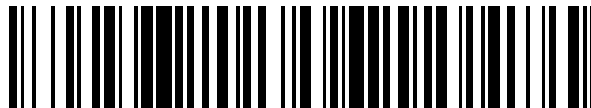


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 575 566**

51 Int. Cl.:

C07D 401/14 (2006.01)

A01N 43/56 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **10.06.2011 E 11725429 (2)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **30.03.2016 EP 2582693**

54 Título: **Nuevos derivados de arilamida orto-sustituídos**

30 Prioridad:

15.06.2010 US 354913 P

15.06.2010 EP 10166061

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

29.06.2016

73 Titular/es:

**BAYER INTELLECTUAL PROPERTY GMBH
(100.0%)**

**Alfred-Nobel-Strasse 10
40789 Monheim, DE**

72 Inventor/es:

**FISCHER, RÜDIGER;
FUNKE, CHRISTIAN;
GRONDAL, CHRISTOPH;
GESING, ERNST RUDOLF;
HEIL, MARKUS;
WROBLOWSKY, HEINZ-JUERGEN;
BECKER, ANGELA;
VOERSTE, ARND y
GÖRGENS, ULRICH**

74 Agente/Representante:

CARPINTERO LÓPEZ, Mario

Observaciones :

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

ES 2 575 566 T3

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

DESCRIPCIÓN

Nuevos derivados de arilamida orto-sustituidos

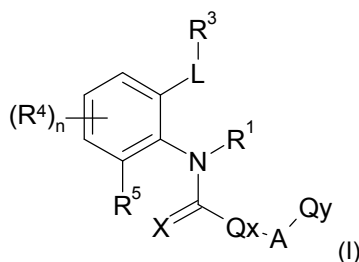
5 La presente invención se refiere a nuevos derivados de arilamida orto-sustituidos o a derivados del ácido antranílico, a su uso como insecticidas y acaricidas para controlar plagas animales, también en combinación con otros agentes para potenciar su actividad, y a varios procedimientos para su preparación.

Se han descrito ya en la bibliografía derivados de ácido antranílico con propiedades insecticidas, por ejemplo, en los documentos WO 01/70671, WO 03/015519, WO 03/016284, WO 03/015518, WO 03/024222, WO 03/016282, WO 03/016283, WO 03/062226, WO 03/027099, WO 04/027042, WO 04/033468, WO 2004/046129, WO 2004/067528, WO 2005/118552, WO 2005/077934, WO 2005/085234, WO 2006/023783, WO 2006/000336, WO 2006/040113, WO 2006/111341, WO 2007/006670, WO 2007/024833, WO2007/020877, WO 2007/144100, WO2007/043677, WO2008/126889, WO2008/126890, WO2008/126933.

No obstante, en su aplicación, los principios activos ya conocidos de acuerdo con los documentos que se han mencionado anteriormente tienen desventajas en algunos aspectos, ya sea que presentan solo un estrecho espectro de aplicación o que no tienen actividad insecticida o acaricida satisfactoria.

15 Ahora se han encontrado nuevos derivados de ácido antranílico que tienen ventajas sobre los compuestos ya conocidos, por ejemplo mejores propiedades biológicas o ecológicas, procedimientos de aplicación más amplia, una mejor actividad insecticida o acaricida y alta compatibilidad con las plantas de cultivo. Los derivados del ácido antranílico se pueden usar en combinación con otros agentes para mejorar la eficacia, en particular contra insectos que son difíciles de combatir.

20 La presente invención por consiguiente tiene por objeto nuevos derivados de arilamida orto-sustituidos o derivados de ácido antranílico de la fórmula (I)



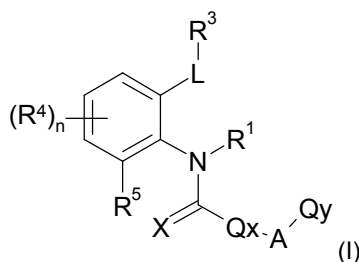
en la que

n representa 0 a 3,

25 comprendiendo los compuestos de la fórmula general (I) además N-óxidos y sales.

Dado el caso, los compuestos de la fórmula (I) pueden estar presentes en diversas formas polimorfas o como mezclas de diferentes formas polimorfas. Tanto los polimorfos puros como las mezclas polimorfas son objeto de la invención y pueden usarse de acuerdo con la invención. Los compuestos de la fórmula (I) comprenden dado el caso diastereómeros o enantiómeros.

30 La fórmula (I) proporciona una definición general y de forma particularmente preferente de los compuestos de acuerdo con la invención.



