



### OFICINA ESPAÑOLA DE PATENTES Y MARCAS

**ESPAÑA** 



11 Número de publicación: 2 574 414

(51) Int. Cl.:

A01N 43/56 (2006.01) A01N 43/58 (2006.01) C07D 401/14 (2006.01) C07D 403/12 (2006.01) C07D 405/14 (2006.01) C07D 411/14 C07D 417/14 (2006.01) C07D 409/14 (2006.01)

(12) TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

**T3** 

- (96) Fecha de presentación y número de la solicitud europea: 16.04.2012 E 12713758 (6) (97) Fecha y número de publicación de la concesión europea: EP 2699563 06.04.2016
- (54) Título: Compuestos de pirazol pesticidas novedosos
- (30) Prioridad:

21.04.2011 US 201161477620 P

(45) Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente: 17.06.2016

(73) Titular/es:

BASF SE (100.0%) Carl-Bosch-Strasse 38 67056 Ludwigshafen am Rhein, DE

(72) Inventor/es:

**DEFIEBER, CHRISTIAN;** SÖRGEL, SEBASTIAN; SÄLINGER, DANIEL; LE VEZOUET, RONAN; KÖRBER, KARSTEN; GROSS, STEFFEN; **CULBERTSON, DEBORAH L. y GUNJIMA, KOSHI** 

(74) Agente/Representante:

CARVAJAL Y URQUIJO, Isabel

#### Observaciones:

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

#### **DESCRIPCIÓN**

Compuestos de pirazol pesticidas novedosos

La presente invención se refiere a pirazoles novedosos de fórmula I

5 en la que U es N o CH;

Tes OoS;

30

35

 $R^1$  es H, alquilo  $C_1$ - $C_2$  o (alcoxi  $C_1$ - $C_2$ )-alquilo  $C_1$ - $C_2$ ;

R<sup>2</sup> es CH<sub>3</sub> o halometilo;

R<sup>3</sup> es alquilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> y alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquenilo C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, CN, NO<sub>2</sub> o S(O)<sub>n</sub>R<sup>b</sup>, en los que los átomos de C pueden no estar sustituidos o estar parcial o completamente sustituidos con R<sup>a</sup>;

 $R^a$  es halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-haloalcoxilo o S(O)<sub>n</sub> $R^b$ , en los que n es 0, 1, ó 2;

 $R^b$  es hidrógeno, alquilo  $C_1$ - $C_2$ , haloalquilo  $C_1$ - $C_2$ , cicloalquilo  $C_3$ - $C_6$  o alcoxilo  $C_1$ - $C_4$ ,  $R^4$  es alquilo  $C_1$ - $C_4$  o un grupo mencionado para  $R^3$ ;

R<sup>5</sup> es H o un grupo mencionado para R<sup>4</sup>;

R³ y R⁴ pueden formar juntos un carbo o heterociclo de tres a seis miembros, que puede contener 1 ó 2 heteroátomos seleccionados de N-Rc, O y S, en los que S puede estar oxidado, carbo o heterociclo que puede estar sustituido con Rª;

20 R<sup>c</sup> es hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, alquilcarbonilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> o (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-carbonilo; y los estereoisómeros, sales, tautómeros y N-óxidos de los mismos.

Además, la invención se refiere a composiciones que los comprende y a su uso para combatir plagas de invertebrados. Además, la invención se refiere a métodos de aplicación de tales compuestos.

Pueden encontrarse realizaciones adicionales de la presente invención en las reivindicaciones, la descripción y los ejemplos. Debe entenderse que las características mencionadas anteriormente y aquellas que van a ilustrarse a continuación del objeto de la invención pueden aplicarse no sólo en la combinación respectiva dada sino también en otras combinaciones sin salirse del alcance de la invención.

Los documentos WO 2009/027393, WO 2010/034737, WO 2010/034738 y WO 2010/112177 describen derivados de N-arilamidas, derivados de ácidos pirazol-carboxílicos. Se menciona que estos compuestos son útiles para combatir plagas de invertebrados.

Las plagas de invertebrados y en particular de artrópodos y nematodos destruyen cultivos en crecimiento y cosechados y atacan estructuras de madera de viviendas y comercios, provocando por tanto grandes pérdidas económicas a la fuente de alimentos y a la propiedad. Existe una necesidad continua de nuevos agentes para combatir plagas de invertebrados tales como insectos, arácnidos y nematodos. Por tanto, un objeto de la presente invención es proporcionar compuestos que tengan una buena actividad pesticida y que muestren un amplio espectro de actividad frente a un gran número de diferentes plagas de invertebrados, especialmente frente a plagas difíciles de controlar, tales como insectos.

Se ha encontrado que estos objetivos pueden lograrse mediante compuestos de fórmula I, tal como se definió al principio, y mediante sus estereoisómeros, sales, tautómeros y N-óxidos, en particular sus sales agrícolamente

#### aceptables.

20

Una realización de la invención se refiere a compuestos de fórmula I, en la que U es CH. Estos compuestos corresponden a la fórmula I.A.

5 Una realización adicional de la invención se refiere a compuestos de fórmula I, en la que U es N. Estos compuestos corresponden a la fórmula I.B.

Los compuestos según la invención pueden prepararse de manera análoga a las rutas de síntesis descritas en los documentos WO 2009/027393 y WO 2010/034737 según procedimientos convencionales de química orgánica, por ejemplo según la siguiente ruta de síntesis:

Pueden prepararse compuestos de fórmula I, en la que T es O (fórmula 1.1), por ejemplo haciendo reaccionar derivado de ácido pirazol-carboxílico activado II con una 3-aminopiridina o 4-aminopiridazina de fórmula III (por ejemplo Houben-Weyl: "Methoden der organ. Chemie" [Métodos de química orgánica], Georg-Thieme-Verlag, Stuttgart, Nueva York 1985, volumen E5, págs. 941-1045).

Los derivados de ácido pirazol-carboxílico activados II son preferiblemente haluros, ésteres activados, anhídridos, azidas, por ejemplo cloruros, fluoruros, bromuros, ésteres para-nitrofenílicos, ésteres pentafluorofenílicos, Nhidroxisuccinimidas, ésteres hidroxibenzotriazol-1-ílicos.

En las fórmulas II y III, los radicales tienen los significados mencionados anteriormente para la fórmula I y en particular los significados que se menciona que se prefieren, X es un grupo saliente adecuado tal como halógeno, N<sub>3</sub>, p-nitrofenoxilo o pentafluorofenoxilo y similares.

También pueden prepararse compuestos de fórmula 1.1 en la que R<sup>1</sup> es diferente de hidrógeno alquilando las amidas 1.1, en las que R<sup>1</sup> es hidrógeno, usando agentes de alquilación adecuados en presencia de bases. La alquilación puede realizarse en condiciones convencionales conocidas a partir de la bibliografía.

Los compuestos de fórmula I pueden estar presentes en dos formas isoméricas, y los compuestos de fórmula I.B en tres formas isoméricas, por tanto la fórmula I abarca los tautómeros tanto T-A como T-B, y para la fórmula I.B también el T-C:

Por motivos de claridad sólo se hace referencia al isómero T-A a lo largo de toda la memoria descriptiva, pero su descripción también abarca la divulgación de los demás isómeros.

El isómero T-C puede obtenerse mediante alquilación de compuestos I.B.1 en los que R<sup>1</sup> es hidrógeno. La reacción puede realizarse mediante analogía a la N-alquilación conocida de piridazinas. En la bibliografía se conoce la N-alquilación de piridazinas y puede encontrarse, por ejemplo, en: J. Chem. Soc., Perkin Trans. vol. 1, pág. 401 (1988), y J. Org. Chem. Vol. 46, p. 2467 (1981).

5

20

25

30

35

40

Pueden prepararse compuestos de la fórmula I, en la que T es S (fórmula 1.2), por ejemplo haciendo reaccionar compuestos de fórmula I.1 con 2,4-bis(4-metoxifenil)-1,3,2,4-ditiadifosfetano-2,4-di-sulfuro o PS5 según el método descrito en Synthesis 2003, pág. 1929.

Los compuestos II y III se conocen en la técnica o están comercialmente disponibles o pueden prepararse mediante métodos conocidos a partir de la bibliografía (véanse los documentos WO 05/040169; WO 08/074824; Journal of Fluorine chemistry 132(11), pág. 995 (2011)).

Pueden prepararse N-óxidos de los compuestos de fórmula I mediante oxidación de compuestos I según métodos convencionales de preparación de N-óxidos heteroaromáticos, por ejemplo mediante el método descrito en Journal of Organometallic Chemistry 1989, 370, 17-31.

Si no pueden prepararse compuestos individuales mediante las rutas descritas anteriormente, pueden prepararse mediante derivatización de otros compuestos I o mediante modificaciones habituales de las rutas de síntesis descritas. Por ejemplo, en casos individuales, determinados compuestos I pueden prepararse ventajosamente a partir de otros compuestos I mediante hidrólisis de éster, amidación, esterificación, escisión de éter, olefinación, reducción, oxidación y similares.

Las mezclas de reacción se someten a tratamiento final de la manera habitual, por ejemplo mezclando con agua, separando las fases y, si es apropiado, purificando los productos brutos mediante cromatografía, por ejemplo sobre alúmina o sobre gel de sílice. Algunos de los productos intermedios y productos finales pueden obtenerse en forma de aceites viscosos incoloros o de color marrón pálido que se liberan o purifican de componentes volátiles a presión reducida y a temperatura moderadamente elevada. Si los productos intermedios y productos finales se obtienen como sólidos, pueden purificare mediante recristalización o trituración.

El término "compuesto(s) según la invención" o "compuestos de fórmula l" comprende el/los compuesto(s) tal como se define(n) en el presente documento así como un estereoisómero, sal, tautómero o N-óxido del/de los mismo(s). El término "compuesto(s) de la presente invención" debe entenderse como equivalente del término "compuesto(s) según la invención", por tanto también comprende un estereoisómero, sal, tautómero o N-óxido del/de los mismo(s).

Los radicales unidos al esqueleto de fórmula I pueden contener uno o más centros de quiralidad. En este caso, la fórmula I está presente en forma de diferentes enantiómeros o diastereómeros, dependiendo de los sustituyentes. La presente invención se refiere a todos los posibles estereoisómeros de la fórmula I, es decir a enantiómeros o diastereómeros individuales así como a mezclas de los mismos.

Los compuestos de fórmula I pueden ser amorfos o pueden existir en uno o más estados cristalinos diferentes (polimorfos) que pueden tener diferentes propiedades macroscópicas tales como estabilidad o mostrar diferentes propiedades biológicas tales como actividades. La presente invención se refiere a compuestos amorfos y cristalinos de fórmula I, a mezclas de diferentes estados cristalinos del respectivo compuesto I, así como a sales amorfas o cristalinas de los mismos.

Las sales de los compuestos de la fórmula I son preferiblemente sales agrícolamente aceptables. Pueden formarse de una manera habitual, por ejemplo haciendo reaccionar el compuesto con un ácido del anión en cuestión si el compuesto de fórmula I tiene una funcionalidad básica.

Las sales agrícolamente útiles de los compuestos de fórmula I abarcan especialmente las sales de adición de ácido de aquellos ácidos cuyos cationes y aniones, respectivamente, no tienen ningún efecto adverso sobre la acción pesticida de los compuestos de fórmula I.

5

10

20

25

30

35

50

Los aniones de sales de adición de ácido útiles son principalmente cloruro, bromuro, fluoruro, hidrogenosulfato, sulfato, dihidrogenofosfato, hidrogenofosfato, fosfato, nitrato, bicarbonato, carbonato, hexafluorosilicato, hexafluorofosfato, benzoato, y los aniones de ácidos alcanoicos C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, preferiblemente formiato, acetato, propionato y butirato. Pueden formarse haciendo reaccionar compuestos de fórmula I con un ácido del anión correspondiente, preferiblemente de ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico o ácido nítrico.

El término "N-óxido" incluye cualquier compuesto de fórmula I que tiene al menos un átomo de nitrógeno terciario que está oxidado para dar un resto N-óxido.

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

El término "halógeno" indica en cada caso flúor, bromo, cloro o yodo, en particular flúor, cloro o bromo.

El término "alquilo" tal como se usa en el presente documento y en los restos alquilo de alcoxilo, alquilcarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfinilo y alcoxialquilo indica en cada caso un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene habitualmente desde 1 hasta 6 átomos de carbono, preferiblemente de 1 a 4 átomos de carbono y en particular desde 1 hasta 3 átomos de carbono. Ejemplos de un grupo alquilo son metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, 2-butilo, iso-butilo, terc-butilo, n-pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, n-hexilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, 1,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1,1-etilbutilo, 1,1-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo y 1-etil-2-metilpropilo.

El término "haloalquilo" tal como se usa en el presente documento y en los restos haloalquilo de haloalcoxilo, haloalquiltio, haloalquilcarbonilo, haloalquilsulfonilo y haloalquilsulfinilo, indica en cada caso un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene habitualmente desde 1 hasta 6 átomos de carbono, frecuentemente desde 1 hasta 4 átomos de carbono, en el que los átomos de hidrógeno de este grupo están parcial o totalmente sustituidos por átomos de halógeno. Se seleccionan restos haloalquilo preferidos de haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, en particular de fluoroalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> tal como fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2-trifluoroetilo, pentafluoroetilo y similares.

El término "alcoxilo" tal como se usa en el presente documento indica en cada caso un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que está unido mediante un átomo de oxígeno y tiene habitualmente desde 1 hasta 6 átomos de carbono, preferiblemente de 1 a 4 átomos de carbono. Ejemplos de un grupo alcoxilo son metoxilo, etoxilo, n-propoxilo, iso-propoxilo, n-butiloxilo, 2-butiloxilo, iso-butiloxilo, terc-butiloxilo, y similares.

El término "cicloalquilo" tal como se usa en el presente documento y en los restos cicloalquilo de cicloalcoxilo y cicloalquilmetilo indica en cada caso un radical cicloalifático monocíclico que tiene habitualmente desde 3 hasta 6 átomos de carbono, tales como ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo.

40 El término "alquenilo", tal como se usa en el presente documento, indica en cada caso un radical hidrocarbonado con insaturación individual que tiene habitualmente de 2 a 6, preferiblemente de 2 a 4 átomos de carbono, por ejemplo vinilo, alilo (2-propen-1-ilo), 1-propen-1-ilo, 2-propen-2-ilo, metalilo (2-metilprop-2-en-1-ilo), 2-buten-1-ilo, 3-buten-1-ilo, 2-penten-1-ilo, 3-penten-1-ilo, 4-penten-1-ilo, 1-metilbut-2-en-1-ilo, 2-etilprop-2-en-1-ilo y similares.

El término "alquinilo", tal como se usa en el presente documento, indica en cada caso un radical hidrocarbonado con insaturación individual que tiene habitualmente de 2 a 6, preferiblemente de 2 a 4 átomos de carbono, por ejemplo etinilo, propargilo (2-propin-1-ilo), 1-propin-1-ilo, 1-metilprop-2-in-1-ilo, 2-butin-1-ilo, 3-butin-1-ilo, 1-metilbut-2-in-1-ilo, 1-etilprop-2-in-1-ilo y similares.

El término "alcoxialquilo", tal como se usa en el presente documento, se refiere a alquilo que comprende habitualmente de 1 a 2 átomos de carbono, en el que 1 átomo de carbono porta un radical alcoxilo que comprende habitualmente 1 ó 2 átomos de carbono tal como se definió anteriormente. Ejemplos son CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>-OC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, 2-(metoxi)etilo y 2-(etoxi)etilo.

El término "heterocíclico" incluye en general radicales no aromáticos heterocíclicos, monocíclicos de 5 ó 6 miembros, en particular de 6 miembros. Los radicales no aromáticos heterocíclicos comprenden habitualmente 1, 2 ó 3 heteroátomos seleccionados de N, O y S como miembros de anillo, en los que los átomos de S como miembros de anillo pueden estar presentes como S, SO o  $SO_2$ .

- 5 Los ejemplos de radicales heterocíclicos de 5 ó 6 miembros comprenden anillos heterocíclicos no aromáticos, saturados o insaturados, tales como oxiranilo, oxetanilo, tietanilo, tietanil-S-óxido (S-oxotietanil), tietanil-S-dióxido (Sdioxotietanil), pirrolidinilo, pirrolinilo, pirazolinilo, tetrahidrofuranilo, dihidrofuranilo, 1,3-dioxolanilo, tiolanilo, Soxotiolanilo, S-dioxotiolanilo, dihidrotienilo, S-oxodihidrotienilo, S-dioxodihidrotienilo, oxazolidinilo, oxazolinilo, tiazolinilo, oxatiolanilo, piperidinilo, piperazinilo, piranilo, dihidropiranilo, tetrahidropiranilo, 1,3- y 1,4-dioxanilo, tiopiranilo, S-oxotiopiranilo, S-dioxotiopiranilo, dihidrotiopiranilo, S-oxodihidrotiopiranilo, S-dioxodihidrotiopiranilo, 10 S-oxotetrahidrotiopiranilo, tetrahidrotiopiranilo, S-dioxotetrahidrotiopiranilo, morfolinilo, tiomorfolinilo, oxotiomorfolinilo, S-dioxotiomorfolinilo, tiazinilo y similares. Los ejemplos para anillo heterocíclico que también comprende 1 ó 2 grupos carbonilo como miembros de anillo comprenden pirrolidin-2-onilo, pirrolidin-2,5-dionilo, imidazolidin-2-onilo, oxazolidin-2-onilo, tiazolidin-2-onilo y similares.
- 15 Con respecto a las variables, las realizaciones particularmente preferidas de los productos intermedios corresponden a los de los grupos de fórmula I.

En una realización particular, las variables de los compuestos de fórmula I tienen los siguientes significados, siendo estos significados, tanto por sí mismos como en combinación con otros, realizaciones particulares de los compuestos de la fórmula I: En una realización preferida de los compuestos de la fórmula I, U es CH. Estos compuestos corresponden a la fórmula I.A.

En una realización adicional de los compuestos de fórmula I, U es N. Estos compuestos corresponden a la fórmula I R

En una primera realización preferida de fórmula I, T es O. Estos compuestos corresponden a la fórmula 1.1.

$$\begin{array}{c|c}
R^5 & N & N & N \\
R^4 & R^2 & R^1 \\
R^3 & I.1
\end{array}$$

$$\begin{array}{c|c}
R^5 & N & N & N \\
R^4 & R^3 & R^2 & R^1
\end{array}$$

25 En otra realización de fórmula I, T es S. Estos compuestos corresponden a la fórmula I.2.

En una primera realización, R1 es H.

20

35

En una realización adicional, R1 es alquilo C1-C2, preferiblemente CH3.

En una realización adicional, R1 es CH2CH3.

En una realización adicional,  $R^1$  es (alcoxi  $C_1$ - $C_2$ )-alquilo  $C_1$ - $C_2$ , preferiblemente alcoxi  $C_1$ - $C_2$ -metilo, particularmente  $CH_2OCH_3$ .

En una primera realización, R<sup>2</sup> es CH<sub>3</sub>.

En una realización adicional,  $R^2$  es halometilo, preferiblemente fluorometilo, particularmente  $CHF_2$ , o  $CF_3$ . En una primera realización preferida,  $R^3$  es alquilo  $C_2$ - $C_6$ , preferiblemente alquilo  $C_2$ - $C_4$ , particularmente  $CH_2CH_3$ , o  $C(CH_3)_3$ .

En otra realización preferida,  $R^3$  es haloalquilo  $C_1$ - $C_6$ , preferiblemente alquilo  $C_1$ - $C_2$ , más preferido halometilo, tal como  $CHF_2$ , o  $CF_3$ , particularmente  $CF_3$ .

En otra realización preferida,  $R^3$  es (alcoxi  $C_1$ - $C_2$ )-alquilo  $C_1$ - $C_2$ , preferiblemente alcoxi  $C_1$ - $C_2$ -metilo, particularmente  $CH_2OCH_3$ .

En otra realización preferida, R<sup>3</sup> es cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, preferiblemente ciclopropilo, que no está sustituido o está sustituido, preferiblemente con halógeno o ciano. Los sustituyentes están preferiblemente en la posición 1 ó 2,2.

40 En una primera realización preferida R<sup>4</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, preferiblemente alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, particularmente CH<sub>3</sub>.

En otra realización preferida  $R^4$  es haloalquilo  $C_1$ - $C_6$ , preferiblemente alquilo  $C_1$ - $C_2$ , particularmente halometilo, tal como  $CF_3$ .

En una realización adicional  $R^4$  es cicloalquilo  $C_3$ - $C_6$ , preferiblemente ciclopropilo, que puede estar sustituido, preferiblemente con halógeno o ciano. Los sustituyentes están preferiblemente en la posición 1 ó 2,2.

5 En una primera realización preferida, R<sup>5</sup> es hidrógeno.

En otra realización preferida, R<sup>5</sup> es CN o NO<sub>2</sub>, preferiblemente CN.

En otra realización preferida, R<sup>5</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, preferiblemente alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, particularmente CH<sub>3</sub>.

En otra realización, R³ y R⁴ forman un carbociclo saturado de cinco o seis miembros, tal como ciclopentilo o ciclohexilo, que no está sustituido o está sustituido con uno o más grupos Rª. Tales grupos Rª son preferiblemente halógeno, ciano o halometilo.

En otra realización, R³ y R⁴ forman un heterociclo saturado de cinco o seis miembros, que contiene 1 ó 2, preferiblemente 1, heteroátomos seleccionados de N-R°, O y S, en los que S puede estar oxidado, estando el heterociclo no sustituido o sustituido con uno o más grupos Rd.

 $R^c$  indica preferiblemente alquilo  $C_1$ - $C_2$ , particularmente  $CH_3$ , o alquilcarbonilo  $C_1$ - $C_2$ , particularmente acetilo. El heterociclo está preferiblemente no sustituido.

En una realización, el heterociclo que está formado por R3 y R4 representa un grupo H:

$$R^{5}$$
  $G$  H

en el que G representa N-R<sup>c</sup>, O, S, S(=O) o SO<sub>2</sub>, y # el enlace al resto pirazol.

Otra realización se refiere a compuestos de fórmula I excluyendo los compuestos racémicos, en la que T es O, R<sup>1</sup> es H, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> o CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>, R<sup>2</sup> es CH<sub>3</sub>, CHF<sub>2</sub> o CF<sub>3</sub>, R<sup>3</sup> es CF<sub>3</sub> o ciclopropilo, R<sup>4</sup> es CH<sub>3</sub>, y R<sup>5</sup> es H.

