cicloalquil-C₃-C₆-alquilo-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄, haloalcoxi-C₁-C₄, alquiltio-C₁-C₄, alcoxycarbonilo-C₁-C₄, alcoxycarbonilmetilo-C₁-C₄, alcoxycarbonilmetilo-C₁-C₄, $C(X)NR^2R^3$, (en donde X representa oxígeno o azufre, R^2 representa hidrógeno o alquilo-C₁-C₄ y R^3 representa alquilo-C₁-C₅, haloalquilo-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄, ciano-alquilo-C₁-C₄, alquinilo-C₂-C₄, cicloalquilo-C₃-C₆, cicloalquil-C₃-C₆-alquilo-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄, alquiltio-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄ o fenil-alquilo-C₁-C₄), alquilsufinilo-C₁-C₄, alquilsulfonilo-C₁-C₄, los radicales heterocíclico
 50 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,

5 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, alquiltio-C₁-C₄, alquiltio-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄ o 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 sustituido con halógeno, ciano, alquilo-C₁-C₄, haloalquilo-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄, haloalcoxi-C₁-C₄, dioxolanilo, piperidinonilo, pirrolidinonilo o dihidrodioxazinilo.

8. Compuestos de la fórmula (IA) de acuerdo con la reivindicación 5, en la que

10 G¹ representa CH,

R¹ representa hidrógeno y

G³ representa en cada caso oxazolínilo, dihidrooxadiazínilo o hidroxipiridilo dado el caso sustituidos con piridilo o pirimidínilo,

representa en cada caso pirazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, piridilo, pirimidínilo, 1,3,5-triazínilo, triazinilo u oxadiazolilo,

dado el caso sustituidos con halógeno, nitro, amino, haloalquilo-C₁-C₄, cicloalquilo-C₃-C₆-alquilo-C₁-C₄,

15 alcoxi-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄, bis(alcoxi-C₁-C₄)-alquilo-C₁-C₄, alcoxicarbonilo-C₁-C₄, alfa-hidroxiimino-alcoxicarbonilmetilo-C₁-C₄, C(X)NR²R³, (en donde 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,

cicloalquilo-C₃-C₆-alquilo-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄, alquiltio-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄ o fenilo-alquilo-

20 C₁-C₄), alquiltio-C₁-C₄, alquilsulfonilo-C₁-C₄, los radicales heterociclilo morfolínilo, triazolinonilo, dihidrodioxazinilo, dihidrooxadiazínilo, 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), los radicales heteroarilo pirrolilo, piridilo, piridilo-N-óxido, pirimidínilo, pirazolilo, tiazolilo, furanilo,

25 tienilo, triazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, pirazinilo, triazinilo e isoquinolinilo (que por su parte pueden estar sustituidos con halógeno, nitro, alquilo-C₁-C₄, haloalquilo-C₁-C₄, alcanediilo-C₃-C₄, alcoxi-C₁-C₄, cicloalquilo-

C₃-C₆), los radicales heteroarilalquilo triazolilo-alquilo-C₁-C₄, piridilo-alquilo-C₁-C₄, pirimidínilo-alquilo-C₁-C₄ u

oxadiazolilo-alquilo-C₁-C₄ (que por su parte pueden estar sustituidos con alquilo-C₁-C₄) o

representa fenilo sustituido con halógeno, haloalquilo-C₁-C₄, dioxolanilo, piperidinonilo, pirrolidinonilo o

dihidrodioxazinilo.

9. Composiciones **caracterizadas por** un contenido de al menos un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 5.

10. Procedimiento no terapéutico para controlar plagas, **caracterizado porque** se deja que un compuesto de la fórmula (I), de acuerdo con la reivindicación 5, o un medio, de acuerdo con la reivindicación 9, actúen sobre las plagas y/o su hábitat.