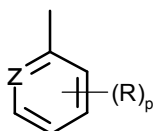
en la que

35 n representa 0 a 3,
L representa C(=K)NR²-,
K representa S,
R¹ representa hidrógeno,

- R² representa hidrógeno, metilo.
 R³ representa hidrógeno, alquilo C₁-C₄ (metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo o terc-butilo), ciclo-propilo, ciclo-butilo, ciano-alquilo C₁-C₃ (cianometilo, 1-cianoetilo, 2-cianoetilo, 1-ciano-n-propilo, 2-ciano-n-propilo, 3-ciano-n-propilo, 1-ciano-iso-propilo, 2-ciano-iso-propilo), difluorometilo, trifluorometilo, fenilo, piridilo o
 5 R³ de forma especialmente preferente representa hidrógeno, metilo, iso-propilo, ciclo-propilo, terc-butilo, difluorometilo, trifluorometilo o cianometilo.
 R⁴ representa hidrógeno, metilo, trifluorometilo, ciano, flúor, cloro, bromo, yodo o trifluorometoxi. Además, dos radicales R⁴ adyacentes de forma muy particularmente preferente representan -(CH₂)₄- o -(CH=CH)₂-.
 10 R⁴ de forma preferente representa cloro, flúor o bromo,
 R⁴ de forma especialmente preferente representa además yodo o ciano.

dos radicales R⁴ adyacentes de forma especialmente preferente representan -(CH=CH)₂

- R⁵ representa metilo, flúor, cloro, bromo o yodo,
 R⁵ de forma especialmente preferente representa metilo o cloro,
 15 Q_x representa pirazol, pirrol, tiazol, piridimina que está monosustituido con el grupo



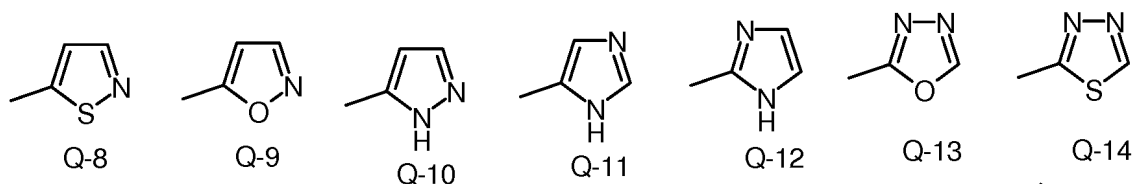
en el que Z, R y p pueden tener los significados generales y los particularmente preferentes indicados a continuación,

- A representa -CH₂-, -CH(CH₃), C(CH₃)₂-, -CH₂CH₂-, -CH(CN)-, -CH₂O- o -C(=O)-CH₂-,
 20 A de forma especialmente preferente representa CH₂, CH(CH₃), -CH₂O- o -C(=O)-CH₂-,
 R independientemente representa flúor, cloro o bromo,
 R de forma especialmente preferente representa cloro,
 P representa 1
 X representa O,
 25 Z representa N, CCl o CH,
 Q_Y representa un anillo de 5 o 6 miembros heteroaromático dado el caso mono- o polisustituido de la serie Q-36 a Q-40, Q43, Q-58 a Q-59, Q62, Q63, un sistema de anillo de 9 miembros condensado heterobíciclico aromático Q-54 a Q-56 o un anillo de 5 miembros heterocíclico Q-60 a Q-61 en el que los sustituyentes, independientemente uno de otro, se pueden seleccionar de alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₂, halógeno, ciano, hidroxilo, nitro y haloalcoxi C₁-C₂,
 30

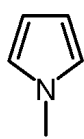
o en el que los sustituyentes, independientemente uno de otro, se pueden seleccionar de fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, en el que el fenilo o el anillo pueden estar dado el caso mono- o polisustituidos con sustituyentes iguales o distintos con alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, halógeno, CN, NO₂, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄,
 35

- Q_Y de forma especialmente preferente representa un anillo heteroaromático dado el caso mono- o polisustituido de forma igual o distinta de la serie Q-37, Q-38, Q-39, Q-40, Q43, Q-58, Q-59, Q62 y Q63 o un anillo de 5 miembros heterocíclico Q-60 en el que los sustituyentes se pueden seleccionar independientemente uno de otro de metilo, etilo, ciclo-propilo, terc-butilo, cloro, flúor, yodo, bromo, ciano, nitro, difluorometilo, trifluorometilo, pentafluoroetilo, n-heptafluoropropilo e iso-heptafluoropropilo
 40

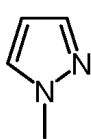
o en el que los sustituyentes, independientemente uno de otro, se pueden seleccionar de fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, en el que los sustituyentes, independientemente uno de otro, se pueden seleccionar de metilo, etilo, ciclo-propilo, terc-butilo, cloro, flúor, yodo, bromo, ciano, nitro, difluorometilo, trifluorometilo, pentafluoroetilo, n-heptafluoropropilo e iso-heptafluoropropilo,