En particular, con vista a su uso, se da preferencia a los compuestos de la fórmula I recopilados en las tablas a continuación, compuestos que corresponden a la fórmula 1.1. Cada uno de los grupos mencionados para un sustituyente en las tablas es además *per se*, independientemente de la combinación en la que se mencione, un aspecto particularmente preferido del sustituyente en cuestión.

$$\begin{array}{c|c}
R^5 & N & N & N \\
R^4 & R^3 & R^1 & N & 1.1
\end{array}$$

#### Tabla 1

10

15

20

25

Compuestos de fórmula I.1 en la que U es CH, R¹ es H, R² es CH₃ y la combinación de R³, R⁴ y R⁵ para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

#### Tabla 2

Compuestos de fórmula I.1 en la que U es N, R<sup>1</sup> es H, R<sup>2</sup> es CH<sub>3</sub> y la combinación de R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

#### Tabla 3

Compuestos de fórmula I.1 en la que U es CH, R¹ es H, R² es CHF₂ y la combinación de R³, R⁴ y R⁵ para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

#### Tabla 4

Compuestos de fórmula I.1 en la que U es N, R<sup>1</sup> es H, R<sup>2</sup> es CHF<sub>2</sub> y la combinación de R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 5

5 Compuestos de fórmula I.1 en la que U es CH, R<sup>1</sup> es H, R<sup>2</sup> es CF<sub>3</sub> y la combinación de R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 6

Compuestos de fórmula I.1 en la que U es N, R<sup>1</sup> es H, R<sup>2</sup> es CF<sub>3</sub> y la combinación de R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

10 Tabla 7

Compuestos de fórmula I.1 en la que U es CH, R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> son CH<sub>3</sub> y la combinación de R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 8

Compuestos de fórmula I.1 en la que U es N, R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> son CH<sub>3</sub> y la combinación de R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 9

Compuestos de fórmula I.1 en la que U es CH, R<sup>1</sup> es CH<sub>3</sub>, R<sup>2</sup> es CHF<sub>2</sub> y la combinación de R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 10

Compuestos de fórmula I.1 en la que U es N, R<sup>1</sup> es CH<sub>3</sub>, R<sup>2</sup> es CHF<sub>2</sub> y la combinación de R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 11

Compuestos de fórmula I.1 en la que U es CH,  $R^1$  es  $CH_3$ ,  $R^2$  es  $CF_3$  y la combinación de  $R^3$ ,  $R^4$  y  $R^5$  para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

25 Tabla 12

Compuestos de fórmula I.1 en la que U es N,  $R^1$  es  $CH_3$ ,  $R^2$  es  $CF_3$  y la combinación de  $R^3$ ,  $R^4$  y  $R^5$  para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 13

Compuestos de fórmula I.1 en la que U es CH, R¹ es CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, R² es CH<sub>3</sub> y la combinación de R³, R⁴ y R⁵ para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 14

Compuestos de fórmula I.1 en la que U es N, R<sup>1</sup> es CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, R<sup>2</sup> es CH<sub>3</sub> y la combinación de R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 15

Compuestos de fórmula I.1 en la que U es CH, R<sup>1</sup> es CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, R<sup>2</sup> es CHF<sub>2</sub> y la combinación de R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 16

Compuestos de fórmula I.1 en la que U es N, R<sup>1</sup> es CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, R<sup>2</sup> es CHF<sub>2</sub> y la combinación de R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 17

Compuestos de fórmula I.1 en la que U es CH, R<sup>1</sup> es CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, R<sup>2</sup> es CF<sub>3</sub> y la combinación de R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 18

5

Compuestos de fórmula I.1 en la que U es N, R<sup>1</sup> es CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, R<sup>2</sup> es CF<sub>3</sub> y la combinación de R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 19

10 Compuestos de fórmula I.1 en la que U es CH, R<sup>1</sup> es CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>, R<sup>2</sup> es CH<sub>3</sub> y la combinación de R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 20

Compuestos de fórmula I.1 en la que U es N, R<sup>1</sup> es CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>, R<sup>2</sup> es CH<sub>3</sub> y la combinación de R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

15 Tabla 21

Compuestos de fórmula I.1 en la que U es CH, R<sup>1</sup> es CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>, R<sup>2</sup> es CHF<sub>2</sub> y la combinación de R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 22

Compuestos de fórmula I.1 en la que U es N, R¹ es CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>, R² es CHF<sub>2</sub> y la combinación de R³, R⁴ y R⁵ para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 23

Compuestos de fórmula I.1 en la que U es CH, R¹ es CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>, R² es CF<sub>3</sub> y la combinación de R³, R⁴ y R⁵ para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 24

Compuestos de fórmula I.1 en la que U es N, R¹ es CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>, R² es CF<sub>3</sub> y la combinación de R³, R⁴ y R⁵ para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 25

Compuestos de fórmula I.1 en la que U es CH,  $R^1$  es  $CH_2OCH_2CH_3$ ,  $R^2$  es  $CH_3$  y la combinación de  $R^3$ ,  $R^4$  y  $R^5$  para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

30 Tabla 26

Compuestos de fórmula I.1 en la que U es N, R<sup>1</sup> es CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, R<sup>2</sup> es CH<sub>3</sub> y la combinación de R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 27

Compuestos de fórmula I.1 en la que U es CH, R<sup>1</sup> es CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, R<sup>2</sup> es CHF<sub>2</sub> y la combinación de R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla 28

Compuestos de fórmula I.1 en la que U es N,  $R^1$  es  $CH_2OCH_2CH_3$ ,  $R^2$  es  $CHF_2$  y la combinación de  $R^3$ ,  $R^4$  y  $R^5$  para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

#### Tabla 29

Compuestos de fórmula I.1 en la que U es CH,  $R^1$  es  $CH_2OCH_2CH_3$ ,  $R^2$  es  $CF_3$  y la combinación de  $R^3$ ,  $R^4$  y  $R^5$  para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

#### Tabla 30

Compuestos de fórmula I.1 en la que U es N, R¹ es CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, R² es CF<sub>3</sub> y la combinación de R³, R⁴ y R⁵ para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A.

Tabla A

N.º	R <sup>3</sup>	R⁴	R⁵	N.º	R³	R⁴	R⁵
A-1	CN	CH₃	Н	A-7	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	CH₃	Н
A-2	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	A-8	1-F-c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH₃	Н
A-3	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH₃	Н	A-9	1-CN-c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH₃	Н
A-4	CHF <sub>2</sub>	CH₃	Н	A-10	2,2-F <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>3</sub>	CH₃	Н
A-5	CF <sub>3</sub>	CH₃	Н	A-11	2,2-Cl <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>3</sub>	CH₃	Н
A-6	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	A-12	c-C₄H <sub>7</sub>	CH₃	Н

N.º	R³	R⁴	R <sup>5</sup>	N.º	R <sup>3</sup>	R⁴	R <sup>5</sup>
A-13	c-C₅H <sub>9</sub>	CH₃	Н	A-53	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃	CH₃
A-14	c-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	A-54	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-15	1-CN-c-C <sub>6</sub> H <sub>10</sub>	CH₃	Н	A-55	CHF <sub>2</sub>	CH₃	CH <sub>3</sub>
A-16	1-CH <sub>3</sub> -C-C <sub>6</sub> H <sub>10</sub>	CH₃	Н	A-56	CF <sub>3</sub>	CH₃	CH <sub>3</sub>
A-17	1-CF <sub>3</sub> -c-C <sub>6</sub> H <sub>10</sub>	CH₃	Н	A-57	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH₃	CH <sub>3</sub>
A-18	CN	CH₂CH₃	Н	A-58	c-C₃H₅	CH₃	CH <sub>3</sub>
A-19	CH₂CH₃	CH₂CH₃	Н	A-59	1-F-c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH₃	CH₃
A-20	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH₂CH₃	Н	A-60	1-CN-c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH₃	CH₃
A-21	CHF <sub>2</sub>	CH₂CH₃	Н	A-61	2,2-F <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>3</sub>	CH₃	CH₃
A-22	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Н	A-62	2,2-Cl <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>3</sub>	CH₃	CH₃
A-23	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Н	A-63	c-C <sub>4</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-24	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Н	A-64	c-C₅H <sub>9</sub>	CH₃	CH <sub>3</sub>
A-25	1-F-c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Н	A-65	c-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	CH₃	CH <sub>3</sub>
A-26	1-CN-c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Н	A-66	1-CN-c-C <sub>6</sub> H <sub>10</sub>	CH₃	CH <sub>3</sub>
A-27	2,2-F <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>3</sub>	CH₂CH₃	Н	A-67	1-CH <sub>3</sub> -c-C <sub>6</sub> H <sub>10</sub>	CH₃	CH₃
A-28	2,2-Cl <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Н	A-68	1-CF <sub>3</sub> -c-C <sub>6</sub> H <sub>10</sub>	CH₃	CH₃
A-29	c-C₄H <sub>7</sub>	CH₂CH₃	Н	A-69	CN	CH₂CH₃	CH <sub>3</sub>
A-30	c-C₅H <sub>9</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Н	A-70	CH₂CH₃	CH₂CH₃	CH <sub>3</sub>
A-31	c-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Н	A-71	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-32	1-CN-c-C <sub>6</sub> H <sub>10</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Н	A-72	CHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-33	1-CH <sub>3</sub> -c-C <sub>6</sub> H <sub>10</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Н	A-73	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-34	1-CF <sub>3</sub> -c-C <sub>6</sub> H <sub>10</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Н	A-74	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-35	CN	CF₃	Н	A-75	c-C₃H₅	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-36	CH₂CH₃	CF <sub>3</sub>	Н	A-76	1-F-c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-37	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Н	A-77	1-CN-c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃
A-38	CHF <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Н	A-78	2,2-F <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-39	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Н	A-79	2,2-Cl <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃
A-40	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Н	A-80	c-C <sub>4</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-41	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	Н	A-81	c-C₅H <sub>9</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃
A-42	1-F-c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CF <sub>3</sub>	Н	A-82	c-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-43	1-CN-c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CF <sub>3</sub>	Н	A-83	1-CN-c-C <sub>6</sub> H <sub>10</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃
A-44	2,2-F <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Н	A-84	1-CH <sub>3</sub> -c-C <sub>6</sub> H <sub>10</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃
A-45	2,2-Cl <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Н	A-85	1-CF <sub>3</sub> -c-C <sub>6</sub> H <sub>10</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃
A-46	c-C₄H <sub>7</sub>	CF₃	Н	A-86	CN	CF <sub>3</sub>	CH₃
A-47	c-C₅H <sub>9</sub>	CF₃	Н	A-87	CH₂CH₃	CF <sub>3</sub>	CH₃
A-48	c-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	CF <sub>3</sub>	Н	A-88	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH₃
A-49	1-CN-c-C <sub>6</sub> H <sub>10</sub>	CF₃	Н	A-89	CHF <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CH₃
A-50	1-CH <sub>3</sub> -c-C <sub>6</sub> H <sub>10</sub>	CF <sub>3</sub>	Н	A-90	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-51	1-CF <sub>3</sub> -c-C <sub>6</sub> H <sub>10</sub>	CF <sub>3</sub>	Н	A-91	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-52	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-92	c-C₃H₅	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>

N.º	R <sup>3</sup>	R⁴	R <sup>5</sup>	N.º	R <sup>3</sup>	R⁴	R⁵
A-93	1-F-c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-133	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH₃	CN
A-94	1-CN-c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-134	CHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CN
A-95	2,2-F <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-135	CF <sub>3</sub>	CH₃	CN
A-96	2,2-Cl <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-136	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH₃	CN
A-97	c-C₄H <sub>7</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-137	c-C₃H₅	CH₃	CN
A-98	c-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-138	1-F-c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH₃	CN
A-99	c-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-139	1-CN-c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH₃	CN
A-100	1-CN-c-C <sub>6</sub> H <sub>10</sub>	CF₃	CH <sub>3</sub>	A-140	2,2-F <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>3</sub>	CH₃	CN
A-101	1-CH <sub>3</sub> -C-C <sub>6</sub> H <sub>10</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-141	2,2-Cl <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>3</sub>	CH₃	CN
A-102	1-CF <sub>3</sub> -c-C <sub>6</sub> H <sub>10</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-142	c-C₄H <sub>7</sub>	CH₃	CN
A-103	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	A-143	c-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CN
A-104	1-F-c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	A-144	c-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	CH₃	CN
A-105	1-CN-c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	A-145	1-CN-c-C <sub>6</sub> H <sub>10</sub>	CH₃	CN
A-106	2,2-F <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>3</sub>	CH₂CH₃	CF <sub>3</sub>	A-146	1-CH <sub>3</sub> -C-C <sub>6</sub> H <sub>10</sub>	CH₃	CN
A-107	2,2-Cl <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	A-147	1-CF <sub>3</sub> -c-C <sub>6</sub> H <sub>10</sub>	CH₃	CN
A-108	c-C₄H <sub>7</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	A-148	CN	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CN
A-109	c-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	A-149	CH₂CH₃	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CN
A-110	C-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	A-150	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CN
A-111	1-CN-c-C <sub>6</sub> H <sub>10</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	A-151	CHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CN
A-112	1-CH <sub>3</sub> -c-C <sub>6</sub> H <sub>10</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	A-152	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CN
A-113	1-CF <sub>3</sub> -c-C <sub>6</sub> H <sub>10</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	A-153	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CN
A-114	CN	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	A-154	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CN
A-115	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	A-155	1-F-c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CN
A-116	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	A-156	1-CN-c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CN
A-117	CHF <sub>2</sub>	CF₃	CF <sub>3</sub>	A-157	2,2-F <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CN
A-118	CF <sub>3</sub>	CF₃	CF <sub>3</sub>	A-158	2,2-Cl <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>3</sub>	CH₂CH₃	CN
A-119	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	A-159	c-C₄H <sub>7</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CN
A-120	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	CF₃	CF <sub>3</sub>	A-160	c-C₅H <sub>9</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CN
A-121	1-F-c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	A-161	c-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CN
A-122	1-CN-c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	A-162	1-CN-c-C <sub>6</sub> H <sub>10</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CN
A-123	2,2-F <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	A-163	1-CH <sub>3</sub> -c-C <sub>6</sub> H <sub>10</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CN
A-124	2,2-Cl <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	A-164	1-CF <sub>3</sub> -c-C <sub>6</sub> H <sub>10</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CN
A-125	c-C₄H <sub>7</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	A-165	CN	CF <sub>3</sub>	CN
A-126	c-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	A-166	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CN
A-127	c-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	A-167	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CN
A-128	1-CN-c-C <sub>6</sub> H <sub>10</sub>	CF₃	CF₃	A-168	CHF <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CN
A-129	1-CH <sub>3</sub> -c-C <sub>6</sub> H <sub>10</sub>	CF₃	CF₃	A-169	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CN
A-130	1-CF <sub>3</sub> -c-C <sub>6</sub> H <sub>10</sub>	CF₃	CF <sub>3</sub>	A-170	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CN
A-131	CN	CH₃	CN	A-171	c-C₃H₅	CF <sub>3</sub>	CN
A-132	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CN	A-172	1-F-c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CF <sub>3</sub>	CN

N.º	R <sup>3</sup>	R⁴	R⁵	N.º	R <sup>3</sup>	R⁴	R⁵
A-173	1-CN-c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CF <sub>3</sub>	CN	A-192	-CH₂CF	2-	CF <sub>3</sub>
A-174	2,2-F <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>3</sub> CF <sub>3</sub>		CN	A-193	-CH₂CC	;l <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>
A-175	2,2-Cl <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CN	A-194	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>
A-176	c-C <sub>4</sub> H <sub>7</sub>	CF <sub>3</sub>	CN	A-195	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -CH	I <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>
A-177	c-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	CF <sub>3</sub>	CN	A-196	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>
A-178	c-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	CF <sub>3</sub>	CN	A-197	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -O-C	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>
A-179	1-CN-c-C <sub>6</sub> H <sub>10</sub>	CF <sub>3</sub>	CN	A-198	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub>	)-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>
A-180	1-CH <sub>3</sub> -c-C <sub>6</sub> H <sub>10</sub>	CF <sub>3</sub>	CN	A-199	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(COCI	H <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>
A-181	1-CF <sub>3</sub> -c-C <sub>6</sub> H <sub>10</sub> CF <sub>3</sub>		CN	A-200	-CH₂CH	<b>l</b> <sub>2</sub> -	CN
A-182	-CH₂CH	l <sub>2</sub> -	H	A-201	-CH₂CF	2-	CN
A-183	-CH₂CF	2-	Н	A-202	-CH₂CC	;l <sub>2</sub> -	CN
A-184	-CH₂CC	;l <sub>2</sub> -	Н	A-203	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		CN
A-185	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>2</sub> -	Н	A-204	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -CH	I <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	CN
A-186	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -CH	I <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	Н	A-205	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CN
A-187	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	Н	A-206	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -O-C	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CN	
A-188	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -		Н	A-207	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub>	)-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CN
A-189	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub>	Н	A-208	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(COCI	H <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CN	
A-190	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(COCI	Н					
A-191	-CH₂CH	CF <sub>3</sub>					

Debido a su excelente actividad, los compuestos de la presente invención pueden usarse para controlar plagas de invertebrados.

- Por consiguiente, la presente invención proporciona también un método para controlar plagas de invertebrados método que comprende tratar las plagas, su suministro de alimento, su hábitat o su terreno de reproducción o una planta cultivada, materiales de propagación de plantas (tales como semilla), suelo, zona, material o entorno en el que las plagas están creciendo o pueden crecer, o los materiales, plantas cultivadas, semilla, suelos, superficies o espacios que van a protegerse del ataque o infestación por plagas con una cantidad eficaz como pesticida de un compuesto de la presente invención o una composición tal como se define anteriormente.
- La presente invención también se refiere a un método para proteger plantas en crecimiento del ataque o la infestación por plagas de invertebrados, preferiblemente del grupo de los insectos, método que comprende poner en contacto una planta, o terreno o agua en el que está creciendo la planta o puede crecer, con una cantidad eficaz desde el punto de vista pesticida de al menos un compuesto según la invención incluyendo un estereoisómero, una sal, un tautómero o un N-óxido del mismo o una composición según la invención.
- Preferiblemente, el método de la invención sirve para proteger material de propagación de plantas (tal como semillas) y la planta que crece a partir del mismo, de ataque o infestación de plagas de invertebrados y comprende tratar el material de propagación de plantas (tal como semillas) con una cantidad eficaz como pesticida de un compuesto de la presente invención tal como se definió anteriormente o con una cantidad eficaz como pesticida de una composición agrícola tal como se definió anteriormente y a continuación. El método de la invención no se limita a la protección del "sustrato" (planta, materiales de propagación de plantas, material de suelo, etc.) que se ha tratado según la invención, sino que también tiene un efecto preventivo, por tanto, por ejemplo, según la protección a una planta que crece a partir de materiales de propagación de plantas (tales como semillas) tratados, no habiéndose tratado la propia planta.
- En el sentido de la presente invención, "plagas de invertebrados" se selecciona preferiblemente de artrópodos y nematodos, más preferiblemente de insectos, arácnidos y nematodos perjudiciales, e incluso más preferiblemente de insectos, ácaros y nematodos. En el sentido de la presente invención, "plagas de invertebrados" son lo más preferiblemente insectos

Los compuestos de la presente invención, incluyendo sus sales, estereoisómeros y tautómeros, son en particular adecuados para controlar eficazmente plagas de artrópodos tales como arácnidos, miriápodos e insectos así como nematodos, especialmente insectos. Son especialmente adecuados para combatir o controlar eficazmente las siguientes plagas: Insectos del orden de los lepidópteros (Lepidoptera), por ejemplo Agrotis ypsilon, Agrotis segetum, Alabama argillacea, Anticarsia gemmatalis, Argyrestia conjugella, Autographa gamma, Bupalus piniarius, Cacoecia murinana, Capua reticulana, Cheimatobia brumata, Choristoneura fumiferana, Choristoneura occidentalis, Cirphis unipuncta, Cydia pomonella, Dendrolimus pini, Diaphania nitidalis, Diatraea grandiosella, Earias insulana, Elasmopalpus lignosellus, Eupoecilia ambiguella, Evetria bouliana, Feltia subterranea, Galleria mellonella, Grapholitha funebrana, Grapholitha molesta, Heliothis armigera, Heliothis virescens, Heliothis zea, Hellula undalis, Hibernia defoliaria, Hyphantria cunea, Hyponomeuta malinellus, Keiferia lycopersicella, Lambdina fiscellaria, Laphygma exiqua, Leucoptera coffeella, Leucoptera scitella, Lithocolletis blancardella, Lobesia botrana, Loxostege sticticalis, Lymantria dispar, Lymantria monacha, Lyonetia clerkella, Malacosoma neustria, Mamestra brassicae, Orgyia pseudotsugata, Ostrinia nubilalis, Panolis flammea, Pectinophora gossypiella, Peridroma saucia, Phalera bucephala, Phthorimaea operculella, Phyllocnistis citrella, Pieris brassicae, Plathypena scabra, Plutella xilostella, Pseudoplusia includens, Rhyacionia frustrana, Scrobipalpula absoluta, Sitotroga cerealella, Sparganothis pilleriana, Spodoptera frugiperda, Spodoptera littoralis, Spodoptera litura, Thaumatopoea pityocampa, Tortrix viridana, Trichoplusia ni v Zeiraphera canadensis:

5

10

15

20

25

50

55

escarabajos (Coleoptera), por ejemplo Agrilus sinuatus, Agriotes lineatus, Agriotes obscurus, Amphimallus solstitialis, Anisandrus dispar, Anthonomus grandis, Anthonomus pomorum, Aphthona euphoridae, Athous haemorrhoidalis, Atomaria linearis, Blastophagus piniperda, Blitophaga undata, Bruchus rufimanus, Bruchus pisorum, Bruchus lentis, Byctiscus betulae, Cassida nebulosa, Cerotoma trifurcata, Cetonia aurata, Ceuthorrhynchus assimilis, Ceuthorrhynchus napi, Chaetocnema tibialis, Conoderus vespertinus, Crioceris asparagi, Ctenicera ssp., Diabrotica longicornis, Diabrotica semipunctata, Diabrotica 12-punctata, Diabrotica speciosa, Diabrotica virgifera, Epilachna varivestis, Epitrix hirtipennis, Eutinobothrus brasiliensis, Hylobius abietis, Hypera brunneipennis, Hypera postica, Ips typographus, Lema bilineata, Lema melanopus, Leptinotarsa decemlineata, Limonius californicus, Lissorhoptrus oryzophilus, Melanotus communis, Meligetes aeneus, Melolontha hippocastani, Melolontha melolontha, Oulema oryzae, Otiorrhynchus sulcatus, Otiorrhynchus ovatus, Phaedon cochleariae, Phyllobius pyri, Phyllotreta chrysocephala, Phyllophaga sp., Phyllopertha horticola, Phyllotreta nemorum, Phyllotreta striolata, Popillia japonica, Sitona lineatus y Sitophilus granaria;