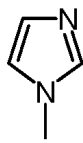
45



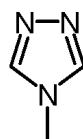
Q-36



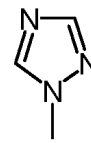
Q-37



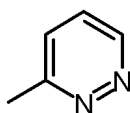
Q-38



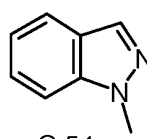
Q-39



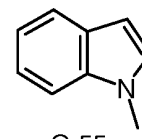
Q-40



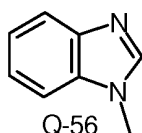
Q-43



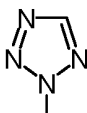
Q-54



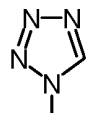
Q-55



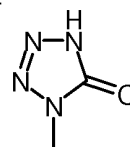
Q-56



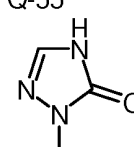
Q-58



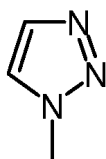
Q-59



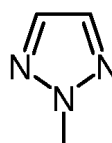
Q-60



Q-61



Q-62



Q-63

5

Los anillos o sistemas de anillos listados anteriormente pueden estar, de forma opcional e independiente uno de otro, adicionalmente sustituidos con oxo, tioxo, $(=O)=NH$, $(=O)=N-CN$, $(=O)_2$. Ejemplos que se pueden citar son dióxido de tetrahidrotiofeno, imidazolidona. Aquí, el anillo o el sistema de anillos Q_y está sustituido de forma adicional preferentemente con $(=O)$ o $(=O)_2$.

- 10 En este caso, el grupo oxo como sustituyente en un átomo de C de anillo significa, por ejemplo, un grupo carbonilo en el anillo heterocíclico. Esto comprende también preferentemente lactonas y lactamas. El grupo oxo también puede estar presente en los heteroátomos de anillo, que pueden existir en diversos niveles de oxidación, por ejemplo en el caso de N y S, en cuyo caso estos forman, por ejemplo, los grupos divalentes $-N(O)-$, $-S(O)-$ (abreviados también como SO) y $-S(O)_2-$ (abreviados también como SO_2) en el anillo heterocíclico. En el caso de grupos $-N(O)-$ y $-S(O)-$, en cada caso se incluyen ambos enantiómeros.

15 En un anillo heterocíclico, también pueden estar unidos a un heteroátomo sustituyentes distintos del grupo oxo, por ejemplo en un átomo de nitrógeno, si un átomo de hidrógeno en el átomo de nitrógeno del esqueleto se reemplaza en el proceso. En el caso del átomo de nitrógeno y también otros heteroátomos tales como, por ejemplo, el átomo de azufre, también puede haber sustitución adicional con formación de compuestos de amonio cuaternario o compuestos de sulfonio.

20 Las definiciones o aclaraciones generales de los radicales citados con anterioridad o las citadas en los intervalos de preferencia pueden combinarse de forma discrecional entre sí, en otras palabras, incluyendo combinaciones entre los respectivos intervalos e intervalos de preferencia. Se aplican a los productos finales y, correspondientemente, a precursores e intermedios.

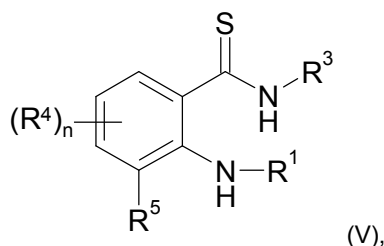
- 25 Los compuestos de las fórmulas (I) pueden estar presentes particularmente en forma de regioisómeros diferentes. Por ejemplo en la forma de mezclas de compuestos con la definición Q62 o Q63 o en la forma de mezclas de Q58 y 59. Por tanto, la invención comprende también mezclas de compuestos de las fórmulas (I) en la que Q_y tiene los significados Q62 y Q63 y también Q58 y Q59 y los compuestos se pueden presentar en diversas proporciones de

mezcla. En este contexto se da preferencia a las proporciones de mezcla de los compuestos de la fórmula (I) en la que el radical Q_Y es Q62 o es Q58 a los compuestos de la fórmula (I) en la que el radical Q_Y es Q63 o es Q59, de 60:40 a 99:1, de forma particularmente preferente de 70:30 a 97:3, de forma muy particularmente preferente de 80:20 a 95:5. Son especialmente preferentes las proporciones de mezcla siguientes para un compuesto de la fórmula (I) en la que Q_Y tiene la definición de Q62 o Q58 al compuesto de la fórmula (I) en la que Q_Y tiene la definición Q63 o Q59: 80:20; 81:19; 82:18; 83:17; 84:16; 85:15; 86:14; 87:13; 88:12; 89:11; 90:10; 91:9; 92:8; 93:7; 96:6; 95:5.

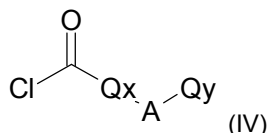
Procedimientos de preparación

Los compuestos de la fórmula general (I) se pueden obtener cuando

10 (C) anilinas de la fórmula (V)



en la que R¹, R³, R⁴, R⁵ y n tienen los significados dados antes se hacen reaccionar con, por ejemplo, cloruros de ácido carboxílico de la fórmula (IV)



15 en la que Q_x, A y Q_y tienen los significados dados antes, en presencia de un agente de condensación.