30 moscas, mosquitos (Diptera), por ejemplo Aedes aegypti, Aedes albopictus, Aedes vexans, Anastrepha ludens, Anopheles maculipennis, Anopheles crucians, Anopheles albimanus, Anopheles gambiae, Anopheles freeborni, Anopheles leucosphyrus, Anopheles minimus, Anopheles quadrimaculatus, Calliphora vicina, Ceratitis capitata, Chrysomya bezziana, Chrysomya hominivorax, Chrysomya macellaria, Chrysops discalis, Chrysops silacea, Chrysops atlanticus, Cochliomyia hominivorax, Contarinia sorghicola Cordylobia anthropophaga, Culicoides furens, 35 Culex pipiens, Culex nigripalpus, Culex quinquefasciatus, Culex tarsalis, Culiseta inornata, Culiseta melanura, Dacus cucurbitae, Dacus oleae, Dasineura brassicae, Delia antique, Delia coarctata, Delia platura, Delia radicum, Dermatobia hominis, Fannia canicularis, Geomyza Tripunctata, Gasterophilus intestinalis, Glossina morsitans, Glossina palpalis, Glossina fuscipes, Glossina tachinoides, Haematobia irritans, Haplodiplosis equestris, Hippelates spp., Hylemyia platura, Hypoderma lineata, Leptoconops torrens, Liriomyza sativae, Liriomyza trifolii, Lucilia caprina, Lucilia cuprina, Lucilia sericata, Lycoria pectoralis, Mansonia titillanus, Mayetiola destructor, Musca autumnalis, 40 Musca domestica, Muscina stabulans, Oestrus ovis, Opomyza florum, Oscinella frit, Pegomya hysocyami, Phorbia antiqua, Phorbia brassicae, Phorbia coarctata, Phlebotomus argentipes, Psorophora columbiae, Psila rosae, Psorophora discolor, Prosimulium mixtum, Rhagoletis cerasi, Rhagoletis pomonella, Sarcophaga haemorrhoidalis, Sarcophaga spp., Simulium vittatum, Stomoxis calcitrans, Tabanus bovinus, Tabanus atratus, Tabanus lineola, y 45 Tabanus similis, Tipula oleracea y Tipula paludosa;

trips (Thysanoptera), por ejemplo Dichromothrips corbetti, Dichromothrips ssp., Frankliniella fusca, Frankliniella occidentalis, Frankliniella tritici, Scirtothrips citri, Thrips oryzae, Thrips palmi y Thrips tabaci,

termitas (Isoptera), por ejemplo Calotermes flavicollis, Leucotermes flavipes, Heterotermes aureus, Reticulitermes flavipes, Reticulitermes virginicus, Reticulitermes lucifugus, Reticulitermes santonensis, Reticulitermes grassei, Termes natalensis y Coptotermes formosanus;

cucarachas (Blattaria - Blattodea), por ejemplo Blattella germanica, Blattella asahinae, Periplaneta americana, Periplaneta japonica, Periplaneta brunnea, Periplaneta fuligginosa, Periplaneta australasiae y Blatta orientalis;

chinches, áfidos, chicharras, moscas blancas, cochinillas, cigarras (Hemiptera), por ejemplo Acrosternum hilare, Blissus leucopterus, Cyrtopeltis notatus, Dysdercus cingulatus, Dysdercus intermedius, Eurygaster integriceps, Euschistus impictiventris, Leptoglossus phyllopus, Lygus lineolaris, Lygus pratensis, Nezara viridula, Piesma quadrata, Solubea insularis, Thyanta perditor, Acyrthosiphon onobrychis, Adelges laricis, Aphidula nasturtii, Aphis fabae, Aphis forbesi, Aphis pomi, Aphis gossypii, Aphis grossulariae, Aphis schneideri, Aphis spiraecola, Aphis sambuci, Acyrthosiphon pisum, Aulacorthum solani, Bemisia argentifolii, Brachycaudus cardui, Brachycaudus helichrysi, Brachycaudus persicae, Brachycaudus prunicola, Brevicoryne brassicae, Capitophorus horni, Cerosipha

gossypii, Chaetosiphon fragaefolii, Cryptomyzus ribis, Dreyfusia nordmannianae, Dreyfusia piceae, Dysaphis radicola, Dysaulacorthum pseudosolani, Dysaphis plantaginea, Dysaphis pyri, Empoasca fabae, Hyalopterus pruni, Hyperomyzus lactucae, Macrosiphum avenae, Macrosiphum euphorbiae, Macrosiphon rosae, Megoura viciae, Melanaphis pirarius, Metopolophium dirhodum, Myzus persicae, Myzus ascalonicus, Myzus cerasi, Myzus varians, Nasonovia ribis-nigri, Nilapar vata lugens, Pemphigus bursarius, Perkinsiella saccharicida, Phorodon humuli, Psylla mali, Psylla piri, Rhopalomyzus ascalonicus, Rhopalosiphum maidis, Rhopalosiphum padi, Rhopalosiphum insertum, Sappaphis mala, Sappaphis mali, Schizaphis graminum, Schizoneura lanuginosa, Sitobion avenae, Trialeurodes vaporariorum, Toxoptera aurantiiand, Viteus vitifolii, Cimex lectularius, Cimex hemipterus, Reduvius senilis, Triatoma spp. y Arilus critatus; hormigas, abejas, avispas, moscas de sierra (Hymenoptera), por ejemplo Athalia rosae, Atta 10 cephalotes, Atta capiguara, Atta cephalotes, Atta laevigata, Atta robusta, Atta sexdens, Atta texana, Crematogaster spp., Hoplocampa minuta, Hoplocampa testudinea, Lasius niger, Monomorium pharaonis, Solenopsis geminata, Solenopsis invicta, Solenopsis richteri, Solenopsis xyloni, Pogonomyrmex barbatus, Pogonomyrmex californicus, Pheidole megacephala, Dasymutilla occidentalis, Bombus spp., Vespula squamosa, Paravespula vulgaris, Paravespula pennsylvanica, Paravespula germanica, Dolichovespula maculata, Vespa crabro, Polistes rubiginosa, 15 Camponotus floridanus y Linepithema humile;

grillos, saltamontes, langostas (Orthoptera), por ejemplo Acheta domestica, Gryllotalpa gryllotalpa, Locusta migratoria, Melanoplus bivittatus, Melanoplus femurrubrum, Melanoplus mexicanus, Melanoplus sanguinipes, Melanoplus spretus, Nomadacris septemfasciata, Schistocerca americana, Schistocerca gregaria, Dociostaurus maroccanus, Tachycines asynamorus, Oedaleus senegalensis, Zonozerus variegatus, Hieroglyphus daganensis, Kraussaria angulifera, Calliptamus italicus, Chortoicetes terminifera y Locustana pardalina;

pulgas (Siphonaptera), por ejemplo *Ctenocephalides felis*, *Ctenocephalides canis*, *Xenopsilla cheopis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans y Nosopsillus fasciatus*, lepisma, insecto del fuego (Thysanura), por ejemplo *Lepisma saccharina* y *Thermobia domestica*, centípedos (Chilopoda), por ejemplo *Scutigera coleoptrata*,

milípedos (Diplopoda), por ejemplo Narceus spp.,

20

25 tijeretas (Dermaptera), por ejemplo forficula auricularia,

piojos (Phthiraptera), por ejemplo *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pthirus pubis*, *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus suis*, *Linognathus vituli*, *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*, *Menacanthus stramineus* y *Solenopotes capillatus*.

Collembola (colémbolos), por ejemplo Onychiurus ssp.

- 30 Los compuestos de la presente invención, incluyendo sus sales, estereoisómeros y tautómeros, son particularmente útiles para controlar insectos, preferiblemente insectos chupadores o perforadores tales como insectos de los géneros *Thysanoptera*, *Diptera* y *Hemiptera*, en particular las siguientes especies: *Thysanoptera*: *Frankliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella tritici*, *Scirtothrips citri*, *Thrips oryzae*, *Thrips palmi* y *Thrips tabaci*.
- Diptera, por ejemplo Aedes aegypti, Aedes albopictus, Aedes vexans, Anastrepha ludens, Anopheles maculipennis, 35 Anopheles crucians, Anopheles albimanus, Anopheles gambiae, Anopheles freeborni, Anopheles leucosphyrus, Anopheles minimus, Anopheles quadrimaculatus, Calliphora vicina, Ceratitis capitata, Chrysomya bezziana, Chrysomya hominivorax, Chrysomya macellaria, Chrysops discalis, Chrysops silacea, Chrysops atlanticus, Cochliomyia hominivorax, Contarinia sorghicola Cordylobia anthropophaga, Culicoides furens, Culex pipiens, Culex nigripalpus, Culex quinquefasciatus, Culex tarsalis, Culiseta inornata, Culiseta melanura, Dacus cucurbitae, Dacus oleae, Dasineura brassicae, Delia antique, Delia coarctata, Delia platura, Delia radicum, Dermatobia hominis, Fannia 40 canicularis, Geomyza Tripunctata, Gasterophilus intestinalis, Glossina morsitans, Glossina palpalis, Glossina fuscipes, Glossina tachinoides, Haematobia irritans, Haplodiplosis equestris, Hippelates spp., Hylemyia platura, Hypoderma lineata, Leptoconops torrens, Liriomyza sativae, Liriomyza trifolii, Lucilia caprina, Lucilia cuprina, Lucilia sericata, Lycoria pectoralis, Mansonia titillanus, Mayetiola destructor, Musca autumnalis, Musca domestica, Muscina 45 stabulans, Oestrus ovis, Opomyza florum, Oscinella frit, Pegomya hysocyami, Phorbia antiqua, Phorbia brassicae, Phorbia coarctata, Phlebotomus argentipes, Psorophora columbiae, Psila rosae, Psorophora discolor, Prosimulium mixtum, Rhagoletis cerasi, Rhagoletis pomonella, Sarcophaga haemorrhoidalis, Sarcophaga spp., Simulium vittatum, Stomoxis calcitrans, Tabanus bovinus, Tabanus atratus, Tabanus lineola, y Tabanus similis, Tipula oleracea y Tipula paludosa:
- Hemiptera, en particular áfidos: Acyrthosiphon onobrychis, Adelges laricis, Aphidula nasturtii, Aphis fabae, Aphis forbesi, Aphis pomi, Aphis gossypii, Aphis grossulariae, Aphis schneideri, Aphis spiraecola, Aphis sambuci, Acyrthosiphon pisum, Aulacorthum solani, Brachycaudus cardui, Brachycaudus helichrysi, Brachycaudus persicae, Brachycaudus prunicola, Brevicoryne brassicae, Capitophorus horni, Cerosipha gossypii, Chaetosiphon fragaefolii, Cryptomyzus ribis, Dreyfusia nordmannianae, Dreyfusia piceae, Dysaphis radicola, Dysaulacorthum pseudosolani, Dysaphis plantaginea, Dysaphis pyri, Empoasca fabae, Hyalopterus pruni, Hiperomyzus lactucae, Macrosiphum

avenae, Macrosiphum euphorbiae, Macrosiphon rosae, Megoura viciae, Melanaphis pyrarius, Metopolophium dirhodum, Myzodes persicae, Myzus ascalonicus, Myzus cerasi, Myzus varians, Nasonovia ribis-nigri, Nilaparvata lugens, Pemphigus bursarius, Perkinsiella saccharicida, Phorodon humuli, Psylla mali, Psylla piri, Rhopalomyzus ascalonicus, Rhopalosiphum maidis, Rhopalosiphum padi, Rhopalosiphum insertum, Sappaphis mala, Sappaphis mali, Schizaphis graminum, Schizoneura lanuginosa, Sitobion avenae, Trialeurodes vaporariorum, Toxoptera aurantii y Viteus vitifolii.

Los compuestos de la presente invención, incluyendo sus sales, estereoisómeros y tautómeros, son particularmente útiles para controlar insectos de los órdenes Hemiptera y Thysanoptera.

La invención proporciona además una composición agrícola para combatir plagas de invertebrados, que comprende una cantidad de este tipo de al menos un compuesto según la invención y al menos un líquido inerte y/o portador sólido agronómicamente aceptable que tiene una acción pesticida y, si se desea, al menos un tensioactivo.

Una composición de este tipo puede comprender un único compuesto activo de la presente invención o una mezcla de varios compuestos activos de la presente invención. La composición según la presente invención puede comprender un isómero individual o mezclas de isómeros o sal así como tautómeros individuales o mezclas de tautómeros.

Los compuestos de la presente invención pueden ser útiles como tales, en forma de sus formulaciones o las formas de uso preparadas a partir de los mismos, por ejemplo en forma de disoluciones directamente pulverizables, polvos, suspensiones o dispersiones, emulsiones, dispersiones de aceite, pastas, productos espolvoreables, materiales para extensión, o gránulos, por medio de pulverización, atomización, espolvoreo, extensión o vertido. Las formas de uso dependen totalmente de los fines previstos; pretenden garantizar en cada caso la distribución más fina posible de los compuestos activos según la invención.

Las formulaciones se preparan de manera conocida (véanse, por ejemplo, para revisión los documentos US 3.060.084, EP-A 707.445 (para concentrados líquidos), Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, 4 de diciembre de 1967, 147-48, "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 4ª Ed., McGraw-Hill, Nueva York, 1963, páginas 8-57 y siguientes, los documentos WO 91/13546, US 4.172.714, US 4.144.050, US 3.920.442, US 5.180.587, US 5.232.701, US 5.208.030, GB 2.095.558, US 3.299.566, Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., Nueva York, 1961, Hance *et al.*, Weed Control Handbook, 8ª Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989 y Mollet, H., Grubemann, A., Formulation Technology, Wiley VCH Verlag GmbH, Weinheim (Alemania), 2001, 2. D. A. Knowles, Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations, Kluwer Academic Publishers, Dordrecht, 1998, por ejemplo extendiendo el compuesto activo con agentes auxiliares adecuados para la formulación de productos agroquímicos, tales como disolventes y/o portadores, si se desea emulsionantes, tensioactivos y dispersantes, conservantes, agentes antiespumantes, agentes anticongelantes, para formulación de tratamiento de semillas, también opcionalmente colorantes y/o aglutinantes y/o agentes gelificantes.

Disolventes/portadores, que son adecuados, son por ejemplo:

5

15

20

25

30

45

- disolventes tales como agua, disolventes aromáticos (por ejemplo productos Solvesso, xileno y similares), parafinas (por ejemplo fracciones minerales), alcoholes (por ejemplo metanol, butanol, pentanol, alcohol bencílico), cetonas (por ejemplo ciclohexanona, gamma-butirolactona), pirrolidonas (N-metil-pirrolidona (NMP), N-octilpirrolidona NOP), acetatos (diacetato de glicol), lactados de alquilo, lactonas tales como g-butirolactona, glicoles, dimetilamidas de ácidos grasos, ácidos grasos y ésteres de ácidos grasos, triglicéridos, aceites de origen vegetal o animal y aceites modificados tales como aceites vegetales alquilados. En principio, también pueden usarse mezclas de disolventes.
  - Portadores tales como minerales naturales triturados y minerales sintéticos triturados, tales como geles de sílice, ácido silícico finamente dividido, silicatos, talco, caolín, Attaclay, caliza, cal, creta, bolo, loes, arcilla, dolomía, tierra de diatomeas, sulfato de calcio y sulfato de magnesio, óxido de magnesio, materiales sintéticos triturados, fertilizantes, tales como, por ejemplo, sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, ureas y productos de origen vegetal, tales como harina de cereales, harina de corteza de árbol, harina de madera y harina de cáscara de nuez, polvos de celulosa y otros portadores sólidos.

Emulsionantes adecuados son emulsionantes no iónicos y aniónicos (por ejemplo éteres de alcoholes grasos de polioxietileno, alquilsulfonatos y arilsulfonatos).

50 Ejemplos de dispersantes son aguas residuales de lignina-sulfito y metilcelulosa.

Tensioactivos adecuados usados son sales de metales alcalinos, metales alcalinotérreos y amonio de ácido lignosulfónico, ácido naftalenosulfónico, ácido fenolsulfónico, ácido dibutilnaftalenosulfónico, alquilarilsulfonatos, alquilsulfonatos, sulfatos de alcoholes grasos, ácidos grasos y glicol éteres de alcoholes grasos

sulfatados, además condensados de naftaleno sulfonado y derivados de naftaleno con formaldehído, condensados de naftaleno o de ácido naftalenosulfónico con fenol y formaldehído, octilfenil éter de polioxietileno, isooctilfenol etoxilado, octilfenol, nonilfenol, alquilfenilpoliglicol éteres, tributilfenilpoliglicol éter, triestearilfenilpoliglicol éter, alquilaril poliéter alcoholes, condensados de alcoholes y alcoholes grasos con óxido de etileno, aceite de ricino etoxilado, polioxietilén alquil éteres, polioxipropileno etoxilado, poliglicol éter acetal de alcohol láurico, ésteres de sorbitol.

También pueden añadirse a la formulación agentes anticongelantes tales como glicerina, etilenglicol, propilenglicol y bactericidas tales como.

Agentes antiespumantes adecuados son por ejemplo agentes antiespumantes basados en estearato de silicio o magnesio.

Conservantes adecuados son por ejemplo diclorofeno y hemiformal de alcohol bencílico.

5

15

20

25

40

Espesantes adecuados son compuestos que confieren un comportamiento de flujo pseudoplástico a la formulación, es decir alta viscosidad en reposo y baja viscosidad en fase agitada. Puede hacerse mención, en este contexto, por ejemplo, de espesantes comerciales basados en polisacáridos, tales como Xanthan Gum® (Kelzan® de Kelco), Rhodopol®23 (Rhone Poulenc) o Veegum® (de R.T. Vanderbilt), o filosilicatos orgánicos, tales como Attaclay® (de Engelhardt). Agentes antiespuma adecuados para las dispersiones según la invención son, por ejemplo, emulsiones de silicona (tales como, por ejemplo, Silikon® SRE, Wacker o Rhodorsil® de Rhodia), alcoholes de cadena larga, ácidos grasos, compuestos de organoflúor y mezclas de los mismos. Pueden añadirse biocidas para estabilizar las composiciones según la invención frente al ataque por microorganismos. Biocidas adecuados, por ejemplo, se basan en isotiazolonas tales como los compuestos comercializados con los nombres comerciales Proxel® de Avecia (o Arch) o Acticide® RS de Thor Chemie y Kathon® MK de Rohm & Haas. Agentes anticongelantes adecuados son polioles orgánicos, por ejemplo etilenglicol, propilenglicol o glicerol. Estos se emplean habitualmente en cantidades de no más del 10% en peso, basándose en el peso total de la composición de compuesto activo. Si es apropiado, las composiciones de compuesto activo según la invención pueden comprender del 1 al 5% en peso de tampón. basándose en la cantidad total de la formulación preparada, para regular el pH, la cantidad y el tipo del tapón usado dependiendo de las propiedades químicas del compuesto activo o los compuestos activos. Los ejemplos de tampones son sales de metales alcalinos de ácidos orgánicos e inorgánicos débiles, tales como, por ejemplo, ácido fosfórico, ácido borónico, ácido acético, ácido propiónico, ácido cítrico, ácido fumárico, ácido tartárico, ácido oxálico y ácido succínico.

30 Sustancias que son adecuadas para la preparación de disoluciones, emulsiones, pastas o dispersiones oleosas directamente pulverizables son fracciones de aceite mineral de punto de ebullición de medio a alto, tales como queroseno o gasóleo, además aceites de alquitrán de hulla y aceites de origen vegetal o animal, hidrocarburos alifáticos, cíclicos y aromáticos, por ejemplo tolueno, xileno, parafina, tetrahidronaftaleno, naftalenos alquilados o sus derivados, metanol, etanol, propanol, butanol, ciclohexanol, ciclohexanona, isoforona, disolventes fuertemente polares, por ejemplo, dimetilsulfóxido, N-metil-pirrolidona y aqua.

Pueden prepararse polvos, materiales para dispersión y productos espolvoreables mezclando o moliendo de manera concomitante los principios activos con un portador sólido.

Pueden prepararse gránulos, por ejemplo gránulos recubiertos, gránulos impregnados y gránulos homogéneos, uniendo los principios activos a portadores sólidos. Ejemplos de portadores sólidos son tierras minerales tales como geles de sílice, silicatos, talco, caolín, atapulgita activada, caliza, cal, creta, arcilla calcareoferruginisa, loess, arcilla, dolomita, tierra de diatomeas, sulfato de calcio, sulfato de magnesio, óxido de magnesio, materiales sintéticos molidos, fertilizantes tales como, por ejemplo, sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, ureas y productos de origen vegetal tales como harina de cereal, harina de corteza de árbol, harina de madera y harina de cáscara de nuez, polvos de celulosa y otros portadores sólidos.

45 En general, las formulaciones, es decir las composiciones según la invención, comprenden desde el 0,01 hasta el 95% en peso, preferiblemente desde el 0,1 hasta el 90% en peso, del principio activo. Los principios activos se emplean con una pureza de desde el 90 hasta el 100% en peso, preferiblemente del 95 al 100% en peso (según el espectro de RMN).

Con fines de tratamiento de semillas, las formulaciones respectivas pueden diluirse 2-10 veces, conduciendo a concentraciones en las preparaciones listas para usar del 0,01 al 60% en peso de compuesto activo en peso, preferiblemente del 0,1 al 40% en peso.

Los siguientes son ejemplos de formulaciones:

1. Productos para dilución con aqua. Para fines de tratamiento de semillas, tales productos pueden aplicarse a las

semillas diluidos o no diluidos.

5

A) Concentrados solubles en agua (SL, LS)

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

B) Concentrados dispersables (CD)

Se disuelven 20 partes en peso del compuesto activo en 70 partes en peso de ciclohexanona con adición de 10 partes en peso de un dispersante, por ejemplo polivinilpirrolidona. La dilución con agua da una dispersión, con lo que se obtiene una formulación con el 20% (p/p) de compuestos activos.

10 C) Concentrados emulsionables (CE)

Se disuelven 15 partes en peso de los compuestos activos en 7 partes en peso de xileno con adición de dodecilbencenosulfonato cálcico y etoxilato de aceite de ricino (en cada caso, 5 partes en peso). La dilución con agua da una emulsión, con lo que se obtiene una formulación con el 15% (p/p) de compuestos activos.

- D) Emulsiones (EW, EO, ES)
- 15 Se disuelven 25 partes en peso del compuesto activo en 35 partes en peso de xileno con adición de dodecilbencenosulfonato cálcico y etoxilato de aceite de ricino (en cada caso, 5 partes en peso). Se introduce esta mezcla en 30 partes en peso de agua por medio de una máquina emulsionante (por ejemplo, Ultraturrax) y se forma una emulsión homogénea. La dilución con agua da una emulsión, con lo que se obtiene una formulación con el 25% (p/p) de compuesto activo.
- 20 E) Suspensiones (SC, OD, FS)

En un molino de bolas con agitación, se trituran 20 partes en peso del compuesto activo con adición de 10 partes en peso de dispersantes, humectantes y 70 partes en peso de agua o de un disolvente orgánico, para dar una suspensión fina de compuesto activo. La dilución con agua da una suspensión estable del compuesto activo, con lo que se obtiene una formulación con el 20% (p/p) de compuesto activo.

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

Se muelen finamente 50 partes en peso del compuesto activo con adición de 50 partes en peso de dispersantes y humectantes y se forman gránulos dispersables en agua o solubles en agua por medio de aparatos técnicos (por ejemplo, extrusión, torre de pulverización, lecho fluidizado). La dilución con agua da una dispersión o disolución estable del compuesto activo, con lo que se obtiene una formulación con el 50% (p/p) de compuesto activo.

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

Se muelen 75 partes en peso del compuesto activo en un molino de rotor-estator con adición de 25 partes en peso de dispersantes, humectantes y gel de sílice. La dilución con agua da una dispersión o disolución estable del compuesto activo, con lo que se obtiene una formulación con el 75% (p/p) de compuesto activo.

- H) Formulaciones en gel (GF)
- 35 Se trituran en un molino de bolas con agitación 20 partes en peso del compuesto activo con adición de 10 partes en peso de dispersantes, 1 parte en peso de humectantes de agente gelificante y 70 partes en peso de agua o de un disolvente orgánico, para dar una suspensión fina de compuesto activo. La dilución con agua da una suspensión estable del compuesto activo, con lo que se obtiene una formulación con el 20% (p/p) de compuesto activo.
- 2. Productos que van a aplicarse sin dilución para aplicaciones foliares. Para fines de tratamiento de semillas, tales productos pueden aplicarse a las semillas diluidos o no diluidos.
  - I) Polvos espolvoreables (DP, DS)

Se muelen finamente 5 partes en peso del compuesto activo y se mezclan de manera íntima con 95 partes en peso de caolín finamente dividido. Esto da un producto espolvoreable que tiene el 5% (p/p) de compuesto activo.

J) Gránulos (GR, FG, GG, MG)

Se muelen finamente 0,5 partes en peso del compuesto activo y se asocian con 95,5 partes en peso de portadores, con lo que se obtiene una formulación con el 0,5% (p/p) de compuesto activo. Los métodos actuales son extrusión, secado por pulverización o el lecho fluidizado. Esto da gránulos que van a aplicarse sin dilución para uso foliar.

5 K) Disoluciones ULV (UL)

10

15

Se disuelven 10 partes en peso del compuesto activo en 90 partes en peso de un disolvente orgánico, por ejemplo xileno. Esto da un producto que tiene el 10% (p/p) de compuesto activo, que se aplica sin dilución para uso foliar.

Pueden prepararse formas de uso acuosas a partir de concentrados de emulsión, pastas o polvos humectables (polvos pulverizables, dispersiones de aceite) añadiendo agua. Para preparar emulsiones, pastas o dispersiones de aceite, las sustancias, como tales o disueltas en un aceite o disolvente, pueden homogeneizarse en agua por medio de un humectante, agente de pegajosidad, dispersante o emulsionante. Alternativamente, es posible preparar concentrados compuestos por sustancia activa, humectante, agente de pegajosidad, dispersante o emulsionante y, si es apropiado, disolvente o aceite, y tales concentrados son adecuados para su dilución con agua.

Las concentraciones del principio activo en los productos listos para usar pueden variar dentro de intervalos relativamente amplios. En general, son de desde el 0,0001 hasta el 10%, preferiblemente desde el 0,01 hasta el 1%.

Los principios activos pueden usarse también satisfactoriamente en el procedimiento de volumen ultra bajo (ULV), siendo posible aplicar formulaciones que comprenden más del 95% en peso de principio activo, o incluso aplicar el principio activo sin aditivos.

En los métodos y usos de esta invención, los compuestos según la invención pueden aplicarse con otros principios activos, por ejemplo con otros pesticidas, insecticidas, herbicidas, fertilizantes tales como nitrato de amonio, urea, potasa, y superfosfato, productos fitotóxicos y reguladores del crecimiento de plantas, protectores y nematicidas. Estos componentes adicionales pueden usarse secuencialmente o en combinación con las composiciones descritas anteriormente, si es apropiado también añadirse sólo inmediatamente antes del uso (mezcla en tanque). Por ejemplo, la(s) planta(s) puede(n) pulverizarse con una composición de esta invención o bien antes o bien después de tratarse con otros principios activos.

La siguiente lista M de pesticidas junto con los que pueden usarse los compuestos según la invención y con los que podrían producirse posibles efectos sinérgicos, pretende ilustrar las posibles combinaciones, pero no imponer ninguna limitación:

- M.1. Compuestos de organo (tio) fosfato: acefato, azametifos, azinfos-etilo, azinfos-metilo, cloretoxifos, clorfenvinfos, clormefos, clorpirifos, clorpirifos-metilo, cumafos, cianofos, demetón-S-metilo, diazinón, diclorvos/ DDVP, dicrotofos, dimetoato, dimetilvinfos, disulfoton, EPN, etión, etoprofos, famfur, fenamifos, fenitrotión, fentión, flupirazofos, fostiazato, heptenofos, isoxatión, malatión, mecarbam, metamidofos, metidatión, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemetón-metilo, paratión, paratión-metilo, fentoato, forato, fosalona, fosmet, fosfamidona, foxim, pirimifos-metilo, profenofos, propetafos, protiofos, piraclofos, piridafentión, quinalfos, sulfotep, tebupirimfos, temefos, terbufos, tetraclorvinfos, tiometón, triazofos, triclorfon, vamidotión;
  - M.2. compuestos de carbamato: aldicarb, alanicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbarilo, carbofurano, carbosulfano, etiofencarb, fenobucarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, trimethacarb, triazamato, XMC, xililcarb, triazamato;
- 40 M.3. compuestos piretroides: acrinatrina, aletrina, d-cis-trans aletrina, d-trans aletrina, bioaletrina, bioaletrina, bioaletrina Sciclopentenilo, biorresmetrina, cicloprotrina, ciflutrina, betaciflutrina, cihalotrina, λ-cihalotrina, γ-cihalotrina, cipermetrina, α-cipermetrina, β-cipermetrina, β-cipermetrina, ζ-cipermetrina, cifenotrina, deltametrina, empentrina, esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flumetrina, τ-fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, metoflutrina, permetrina, fenotrina, praletrina, proflutrina, piretrina (piretro), resmetrina, silafluofeno, teflutrina, tetrametrina, tralometrina, transflutrina;
  - M.4. miméticos de hormona juvenil: hidropreno, cinopreno, metopreno, fenoxicarb, piriproxifeno;
  - M.5. compuestos agonistas/antagonistas de receptor nicotínico: acetamiprid, bensultap, clorhidrato de cartap, clotianidina, dinotefurán, imidacloprid, tiametoxam, nitenpiram, nicotina, espinosad (agonista alostérico), espinetoram (agonista alostérico), tiacloprid, tiociclam, tiosultap-sodio y AKD1022.
- 50 M.6. Compuestos antagonistas de los canales de cloro dependientes de GABA: clordano, endosulfán, γ-HCH

- (lindano), etiprol, fipronil, pirafluprol, piriprol
- M.7. activadores de canal de cloruro: abamectina, benzoato de emamectina, milbemectina, lepimectina;
- M.8. compuestos METI: fenazaquina, fenpiroximato, pirimidifeno, piridabeno, tebufenpirad, tolfenpirad, flufenerim, rotenona;
- 5 M.9. compuestos METI II y III: acequinocilo, fluaciprim, hidrametilnona;
  - M.10. desacopladores de la fosforilación oxidativa: clorfenapir, DNOC;
  - M.11. inhibidores de la fosforilación oxidativa: azociclotina, cihexatina, diafentiurón, óxido de fenbutatina, propargita, tetradifón:
  - M.12. alteradores de la muda: ciromazina, cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida, tebufenozida:
- 10 M.13. sinergistas: butóxido de piperonilo, tribufos;
  - M.14. compuestos bloqueantes de los canales de sodio: indoxacarb, metaflumizona;
  - M.15. fumigadores: bromuro de metilo, fluoruro de cloropicrinsulfurilo;
  - M.16. bloqueantes selectivos de alimentación: criolita, pimetrozina, flonicamid;
  - M.17. inhibidores del crecimiento de ácaros: clofentezina, hexitiazox, etoxazol:
- M.18. inhibidores de la síntesis de quitina: buprofezina, bistriflurón, clorfluazurón, diflubenzurón, flucicloxurón, flufenoxurón, hexaflumurón, lufenurón, novalurón, noviflumurón, teflubenzurón, triflumurón;
  - M.19. inhibidores de la biosíntesis de lípidos: espirodiclofeno, espiromesifeno, espirotetramato;
  - M.20. agonistas octopaminérgicos: amitraz;
- M.21. moduladores de receptor de rianodina: flubendiamida; (R) -, (S) -3-cloro-N1-{2-metil-4-[1, 2, 2, 2-tetrafluoro-1 (trifluorometil) etil]fenil}-N2-(1-metil-2-metilsulfoniletil) ftalamida (M21.1);
- M.22. Compuestos de isoxazolina: 4-[5-(3,5-dicloro-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-isoxazol-3-il]-2-metil-N-piridin-2ilmetil-benzamida (M22.1), 4-[5-(3,5-dicloro-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-isoxazol-3-il]-2-metil-N-(2,2,2-trifluoroetil)-benzamida (M22.2), 4-[5-(3,5-dicloro-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-isoxazol-3-il]-2-metil-N-[(2,2,2-trifluoroetilcarbamoil)-metil]-benzamida (M22.3), [(2,2,2-trifluoro-etilcarbamoil)-metil]-amida del ácido 4-[5-(3,5-dicloro-fenil)-4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-trifluorometil-4,5-5-trifluorometil-4.5-dihidro-isoxazol-3-ill-naftaleno-1-carboxílico (M22.4). 25 dihidro-isoxazol-3-il]-N-[(metoxiimino)metil]-2-metilbenzamida (M22.5)4-[5-(3-cloro-5-trifluorometil-fenil)-5trifluorometil-4,5-dihidroisoxazol-3-il]-2-metil-N-[(2,2,2-trifluoro-etilcarbamoil)-metil]-benzamida (M22.6), [(2,2,2trifluoro-etilcarbamoil)-metill-amida del ácido 4-[5-(3-cloro-5-trifluorometil-fenil)-5-trifluorometil-4.5-dihidro-isoxazol-3-5-[5-(3,5-dicloro-4-fluoro-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-isoxazol-3-il]-2il]-naftaleno-1-carboxílico (M22.7)У 30 [1,2,4]triazol-1-il-benzonitrilo (M22.8);
- M.23. Compuestos de antranilamida: clorantraniliprol, ciantraniliprol, [4-ciano-2-(1-ciclopropil-etilcarbamoil)-6-metilfenil]-amida del ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (M23.1), [2-cloro-4-ciano-6-(1ciclopropil-etilcarbamoil)-fenil]-amida del ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (M23.2), [2bromo-4-ciano-6-(1-ciclopropil-etilcarbamoil)-fenil]-amida del ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3carboxílico (M23.3), [2-bromo-4-cloro-6-(1-ciclopropil-etilcarbamoil)-fenil]-amida del ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-35 2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (M23.4), [2,4-dicloro-6-(1-ciclopropil-etilcarbamoil)-fenil]-amida del ácido 5-bromo-2-(3cloropiridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (M23.5), [4-cloro-2-(1-ciclopropil-etilcarbamoil)-6-metil-fenil]-amida del ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (M23.6), éster metílico del ácido N'-(2-{[5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (M23.6), éster metílico (M23 piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carbonil]-amino}-5-cloro-3-metil-benzoil)-hidrazinacarboxílico (M23.7), éster metílico del N'-(2-{[5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carbonil]-amino}-5-cloro-3-metil-benzoil)-N'-metil-40 hidrazinacarboxílico (M23.8), éster metílico del ácido N'-(2-{[5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carbonil]amino}-5-cloro-3-metil-benzoil)-N,N'-dimetil-hidrazinacarboxílico (M23.9), éster metílico del ácido N'-(3,5-dibromo-2-{[5-bromo2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carbonil]-amino}-benzoil)-hidrazinacarboxílico (M23.10), éster metílico N'-(3,5-dibromo-2-{[5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carbonil]-amino}-benzoil)-N'-metilhidrazinacarboxílico (M23.11) y éster metílico del ácido N'-(3,5-dibromo-2-{[5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-45
  - pirazol-3-carbonil]-amino}-benzoil)-N,N'-dimetil-hidrazinacarboxílico (M23.12);

- $\label{eq:malononitrilo} M.24. \quad compuestos \quad de \quad malononitrilo: \quad 2-(2,2,3,3,4,4,5,5-octafluoropentil)-2-(3,3,3-trifluoropropil)\\ malonodinitrilo (CF_2HCF_2CF_2CH_2C(CN)_2CH_2CF_3) \quad (M24.1) \quad y \quad 2-(2,2,3,3,4,4,5,5-octafluoropentil)-2-(3,3,4,4,4-pentafluorobutil)-\\ malonodinitrilo (CF_2HCF_2CF_2CH_2C(CN)_2CH_2CF_2CF_3) \quad (M24.2);$
- M.25. Disruptores microbianos: Bacillus thuringiensis subsp. Israelensi, Bacillus sphaericus, Bacillus thuringiensis subsp. Aizawai, Bacillus thuringiensis subsp. Kurstaki, Bacillus thuringiensis subsp. Tenebrionis;
  - M.26. Compuestos de aminofuranona: 4-{[(6-bromopirid-3-il)metil](2-fluoroetil)amino}furan-2(5H)-ona (M26.1), 4-{[(6-bromop fluoropirid-3-il)metil](2,2-difluoroetil)amino}furan-2(5H)-ona (M26.2), 4-{[(2-cloro-1,3-tiazolo-5-il)metil](2fluoroetil)amino}furan-2(5H)-ona (M26.3), 4-{[(6-cloropirid-3-il)metil](2-fluoroetil)amino}furan-2(5H)-ona (M26.4), 4-{[(6-cloropirid-3-il)metil](2,2-difluoroetil)amino}furan-2(5H)-ona (M26.5),4-{[(6-cloro-5-fluoropirid-3il)metil](metil)amino}furan-2(5H)-ona (M26.6), 4-{[(5,6-cicloropirid-3-il)metil](2-fluoroetil)amino}furan-2(5H)-ona 4-{[(6-cloro-5-fluoropirid-3-il)metil](ciclopropil)amino}furan-2(5H)-ona (M26.8), 4-{[(6-cloropirid-3-(M26.7),il)metil](ciclopropil)amino}furan-2(5H)-ona (M26.9) y 4-{[(6-cloropirid-3-il)metil](metil)amino}furan-2(5H)-ona (M26.10);
- M.27. Compuestos diversos: fosfuro de aluminio, amidoflumet, benclotiaz, benzoximato, bifenazato, bórax, bromopropilato, cianuro, cienopirafeno, ciflumetofeno, quinometionato, dicofol, fluoroacetato, fosfina, piridalilo, pirifluquinazona, azufre, compuestos orgánicos de azufre, tártaro emético, sulfoxaflor, N-R'-2,2-dihalo-1-R"ciclo-propanocarboxamida-2-(2,6-dicloro-a,a,a-trifluoro-p-tolil)hidrazona o N-R'-2,2-di(R"')propionamida-2-(2,6-dicloro-a,a,a-trifluoro-p-tolil)-hidrazona, en las que R' es metilo o etilo, halo es cloro o bromo, R" es hidrógeno o metilo y R'' es metilo o etilo, 4-but-2-iniloxi-6-(3,5-dimetil-piperidin-1-il)-2-fluoro-pirimidina (M27.1), ácido ciclopropanoacético, éster de 1,1'-[(3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bS)-4-[[(2-ciclopropilacetil)oxi]metil]-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-decahidro-12-hidroxi-4,6a,12b-trimetil-11-oxo-9-(3-piridinil)-2H,1H-naphtho[2,1-b]pirano[3,4-e]piran-3,6-diílo] (M27.2) y 8-(2-ciclopropilmetoxi-4-trifluorometil-fenoxi)-3-(6-trifluorometil-piridazin-3-il)-3-aza-biciclo[3,2.1]octano (M27.3).

Los compuestos comercialmente disponibles del grupo M pueden encontrarse en "The Pesticide Manual", 13ª edición, British Crop Protection Council (2003), entre otras publicaciones.

El paraoxón y su preparación se han descrito en Farm Chemicals Handbook, volumen 88, Meister Publishing Company, 2001. El flupirazofos se ha descrito en Pesticide Science 54, 1988, págs. 237-243 y en el documento US 4822779. AKD 1022 y su preparación se han descrito en el documento US 6300348. M21.1 se conoce del documento WO 2007/101540. Las isoxazolinas de M22.1 a M22.8 se han descrito por ejemplo en los documentos WO2005/085216, WO 2007/079162, WO 2007/026965, WO 2009/126668 y WO2009/051956. Las antranilamidas de M23.1 a M23.6 se han descrito en los documentos WO 2008/72743 y WO 200872783, las de M23.7 a M23.12 en el documento WO 2007/043677. Los malononitrilos M24.1 y M24.2 se han descrito en los documentos WO 02/089579, WO 02/090320, WO 02/090321, WO 04/006677, WO 05/068423, WO 05/068432 y WO 05/063694. M26.1 a M6.10 se han descrito por ejemplo en el documento WO 2007/115644. M27.1 se describe por ejemplo en el documento JP 2006131529. Los compuestos orgánicos de azufre se han descrito en el documento WO 2007060839. M27.2 se ha descrito en los documentos WO 2008/66153 y WO 2008/108491. M27.3 se ha descrito en el documento JP 2008/115155.

Se pretende que la siguiente lista F de principios activos, conjuntamente con los compuestos según la invención que pueden usarse, ilustre las posibles combinaciones pero sin limitarse a ellas:

F.I) Inhibidores de la respiración

5

10

50

- F.I-1) Inhibidores del complejo III en el sitio Qo (por ejemplo estrobilurinas) estrobilurinas: azoxistrobina, dimoxistrobina, enestroburina, fluoxastrobina, kresoxim-metilo, metominostrobina, orisastrobina, picoxistrobina, piraclostrobina, pirametostrobina, piraoxistrobina, piribencarb, triclopiricarb/clorodincarb, trifloxistrobina, éster metílico del ácido 2-[2-(2,5-dimetil-fenoximetil)-fenil]-3-metoxi-acrílico y 2(2-(3-(2,6-diclorofenil)-1-metil-alilidenoaminooximetil)-fenil)-2-metoxiimino-N-metil-acetamida; oxazolidindionas e imidazolinonas: famoxadona, fenamidona;
- 45 F.I-2) Inhibidores del complejo II (por ejemplo carboxamidas):
  - carboxanilidas: benodaniol, bixafeno, boscalid, carboxina, fenfuram, fenhexamida, fluopiram, flutolanil, furametpir, isopirazam, isotianil, mepronil, oxicarboxina, penflufeno, pentiopirad, sedaxano, tecloftalam, tifluzamida, tiadinil, 2-amino-4metil-tiazol-5-carboxanilida, N-(3',4',5'-trifluorobifenil-2il)-3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4carboxamida, N-(4'-trifluorometiltiobifenil-2-il)-3-difluorometil-1-metil-1H pirazol-4-carboxamida y N-(2-(1,3,3-trimetil-butil)-fenil)-1,3-dimetil-5 fluoro-1H-pirazol-4 carboxamida;
  - F.I-3) Inhibidores del complejo III en el sitio Qi: ciazofamida, amisulbrom;
  - F.I-4) Otros inhibidores de la respiración (complejo I, desacopladores) diflumetorim; tecnazeno; ferimzona;

ametoctradina; siltiofam; derivados de nitrofenilo: binapacrilo, dinobutón, dinocap, fluazinam, nitral-isopropilo, compuestos organometálicos: sales de fentina, tales como acetato de fentina, cloruro de fentina o hidróxido de fentina;

- F.II) Inhibidores de la biosíntesis de esterol (fungicidas de SBI)
- F.II-1) Inhibidores de C14-desmetilasa (fungicidas de DMI, por ejemplo triazoles, imidazoles) triazoles: azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanilo, paclobutrazol, penconazol, propiconazol, protioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefón, triadimenol, triticonazol, uniconazol; imidazoles: imazalil, pefurazoato, oxpoconazol, procloraz, triflumizol; pirimidinas, piridinas y piperazinas: fenarimol, nuarimol, pirifenox, triforina;
  - F.II-2) Inhibidores de delta 14-reductasa (aminas, por ejemplo morfolinas, piperidinas) morfolinas: aldimorph, dodemorph, acetado de dodemorph, fenpropimorph, tridemorph; piperidinas: fenpropidina, piperalina; espiroquetalaminas: espiroxamina;
  - F.II-3) Inhibidores de 3-ceto-reductasa: hidroxianilidas: fenhexamida;
- 15 F.III) Inhibidores de la síntesis de ácidos nucleicos
  - F.III-1) Síntesis de ARN, ADN

Fungicidas de acil-aminoácido o fenilamidas: benalaxilo, benalaxilo-M, kiralaxilo, metalaxilo, metalaxilo-M (mefenoxam), ofurace, oxadixilo; isoxazoles e iosotiazolonas: himexazol, octilinona;

- F.III-2) Inhibidores de la ADN topoisomerasa: ácido oxolínico;
- 20 F.III-3) Metabolismo de nucleótidos (por ejemplo adenosina-desaminasa)

hidroxi(2-amino)-pirimidinas: bupirimato;

- F.IV) Inhibidores de la división celular y/o el citoesqueleto
- F.IV-1) Inhibidores de tubulina: bencimidazoles y tiofanatos: benomilo, carbendazim, fuberidazol, tiabendazol, tiopfanato-metilo;
- 25 triazolopirimidinas: 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)-[1,2,4]triazolo[1,5a]pirimidina
  - F.IV-2) Otros inhibidores de la división celular

benzamidas y fenilacetamidas: dietofencarb, etaboxam, penclcurón, fluopicolida, zoxamida;

- F.IV-3) Inhibidores de actina: benzofenonas: metrafenona;
- F.V) Inhibidores de la síntesis de aminoácidos y proteínas
- 30 F.V-1) Inhibidores de la síntesis de metionina (anilino-pirimidinas)

anilino-pirimidinas: ciprodinil, mepanipirim, nitrapirin, pirimetanil;

F.V-2) Inhibidores de la síntesis de proteínas (anilino-pirimidinas)

antibióticos: blasticidina-S, kasugamicina, clorhidrato-hidrato de kasugamicina, mildio-micina, estreptomicina, oxitetraciclina, polioxina, validamicina A;

- 35 F.VI) Inhibidores de transducción de señales
  - F.VI-1) Inhibidores de MAP / histidina cinasa (por ejemplo anilino-pirimidinas)

dicarboximidas: fluoroimida, iprodiona, procimidona, vinclozolina; fenilpirroles: fenpiclonilo, fludioxonilo;

- F.VI-2) Inhibidores de proteínas G: quinolinas: quinoxifeno;
- F.VII) Inhibidores de la síntesis de lípidos y membranas
- F.VIII-1) Principios activos inorgánicos: Mezcla de Bordeaux, acetato de cobre, hidróxido de cobre, oxicloruro de cobre, sulfato básico de cobre, azufre;
- 5 F.VIII-2) Tio- y ditiocarbamato: ferbam, mancozeb, maneb, metam, metasulfocarb, metiram, propineb, thiram, zineb, ziram:
  - F.VIII-3) Compuestos de organocloro (por ejemplo ftalimidas, sulfamidas, cloronitrilos):
  - anilazina, clorotalonilo, captafol, captán, folpet, diclofluanida, diclorofeno, flusulfamida, hexaclorobenceno, pentaclorfenol y sus sales, ftalida, tolilfluanida, N-(4-cloro-2-nitro-fenil)-N-etil-4-metil-bencenosulfonamida;
- F.VIII-4) Guanidinas: guanidina, dodina, base libre de dodina, guazatina, acetato de guazatina, iminoctadina, triacetato de iminoctadina, tris(albesilato) de iminoctadina;
  - F.VIII-5) Antraquinonas: ditianona;
  - F.IX) Inhibidores de la síntesis de la pared celular
  - F.IX-1) Inhibidores de la síntesis de glucano: validamicina, polioxina B;
- 15 F.IX-2) Inhibidores de la síntesis de melanina: piroquilón, tricoclazol, carpropamida, diciclomet, fenoxanilo;
  - F.X) Inductores de la defensa de plantas
  - F.X-1) Ruta del ácido salicílico: acibenzolar-S-metilo;
  - F.X-2) Otros: probenazol, isotianilo, tiadinilo, prohexadiona de calcio;
  - fosfonatos: fosetilo, fosetilo de aluminio, ácido fosforoso y sus sales;
- F.XI) Modo de acción desconocido: bronopol, quinometionat, ciflufenamida, cimoxanilo, dazomet, debacarb, diclomezina, difenzoquat, metilsulfato de difenzoquat, difenilamina, flumetover, flusulfamida, flutianilo, metasulfocarb, oxina de cobre, proquinazid, tebufloquina, tecloftalam, triazoxida, 2-butoxi-6-yodo-3-propil-cromen-4-ona, N-(ciclopropilmetoxiimino-(6-difluoro-metoxi-2,3-difluoro-fenil)-metil)-2-fenilacetamida, N'-(4-(4-cloro-3-trifluorometil-fenoxi)-2,5-dimetil-formamidina, N'-(4-(4-fluoro-3-trifluorometil-fenoxi)-2,5-dimetil-fenoxi)-2,5-dimetil-fenoxi
- fenil)-N-etil-N-metil-formamidina, N'-(2-metil-5-trifluorometil-4-(3-trimetilsilanil-propoxi)-fenil)-N-etil-N-metil-formamidina, N'-(5-difluorometil-2-metil-4-(3-trimetilsilanil-propoxi)-fenil)-N-etil-N-metil-formamidina, metil-(1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-il)-amida del ácido 2-{1-[2-(5-metil-3-trifluorometil-pirazol-1-il)-acetil]-piperidin-4-il}-tiazol-4-carboxílico, metil-(R)-1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-il-amida del ácido 2-{1-[2-(5-metil-3-trifluorometil-pirazol-1-il)-acetil]-piperidin-4-il}-tiazol-4-carboxílico, éster de 6-terc-butil-8-fluoro-2,3-dimetilquinolin-4-ilo del ácido metoxi-acético v N-metil-2-{1-[(5-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-1-il)-acetil]-piperidin-4-il}-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-il]-4
  - y N-metil-2-{1-[(5-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-1-il)-acetil]-piperidin-4-il}-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il]-4-tiazolcarboxamida, 3-[5-(4-cloro-fenil)-2,3-dimetil-isoxazolidin-3-il]-piridina, pirisoxazol, éster S-alílico del ácido 5-amino-2-isopropil-3-oxo-4-orto-tolil-2,3-dihidropirazol-1-carbotioico, amida del ácido N-(6-metoxi-piridin-3-il)ciclopropanocarboxílico, 5-cloro-1(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)-2-metil-1H-benzoimidazol, 2-(4-cloro-fenil)-N-[4-(3,4-dimetoxi-fenil)-isoxazol-5-il]-2-prop-2-iniloxi-acetamida;
- F.XI) Reguladores del crecimiento: ácido abscísico, amidocloro, ancimidol, 6-bencilaminopurina, brasinolida, butralina, clormequat (cloruro de clormequat), cloruro de colina, ciclanilida, daminozida, dikegulac, dimetipina, 2,6-dimetilpuridina, etefón, flumetralina, flurprimidol, flutiacet, forclorfenurón, ácido giberélico, inabenfida, ácido indol-3-acético, hidrazida maleica, mefluidida, mepiquat (cloruro de mepiquat), ácido naftalenoacético, N-6-benciladenina, paclobutrazol, prohexadiona (prohexadiona de calcio), prohidrojasmon, tidiazuron, triapentenol, fosforotritioato de tributilo, ácido 2,3,5-triyodobenzoico, trinexapac-etilo y uniconazol;
  - F.XII) Agentes de control biológico: antes de biocontrol antifúngico:

45

cepa de *Bacillus substilis* con NRRL n.º B-21661 (por ejemplo RHAP-SODY®, SERENADE® MAX y SERENADE® ASO de AgraQuest, Inc., EE.UU.), cepa de *Bacillus pumilus* con NRRL n.º B-30087 (por ejemplo SONATA® y BALLAD® Plus de AgraQuest, Inc., EE.UU.), *Ulocladium oudemansii* (por ejemplo el producto BOTRY-ZEN de BotriZen Ltd., Nueva Zelanda), quitosano (por ejemplo ARMOUR-ZEN de BotriZen Ltd., Nueva Zelanda).

La plaga de invertebrados (también denominada "plaga animal"), es decir insectos, arácnidos y nematodos, la planta, el suelo o el agua en que la planta está creciendo o puede crecer puede ponerse en contacto con los compuestos de la presente invención o la(s) composición/composiciones que los comprenden mediante cualquier método de aplicación conocido en la técnica. Como tal, "poner en contacto" incluye tanto contacto directo (aplicar los compuestos/las composiciones directamente sobre la plaga de invertebrados o la planta, normalmente al follaje, tallo o raíces de la planta) como contacto indirecto (aplicar los compuestos/las composiciones al lugar de la plaga de invertebrados o la planta).

Los compuestos de la presente invención o las composiciones pesticidas que los comprenden pueden usarse para proteger plantas en crecimiento y cultivos del ataque o la infestación por plagas animales, especialmente insectos, ácaros o arácnidos poniendo en contacto la planta/el cultivo con una cantidad eficaz desde el punto de vista pesticida de compuestos de la presente invención. El término "cultivo" se refiere a cultivos tanto en crecimiento como cosechados.