Las anilinas de la fórmula (V) son conocidas o se pueden preparar por procedimientos conocidos (por ejemplo documento WO 2007077889).

20 Los principios activos de acuerdo con la invención, en combinación con una buena tolerancia por las plantas, toxicidad aceptable para animales de sangre caliente y siendo bien tolerados por el medio ambiente, son adecuados para proteger plantas y órganos de plantas, para aumentar el rendimiento de las cosechas, para mejorar la calidad del producto cosechado y para controlar plagas animales, en particular insectos, arácnidos, helmintos, nematodos y moluscos que se encuentran en agricultura, en horticultura, en la cría de animales, en bosques, en jardines e instalaciones de recreo, en la protección de productos almacenados y de materiales y en el sector de la higiene. Preferentemente, se pueden usar como agentes fitoprotectores. Son activos contra especies normalmente sensibles y resistentes y contra todos o contra algunos estadios del desarrollo. Las plagas mencionadas anteriormente incluyen:

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

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

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

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

40 Del orden de los coleópteros, por ejemplo, Acanthoscelides obtectus, Adoretus spp., Agelastica alni, Agriotes spp., Amphimallon solstitialis, Anobium punctatum, Anoplophora spp., Anthonomus spp., Anthrenus spp., Apogonia spp., Atomaria spp., Attagenus spp., Bruchidius obtectus, Bruchus spp., Ceuthorrhynchus spp., Cleonus mendicus, Conoderus spp., Cosmopolites spp., Costelytra zealandica, Curculio spp., Cryptorhynchus lapathi, Dermestes spp., Diabrotica spp., Epilachna spp., Faustinus cubae, Gibbium psylloides, Heteronychus arator, Hylamorphia elegans, Hylotrupes bajulus, Hypera postica, Hypothenemus spp., Lachnosterna consanguinea, Leptinotarsa decemlineata, Lissorhoptrus oryzophilus, Lixus spp., Lyctus spp., Meligethes aeneus, Melolontha melolontha, Migdolus spp.,