10

15

20

25

30

35

40

45

50

Los compuestos de la presente invención y las composiciones que los comprenden son particularmente importantes en el control de una multitud de insectos en diversas plantas cultivadas, tales como cereales, cultivos de raíz, cultivos de aceite, vegetables, especias, plantas ornamentales, por ejemplo semilla de trigo duro y otro trigo, cebada, avena, centeno, maíz (maíz de forraje y maíz de azúcar / maíz dulce y de campo), soja, cultivos de aceite, crucíferas, algodón, girasol, bananas, arroz, colza, nabo, remolacha azucarera, remolacha de forraje, berenjenas, patatas, hierba, pasto, césped, hierba de forraje, tomates, puerros, calabaza/zapallo, repollo, lechuga iceberg, pimiento, pepinos, melones, especies de *Brassica*, melones, judías, guisantes, ajo, cebollas, zanahorias, plantas tuberosas tales como patatas, caña de azúcar, tabaco, uvas, petunias, geranio/pelargonios, pensamientos y impatiens.

Los compuestos de la presente invención se emplean como tales o en forma de composiciones tratando los insectos o las plantas, los materiales de propagación de plantas, tales como semillas, terreno, superficies, materiales o habitaciones que van a protegerse frente al ataque insecticida con una cantidad insecticidamente eficaz de los compuestos activos. La aplicación puede llevarse a cabo antes y después de la infección de las plantas, los materiales de propagación de plantas, tales como semillas, terreno, superficies, materiales o habitaciones por los insectos.

Además, las plagas de invertebrados pueden controlarse poniendo en contacto de la plaga objetivo, su suministro de alimento, hábitat, terreno de reproducción o su lugar con una cantidad eficaz como pesticida de compuestos de la presente invención. Como tal, la aplicación puede llevarse a cabo antes o después de la infección del lugar, cultivos en crecimiento o cultivos recolectados por la plaga.

Los compuestos de la presente invención también pueden aplicarse preventivamente a lugares en los que se espera la aparición de las plagas.

Los compuestos de la presente invención también pueden usarse para proteger plantas en crecimiento del ataque o la infestación por plagas poniendo en contacto la planta con una cantidad eficaz desde el punto de vista pesticida de compuestos de la presente invención. Como tal, "poner en contacto" incluye tanto contacto directo (aplicando los compuestos/las composiciones directamente sobre la plaga y/o planta, normalmente a las hojas, el tallo o las raíces de la planta) como contacto indirecto (aplicando los compuestos/las composiciones al lugar de la plaga y/o planta).

"Lugar" significa un hábitat, terreno de reproducción, planta, semilla, suelo, zona, material o entorno en que una plaga o parásito crece o puede crecer.

En general, "cantidad eficaz como pesticida" significa la cantidad de principio activo necesaria para conseguir un efecto observable sobre el crecimiento, incluyendo los efectos de necrosis, muerte, retraso, prevención y eliminación, destrucción o disminución de otro modo de la aparición y actividad del organismo objetivo. La cantidad eficaz como pesticida puede variar para los diversos compuestos/composiciones usados en la invención. Una cantidad eficaz como pesticida de las composiciones variará también según las condiciones reinantes tales como la duración y el efecto del pesticida deseados, el clima, la especie objetivo, el lugar, el modo de aplicación y similares.

En el caso de tratamiento de suelo o de aplicación al sitio de residencia o nido de las plagas, la cantidad de principio activo oscila entre 0,0001 y 500 g por 100 m², preferiblemente desde 0,001 hasta 20 g por 100 m².

Las tasas de aplicación habituales en la protección de materiales son, por ejemplo, de 0,01 g a 1000 g de compuesto activo por m² de material tratado, de manera deseable desde 0,1 g hasta 50 g por m².

Las composiciones insecticidas para su uso en la impregnación de materiales normalmente contienen desde el 0,001 hasta el 95% en peso, preferiblemente desde el 0,1 hasta el 45% en peso, y más preferiblemente desde el 1 hasta el 25% en peso, de al menos un repelente y/o insecticida.

Para su uso en el tratamiento de plantas de cultivo, la tasa de aplicación de los principios activos de esta invención puede estar en el intervalo de 0,1 g a 4000 g por hectárea, de manera deseable desde 25 g hasta 600 g por hectárea, de manera más deseable desde 50 g hasta 500 g por hectárea.

Los compuestos de la presente invención son eficaces tanto a través de contacto (por medio del terreno, cristales, paredes, mosquiteras, alfombras, partes de plantas o partes de animales) como de ingestión (cebo, o parte de planta).

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

Los compuestos de la presente invención pueden aplicarse también a plagas de insectos que no son de cultivos, tales como hormigas, termitas, avispas, moscas, mosquitos, grillos o cucarachas. Para su uso frente a dichas plagas que no son de cultivos, los compuestos de la presente invención se usan preferiblemente en una composición de cebo

El cebo puede ser una preparación líquida, sólida o semisólida (por ejemplo un gel). Pueden formarse cebos sólidos en diversas conformaciones y formas adecuadas para la respectiva aplicación, por ejemplo gránulos, bloques, varillas, discos. Pueden llenarse diversos dispositivos con cebos líquidos para garantizar su aplicación apropiada, por ejemplo recipientes abiertos, dispositivos de pulverización, fuentes de gotitas o fuentes de evaporación. Los geles pueden basarse en matrices acuosas o aceitosas y pueden formularse según las necesidades particulares en cuanto a pegajosidad, retención de humedad o características de envejecimiento.

El cebo empleado en la composición es un producto, que es suficientemente atractivo como para incitar a insectos tales como hormigas, termitas, avispas, moscas, mosquitos, grillos etc. o cucarachas a comerlo. La capacidad de atracción puede manipularse usando estimulantes de la alimentación o feromonas sexuales. Los estimulantes de la alimentación se eligen, por ejemplo, pero no exclusivamente, de proteínas animales y/o vegetales (harina de carne, pescado o sangre, partes de insecto, yema de huevo), de grasas y aceites de origen animal y/o vegetal, o mono-, oligo- o poliorganosacáridos, especialmente de sacarosa, lactosa, fructosa, dextrosa, glucosa, almidón, pectina o incluso melazas o miel. Partes frescas o en descomposición de frutas, cultivos, plantas, animales, insectos o partes específicas de los mismos también pueden servir como estimulante de la alimentación. Se sabe que las feromonas sexuales son más específicas de insectos. Se describen feromonas específicas en la bibliografía y las conocen los expertos en la técnica.

Para su uso en composiciones de cebo, el contenido típico de principio activo es de desde el 0,001% en peso hasta el 15% en peso, deseablemente desde el 0,001% en peso hasta el 5% en peso de principio activo.

Formulaciones de compuestos de la presente invención como aerosoles (por ejemplo en frascos pulverizadores), pulverizadores de aceite o pulverizadores de bomba son altamente adecuados para el usuario no profesional para controlar plagas tales como moscas, pulgas, garrapatas, mosquitos o cucarachas. Las recetas de aerosol están compuestas preferiblemente por el compuesto activo, disolventes tales como alcoholes inferiores (por ejemplo metanol, etanol, propanol, butanol), cetonas (por ejemplo acetona, metil etil cetona), hidrocarburos de parafina (por ejemplo querosenos) que tienen intervalos de ebullición de aproximadamente 50 a 250°C, dimetilformamida, N-metilpirrolidona, dimetilsulfóxido, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, xileno, agua, además agentes auxiliares tales como emulsionantes tales como monooleato de sorbitol, etoxilato de oleílo que tiene 3-7 mol de óxido de etileno, etoxilato de alcohol graso, aceites de perfume tales como aceites etéreos, ésteres de ácidos grasos medios con alcoholes inferiores, compuestos de carbonilo aromáticos, si es apropiado estabilizadores tales como benzoato de sodio, tensioactivos anfóteros, epóxidos inferiores, ortoformiato de trietilo y, si se requiere, propelentes tales como propano, butano, nitrógeno, aire comprimido, dimetil éter, dióxido de carbono, óxido nitroso, o mezclas de estos gases.

Las formulaciones de pulverización de aceite difieren de las recetas de aerosol en que no se usan propelentes.

Para su uso en composiciones de pulverización, el contenido del principio activo es de desde el 0,001 hasta el 80% en peso, preferiblemente desde el 0,01 hasta el 50% en peso y lo más preferiblemente desde el 0,01 hasta el 15% en peso.

Los compuestos de la presente invención y sus respectivas composiciones también pueden usarse en bobinas de fumigación y mosquitos, cartuchos de humo, placas vaporizadoras o vaporizadores de duración prolongada y también en papeles para polillas, almohadillas para polillas, u otros sistemas vaporizadores independientes del calor.

Los métodos para controlar enfermedades infecciosas transmitidas por insectos (por ejemplo malaria, dengue y fiebre amarilla, filariasis linfática y leishmaniosis) con compuestos de la presente invención y sus respectivas composiciones también comprenden tratar superficies de cabañas y casas, pulverización de aire e impregnación de cortinas, toldos, artículos de ropa, mosquiteras, trampas para mosca tse tse o similares. Las composiciones insecticidas para su aplicación a fibras, material textil, artículos de punto, materiales textiles no tejidos, material de red o láminas y lonas comprenden preferiblemente una mezcla que incluye el insecticida, opcionalmente un

repelente y al menos un aglutinante. Repelentes adecuados son por ejemplo N,N-dietil-meta-toluamida (DEET), N,N-dietilfenilacetamida (DEPA), 1-(3-ciclohexan-1-il-carbonil)-2-metilpiperina, lactona de ácido (2-hidroxi-metilciclohexil)acético, 2-etil-1,3-hexanodiol, indalona, metilneodecanamida (MNDA), un piretroide no usado para el control de insectos tal como {(+/-)-3-alil-2-metil-4-oxociclopent-2-(+)-enil-(+)-trans-crisantemato (esbiotrina), un repelente derivado de o idéntico a extractos vegetales como limoneno, eugenol, (+)-eucamalol (1), (-)-1-epi-eucamalol o extractos vegetales en bruto de plantas como *Eucalyptus maculata*, *Vitex rotundifolia*, *Cymbopogan martinii*, *Cymbopogan citratus* (limoncillo), *Cymopogan nartdus* (citronela). Se seleccionan aglutinantes adecuados por ejemplo de polímeros y copolímeros de ésteres vinílicos de ácidos alifáticos (tales como acetato de vinilo y versatato de vinilo), ésteres acrílicos y metacrílicos de alcoholes, tales como acrilato de butilo, acrilato de 2-etilhexilo, y acrilato de metilo, hidrocarburos mono- y di-etilénicamente insaturados, tales como estireno, y dienos alifáticos, tales como butadieno.

10

35

45

50

55

La impregnación de cortinas y mosquiteras se realiza en general sumergiendo el material textil en emulsiones o dispersiones del insecticida o pulverizándolas sobre las mosquiteras.

Los compuestos de la presente invención y sus composiciones pueden usarse para proteger materiales de madera tales como árboles, vallas de madera, traviesas, etc. y edificios tales como casas, letrinas, fábricas, pero también materiales de construcción, muebles, pieles, fibras, artículos de vinilo, cables e hilos eléctricos, etc., frente a hormigas y/o termitas, y para controlar el daño de hormigas y termitas a cultivos o seres humanos (por ejemplo cuando las plagas invaden casas e instalaciones públicas). Los compuestos de la presente invención se aplican no sólo a la superficie de terreno circundante o al terreno bajo el piso con el fin de proteger materiales de madera sino que también pueden aplicarse a artículos de madera tales como superficies del hormigón bajo el piso, columnas, vigas, madera contrachapada, muebles, etc., artículos de madera tales como tableros de partículas, medios tableros, etc. y artículos de vinilo tales como hilos eléctricos recubiertos, láminas de vinilo, material de aislamiento térmico tal como espumas de estireno, etc. En el caso de la aplicación contra hormigas que producen daño a cultivos o seres humanos, el controlador de hormigas de la presente invención se aplica a los cultivos o el terreno circundante, o se aplica directamente al nido de hormigas o similar.

Los compuestos de la presente invención también son adecuados para el tratamiento de material de propagación de plantas, especialmente semillas, con el fin de protegerlas de la plaga de insectos, en particular de plagas de insectos que viven en el terreno y los brotes y raíces de la planta resultantes e insectos foliares.

Los compuestos de la presente invención son particularmente útiles para la protección de la semilla frente a plagas del terreno y los brotes y raíces de la planta resultantes frente a plagas del terreno e insectos foliares. Se prefiere la protección de los brotes y raíces de la planta resultantes. Se prefiere más la protección de los brotes de la planta resultantes frente a insectos chupadores y perforadores, siendo la más preferida la protección frente a áfidos.

La presente invención comprende por tanto un método para la protección de semillas frente a insectos, en particular frente a insectos del terreno y de los brotes y raíces de las plántulas frente a insectos, en particular del terreno e insectos foliares, comprendiendo dicho método poner en contacto las semillas antes de la siembra y/o tras la pregerminación con un compuesto de la presente invención, incluyendo una sal del mismo. Se prefiere particularmente un método en el que los brotes y raíces de la planta se protegen, más preferiblemente un método en el que los brotes de la planta se protegen frente a insectos chupadores y perforadores, lo más preferiblemente un método en el que los brotes de las plantas se protegen frente a áfidos.

40 El término semilla engloba semillas y propágulos de plantas de todas las clases incluyendo pero sin limitarse a, semillas verdaderas, trozos de semillas, chupones, cormos, bulbos, frutos, tubérculos, granos, esquejes, vástagos cortados y similares y significa en una realización preferida semillas verdaderas.

El término tratamiento de semillas comprende todas las técnicas adecuadas de tratamiento de semillas conocidas en la técnica, tales como desinfección de semillas, recubrimiento de semillas, espolvoreado de semillas, inmersión de semillas y peletización de semillas.

La presente invención también comprende semillas recubiertas con o que contienen el compuesto activo. El término "recubierto con y/o que contiene" significa generalmente que el principio activo está principalmente sobre la superficie del producto de propagación en el momento de su aplicación, aunque una parte mayor o menor del componente puede penetrar en el producto de propagación, dependiendo del método de aplicación. Cuando dicho producto de propagación vuelve a plantarse, puede absorber el principio activo.

Semillas adecuadas son semillas de cereales, cultivos de raíz, cultivos de oleaginosas, verduras, especias, plantas ornamentales, por ejemplo semilla de trigo duro y otro trigo, cebada, avena, centeno, maíz (maíz de forraje y maíz de azúcar / maíz dulce y de campo), soja, cultivos de oleaginosas, crucíferas, algodón, girasol, bananas, arroz, colza, nabo, remolacha azucarera, remolacha de forraje, berenjenas, patatas, hierba, pasto, césped, hierba de forraje, tomates, puerros, calabaza/zapallo, repollo, lechuga iceberg, pimiento, pepinos, melones, especies de

*Brassica*, melones, judías, guisantes, ajo, cebollas, zanahorias, plantas tuberosas tales como patatas, caña de azúcar, tabaco, uvas, petunias, geranio/pelargonios, pensamientos e impatiens.

Además, el compuesto activo también puede usarse para el tratamiento de semillas de plantas que toleran la acción de herbicidas o fungicidas o insecticidas debido a métodos de reproducción, incluyendo métodos de ingeniería genética.

Por ejemplo, el compuesto activo puede emplearse en el tratamiento de semillas de plantas que son resistentes a herbicidas del grupo que consiste en las sulfonilureas, imidazolinonas, glufosinato-amonio o glifosato-isopropilamonio y sustancias activas análogas (véanse, por ejemplo, los documentos EP-A 242 236, EP-A 242 246, WO 92/00377, EP-A 257 993, US 5.013.659) o en plantas de cultivo transgénicas, por ejemplo algodón, con la capacidad de producir toxinas de *Bacillus thuringiensis* (toxinas de Bt) que hacen que las plantas sean resistentes a determinadas plagas (documentos EP-A 142 924, EP-A 193 259).

Además, el compuesto activo puede usarse también para el tratamiento de semillas de plantas, que tienen características modificadas en comparación con las plantas existentes, que pueden generarse por ejemplo mediante métodos de reproducción tradicionales y/o la generación de mutantes, o mediante procedimientos recombinantes). Por ejemplo, se han descrito varios casos de modificaciones recombinantes de plantas de cultivo para el fin de modificar el almidón sintetizado en las plantas (por ejemplo documentos WO 92/11376, WO 92/14827, WO 91/19806) o de plantas de cultivo transgénicas que tienen una composición de ácidos grasos modificada (documento WO 91/13972).

La aplicación de tratamiento de semillas del compuesto activo se lleva a cabo pulverizando o espolvoreando las semillas antes de la siembra de las plantas y antes de que broten las plantas.

Composiciones que son especialmente útiles para el tratamiento de semillas son por ejemplo:

A Concentrados solubles (SL, LS)

D Emulsiones (EW, EO, ES)

5

10

15

30

35

40

45

E Suspensiones (SC, OD, FS)

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

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

H Formulaciones de gel (GF)

I Polvos espolvoreables (DP, DS)

Las formulaciones convencionales de tratamiento de semillas incluyen por ejemplo concentrados fluidos FS, disoluciones LS, polvos para tratamiento en seco DS, polvos dispersables en agua para tratamiento en suspensión WS, polvos solubles en agua SS y emulsión ES y EC y formulación de gel GF. Estas formulaciones pueden aplicarse a la semilla diluidas o no diluidas. La aplicación a las semillas se lleva a cabo antes de la siembra, o bien directamente sobre las semillas o bien tras haber pregerminado estas últimas.

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

Las formulaciones FS especialmente preferidas de compuestos de la presente invención para el tratamiento de semillas comprenden habitualmente desde el 0,1 hasta el 80% en peso (de 1 a 800 g/l) del principio activo, desde el 0,1 hasta el 20% en peso (de 1 a 200 g/l) de al menos un tensioactivo, por ejemplo del 0,05 al 5% en peso de un humectante y desde el 0,5 hasta el 15% en peso de un agente de dispersión, hasta el 20% en peso, por ejemplo desde el 5 hasta el 20% de un agente anticongelante, desde el 0 hasta el 15% en peso, por ejemplo del 1 al 15% en peso de un pigmento y/o un tinte, desde el 0 hasta el 40% en peso, por ejemplo del 1 al 40% en peso de un aglutinante (adhesivo/agente de adhesión), opcionalmente hasta el 5% en peso, por ejemplo desde el 0,1 hasta el 5% en peso de un agente antiespumante, y opcionalmente un conservante tal como un biocida, antioxidante o similar, por ejemplo en una cantidad de desde el 0,01 hasta el 1% en peso y una carga/vehículo hasta el 100% en peso. Las formulaciones de tratamiento de semillas pueden comprender también adicionalmente aglutinantes y opcionalmente colorantes. Pueden añadirse aglutinantes

para mejorar la adhesión de los materiales activos sobre las semillas tras el tratamiento. Aglutinantes adecuados son homo- y copolímeros de óxidos de alquileno como óxido de etileno u óxido de propileno, poli(acetato de vinilo), poli(alcoholes vinílicos), polivinilpirrolidonas, y copolímeros de los mismos, copolímeros de etileno-acetato de vinilo, homo- y copolímeros acrílicos, polietilenaminas, polietilenamidas y polietileniminas, polisacáridos como celulosas, tilosa y almidón, homo- y copolímeros de poliolefina como copolímeros de olefina/anhídrido maleico, poliuretanos, poliésteres, homo y copolímeros de poliestireno.

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

Un ejemplo de un agente gelificante es carragenano (Satiagel®).

En el tratamiento de semilla, las tasas de aplicación de los compuestos de la presente invención son generalmente de desde 0,1 g hasta 10 kg por 100 kg de semilla, preferiblemente desde 1 g hasta 5 kg por 100 kg de semilla, más preferiblemente desde 1 g hasta 1000 g por 100 kg de semilla y en particular desde 1 g hasta 200 g por 100 kg de semilla.

La invención también se refiere por tanto a una semilla que comprende un compuesto de la presente invención, incluyendo una sal agrícolamente útil del mismo, tal como se define en el presente documento. La cantidad del compuesto de la presente invención, incluyendo una sal agrícolamente útil del mismo variará en general desde 0,1 g hasta 10 kg por 100 kg de semilla, preferiblemente desde 1 g hasta 5 kg por 100 kg de semilla, en particular desde 1 g hasta 1000 g por 100 kg de semilla. Para cultivos específicos tales como lechuga la tasa puede ser superior.

Los métodos que pueden emplearse para tratar la semilla son, en principio, todas las técnicas de tratamiento de semillas y especialmente desinfección de semillas adecuadas conocidas en la técnica, tales como recubrimiento de semillas (por ejemplo peletización de semillas), espolvoreo de semillas e imbibición de semillas (por ejemplo inmersión de semillas). En el presente documento, "tratamiento de semillas" se refiere a todos los métodos que ponen en contacto las semillas y los compuestos de la presente invención entre sí, y "desinfección de semillas" se refiere a métodos de tratamiento de semillas que proporcionan a las semillas una cantidad de los compuestos de la presente invención, es decir que generan una semilla que comprende un compuesto de la presente invención. En principio, el tratamiento puede aplicarse a la semilla en cualquier momento desde la cosecha de la semilla hasta la siembra de la semilla. La semilla puede tratarse inmediatamente antes, o durante, la plantación de la semilla, por ejemplo usando el método de "caja de plantación". Sin embargo, el tratamiento también puede llevarse a cabo varias semanas o meses, por ejemplo hasta 12 meses, antes de plantar la semilla, por ejemplo en forma de un tratamiento de desinfección de semillas, sin que se observe una eficacia sustancialmente reducida.

Convenientemente, el tratamiento se aplica a la semilla no sembrada. Tal como se usa en el presente documento, el término "semilla no sembrada" pretende incluir una semilla en cualquier periodo desde la cosecha de la semilla hasta la siembra de la semilla en el terreno para el fin de germinación y crecimiento de la planta.

Específicamente, se sigue un procedimiento en el tratamiento en el que la semilla se mezcla, en un dispositivo de decuado, por ejemplo un dispositivo de mezclado para parejas de mezclado sólidas o sólidas/líquidas, con la cantidad deseada de formulaciones de tratamiento de semillas, o bien como tales o bien tras la dilución previa con agua, hasta que la composición se distribuye uniformemente sobre la semilla. Si es apropiado, esto va seguido por una etapa de secado.

#### **Ejemplos**

5

10

25

30

35

50

#### 45 A. Ejemplos de preparación

Con la modificación apropiada de los materiales de partida, se usaron los procedimientos facilitados en los ejemplos de síntesis a continuación para obtener compuestos I adicionales. Los compuestos obtenidos de esta manera se enumeran en la tabla que sigue, junto con datos físicos.

Los productos mostrados a continuación se caracterizaron mediante la determinación del punto de fusión, mediante espectroscopía de RMN o mediante las masas ([m/z]) o el tiempo de retención (TR; [min.]) determinados mediante espectrometría de HPLC-EM o HPLC.

HPLC-MS = cromatografía de líquidos de alta resolución-espectrometría de masas acoplada; métodos de HPLC:

Método 1: columna RP-18 (Chromolith® Speed ROD de Merck KgaA, Alemania), 50\*4,6 mm; fase móvil: acetonitrilo + ácido trifluoroacético al 0,1% (TFA)/agua + TFA al 0,1%, usando un gradiente de 5:95 a 100:0 a lo largo de 5 minutos a 40°C, velocidad de flujo 1,8 ml/min.

Método 2: Phenomenex Kinetex 1,7 μm XB-C18 100A; 50 x 2,1 mm; fase móvil: A: agua + ácido trifluoroacético al 0,1% (TFA); B: acetonitrilo + TFA al 0,1%; gradiente: el 5-100% de B en 1,50 minutos; el 100% de B 0,20 min; flujo: 0,8-1,0 ml/min en 1,50 minutos a 60°C. EM: ionización por electrospray de cuadrupolo, 80 V (modo positivo).

Método 3: Columna: CHIRALPAK® IA 5  $\mu$ m - 250 x 4,6 mm; fase móvil: heptano/diclorometano/etanol/dietilamina 50/50/1/0,1; flujo: 1 ml/min; detección: UV 280 nm; 25°C.

Método 4: Columna: CHIRALPAK® IC 5  $\mu$ m - 250 x 4,6 mm; fase móvil: etanol/metanol 50/50; flujo: 0,7 ml/min; detección: UV 280 nm; 25°C.