ES 2 575 566 T3

- 5 Monochamus spp., Naupactus xanthographus, Niptus hololeucus, Oryctes rhinoceros, Oryzaephilus surinamensis, Otiorrhynchus sulcatus, Oxycetonia jucunda, Phaedon cochleariae, Phyllophaga spp., Popillia japonica, Premnotrypes spp., Psylliodes chrysocephala, Ptinus spp., Rhizobius ventralis, Rhizopertha dominica, Sitophilus spp., Sphenophorus spp., Sternechus spp., Symphyletes spp., Tenebrio molitor, Tribolium spp., Trogoderma spp., Tychius spp., Xylotrechus spp., Zabrus spp..
- Del orden de los colémbolos, por ejemplo, Onychiurus armatus.
- Del orden de los dermápteros, por ejemplo, Forficula auricularia.
- Del orden de los diplópodos, por ejemplo, Blaniulus guttulatus.
- 10 Del orden de los dípteros, por ejemplo, Aedes spp., Anopheles spp., Bibio hortulanus, Calliphora erythrocephala, Ceratitis capitata, Chrysomyia spp., Cochliomyia spp., Cordylobia anthropophaga, Culex spp., Cuterebra spp., Dacus oleae, Dermatobia hominis, Drosophila spp., Fannia spp., Gastrophilus spp., Hylemyia spp., Hyppobosca spp., Hypoderma spp., Liriomyza spp., Lucilia spp., Musca spp., Nezzara spp., Oestrus spp., Oscinella frit, Pegomyia hyoscyami, Phorbia spp., Stomoxys spp., Tabanus spp., Tannia spp., Tipula paludosa, Wohlfahrtia spp.
- 15 De la clase de los gasterópodos, por ejemplo, Arion spp., Biomphalaria spp., Bulinus spp., Deroceras spp., Galba spp., Lymnaea spp., Oncomelania spp., Succinea spp.
- 20 De la clase de los helmintos, por ejemplo, Ancylostoma duodenale, Ancylostoma ceylanicum, Ancylostoma braziliense, Ancylostoma spp., Ascaris lubricoides, Ascaris spp., Brugia malayi, Brugia timori, Bunostomum spp., Chabertia spp., Clonorchis spp., Cooperia spp., Dicrocoelium spp., Dictyocaulus filaria, Diphylobothrium latum, Dracunculus medinensis, Echinococcus granulosus, Echinococcus multilocularis, Enterobius vermicularis, Fasciola spp., Haemonchus spp., Heterakis spp., Hymenolepis nana, Hyostrogylus spp., Loa Loa, Nematodirus spp., Oesophagostomum spp., Opisthorchis spp., Onchocerca volvulus, Ostertagia spp., Paragonimus spp., Schistosoma spp., Strongyloides fuelleborni, Strongyloides stercoralis, Strongyloides spp., Taenia saginata, Taenia solium, Trichinella spiralis, Trichinella nativa, Trichinella britovi, Trichinella nelsoni, Trichinella pseudopsiralis, Trichostrongylus spp., Trichuris trichuria, Wuchereria bancrofti.
- 25 Además, es posible controlar protozoos, tales como Eimeria.
- 30 Del orden de los heterópteros, por ejemplo, Anasa tristis, Antestiopsis spp., Blissus spp., Calocoris spp., Campylomma livida, Cavalerius spp., Cimex spp., Creontiades dilutus, Dasynus piperis, Dichelops furcatus, Diconocoris hewetti, Dysdercus spp., Euschistus spp., Eurygaster spp., Heliopeltis spp., Horcias nobilellus, Leptocoris spp., Leptoglossus phyllopus, Lygus spp., Macropes excavatus, Miridae, Nezzara spp., Oebalus spp., Pentomidae, Piesma quadrata, Piezodorus spp., Psallus seriatus, Pseudacysta perseae, Rhodnius spp., Sahlbergella singularis, Scotinophora spp., Stephanitis nashi, Tibraca spp., Triatoma spp.
- 35 Del orden de los homópteros, por ejemplo, Acyrthosiphon spp., Aeneolamia spp., Agonosceca spp., Aleurodes spp., Aleurolobus barodensis, Aleurothrixus spp., Amrasca spp., Anuraphis cardui, Aonidiella spp.,
- 40 Aphanostigma piri, Aphis spp., Arboridia apicalis, Aspidiella spp., Aspidiotus spp., Atanus spp., Aulacorthum solani, Bemisia spp., Brachycaudus helichrysi, Brachycolus spp., Brevicoryne brassicae, Calligypona marginata, Carnecephala fulgida, Ceratovacuna lanigera, Cercopidae, Ceroplastes spp., Chaetosiphon fragaefolii, Chionaspis tegalensis, Chlorita onukii, Chromaphis juglandicola, Chrysomphalus ficus, Cicadulina mbila, Coccomytilus halli, Coccus spp., Cryptomyzus ribis, Dalbulus spp., Dialeurodes spp., Diaphorina spp., Diaspis spp., Doralis spp., Drosicha spp., Dysaphis spp., Dysmicoccus spp., Empoasca spp., Eriosoma spp., Erythroneura spp., Euscelis bilobatus, Geococcus coffeae, Homalodisca coagulata, Hyalopterus arundinis, Icerya spp., Idiocerus spp., Idioscopus spp., Laodelphax striatellus, Lecanium spp., Lepidosaphes spp., Lipaphis erysimi, Macrosiphum spp., Mahanarva fimbriolata, Melanaphis sacchari, Metcalfiella spp., Metopolophium dirhodum, Monellia costalis, Monelliopsis pecanis, Myzus spp., Nasonovia ribisnigri, Nephrotettix spp., Nilaparvata lugens, Oncometopia spp., Orthezia praelonga, Parabemisia myricae, Paratrioza spp., Parlatoria spp., Pemphigus spp., Peregrinus maidis, Phenacoccus spp.,
- 45 Phloeomyzus passerinii, Phorodon humuli, Phylloxera spp., Pinnaspis aspidistrae, Planococcus spp., Protopulvinaria pyriformis, Pseudaulacaspis pentagona, Pseudococcus spp., Psylla spp., Pteromalus spp., Pyrrilla spp., Quadraspidiotus spp., Quesada gigas, Rastrococcus spp., Rhopalosiphum spp., Saissetia spp., Scaphoideus titanus, Schizaphis graminum, Selenaspis articulatus, Sogata spp., Sogatella furcifera, Sogatodes spp., Stictocephala festina, Tenalaphara malayensis, Tinocallis caryaefoliae, Tomaspis spp., Toxoptera spp., Trialeurodes vaporariorum,
- 50 Trioza spp., Typhlocyba spp., Unaspis spp., Viteus vitifolii.
- Del orden de los himenópteros, por ejemplo, Diprion spp., Hoplocampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Vespa spp.
- Del orden de los isópodos, por ejemplo, Armadillidium vulgare, Oniscus asellus, Porcellio scaber.
- Del orden de los isópteros, por ejemplo, Reticulitermes spp., Odontotermes spp.

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

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

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

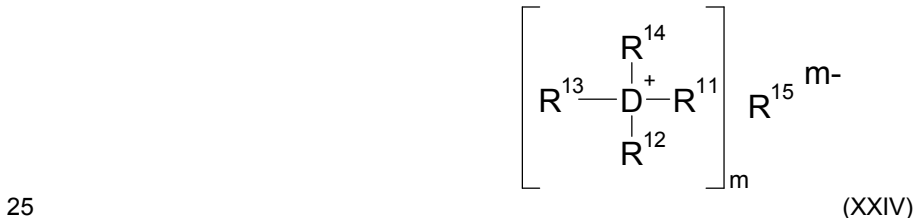
Del orden de los sínfilos, por ejemplo, *Scutigera* spp.

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

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

20 Los nematodos fitoparásitos incluyen, por ejemplo, *Anguina* spp., *Aphelenchoides* spp., *Belonoaimus* spp., *Bursaphelenchus* spp., *Ditylenchus dipsaci*, *Globodera* spp., *Helicocotylenchus* spp., *Heterodera* spp., *Longidorus* spp., *Meloidogyne* spp., *Pratylenchus* spp., *Radopholus similis*, *Rotylenchus* spp., *Trichodorus* spp., *Tylenchorhynchus* spp., *Tylenchulus* spp., *Tylenchulus semipenetrans*, *Xiphinema* spp..

La eficacia de los compuestos de la fórmula (I) puede aumentarse añadiendo sales de amonio y sales de fosfonio. Las sales de amonio y las sales de fosfonio se definen mediante la fórmula (XXIV)



en la que

D representa nitrógeno o fósforo,

D representa preferentemente nitrógeno,

30 R^{11} , R^{12} , R^{13} y R^{14} representan, independientemente unos de otros, hidrógeno o en cada caso alquilo C_1-C_8 dado el caso sustituido o alquileno C_1-C_8 mono- o poliinsaturado, dado el caso sustituido, seleccionándose los sustituyentes de halógeno, nitro y ciano,

R^{11} , R^{12} , R^{13} y R^{14} , con preferencia independientemente unos de otros representan hidrógeno o alquilo C_1-C_4 , en cada caso dado el caso sustituido, pudiendo seleccionarse los sustituyentes de halógeno, nitro y ciano,

35 R^{11} , R^{12} , R^{13} y R^{14} , de forma particularmente preferente, independientemente unos de otros, representan hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, i-butilo s-butilo o t-butilo,

R^{11} , R^{12} , R^{13} y R^{14} de forma muy particularmente preferente representan hidrógeno,

M representa 1, 2, 3 o 4,

M representa preferentemente 1 o 2,

R^{15} representa un anión inorgánico u orgánico,

40 R^{15} representa preferentemente hidrogenocarbonato, tetraborato, fluoruro, bromuro, yoduro, cloruro, monohidrogenofosfato, dihidrogenofostao, hidrogenosulfato, tartrato, sulfato, nitrato, tiosulfato, tiocianato, formato, lactato, acetato, propionato, butirato, pentanoato, citrato u oxalato,

R¹⁵ de modo particularmente preferente representa lactato, sulfato, monohidrogenofosfato, dihidrogenofosfato, nitrato, tiosulfato, tiocianato, citrato, oxalato o formato,

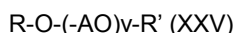
R¹⁵ de forma muy particularmente preferente representa sulfato.

5 Las sales de amonio y las sales de fosfonio de la fórmula (XXIV) pueden usarse en un intervalo de concentraciones amplio para aumentar el efecto de agentes fitoprotectores que comprenden compuestos de la fórmula (I). En general, las sales de amonio o las sales de fosfonio se usan en el agente fitoprotector listo para su uso en una concentración de 0,5 a 80 mmol/l, preferentemente de 0,75 a 37,5 mmol/l, de modo particularmente preferente de 1,5 a 25 mmol/l. En el caso de un producto formulado, la concentración de sal de amonio y/o sal de fosfonio en la formulación se selecciona de modo que esté dentro de estos intervalos generales, preferentes o particularmente
10 preferentes indicados después de la dilución de la formulación a la concentración deseada de principio activo. Aquí la concentración de la sal en la formulación es generalmente del 1 - 50 % en peso.

15 En una forma de realización preferente de la invención, no es solo una sal de amonio o una sal de fosfonio, sino un potenciador de la penetración, lo que se añade a los agentes fitoprotectores para aumentar la actividad. Puede observarse un aumento de actividad incluso en estos casos. Así, la presente invención también tiene por objeto el uso de un potenciador de penetración, y también el uso de una combinación de potenciador de penetración y sales de amonio y/o sales de fosfonio para aumentar la actividad de agentes fitoprotectores que comprenden compuestos con actividad acaricida/insecticida de la fórmula (I) como principio activo. Finalmente, la invención también tiene por objeto el uso de estos agentes para combatir insectos perjudiciales.

20 Potenciadores de penetración adecuados en el presente contexto son todas aquellas sustancias que se usan habitualmente para mejorar la penetración de principios activos agroquímicos en plantas. Los potenciadores de penetración se definen en este contexto por su capacidad de penetración desde un licor de pulverización acuoso y/o desde un revestimiento de pulverización en la cutícula de la planta y aumentar de este modo el movimiento de sustancias (movilidad) de principios activos en la cutícula. El procedimiento descrito en la bibliografía (Baur y col., 1997, Pesticide Science 51, 131-152) puede usarse para determinar esta propiedad.