**Ejemplo 1:** Preparación de piridazin-4-ilamida del ácido 5-metil-1-(2,2,2-trifluoro-1-trifluorometil-etil)-1H-pirazol-4-carboxílico [I-34]

Se añadió gota a gota una disolución de 398 mg de cloruro de 5-metil-1-[2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]pirazol-4-carbonilo en 10 ml de CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> a una disolución de 185 mg de piridazin-4-amina y 750 mg de trietilamina en 30 ml de CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> a 0°C. Se agitó la mezcla a 20-25°C durante aproximadamente 68 h, se diluyó con 25 ml de acetato de etilo, se lavó con 3 X 15 ml de disolución de NH<sub>4</sub>Cl ac. sat., se secó sobre MgSO<sub>4</sub> y se evaporó. La purificación mediante cromatografía ultrarrápida (CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>/MeOH) dio 160 mg del compuesto del título (90% de pureza). HPLC-EM (método 1): TR 2,278 min, m/z [MH]<sup>+</sup> 354,1.

**Ejemplo 2:** Preparación de N,5-dimetil-N-piridazin-4-il-1-[2,2,2-trifluoro-1-(trifluoro-metil)etil]pirazol-4-carboxamida [I-38]

Se agitó a 20-25°C durante aproximadamente 24 h una mezcla de 300 mg de ácido 5-metil-1-[2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]pirazol-4-carboxílico, 127 mg de N-metilpiridazin-4-amina, 710 mg de hexafluorofosfato de O-(7-azabenzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetra-metiluronio [HATU] y 220 mg de trietilamina en 30 ml de THF, luego se evaporó. Se llevó el residuo a 21 ml de CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>, se lavó con 3 X 14 ml de agua, se secó sobre Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>, luego se evaporó. La purificación mediante cromatografía ultrarrápida (CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>/MeOH) dio 130 mg del compuesto del título (90% de pureza). HPLC-EM (método 1): TR 2,271 min, m/z [MH]<sup>+</sup> 368,1.

**Ejemplo 3:** Se efectuó la separación de los enantiómeros I-381 e I-382 mediante cromatografía preparativa en las siguientes condiciones: Columna: CHIRALPAK® AD-H 5  $\mu$ m - 250 x 30 mm; fase móvil: dióxido de carbono/etanol 90/10; flujo: 120 ml/min; detección: UV 280 nm; contrapresión: 150 bar; temperatura: 25°C. 2 g de material en bruto I-377 produjeron 978 mg de (+)-enantiómero I-381, y 972 mg de (-)-enantiómero I-382, cada uno con >99% de ee.

**Ejemplo 4:** Se efectuó la separación de los enantiómeros I-383 e I-384 mediante cromatografía preparativa en las siguientes condiciones: CHIRALPAK® IC 5  $\mu$ m - 250 x 30 mm; fase móvil: dióxido de carbono/etanol 70/30; flujo: 120 ml/min; detección: UV 280 nm; contrapresión: 150 bar; temperatura: 25°C. 2 g de material en bruto I-373 produjeron 864 mg de (+)-enantiómero I-383 (98,4% de ee), y 898 mg de (-)-enantiómero I-384 (98,0% de ee).

Tabla I - Compuestos de fórmula I (isómero T-A)

Nº.	T	U	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^3$	$R^4$	R⁵	Datos	físicos (H MS)	PLC /
								RT	Método	m/z
								[min]		[MH]+
I-1	0	Ν	Н	CH₃	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	-	Н	1,599	1	244,1
I-2	0	Ν	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> S(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1,553	1	338,1
I-3	0	Ν	CH₃	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> S(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1,520	1	352,1
I-4	0	Ν	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	1,714	1	276,1
I-5	0	Ν	CH₃	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	1,638	1	290,2
I-6	0	Ζ	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		Н	2,289	1	300,2
I-7	0	Ν	CH₃	CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		Н	2,114	1	286,2
I-8	0	Ν	Н	CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		Н	2,169	1	272,1
I-9	0	Ν	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃	Н	2,014	1	260,1
I-10	0	Ν	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	2,119	1	288,2
I-11	0	Ν	CH₃	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	1,941	1	274,2
I-12	0	Ν	Н	CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		Н	2,383	1	286,2
I-13	0	Ν	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		Н	2,306	1	300,2

35

5

15

20

25

30

Nº.	Т	U	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R⁵	Datos	físicos (H	PLC /
								DT	MS)	/
								RT [min]	Método	m/z
I-14		N	CH₂CH₃	CH₃	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		Н	[min] 2,459	1	[MH]+ 314,2
I-14	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -		H	2,439	1	286,2
I-16	0	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -		H	1,876	1	272,1
I-17	0	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	2,098	1	332,2
I-18	Ö	N	CH₂CH₃	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	2,229	1	346,2
I-19	Ō	N	H	CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -		H	1,984	1	258,1
I-20	Ō	N	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	2,118	1	318,2
I-21	Ō	N	Н	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH		Н	1,643	1	288,1
I-22	0	N	CH₂CH₃	CH₃	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH		Н	1,634	1	316,1
I-23	0	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH		Н	1,562	1	302,2
I-24	0	Ν	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	2,416	1	330,2
I-25	0	Ν	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH₃	CH₃	1,965	1	290,2
I-26	0	Ν	CH₃	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH₃	CH₃	1,908	1	304,2
I-27	0	Ν	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH₃	Н	2,463	1	358,1
I-28	0	Ν	CH₃	CH <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> CHFCF <sub>3</sub>	CH₃	Н	2,562	1	396,1
I-29	0	Z	CH₃	CH₃	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	CH₃	Η	2,106	1	346,1
I-30	0	N	Н	CH₃	CF <sub>2</sub> CHFCF <sub>3</sub>	CH₃	Н	2,552	1	382,1
I-31	0	N	Н	CH₃	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	CH₃	Н	2,144	1	332,1
I-32	0	N	Н	CH <sub>3</sub>	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1,817	1	271,1
I-33	0	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CN	CH₃	CH <sub>3</sub>	1,762	1	285,0
I-34	0	N	Н	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Н	2,278	1	354,1
I-35	0	N	Н	CH <sub>3</sub>	CN	CH <sub>3</sub>	Н	1,423	1	257,1
I-36	0	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CN	CH₃	Н	1,401	1	271,1
I-37	0	N	CH₂CH₃	CH <sub>3</sub>	CF₃	CF <sub>3</sub>	Н	2,519	1	382,1
I-38	0	N	CH₃	CH <sub>3</sub>	CF₃	CF <sub>3</sub>	H	2,271	1	368,1
I-39	0	N	Н	CH <sub>3</sub>	1-F-c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1,910	1	290,1
I-40	0	N	CH₃	CH₃	1-F-c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH₃	H	1,838	1	304,1
I-41	0	N	Н	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH₃	H	2,436	1	288,2
I-42	0	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH₃	H	2,398	1	302,2
I-43 I-44	0	N C	CH₂OCH₃ H	CH₃ CH₃	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH₃ CH₃	H H	2,509 2,282	1	332,2
I-44 I-45	0	C	 СН₃	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	2,282	1	287,2 301,2
I-45	0	N	CH₂CH₃	CH <sub>3</sub>		CH₃ CH₃	Н	2,139	1	316,2
1-40	0	N	H	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	2,129	1	274,2
I-48	0	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	2,071	1	288,2
I-49	0	N	CH₂OCH₃	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	2,231	1	318,2
I-50	0	C	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	2,110	1	273,2
I-51	Ö	C	CH₃	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	1,946	1	287,2
1-52	Ō	N	H	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	2,734	1	328,1
I-53	Ö	N	CH₃	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	2,788	1	342,1
I-54	Ō	N	CH₂OCH₃	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Н	2,955	1	372,2
I-55	Ō	С	Н	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Н	2,523	1	327,1
I-56	0	N	Н	CF <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH₃	Н	2,936	1	342,1
I-57	0	N	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH₃	Н	3,049	1	356,2
I-58	0	N	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	3,278	1	386,2
I-59	0	С	Н	CF <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH₃	Н	2,781	1	341,2
I-60	0	С	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃	c-C₃H₅	CH₃	Н	2,134	1	329,1
I-61	S	С	CH₃	CH₃	CF <sub>3</sub>	CH₃	Н	2,351	1	329,0
I-62	S	С	CH₂CH₃	CH₃	c-C₃H₅	CH₃	Н	2,569	1	315,2
I-63	S	С	Н	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	2,246	1	315,1
I-64	S	С	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH₃	H	2,524	1	343,0
I-65	0	N	Н	CH <sub>3</sub>	-CCl <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		Н	2,143	1	312,0
I-66	0	N	CH <sub>3</sub>	CH₃	-CCl <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		H	2,073	1	326,0
I-67	0	С	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃	CF₃	CH₃	H	0,868	2	357,2
I-68	0	N	Н	CH₃	CH=CH <sub>2</sub>	CH₃	H	0,716	2	258,0
I-69	0	N	CH₃	CH₃	CH=CH <sub>2</sub>	CH₃	H	0,708	2	272,0
I-70	0	N	CH₂CH₃	CH <sub>3</sub>	CH=CH <sub>2</sub>	CH₃	H	0,761	2	286,1
I-71	0	N	CH₂OCH₃	CH <sub>3</sub>	CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H	0,776	2	302,1
I-72	0	С	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH₂CH₃	CH₂CH₃	Н	2,597	1	341,1

Nº.	Т	U	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^3$	R⁴	R <sup>5</sup>	Datos	s físicos (H MS)	PLC /
								RT [min]	Método	m/z [MH]+
I-73	0	Ν	CH <sub>3</sub>	CH₃	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )(	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	Н	0,727	2	315,1
1-74	0	N	Н	CH₃	CH₂CN	CH₃	Н	1,525	1	271,1
I-75	0	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH₂CN	CH <sub>3</sub>	Н	1,466	1	285,1
I-76	0	N	CH₂CH₃	CH <sub>3</sub>	CH₂CN	CH <sub>3</sub>	Н	1,647	1	299,2
I-77	0	N	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH₂CN	CH <sub>3</sub>	Н	1,669	1	315,1
I-78	0	С	CH₂CH₃	CH₃	CH₂CN	CH <sub>3</sub>	Н	0,613	2	298,2
I-79	0	Ν	CH₂CH₃	CH₃	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	0,866	2	342,2
I-80	0	Ν	Н	CH₃	CF₃	CH₃	CH <sub>3</sub>	0,797	2	314
I-81	0	С	CH₃	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH₃	CH <sub>3</sub>	0,767	2	327,2
I-82	0	Ν	Н	CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		CN	0,831	2	311,1
I-83	0	С	Н	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH₃	CH <sub>3</sub>	0,783	2	313,2
I-84	0	С	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		CN	0,809	2	324,1
I-85	0	Ν	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	0,806	2	328,1
I-86	0	С	CH₂CH₃	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	0,833	2	341,1
I-87	0	N	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	0,944	2	372,2
I-88	0	N	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH₃	CH <sub>3</sub>	0,884	2	358,2
1-89	0	N	Н	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )		Н	0,502	2	301,2
I-90	0	С	Н	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )(		Н	0,497	2	300,1
I-91	0	С	CH₂OCH₃	CH <sub>3</sub>	CF₃	CH₃	CH₃	0,848	2	357,2
I-92	0	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1-CN-c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	1,584	1	311,1
I-93	0	N	Н	CH <sub>3</sub>	1-CN-c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	1,739	1	297,1
I-94	0	С	Н	CH <sub>3</sub>	CH₂CN	CH <sub>3</sub>	Н	1,504	1	270,1
I-95	0	N	Н	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	2,108	1	274,1
I-96	0	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	2,063	1	288,1
I-97	0	N	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	0,946	2	318,1
I-98	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	0,838	2	302,4
1-99	0	С	Н	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	2,030	1	273,1
I-100	0	С	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1,859	1	287,1
I-101	0	С	CH₂CH₃	CH₃	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH₃	H	2,000	1	301,1
I-102	0	N	Н	CH <sub>3</sub>	CF₃	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	0,795	2	314,2
I-103	0	N	CH₃	CH <sub>3</sub>	CF₃	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	2,011	1	328,1
I-104	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF₃	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	2,172	1	342,1
I-105	0	N	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH₃	CF₃	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	2,210	1	358,1
I-106	0	С	Н	CH₃	CF₃	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	2,128	1	313,1
I-107	0	С	CH <sub>3</sub>	CH₃	CF₃	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	1,956	1	327,1
I-108	0	С	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH₃	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	2,146	1	357,0
I-109	0	С	CH <sub>3</sub>	CH₃	CH <sub>2</sub> CN	CH <sub>3</sub>	Н	1,307	1	284,0
I-110	0	N	CH₃ CH₃	CH₃	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		CF <sub>3</sub>	2,596	1	368,1
I-111	0	N N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		CF <sub>3</sub>	2,719 1,075	2	382,1
I-112 I-113	00	N	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH₃ CH₃	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		CF <sub>3</sub>	2,775		412,2
I-113	00	N	<u>Сп<sub>2</sub>ОСп<sub>3</sub></u> Н	CH₃ CH₃	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> - -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		CF <sub>3</sub>	0,948	2	398,1 354,2
I-114	00	C	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃ CH₃	-(СП <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	0,948	2	371,4
I-115	00	С	H	CH₃ CH₃	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		CF <sub>3</sub>	0,812	2	353,2
I-110	0	С	CH₃	CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		CF <sub>3</sub>	0,917	2	367,1
I-117	0	С	CH₂CH₃	CH₃ CH₃	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		CF <sub>3</sub>	0,917	2	381,1
I-118	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃ CH₃	-(CH2)5- -CH2CH20CH2		CF <sub>3</sub>	0,975	2	384,1
I-119	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃ CH₃	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH		CF <sub>3</sub>	0,841	2	370,1
I-120	0	N	Н	CH₃ CH₃	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH		CF <sub>3</sub>	0,791	2	356,1
I-121	0	C	CH₃	CH₃ CH₃	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH		CF <sub>3</sub>	1,865	1	369,1
I-123	0	С	H	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH		CF <sub>3</sub>	0,761	2	355,1
I-123	0	N	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	1,717	1	290,1
I-124	0	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1,667	1	304,1
I-126	0	C	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	0,666	2	289,5
I-127	0	С	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1,538	1	303,1
I-127	0	C	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	0,717	2	317,6
I-129	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	0,747	2	318,5
I-130	0	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		CN	2,226	1	325,1
I-131	0	C	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		CN	2,343	1	338,2
			J. 1201 13	<b>○.</b> i₃	(01.12)5			_,5 10		555,2

Nº.	Т	U	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^3$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	Datos	s físicos (H MS)	PLC /
								RT [min]	Método	m/z [MH]+
I-132	0	N	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> F	CH <sub>3</sub>	Н	0,654	2	264,0
I-133	0	N	CH₃	CH <sub>3</sub>	CH₂F	CH <sub>3</sub>	H	0,645	2	278,3
I-134	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃	CH₂F	CH₃	Н	0,719	2	292,3
I-135	0	С	CH₂CH₃	CH <sub>3</sub>	CH₂F	CH <sub>3</sub>	Н	0,684	2	291,2
I-136	0	С	Н	CH <sub>3</sub>	CH₂F	CH₃	Н	1,443	1	263,1
I-137	0	С	CH₃	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> F	CH <sub>3</sub>	Н	1,008	1	277,1
I-138	0	С	Н	CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		CN	2,275	1	310,1
I-139	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		CN	0,906	2	339,5
I-140	0	N	H	CH <sub>3</sub>	CHFCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	0,708	2	278,2
						_		(A)		
I-141	0	N	CH₃	CH₃	CHFCH <sub>3</sub>	CH₃	Н	0,708 (A)	2	292,5
I-142	0	Ν	CH₂CH₃	CH₃	CHFCH₃	CH₃	Н	0,765 (A)	2	306,1
I-143	0	С	Н	CH₃	CHFCH₃	CH₃	Н	0,686 (A)	2	277,3
I-144	0	С	CH₃	CH <sub>3</sub>	CHFCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	0,677 (A)	2	291,2
I-145	0	С	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃	CHFCH <sub>3</sub>	CH₃	Н	0,731 (A)	2	305,5
I-146	0	N	Н	CH <sub>3</sub>	CHFCH₃	CH₃	Н	0,698 (B)	2	278,1
I-147	0	N	CH₃	CH <sub>3</sub>	CHFCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	0,692 (B)	2	292,3
I-148	0	N	CH₂CH₃	CH <sub>3</sub>	CHFCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	0,743 (B)	2	306,1
I-149	0	С	Н	CH <sub>3</sub>	CHFCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	0,675 (B)	2	277,1
I-150	0	С	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-CH₂CH₂OCH	<sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	0,756 (S)	2	369,1
I-151	0	С	CH₂CH₃	CH <sub>3</sub>	-CH₂CH₂OCH	<sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	2,010 (S)	1	383,1
I-152	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CN	CH <sub>3</sub>	CH₃	0,747	2	299,3
I-153	Ō	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		CN	0,625	2	283,0
I-154	0	N	H	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		CN	0,634	2	269,1
I-154	0	N					CN		2	
			CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>			0,679		297,0
I-156	0	С	CH₂CH₃	CH <sub>3</sub>	CHFCH₃	CH₃	Н	0,656 (B)	2	305,4
I-157	0	С	CH₃	CH <sub>3</sub>	CHFCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	0,656 (B)	2	291,3
I-158	0	С	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	0,720	2	298,0
I-159	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1-CN-c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	0,717	2	325,1
I-160	Ō	N	H	CH <sub>3</sub>	CHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H	0,687	2	282,2
I-161	0	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H	0,680	2	296,3
I-161	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		CHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H	0,000	2	
				CH <sub>3</sub>						310,4
I-163	0	С	Н	CH₃	CHF <sub>2</sub>	CH₃	Н	0,666	2	281,3
I-164	0	С	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	0,706	2	309,3
I-165	0	С	CH₃	CH <sub>3</sub>	CHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	0,639	2	295,3
I-166	0	С	CH₃	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> S(O) <sub>2</sub> C		Н	0,488	2	321,2
I-167	0	С	CH₂CH₃	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> S(O) <sub>2</sub> C	:H <sub>2</sub> -	Н	0,545	2	335,2
I-168	0	N	CH₃	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N[C(O)CH		Н	0,605	2	343,2
I-169	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> S(O) <sub>2</sub> C		Н	0,603	2	336,2
I-170	Ō	C	Н	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> S(O) <sub>2</sub> C		Н	0,511	2	307,2
I-171	0	N	H	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> S(O) <sub>2</sub> C		H	0,523	2	308,2
I-172	0	N	CH₃	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> S(O) <sub>2</sub> C		H	0,523	2	322,2
I-172	0	N								
			CH₃	CH <sub>3</sub>	-CH₂SCH		Н	0,686	2	290,1
I-174	0	N	H	CH₃	-CH <sub>2</sub> SCH		H	0,693	2	276,1
I-175	0	С	Н	CH <sub>3</sub>	-CH₂SCH		Н	0,677	2	275,1
I-176	0	С	CH₃	CH <sub>3</sub>	-CH₂SCH	2-	Н	0,666	2	289,1

Nº.	Т	U	R <sup>1</sup>	$R^2$	R <sup>3</sup>	R⁴	R <sup>5</sup>	Datos	s físicos (H MS)	PLC /
								RT	Método	m/z
1.477	_	_	011 011	011	011.0011			[min]		[MH]+
I-177	0	С	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> SCH		H	0,676	2	303,1
I-178	0	N N	CH₃	CH₃	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	<u>H</u>	0,914	2	316,4
I-179	0		H	CH₃	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Н	0,909	2	302,3
I-180	0	С	H	CH₃	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H :	0,873	2	301,5
I-181	0	С	CH₃	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H :	0,881	2	315,5
I-182	0	C	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H :	0,953	2	329,4
I-183	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	0,962	2	330,5
I-184	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃	-CH <sub>2</sub> SCH		H :	0,741	2	304,1
I-185	0	N	Н	CH₃	-CH <sub>2</sub> S(O)C		H	0,507	2	292,2
I-186	0	N	CH₃	CH₃	-CH <sub>2</sub> S(O)C		Ξ	0,487	2	306,2
I-187	0	С	CH₃	CH <sub>3</sub>	CN	CH₃	CH <sub>3</sub>	0,668	2	284,0
I-188	0	С	Н	CH <sub>3</sub>	CN	CH₃	CH₃	0,663	2	270,3
I-189	0	N	CH₂CH₃	CH₃	-CH <sub>2</sub> S(O)C		H	0,573	2	320,2
I-190	0	С	H	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> S(O)C		H	0,488	2	291,2
I-191	0	N	Н	CH₃	CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH₃	Н	0,987	2	316,5
I-192	0	N	CH₃	CH₃	CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH₃	Н	0,987	2	330,4
I-193	0	N	CH₂CH₃	CH₃	CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH₃	I	1,035	2	344,6
I-194	0	С	Н	CH₃	CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH₃	Η	0,946	2	315,4
I-195	0	С	CH₃	CH₃	CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH₃	Н	0,959	2	329,5
I-196	0	С	CH₂CH₃	CH₃	CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH₃	Н	1,024	2	343,6
I-197	0	N	Н	CH₃	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	0,875	2	288,3
I-198	0	Ν	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH₃	Ι	0,868	2	302,3
I-199	0	Ν	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	0,915	2	316,2
I-200	0	С	Н	CH₃	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH₃	Ι	0,841	2	287,4
I-201	0	С	CH₃	CH₃	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Η	0,835	2	301,4
I-202	0	С	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH₃	Н	0,899	2	315,4
I-203	0	Ν	Н	CH₃	CF <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Н	0,850	2	328,1
I-204	0	Ν	CH₃	CH₃	CF <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Н	0,859	2	342,0
I-205	0	Ν	CH₂CH₃	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Ι	0,917	2	356,1
I-206	0	С	Н	CH₃	CF <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Η	0,834	2	327,3
I-207	0	С	CH₃	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Н	0,842	2	341,2
I-208	0	С	CH₂CH₃	CH₃	CF <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Н	0,903	2	355,3
I-209	0	С	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	c-C₃H₅	Н	0,838	2	353,4
I-210	0	N	Н	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	c-C₃H₅	Н	0,826	2	326,2
I-211	0	N	CH₃	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	H	0,827	2	340,3
I-212	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF₃	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	H	0,873	2	354,3
I-213	0	С	Н	CH <sub>3</sub>	CF₃	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	H	0,796	2	325,2
I-214	0	С	CH₃	CH <sub>3</sub>	CF₃	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	H	0,781	2	339,0
I-215	0	N	H	CH <sub>3</sub>	1-S(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> -c- C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH₃	Н	0,661	2	350,1
I-216	0	N	CH₃	CH₃	1-S(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> -c- C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH₃	Η	0,665	2	364,1
I-217	0	N	CH₂CH₃	CH <sub>3</sub>	1-S(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> -c- C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	0,719	2	378,1
I-218	0	С	Н	CH₃	1-S(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> -c- C <sub>3</sub> H <sub>4</sub> I	CH₃	Η	0,653	2	349,1
I-219	0	С	CH₃	CH <sub>3</sub>	1-S(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> -c- C <sub>3</sub> H <sub>4</sub> I	CH₃	Н	0,651	2	363,0
I-220	0	С	CH₂CH₃	CH <sub>3</sub>	1-S(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> -c- C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH₃	Н	0,706	2	377,2
I-221	0	С	CH₃	CF <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH₃	Н	2,877	1	355,1
I-222	0	Ν	Н	CH <sub>3</sub>	1-CH <sub>3</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH₃	Н	0,816	2	286,2
I-223	0	Ν	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1-CH <sub>3</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	0,870	2	314,2