25 Potenciadores de penetración adecuados son, por ejemplo, alcoxilatos de alcohol. Potenciadores de penetración de acuerdo con la invención son alcoxilatos de alcohol de la fórmula



en la que

R representa un alquilo de cadena lineal o ramificada con de 4 a 20 átomos de carbono,

30 R' representa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, i-butilo, t-butilo, n-pentilo o n-hexilo,

AO representa un radical óxido de etileno, un radical óxido de propileno, un radical óxido de butileno o mezclas de radicales óxido de etileno y radicales óxido de propileno o radicales óxido de butileno y

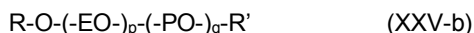
v representa un número entre 2 y 30.

Un grupo preferente de potenciadores de penetración son alcoxilatos de alcohol de la fórmula

35 R-O-(-EO)-n-R' (XXV-a) en la que

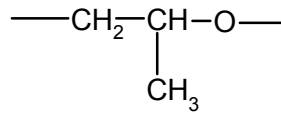
R tiene el significado dado anteriormente,
R' tiene el significado dado anteriormente,
EO representa -CH₂-CH₂-O- y
n representa un número de 2 a 20.

40 Un grupo preferente adicional de potenciadores de penetración son alcoxilatos de alcohol de la fórmula



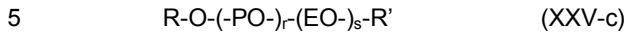
en la que

45 R tiene el significado dado anteriormente,
R' tiene el significado dado anteriormente,
EO representa -CH₂-CH₂-O-
PO representa



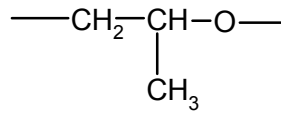
p representa un número de 1 a 10 y
q representa un número de 1 a 10.

Un grupo preferente adicional de potenciadores de penetración son alcoxilatos de alcohol de la fórmula



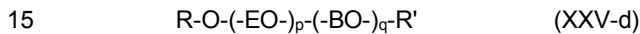
en la que

R tiene el significado dado anteriormente,
R' tiene el significado dado anteriormente,
10 EO representa $-\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-O-}$,
PO representa



r representa un número de 1 a 10 y
s representa un número de 1 a 10.

Un grupo preferente adicional de potenciadores de penetración son alcoxilatos de alcohol de la fórmula



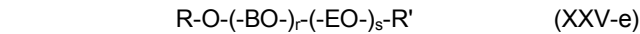
en la que

R y R' tienen los significados dados antes,
EO representa $-\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-O-}$,
BO representa



p representa un número de 1 a 10 y
q representa un número de 1 a 10.

Un grupo preferente adicional de potenciadores de penetración son alcoxilatos de alcohol de la fórmula



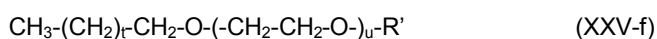
en la que

R y R' tienen los significados dados antes,
BO representa



EO representa $-\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-O-}$ y
r representa un número de 1 a 10 y
s representa un número de 1 a 10.

Un grupo preferente adicional de potenciadores de penetración son alcoxilatos de alcohol de la fórmula



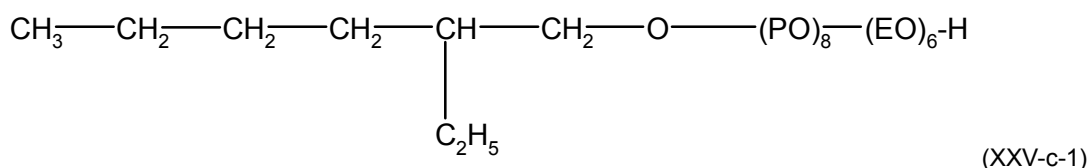
en la que

R' tiene el significado dado anteriormente,
t representa un número de 8 a 13,
y representa un número de 6 a 17.

5 En las fórmulas dadas anteriormente,

R representa preferentemente butilo, i-butilo, n-pentilo, i-pentilo, neopentilo, n-hexilo, i-hexilo, n-octilo, i-octilo, 2-etil-hexilo, nonilo, i-nonilo, decilo, n-dodecilo, i-dodecilo, laurilo, miristilo, i-tridecilo, trimetil-nonilo, palmitilo, estearilo o eicosilo.