Nº.	Т	U	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R⁴	R <sup>5</sup>	Datos	s físicos (H	PLC /
								DT	MS)	/-
								RT [min]	Método	m/z [MH]+
I-224	0	С	Н	CH <sub>3</sub>	1-CH <sub>3</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH₃	Н	0,790	2	285,2
1-225	0	C	CH₃	CH <sub>3</sub>	1-CH <sub>3</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	H	0,768	2	299,2
1-226	0	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2,2-Cl <sub>2</sub> -C-C <sub>3</sub> H <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	0,827	2	354,1
1-227	0	N	H	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N[C(O)CH		H	0,624	2	329,1
1-228	0	N	 H	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CN	CH <sub>3</sub>	<u></u> Н	0,695	2	299,0
1-229	0	N	CH₃	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CN	CH <sub>3</sub>	H	0,698	2	313,1
1-230	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CN	CH <sub>3</sub>	H	0,754	2	327,2
I-231	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	0,808	2	342,1
1-232	0	N	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	0,760	2	314,1
1-233	0	N	CH₃	CH <sub>3</sub>	1-CH <sub>3</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	H	0,817	2	300,2
1-234	0	C	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2,2-Cl <sub>2</sub> -C-C <sub>3</sub> H <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	0,795	2	353,1
1-254			O1 13	0113	2,2-012-0-03113	0113	• • • • • • • • • • • • • • • • • • • •	(S)	_	333,1
I-235	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃	2,2-Cl <sub>2</sub> -C-C <sub>3</sub> H <sub>3</sub>	CH₃	Н	0,883	2	368,1
1.000			011.011	011	0.001.0011	011		(S)		007.4
I-236	0	С	CH₂CH₃	CH <sub>3</sub>	$2,2-Cl_2-C-C_3H_3$	CH₃	Н	0,848 (S)	2	367,1
I-237	0	N	Н	CH <sub>3</sub>	2.2.01.0.0.11.	CH <sub>3</sub>	Н	0,831	2	340,1
I-238	0	N	п СН₃	CH <sub>3</sub>	2,2-Cl <sub>2</sub> -C-C <sub>3</sub> H <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	<u>п</u> Н	0,831	2	328,1
I-239	00	N	<u>СП3</u> Н	CH <sub>3</sub>	1-SCH <sub>3</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH₃ CH₃	<u>п</u> Н	0,752	2	318,0
1-239	0	N	 CH₃	CH <sub>3</sub>		CH <sub>3</sub>	<u>п</u> Н	0,820	2	332,0
I-240	0	N	CH₂CH₃	CH <sub>3</sub>	1-SCH <sub>3</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	<u>п</u> Н	0,818	2	
1-241	0	С	Н	CH <sub>3</sub>	1-SCH <sub>3</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub> 1-SCH <sub>3</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH₃ CH₃	<u>п</u> Н	0,873	2	346,0 317,0
1-242	0	С	 CH₃	CH <sub>3</sub>		CH₃ CH₃	<u>п</u> Н	0,783	2	
I-243	0	С			1-SCH <sub>3</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>		<u>п</u>			331,0
	_	С	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1-SCH <sub>3</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH₃		0,849	2	345,2
I-245	0	С	H	CH <sub>3</sub>	2,2-Cl <sub>2</sub> -C-C <sub>3</sub> H <sub>3</sub>	CH₃	<u>H</u>	0,801	2	339,1
I-246	O	C	CH₂CH₃	CH₃	1-CH <sub>3</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	0,828 (S)	2	313,2
I-247	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	C (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	Н	0,986	2	370,3
I-248	0	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	C (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	Н	0,926	2	356,5
I-249	0	N	H	CH₃	CF <sub>3</sub>	C (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	Н	0,909	2	342,4
I-250	0	N	Н	CH <sub>3</sub>	1-CF <sub>3</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	2,417	1	340,1
I-251	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1-CF <sub>3</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	2,535	1	368,2
I-252	0	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1-CF <sub>3</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	0,865	2	354,1
I-253	0	N	H	CH <sub>3</sub>	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	CH₃	Н	2,047	1	272,1
I-254	0	N	CH₃	CH <sub>3</sub>	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	CH₃	Н	2,028	1	286,2
I-255	Ō	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	0,728	2	314,1
I-256	0	N	Н	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	2,025	1	300,1
I-257	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	0,798	2	328,1
1-258	0	N	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	c-C₃H₅	CH <sub>3</sub>	H	2,133	1	316,2
I-259	Ō	N	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	2,483	1	344,1
I-260	Ō	C	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1,801	1	285,1
I-261	Ō	C	H	CH <sub>3</sub>	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1,965	1	271,1
I-262	Ō	C	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1,954	1	315,1
I-263	Ö	Č	Н	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1,889	1	299,0
I-264	Ō	C	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	1,768	1	313,1
I-265	Ö	Č	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	H	1,976	1	299,2
I-266	0	C	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	1,927	1	327,1
I-267	Ö	Č	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	0,776	2	343,0
I-268	0	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	9,0 (E+)	3	,-
I-269	0	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	10,7	3	
I-270	0	N	CH₃	CH <sub>3</sub>	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	(E-) 12,1	4	
I-271	0	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	c-C₃H₅	CH₃	Н	(E-) 13,5	4	
								(E+)		

Abreviaturas:

- (A), (B): diastereómero A, y B, resp.
- (S): sal de ácido trifluoroacético
- (E+): (+)-enantiómero
- (E-): (-)-enantiómero
- 5 B. Eiemplos biológicos

10

30

35

40

45

La actividad de los compuestos de fórmula I de la presente invención pudo demostrarse y evaluarse en pruebas biológicas descritas a continuación.

Si no se especifica de otra forma, las disoluciones de prueba se prepararon tal como sigue: Se disolvió el compuesto activo a la concentración deseada en una mezcla de agua destilada:acetona 1:1 (vol:vol). Se preparó la disolución de prueba en el día de uso y en general a concentraciones de ppm (p/vol).

B.1 Áfido de la judía careta (Aphis craccivora)

Se pulverizaron plantas de judía careta plantadas en maceta colonizadas con 100 - 150 áfidos de diversos estadios tras haberse registrado la población de plaga. Se evaluó la reducción de población tras 24, 72 y 120 horas.

En esta prueba, los compuestos I-1, I-2, I-3, I-4, I-5, I-6, I-7, I-8, I-9, I-10, I-11, I-12, I-13, I-14, I-15, I-16, I-17, I-18, I-15 19, I-20, I-21, I-22, I-23, I-24, I-25, I-26, I-27, I-28, I-29, I-30, I-31, I-32, I-33, I-34, I-35, I-36, I-37, I-38, I-39, I-40, I-41, I-42, I-43, I-44, I-45, I-46, I-47, I-48, I-50, I-51, I-52, I-53, I-54, I-55, I-56, I-57, I-58, I-59, I-60, I-61, I-62, I-63, I-64, I-62, I-63, I-64, I-62, I-63, I-64, 65, I-66, I-67, I-68, I-69, I-70, I-71, I-72, I-74, I-75, I-76, I-77, I-78, I-79, I-80, I-81, I-82, I-83, I-84, I-85, I-86, I-87, I-88, I-91, I-92, I-93, I-94, I-95, I-96, I-97, I-98, I-99, I-100, I-101, I-102, I-103, I-104, I-105, I-106, I-107, I-108, I-109, I-110, I-111, I-112, I-113, I-114, I-115, I-116, I-117, I-118, I-119, I-120, I-121, I-122, I-123, I-124, I-125, I-126, I-127, I-128, I-129, I-130, I-131, I-132, I-133, I-134, I-135, I-136, I-137, I-138, I-139, I-140, I-141, I-142, I-143, I-144, I-145, I-146, I-20 147, I-148, I-149, I-151, I-152, I-153, I-154, I-155, I-156, I-157, I-158, I-159, I-160, I-161, I-162, I-163, I-164, I-165, I-166, I-167, I-169, I-170, I-171, I-174, I-175, I-176, I-177, I-178, I-184, I-187, I-188, I-189, I-190, I-191, I-192, I-193, I-194, I-195, I-196, I-197, I-198, I-199, I-200, I-201, I-202, I-203, I-204, I-205, I-206, I-207, I-208, I-209, I-210, I-211, I-212, I-213, I-214, I-215, I-216, I-217, I-218, I-219, I-220, I-221, I-253, I-254, I-255, I-256, I-257, I-258, I-259, I-260, I-25 261, I-262, I-263, I-264, I-265, I-266, I-267, I-268, I-269, I-270 y I-271 a 500 ppm mostraron una mortalidad de al menos el 75% en comparación con los controles no tratados.

B.2 Áfido del algodón (*Aphis gossypii*, estadios vitales mezclados)

Se formularon los compuestos activos en ciclohexanona como una disolución de 10.000 ppm suministrada en tubos ABgene® de 1,3 ml. Se insertaron estos tubos en una pulverizadora electrostática automatizada equipada con una boquilla de atomización y sirvieron como disoluciones madre para las cuales se prepararon diluciones inferiores en agua:acetona 1:1 (vol:vol). Se incluyó un tensioactivo no iónico (Kinetic®) en la disolución a un volumen del 0,01% (v/v).

Se infestaron plantas de algodón en el estadio de cotiledón con áfidos antes del tratamiento colocando una hoja altamente infestada de la colonia principal de áfidos en la parte superior de cada cotiledón. Se dejó que los áfidos se transfirieran durante la noche para lograr una infestación de 80-100 áfidos por planta y se retiró la hoja huésped. Después se pulverizaron las plantas infestadas mediante un pulverizador de plantas electrostático automatizado equipado con una boquilla de pulverización de atomización. Se secaron las plantas en la campana extractora del pulverizador, se retiraron del pulverizador y después se mantuvieron en una cámara de crecimiento bajo iluminación fluorescente en un fotoperiodo de 24 h a 25°C y una humedad relativa del 20-40%. Se determinó la mortalidad de los áfidos sobre las plantas tratadas, en relación a la mortalidad en las plantas de control no tratadas después de 5 días.

En esta prueba, los compuestos I-1, I-4, I-5, I-6, I-7, I-9, I-10, I-11, I-12, I-13, I-14, I-15, I-16, I-17, I-18, I-20, I-21, I-22, I-23, I-24, I-26, I-27, I-28, I-29, I-30, I-31, I-32, I-33, I-35, I-36, I-38, I-39, I-42, I-43, I-44, I-45, I-46, I-47, I-48, I-51, I-60, I-61, I-62, I-63, I-64, I-66, I-67, I-75, I-76, I-77, I-78, I-79, I-80, I-81, I-83, I-85, I-87, I-88, I-90, I-91, I-92, I-93, I-94, I-95, I-96, I-97, I-98, I-99, I-100, I-101, I-102, I-103, I-104, I-105, I-106, I-107, I-109, I-112, I-114, I-115, I-120, I-122, I-124, I-125, I-126, I-127, I-128, I-129, I-131, I-132, I-133, I-134, I-135, I-136, I-138, I-141, I-143, I-151, I-152, I-153, I-154, I-155, I-156, I-157, I-158, I-159, I-160, I-161, I-162, I-163, I-164, I-165, I-166, I-167, I-198, I-204, I-209, I-213, I-218, I-253, I-254, I-255, I-256, I-257, I-258, I-259, I-260, I-261, I-262, I-263, I-264, I-265, I-266, I-267, I-268, I-269, I-270 y I-271 a 10 ppm mostraron una mortalidad de al menos el 75% en comparación con los controles no tratados.

50 B.3 Mosca blanca de la hoja plateada (Bemisia argentifolii, adulta)

Se formularon los compuestos activos en ciclohexanona como una disolución de 10.000 ppm suministrada en tubos ABgene® de 1,3 ml. Se insertaron estos tubos en una pulverizadora electrostática automatizada equipada con una boquilla de pulverización y sirvieron como disoluciones madre para las que se prepararon diluciones inferiores en agua:acetona 1:1 (vol:vol). Se incluyó un tensioactivo no iónico (Kinetic®) en la disolución a un volumen del 0,01% (v/v).

Se pulverizaron plantas de algodón en el estadio de cotiledón (una planta por maceta) mediante una pulverizadora de plantas electrostática automatizada equipada con una boquilla de pulverización atomizadora. Se secaron las plantas en la campana extractora de la pulverizadora y luego se retiraron de la pulverizadora. Se puso cada maceta en una cubeta de plástico y se introdujeron de 10 a 12 adultos de mosca blanca (aproximadamente de 3-5 días de edad). Se recogieron los insectos usando un aspirador y tubos Tygon® no tóxicos de 0,6 cm (R-3603) conectados a una punta de pipeta con barrera. Entonces se insertó suavemente la punta, que contenía los insectos recogidos, en el terreno que contenía la planta tratada, permitiendo a los insectos salir de la punta para alcanzar el follaje para que se alimentaran. Se cubrieron las cubetas con una tapa con rejilla reutilizable (rejilla de poliéster de malla de 150 micrómetros Pe-Cap de Tetko, Inc.). Se mantuvieron las plantas de prueba en una sala de crecimiento a 25°C y una humedad relativa del 20-40% durante 3 días, evitando la exposición directa a la luz fluorescente (fotoperiodo de 24 horas) para evitar el atrapamiento de calor dentro de la cubeta. Se evaluó la mortalidad 3 días después del tratamiento, en comparación con plantas control no tratadas.

En esta prueba, los compuestos I-4, I-5, I-6, I-7, I-8, I-9, I-10, I-11, I-12, I-13, I-14, I-18, I-20, I-21, I-22, I-23, I-24, I-27, I-28, I-29, I-30, I-31, I-32, I-33, I-35, I-39, I-43, I-46, I-61, I-63, I-67, I-68, I-76, I-79, I-85, I-87, I-88, I-90, I-91, I-92, I-93, I-94, I-96, I-97, I-98, I-102, I-103, I-104, I-105, I-109, I-113, I-115, I-119, I-120, I-124, I-126, I-128, I-129, I-130, I-133, I-134, I-135, I-136, I-137, I-139, I-141, I-143, I-152, I-153, I-154, I-155, I-156, I-159, I-162, I-163, I-165, I-193, I-199, I-204, I-253, I-254, I-255, I-256, I-257, I-258, I-259, I-263, I-264, I-266 y I-267 a 10 ppm mostraron una mortalidad de al menos el 75% en comparación con los controles no tratados.

B.4 Áfido de la algarroba (Megoura viciae)

10

15

20

30

35

40

50

55

25 Se formularon los compuestos activos en agua:DMSO 3:1 (vol:vol) con diferentes concentraciones de compuestos formulados.

Se colocaron discos de hojas de la judía en placas de microtitulación llenas con el 0,8% de agar-agar y 2,5 ppm de OPUS<sup>TM</sup>. Se pulverizaron los discos de hojas con 2,5 μl de la disolución de prueba y se colocaron de 5 a 8 áfidos adultos en las placas de microtitulación, que después se cerraron y se mantuvieron a 23 ± 1°C y a una humedad relativa del 50 ± 5% con luz fluorescente durante 6 días. Se evaluó la mortalidad basándose en los áfidos vitales reproducidos. Entonces se evaluó visualmente la mortalidad y la fecundidad de los áfidos.

En esta prueba, los compuestos I-1, I-2, I-3, I-4, I-5, I-6, I-7, I-8, I-9, I-10, I-11, I-12, I-13, I-14, I-15, I-16, I-17, I-18, I-19, I-20, I-21, I-22, I-23, I-24, I-25, I-26, I-27, I-28, I-29, I-30, I-31, I-32, I-33, I-34, I-35, I-36, I-38, I-41, I-42, I-43, I-44, I-45, I-46, I-47, I-48, I-49, I-50, I-51, I-52, I-53, I-54, I-55, I-57, I-58, I-59, I-60, I-61, I-62, I-63, I-64, I-65, I-66, I-67, I-68, I-69, I-70, I-71, I-72, I-74, I-75, I-76, I-77, I-78, I-79, I-80, I-81, I-82, I-83, I-84, I-85, I-86, I-87, I-88, I-91, I-92, I-93, I-94, I-95, I-96, I-97, I-98, I-99, I-100, I-101, I-102, I-103, I-104, I-105, I-106, I-107, I-108, I-109, I-112, I-113, I-114, I-115, I-116, I-117, I-118, I-119, I-120, I-121, I-122, I-123, I-124, I-125, I-126, I-127, I-128, I-129, I-131, I-132, I-133, I-134, I-135, I-136, I-137, I-138, I-140, I-141, I-142, I-143, I-144, I-145, I-146, I-147, I-148, I-149, I-150, I-151, I-152, I-153, I-154, I-155, I-156, I-157, I-158, I-173, I-174, I-175, I-176, I-177, I-178, I-179, I-180, I-181, I-182, I-183, I-185, I-187, I-188, I-190, I-215, I-216, I-217, I-218, I-219, I-220, I-253, I-254, I-255, I-256, I-257, I-258, I-259, I-260, I-261, I-262, I-263, I-264, I 265, I-266, I-267, I-268, I-269, I-270 y I-271 at 2500 ppm mostraron una mortalidad de al menos el 75% en comparación con los controles no tratados.

B.5 Áfido verde del melocotonero (*Myzus persicae*)

Se formularon los compuestos activos en ciclohexanona como una disolución de 10.000 ppm suministrada en tubos ABgene® de 1,3 ml. Se insertaron estos tubos en una pulverizadora electrostática automatizada equipada con una boquilla de pulverización y sirvieron como disoluciones madre para las que se prepararon diluciones inferiores en agua:acetona 1:1 (vol:vol). Se incluyó un tensioactivo no iónico (Kinetic®) en la disolución a un volumen del 0,01% (v/v).

Se infestaron plantas de pimiento morrón en el primer estadio de hoja verdadera antes del tratamiento colocando hojas fuertemente infestadas de la colonia principal sobre la parte superior de las plantas de tratamiento. Se dejó que se transfirieran los áfidos durante la noche para lograr una infestación de 30-50 áfidos por planta y se retiraron las hojas del huésped. Entonces se pulverizaron las plantas infestadas mediante una pulverizadora de plantas electrostática automatizada equipada con una boquilla de pulverización atomizadora. Se secaron las plantas en la campana extractora de la pulverizadora, se retiraron y entonces se mantuvieron en una sala de crecimiento bajo iluminación fluorescente en un fotoperiodo de 24 horas a 25°C y una humedad relativa del 20-40%. Se determinó la

mortalidad en las plantas tratadas, en relación con la mortalidad en plantas control no tratadas, tras 5 días.

En esta prueba, los compuestos I-1, I-2, I-4, I-5, I-6, I-7, I-8, I-9, I-10, I-11, I-12, I-13, I-14, I-15, I-16, I-17, I-18, I-19, I-20, I-21, I-22, I-23, I-24, I-27, I-28, I-29, I-30, I-31, I-32, I-33, I-34, I-35, I-36, I-37, I-38, I-39, I-42, I-43, I-44, I-45, I-46, I-47, I-48, I-50, I-60, I-61, I-62, I-63, I-64, I-66, I-67, I-69, I-71, I-74, I-75, I-76, I-77, I-78, I-79, I-80, I-81, I-82, I-83, I-84, I-85, I-86, I-87, I-88, I-89, I-90, I-91, I-92, I-93, I-94, I-95, I-96, I-97, I-98, I-99, I-100, I-101, I-102, I-103, I-104, I-105, I-106, I-107, I-108, I-109, I-110, I-111, I-112, I-114, I-115, I-118, I-119, I-120, I-121, I-122, I-123, I-124, I-125, I-126, I-127, I-128, I-129, I-131, I-132, I-133, I-134, I-135, I-136, I-137, I-138, I-139, I-141, I-143, I-152, I-153, I-155, I-156, I-157, I-159, I-160, I-161, I-162, I-163, I-164, I-165, I-166, I-167, I-198, I-199, I-204, I-209, I-213, I-218, I-253, I-2544, I-255, I-256, I-257, I-258, I-259, I-260, I-261, I-263, I-264, I-265, I-266, I-267, I-268, I-269, I-270 y I-271 a 10 ppm mostraron una mortalidad de al menos el 75% en comparación con los controles no tratados.

B.6 Gorgojo del algodón (Anthonomus grandis)

10

15

25

35

40

45

Se formularon los compuestos en agua:DMSO 3:1 (vol:vol).

Para evaluar el control del gorgojo del algodón (*Anthonomus grandis*) la unidad de prueba consistía en placas de microtitulación de 24 pocillos que contenían una dieta de insectos y 20-30 huevos de *A. grandis*. Se pulverizaron diferentes concentraciones de compuestos formulados sobre la dieta de insectos a 20  $\mu$ l, usando un microatomizador construido a medida, con dos repeticiones. Tras la aplicación, se incubaron las placas de microtitulación a 23  $\pm$  1°C y una humedad relativa del 50  $\pm$  5% durante 5 días. Entonces se evaluó visualmente la mortalidad de huevos y larvas.

En esta prueba, los compuestos I-67, I-85, I-92, I-94, I-95, I-96, I-98, I-102, I-104, I-113, I-123, I-128, I-134, I-154, I-20 261, I-264 y I-267 a 2500 ppm mostraron una mortalidad de al menos el 75% en comparación con los controles no tratados

B.7 Saltamontes del arroz (Nilaparvata lugens)

Se limpiaron plántulas de arroz y se lavaron 24 horas tras la pulverización. Se formularon los compuestos activos en agua:acetona 1:1 (vol:vol) y se añadió tensioactivo (EL 620) al 0,1% vol/vol. Se pulverizaron las plántulas de arroz en macetas con 5 ml de disolución de prueba, se secaron al aire, se colocaron en jaulas y se inocularon con 10 adultos. Se mantuvieron las plantas de arroz tratadas a 28-29°C y una humedad relativa del 50-60%. Se registró el porcentaje de mortalidad tras 72 horas.

En esta prueba, los compuestos I-8, I-9, I-10, I-11, I-25, I-29, I-35, I-62, I-63, I-68, I-113, I-134, I-160, I-165, I-188 y I-258 a 500 ppm mostraron una mortalidad de al menos el 75% en comparación con los controles no tratados.

30 B.8 Trips de las orquídeas (*Dichromothrips corbetti*)

Se formularon los compuestos activos como una disolución de agua:acetona 1:1 (vol:vol). Se añadió tensioactivo (Alkamuls EL 620) a la tasa del 0,1% (vol/vol). Se limpiaron pétalos de orquídeas vanda, se lavaron y se secaron al aire antes de la pulverización. Se sumergieron los pétalos en la disolución de prueba durante 3 segundos, se secaron al aire, se colocaron dentro de un plástico resellable y se inocularon con 20 adultos. Se trataron los pétalos dentro de la sala de mantenimiento a 28-29°C y una humedad relativa del 50-60%. Se registró el porcentaje de mortalidad tras 72 horas.

En esta prueba, los compuestos I-4, I-35, I-39, I-43, I-78, I-83, I-86, I-94, I-95, I-96, I-107, I-109, I-115, I-123, I-124, I-133, I-134, I-137, I-140, I-144, I-156, I-159, I-162, I-163, I-164, I-165, I-205, I-206, I-207, I-208, I-210, I-211, I-212, I-213, I-216, I-217, I-219, I-221, I-257 y I-260 a 500 ppm mostraron una mortalidad de al menos el 75% en comparación con los controles no tratados.

B.9 Saltamontes verde del arroz (Nephotettix virescens)

Se limpiaron plántulas de arroz y se lavaron 24 horas antes de la pulverización. Se formularon los compuestos activos en agua:acetona 1:1 (vol:vol), y se añadió tensioactivo (EL 620) al 0,1% vol/vol. Se pulverizaron plántulas de arroz en macetas con 5 ml de disolución de prueba, se secaron al aire, se colocaron en jaulas y se inocularon con 10 adultos. Se mantuvieron las plantas de arroz tratadas a 28-29°C y una humedad relativa del 50-60%. Se registró la mortalidad en porcentaje tras 72 horas.

En esta prueba, los compuestos I-7, I-8, I-10, I-11, I-32, I-33, I-63, I-79, I-113 y I-160 at 500 ppm mostraron una mortalidad de al menos el 75% en comparación con los controles no tratados.

#### B.10 Polilla de dorso de diamante (Plutella xilostella)

Se formularon los compuestos activos en agua:acetona 1:1 (vol:vol) y tensioactivo Alkamuls EL 620 al 0,1% (vol/vol). Se sumergió un disco de hoja de 6 cm de hojas de repollo en la disolución de prueba durante 3 segundos y se dejó secar al aire en una placa Petri revestida con papel de filtro húmedo. Se inocularon los discos de hoja con 10 larvas en el tercer estadio y se mantuvieron a 25-27°C y una humedad relativa del 50-60% durante 3 días. Se evaluó la mortalidad tras 72 h de tratamiento.

Se demostró la actividad beneficiosa de los compuestos según la invención con respecto a compuestos cercanos estructuralmente conocidos de la técnica anterior mediante los siguientes experimentos comparativos:

Las tablas muestran el % de mortalidad en comparación con controles no tratados.

Compuestos Pruebas / conc.	$\begin{array}{c} H_3C \\ NC \\ H_3C \\ \end{array} \begin{array}{c} N \\ N \\ \end{array} \begin{array}{c} N \\ N \\ \end{array} \begin{array}{c} N \\ N \\ N \\ \end{array}$	H <sub>3</sub> C H <sub>3</sub> C N.º 7 de la tabla 14 en el documento WO10/034737
B.1 / 0,3 ppm	100%	0%
B.2 / 3 ppm	90%	25%

Compuestos Pruebas / conc.	$H_3C$ $H_3C$ $NC$ $N$	H <sub>3</sub> C N N N N N N N N N N N N N N N N N N N
B.1 / 1 ppm	100%	0%
B.2 / 500 ppm	75%	0%

F		
Compuestos	H_C O N	O N
Pruebas / conc.	CH <sup>3</sup> 3 U	CH <sub>3</sub> H <sub>3</sub> C O N N
	H <sub>3</sub> C N	$I \longrightarrow I^{1/3} \longrightarrow I \longrightarrow N$
		H <sub>3</sub> C N
	H <sub>3</sub> C N CH <sub>3</sub>	\
	N.º I-98	CH <sub>3</sub>
	14. 1 50	N.º 175 de la tabla 14 en el documento
		WO10/034737
B.1 / 0,3 ppm	75%	0%
B.2 / 0,1 ppm	95%	0%
B.5 / 0,1 ppm	95%	0%
Pruebas / conc.	N.º I-98	N.º 5 de la tabla 98 en el documento
		WO10/034737
B.3 / 3 ppm	75%	0%
B.10 / 500 ppm	25% de FD*)	100% FD*)
Pruebas / conc.	N.º I-159	N.º 5 de la tabla 98 en el documento
		WO10/034737
B.3 / 1 ppm	100%	0%
B.8 / 500 ppm	75%	0%
Pruebas / conc.	N.º I-162	N.º 5 de la tabla 98 en el documento
		WO10/034737
B.3 / 1 ppm	100%	0%
B.8 / 500 ppm	63%	0%
Pruebas / conc.	N.º I-264	N.º 173 en el documento WO09/027393
B.3 / 10 ppm	75%	25%

10

B.5 / 10 ppm	100%	50%
Pruebas / conc.	N.º I-264	N.º 180 en el documento WO09/027393
B.3 / 100 ppm	100%	0%
*) FD = daño foliar	•	

#### **REIVINDICACIONES**

1. Compuestos de pirazol novedosos de fórmula I

en la que U es N o CH;

5 Tes OoS;

10

R<sup>1</sup> es H, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> o (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>;

R<sup>2</sup> es CH<sub>3</sub> o halometilo;

 $R^3$  es alquilo  $C_2$ - $C_6$ , haloalquilo  $C_1$ - $C_6$ , (alcoxi  $C_1$ - $C_2$ )-alquilo  $C_1$ - $C_2$ , alquenilo  $C_2$ - $C_6$  y alquinilo  $C_2$ - $C_6$ , cicloalquenilo  $C_5$ - $C_6$ , alcoxilo  $C_1$ - $C_6$ , CN, NO<sub>2</sub>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>b</sup>, en los que los átomos de C pueden no estar sustituidos o estar parcial o completamente sustituidos con  $R^a$ ;

R<sup>a</sup> es halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halo-alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> o S(O)<sub>n</sub>R<sup>b</sup>;

n es 0, 1, o 2;

R<sup>b</sup> es hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> o alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>,

R<sup>4</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o un grupo mencionado para R<sup>3</sup>;

15 R<sup>5</sup> es H o un grupo mencionado para R<sup>4</sup>;

 $R^3$  y  $R^4$  pueden formar juntos un carbo o heterociclo de tres a seis miembros, que puede contener 1 ó 2 heteroátomos seleccionados de N- $R^c$ , O y S, en los que S puede estar oxidado, carbo o heterociclo que puede estar sustituido con  $R^a$ ;

R° es hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, alquilcarbonilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> o (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-carbonilo;

- 20 y los estereoisómeros, sales, tautómeros y N-óxidos de los mismos.
  - 2. Compuestos de fórmula I según la reivindicación 1, en los que U es CH.
  - 3. Compuestos de fórmula I según la reivindicación 1, en los que U es N.
  - 4. Compuestos de fórmula I según la reivindicación 1, en los que T es O.
- 5. Compuestos de fórmula I según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en los que R<sup>1</sup> es H, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> o C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alcoximetilo.
  - 6. Compuestos de fórmula I según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en los que R<sup>2</sup> es CH<sub>3</sub>, CHF<sub>2</sub> o CF<sub>3</sub>.
  - 7. Compuestos de fórmula I según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en los que  $R^3$  es CN, alquilo  $C_2$ - $C_6$ , haloalquilo  $C_1$ - $C_2$ , (alcoxi  $C_1$ - $C_2$ )-alquilo  $C_1$ - $C_2$  o cicloalquilo  $C_3$ - $C_6$ , en los que los átomos de C pueden estar sustituidos.
- 30 8. Compuestos según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en los que R<sup>4</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, en los que los átomos de C pueden estar sustituidos.
  - 9. Compuestos según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en los que R<sup>5</sup> es H o CH<sub>3</sub>.

10. Compuestos de fórmula I según la reivindicación 1, que se seleccionan de la siguiente lista:

N.º	Т	U	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^3$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
1.	Ö	N	H	CH <sub>3</sub>	-CH₂CH		H
2.	0	N	Н	CH₃	CH <sub>2</sub> S(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
3.	0	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> S(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
4.	0	N	Н	CH₃	CH₂OCH₃	CH <sub>3</sub>	Н
5.	0	N	CH <sub>3</sub>	CH₃	CH₂OCH₃	CH <sub>3</sub>	Н
6.	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub>	-	Н
7.	0	N	CH <sub>3</sub>	CH₃	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub>	-	Н
8.	0	N	Н	CH₃	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub>		Н
9.	0	N	Н	CH₃	CH₂CH₃	CH <sub>3</sub>	Н
10.	0	N	CH₂CH₃	CH₃	CH₂CH₃	CH <sub>3</sub>	Н
11.	0	N	CH <sub>3</sub>	CH₃	CH₂CH₃	CH <sub>3</sub>	Н
12.	0	N	Н	CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub>		Н
13.	0	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub>	•	Н
14.	0	N	CH₂CH₃	CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub>		Н
15.	0	N	CH₂CH₃	CH₃	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub>		Н
16.	0	N	CH <sub>3</sub>	CH₃	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub>		Н
17.	0	N	CH₃	CH₃	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH₃	Н
18.	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н
19.	0	N	Н	CH₃	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub>		Н
20.	0	N	Н	CH₃	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH₃	Н
21.	0	N	Н	CH₃	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH		Н
22.	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCh		Н
23.	0	N	CH <sub>3</sub>	CH₃	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH		Н
24.	0	N	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃	c-C₃H₅	CH₃	Н
25.	0	N	Н	CH₃	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH₃	CH₃
26.	0	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
27.	0	N	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н
28.	0	N	CH <sub>3</sub>	CH₃	CF <sub>2</sub> CHFCF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н
29.	0	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н
30.	0	N	Н	CH₃	CF₂CHFCF₃	CH <sub>3</sub>	Н
31.	0	N	Н	CH₃	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н
32.	0	N	Н	CH₃	CN	CH₃	CH <sub>3</sub>
33.	0	N	CH <sub>3</sub>	CH₃	CN	CH₃	CH <sub>3</sub>
34.	0	N	Н	CH₃	CF <sub>3</sub>	CF₃	Н
35.	0	N	Н	CH₃	CN	CH₃	Н
36.	0	N	CH <sub>3</sub>	CH₃	CN	CH₃	Н
37.	0 0	N N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃	CF₃	CF₃	Н
38.	0	N	CH₃	CH₃	CF <sub>3</sub>	CF₃	H
39.	0	N	Н	CH₃	1-F-c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH₃	Н
40.			CH₃	CH₃	1-F-c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH₃	
41.	0	N	Н	CH₃	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
42. 43.	0	N N	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH₃ CH₃	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH₃ CH₃	H H
44.	0	C	<u>Сп<sub>2</sub>ОСп<sub>3</sub></u> Н	CH₃ CH₃	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH₃ CH₃	Н
44.	0	C	H CH₃	CH₃ CH₃	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH₃ CH₃	Н
45. 46.	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃ CH₃	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH₃ CH₃	Н
47.	0	N	<u>Сп<sub>2</sub>Сп<sub>3</sub></u> Н	CH₃ CH₃	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Н
48.	0	N	CH <sub>3</sub>	CH₃ CH₃	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Н
49.	0	N	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH₃ CH₃	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Н
50.	0	C	H	CH₃ CH₃	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Н
51.	0	C	CH₃	CH₃ CH₃	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Н
52.	0	N	H H	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Н
53.	0	N	CH₃	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Н
54.	0	N	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Н
55.	0	C	H	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Н
56.	0	N	Н	CF <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н
57.	0	N	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH₃ CH₃	Н
58.	0	N	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH₃ CH₃	Н
59.	0	C	H	CF <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH₃ CH₃	Н
60.	0	C	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	CH₃ CH₃	Н
00.	U	U		OI 13	U-U3I 15	OI 13	11

N.º	Т	U	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^3$	$R^4$	R <sup>5</sup>
61.	S	С	CH <sub>3</sub>	CH₃	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н
62.	S	С	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	c-C₃H₅	CH <sub>3</sub>	Н
63.	S	С	Н	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н
64.	S	С	CH₂CH₃	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н
65.	0	N	H	CH <sub>3</sub>	-CCl₂CH		Н
66.	0	N	CH₃	CH <sub>3</sub>	-CCl₂CH		Н
67.	Ō	C	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н
68.	Ö	N	H	CH <sub>3</sub>	CH=CH <sub>2</sub>	CH₃	H
69.	Ö	N	CH₃	CH <sub>3</sub>	CH=CH <sub>2</sub>	CH₃	H
70.	Ö	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H
71.	0	N	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H
72.	0	C	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H
73.	0	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )		H
74.	0	N	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CN	CH <sub>3</sub>	Н
75.	0	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CN	CH₃	H
76.	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CN	CH <sub>3</sub>	Н
77.	0	N	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CN	CH <sub>3</sub>	H
78.	0	C	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CN	CH₃ CH₃	H
78. 79.	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃ CH₃	CH <sub>2</sub> CN CF <sub>3</sub>	Сн₃ СН₃	CH <sub>3</sub>
79. 80.	0	N		CH₃ CH₃			
	0	C	Н		CF <sub>3</sub>	CH₃	CH₃
81.			CH₃	CH₃	CF <sub>3</sub>	CH₃	CH₃
82.	0 0	N	H	CH₃	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		CN
83.	0	С	Н	CH₃	CF <sub>3</sub>	CH₃	CH <sub>3</sub>
84.	0	С	CH₃	CH₃	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> .		CN
85.	0	N	CH₃	CH₃	CF₃	CH₃	CH₃
86.	0	С	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
87.	0	N	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
88.	0	N	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH₃	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
89.	0	N	Н	CH₃	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )		Н
90.	0	С	Н	CH₃	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> )		Н
91.	0	С	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH₃	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
92.	0	N	CH₃	CH <sub>3</sub>	1-CN-c-C₃H₄	CH₃	Н
93.	0	N	Н	CH₃	1-CN-c-C₃H₄	CH <sub>3</sub>	Н
94.	0	С	Н	CH₃	CH₂CN	CH <sub>3</sub>	Н
95.	0	N	Н	CH₃	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH₃	Н
96.	0	N	CH₃	CH₃	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH₃	Н
97.	0	N	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH₃	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH₃	Н
98.	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н
99.	0	С	Н	CH₃	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH₃	Н
100.	0	С	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н
101.	0	С	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH₃	Н
102.	0	N	Н	CH₃	CF <sub>3</sub>	CH₂CH₃	Н
103.	0	N	CH₃	CH₃	CF <sub>3</sub>	CH₂CH₃	Н
104.	0	N	CH₂CH₃	CH₃	CF <sub>3</sub>	CH₂CH₃	Н
105.	0	N	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH₂CH₃	Н
106.	0	С	Н	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH₂CH₃	Н
107.	0	С	CH <sub>3</sub>	CH₃	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Н
108.	0	С	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH₃	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Н
109.	0	C	CH <sub>3</sub>	CH₃	CH₂CN	CH <sub>3</sub>	Н
110.	0	N	CH₃	CH₃	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		CF <sub>3</sub>
111.	Ö	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> ·		CF <sub>3</sub>
112.	Ö	N	H <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> ·		
113.	Ō	N	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> ·		CF₃ CF₃
114.	Ö	N	H	CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> ·		CF <sub>3</sub>
115.	Ö	C	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH₃	CH <sub>3</sub>
116.	Ö	C	H	CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> .		CF <sub>3</sub>
117.	0	C	CH₃	CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> ·		CF <sub>3</sub>
118.	0	C	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> .		CF <sub>3</sub>
119.	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH		CF <sub>3</sub>
120.	0	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH		CF <sub>3</sub>
120.	0	N	H	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH		CF <sub>3</sub>
121.	0	C	CH₃	CH <sub>3</sub>			CF <sub>3</sub>
122.		U	OI 13	OI 13	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -		UF3

N.º	Т	U	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	$R^3$	$R^4$	R <sup>5</sup>
123.	0	С	Н	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCh		CF <sub>3</sub>
124.	0	N	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н
125.	0	N	CH₃	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н
126.	0	С	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н
127.	0	C	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н
128.	Ö	C	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH₃	H
129.	Ō	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH₃	H
130.	0	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub>		CN
131.	0	C	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub>		CN
131.	0	N	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> F	- CH₃	H
	0	N					Н
133.			CH₃	CH <sub>3</sub>	CH₂F	CH₃	
134.	0	N	CH₂CH₃	CH₃	CH₂F	CH₃	Н
135.	0	С	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH₂F	CH₃	Н
136.	0	С	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> F	CH <sub>3</sub>	Н
137.	0	С	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH₂F	CH <sub>3</sub>	Н
138.	0	С	Н	CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub>		CN
139.	0	N	CH₂CH₃	CH₃	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub>		CN
140.	0	N	Н	CH <sub>3</sub>	CHFCH₃	CH <sub>3</sub>	Н
141.	0	Ν	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CHFCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н
142.	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CHFCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н
143.	0	С	H	CH <sub>3</sub>	CHFCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н
144.	0	С	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CHFCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н
145.	Ō	Č	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CHFCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н
146.	Ō	N	H	CH <sub>3</sub>	CHFCH <sub>3</sub>	CH₃	H
147.	Ö	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CHFCH <sub>3</sub>	CH₃	H
148.	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CHFCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
149.	0	C	H	CH <sub>3</sub>	CHFCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	0	C	п СН₃				CF <sub>3</sub>
150.				CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH		
151.	0	С	CH₂CH₃	CH₃	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH		CF <sub>3</sub>
152.	0	N	CH₂CH₃	CH <sub>3</sub>	CN	CH₃	CH <sub>3</sub>
153.	0	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH		CN
154.	0	N	Н	CH <sub>3</sub>	-CH₂CH		CN
155.	0	N	CH₂CH₃	CH <sub>3</sub>	-CH₂CH		CN
156.	0	С	CH₂CH₃	CH <sub>3</sub>	CHFCH <sub>3</sub>	CH₃	Н
157.	0	С	CH₃	CH₃	CHFCH₃	CH₃	Н
158.	0	С	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CN	CH <sub>3</sub>	CH₃
159.	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1-CN-c-C₃H₄	CH <sub>3</sub>	Н
160.	0	N	Н	CH <sub>3</sub>	CHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н
161.	0	N	CH₃	CH <sub>3</sub>	CHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н
162.	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Н
163.	Ö	С	H	CH <sub>3</sub>	CHF <sub>2</sub>	CH₃	H
164.	0	C	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CHF <sub>2</sub>	CH₃	H
165.	0	C	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CHF <sub>2</sub>	CH₃	H
166.	0	C	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> S(O) <sub>2</sub> (		H
167.	0	С	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> S(O) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O) <sub>2</sub> C		H
168.	0	N		CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N[C(O)Cl		Н
169.	0	N	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		-CH2CH2N[C(O)CI		Н
				CH₃	` /		
170.	0	С	<u>H</u>	CH₃	-CH <sub>2</sub> S(O) <sub>2</sub> (		H
171.	0	N	Н	CH₃	-CH <sub>2</sub> S(O) <sub>2</sub> (		Н
172.	0	N	CH₃	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> S(O) <sub>2</sub> (		Н
173.	0	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> SCH		Н
174.	0	N	Н	CH <sub>3</sub>	-CH₂SC⊦		Н
175.	0	С	Н	CH <sub>3</sub>	-CH₂SC⊦		Н
176.	0	С	CH₃	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> SCH		Н
177.	0	С	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-CH₂SC⊦	H <sub>2</sub> -	Н
178.	0	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Н
179.	0	N	H	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Н
180.	Ö	C	H	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
181.	Ö	C	CH₃	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
182.	0	C	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
183.	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
184.	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> SC		H
104.		IN	OF 12O□3	UI 13	-UП <sub>2</sub> 3UF	12-	11

N.º	Т	U	$R^1$	$R^2$	$R^3$	R⁴	R <sup>5</sup>
185.	0	N	Н	CH₃	-CH <sub>2</sub> S(O)(		Н
186.	0	N	CH₃	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> S(O)C		Н
187.	0	С	CH₃	CH <sub>3</sub>	CN	CH₃	CH <sub>3</sub>
188.	0	С	Н	CH <sub>3</sub>	CN	CH₃	CH <sub>3</sub>
189.	0	N	CH₂CH₃	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> S(O)(		Н
190.	0	С	Н	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> S(O)C	CH <sub>2</sub> -	Н
191.	0	N	Н	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH₃	Н
192.	0	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH₃	H
193.	0	N	CH₂CH₃	CH₃	CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH₃	H
194.	0	С	Н	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH₃	H
195.	0	С	CH₃	CH₃	CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH₃	Н
196.	0	C N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃	CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH₃	H
197. 198.	0	N	H CH₃	CH₃ CH₃	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH₃ CH₃	Н
198.	00	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH₃ CH₃	Н
200.	0	C	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H
201.	0	C	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H
202.	0	C	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H
203.	0	N	H	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
204.	0	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
205.	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
206.	0	C	H	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
207.	0	C	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
208.	0	C	CH₂CH₃	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
209.	0	C	CH₂CH₃	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	c-C₃H₅	Н
210.	0	N	Н	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	c-C₃H₅	Н
211.	0	N	CH₃	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	c-C₃H₅	Н
212.	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	c-C₃H₅	Н
213.	0	С	Н	CH <sub>3</sub>	CF₃	c-C₃H₅	Н
214.	0	С	CH₃	CH <sub>3</sub>	CF₃	c-C₃H₅	Н
215.	0	N	Н	CH₃	1-S(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH₃	Н
216.	0	N	CH₃	CH₃	1-S(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH₃	Н
217.	0	N	CH₂CH₃	CH <sub>3</sub>	1-S(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH₃	Н
218.	0	С	Н	CH <sub>3</sub>	1-S(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub> I	CH₃	Н
219.	0	С	CH₃	CH <sub>3</sub>	1-S(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub> I	CH₃	Н
220.	0	С	CH₂CH₃	CH <sub>3</sub>	1-S(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH₃	Н
221.	0	С	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH₃	Н
222.	0	N	Н	CH <sub>3</sub>	1-CH <sub>3</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH₃	H
223.	0	N	CH₂CH₃	CH₃	1-CH <sub>3</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH₃	Н
224.	0	С	Н	CH <sub>3</sub>	1-CH <sub>3</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH₃	H
225.	0	C	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1-CH <sub>3</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH₃	H
226.	0	N N	CH₃	CH₃	2,2-Cl <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>3</sub>	CH₃	H
227. 228.	0	N	H H	CH₃ CH₃	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N[C(O)CI C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CN	-13]СH2СH2- СН3	H
229.	00	N	⊓ CH₃	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CN C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CN	CH <sub>3</sub>	Н
230.	0	N	CH₂CH₃	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CN C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CN	CH₃ CH₃	Н
231.	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
232.	0	N	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH₃	H
233.	0	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1-CH <sub>3</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	H
234.	0	C	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2,2-Cl <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>3</sub>	CH₃	H
235.	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2,2-Cl <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>3</sub>	CH₃	H
236.	0	С	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2,2-Cl <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>3</sub>	CH₃	Н
237.	0	N	Н	CH <sub>3</sub>	2,2-Cl <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>3</sub>	CH₃	Н
238.	0	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н
239.	0	N	Н	CH <sub>3</sub>	1-SCH <sub>3</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	Н
240.	0	N	CH₃	CH <sub>3</sub>	1-SCH₃-c-C₃H₄	CH₃	Н
241.	0	N	CH₂CH₃	CH <sub>3</sub>	1-SCH₃-c-C₃H₄	CH₃	Н
242.	0	С	Н	CH <sub>3</sub>	1-SCH₃-c-C₃H₄	CH₃	Н
243.	0	С	CH₃	CH₃	1-SCH <sub>3</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH₃	Н
244.	0	С	CH₂CH₃	CH₃	1-SCH <sub>3</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH₃	Н
245.	0	С	Н	CH <sub>3</sub>	2,2-Cl <sub>2</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>3</sub>	CH₃	Н
246.	0	С	CH₂CH₃	CH <sub>3</sub>	1-CH <sub>3</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH₃	Н

N.º	Т	U	$R^1$	$R^2$	$R^3$	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
247.	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃	CF₃	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	Н
248.	0	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF₃	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	Н
249.	0	N	Н	CH <sub>3</sub>	CF₃	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	Н
250.	0	N	Н	CH <sub>3</sub>	1-CF <sub>3</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	Н
251.	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1-CF <sub>3</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	Н
252.	0	N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	1-CF <sub>3</sub> -c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	Н
253.	0	Ν	Н	CH <sub>3</sub>	c-C₃H₅	CH <sub>3</sub>	Н
254.	0	Ν	CH₃	CH <sub>3</sub>	c-C₃H₅	CH <sub>3</sub>	Н
255.	0	Ν	CH₃	CH <sub>3</sub>	CF₃	CH₃	Н
256.	0	Ν	Н	CH₃	CF₃	CH₃	Н
257.	0	Ν	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃	CF₃	CH₃	Н
258.	0	N	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH₃	c-C₃H₅	CH₃	Н
259.	0	Ν	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH₃	CF₃	CH₃	Н
260.	0	С	CH₃	CH₃	c-C₃H₅	CH₃	Н
261.	0	С	Н	CH₃	c-C₃H₅	CH₃	Н
262.	0	С	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH₃	c-C₃H₅	CH₃	Н
263.	0	С	Н	CH₃	CF₃	CH₃	Н
264.	0	С	CH₃	CH₃	CF₃	CH₃	Н
265.	0	С	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃	c-C₃H₅	CH₃	Н
266.	0	С	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃	CF₃	CH₃	Н
267.	0	С	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH₃	CF₃	CH₃	Н
268.	0	N	CH <sub>3</sub>	CH₃	CF₃	CH₃	Н
269.	0	N	CH₃	CH₃	CF₃	CH₃	Н
270.	0	N	CH₃	CH₃	c-C₃H₅	CH₃	Н
271.	0	Ν	CH₃	CH₃	c-C₃H₅	CH₃	Н

11. Compuestos de fórmula I según la reivindicación 1. que se seleccionan de la siguiente lista:

N.º	T	U	R <sup>1</sup>	$R^2$	$R^3$	R⁴	R⁵
32.	0	N	Н	CH₃	CN	CH₃	CH₃
98.	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH₃	Н
159.	0	N	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH₃	1-CN-c-C <sub>3</sub> H <sub>4</sub>	CH₃	Н
162.	0	С	CH₃	CH₃	CHF <sub>2</sub>	CH₃	Н
264.	0	С	CH₃	CH₃	CF <sub>3</sub>	CH₃	Н

- 12. Composición que comprende al menos un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11 y al menos un portador líquido y/o sólido inerte.
- 13. Composición agrícola para combatir plagas animales que comprende al menos un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11 y al menos un portador aceptable líquido y/o sólido inerte y, si se desea, al menos un tensioactivo.
  - 14. Método no terapéutico para combatir o controlar plagas de invertebrados, método que comprende poner en contacto dicha plaga o su fuente de alimentos, hábitat o lugar de incubación con una cantidad eficaz desde el punto de vista pesticida de al menos un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11.
- 15. Método para proteger plantas en crecimiento frente al ataque o infestación por plagas de invertebrados, método que comprende poner en contacto una planta, o terreno o agua en el que está creciendo la planta, con una cantidad eficaz desde el punto de vista pesticida de al menos un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11.
  - 16. Semilla que comprende un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11, o los enantiómeros, diastereómeros o sales del mismo, en una cantidad de desde 0,1 g hasta 10 kg por 100 kg de semilla.
- 15 17. Uso de los compuestos según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11, para proteger plantas en crecimiento frente al ataque o infestación por plagas de invertebrados.