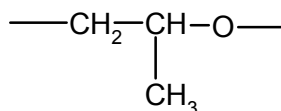
10 Como ejemplo de un alcoxilato de alcohol de la fórmula (XXV-c) puede hacerse mención del alcoxilato de 2-etil-hexilo de la fórmula



en la que

EO representa -CH₂-CH₂-O-,

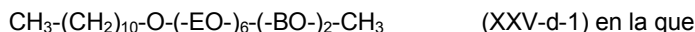
PO representa



15

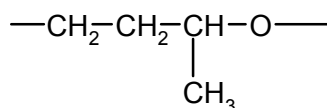
y los números 8 y 6 representan valores promedio.

Como ejemplo de un alcoxilato de alcohol de la fórmula (XII-d) puede hacerse mención de la fórmula



EO representa -CH₂-CH₂-O-,

20 BO representa

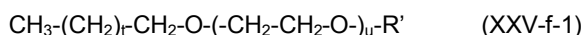


y los números 10, 6 y 2 representan valores promedio.

Alcoxilatos de alcohol de la fórmula (XXV-f) particularmente preferentes son compuestos de esta fórmula en los que

25 t representa un número entre 9 y 12 y
u representa un número de 7 a 9.

Con preferencia muy particular puede hacerse mención del alcoxilato de alcohol de la fórmula (XXV-f-1)



en la que

30 t representa el valor promedio 10,5 y
u representa el valor promedio 8,4.

Las fórmulas anteriores proporcionan definiciones generales de los alcoxilatos de alcohol. Estas sustancias son mezclas de sustancias del tipo establecido con longitudes de cadena diferentes. Los índices son, por lo tanto, valores promedio que pueden también desviarse de los números enteros.

35 Los alcoxilatos de alcohol de las fórmulas indicadas son conocidos, y algunos de ellos están disponibles comercialmente o pueden prepararse por procedimientos conocidos (véanse los documentos WO 98/35 553,

WO 00/35 278 y EP-A 0 681 865)

5 Potenciadores de penetración adecuados incluyen también, por ejemplo, sustancias que promueven la solubilidad de los compuestos de la fórmula (I) en el revestimiento de pulverización. Estos incluyen, por ejemplo, aceites minerales y vegetales. Aceites adecuados son todos los aceites minerales o vegetales dado el caso modificados que pueden usarse habitualmente en composiciones agroquímicas. A modo de ejemplo, pueden mencionarse aceite de girasol, aceite de semilla de colza, aceite de oliva, aceite de ricino, aceite de colza, aceite de semilla de maíz y aceite de soja o los ésteres de dichos aceites. Se da preferencia al aceite de semilla de colza, aceite de girasol y sus ésteres metílicos o etílicos.

10 La concentración de potenciador de penetración puede variar dentro de un intervalo amplio. En el caso de un agente fitoprotector, generalmente es del 1 al 95 % en peso, preferentemente del 1 al 55 % en peso, de forma particularmente preferente del 15 al 40 % en peso. En las composiciones listas para usar (licores para pulverizar), las concentraciones varían, en general, de 0,1 a 10 g/l, preferentemente de 0,5 a 5 g/l.

15 Las combinaciones de principio activo, sal y potenciador de penetración en las que se pone énfasis de acuerdo con la invención se enumeran en la tabla siguiente. Aquí, "de acuerdo con el ensayo" significa que cualquier compuesto que actúa como potenciador de penetración en el ensayo de penetración en la cutícula (Baur y col., 1997, Pesticide Science 51, 131-152) es adecuado.

n°	Principio activo	Sal	Potenciador de penetración
1	I	sulfato amónico	De acuerdo con el ensayo
2	I	lactato amónico	De acuerdo con el ensayo
3	I	nitrate amónico	De acuerdo con el ensayo
4	I	tiosulfato amónico	De acuerdo con el ensayo
5	I	tiocianato amónico	De acuerdo con el ensayo
6	I	citrato amónico	De acuerdo con el ensayo
7	I	oxalato amónico	De acuerdo con el ensayo
8	I	formiato amónico	De acuerdo con el ensayo
9	I	hidrogenofosfato amónico	De acuerdo con el ensayo
10	I	dihidrogenofosfato amónico	De acuerdo con el ensayo
11	I	carbonato amónico	De acuerdo con el ensayo
12	I	benzoato amónico	De acuerdo con el ensayo
13	I	sulfito amónico	De acuerdo con el ensayo
14	I	benzoato amónico	De acuerdo con el ensayo
15	I	hidrogenooxalato amónico	De acuerdo con el ensayo
16	I	hidrogenocitrato amónico	De acuerdo con el ensayo
17	I	acetato amónico	De acuerdo con el ensayo
18	I	sulfato de tetrametilamonio	De acuerdo con el ensayo
19	I	lactato de tetrametilamonio	De acuerdo con el ensayo
20	I	nitrate de tetrametilamonio	De acuerdo con el ensayo
21	I	tiosulfato de tetrametilamonio	De acuerdo con el ensayo
22	I	tiocianato de tetrametilamonio	De acuerdo con el ensayo
23	I	citrato de tetrametilamonio	De acuerdo con el ensayo
24	I	oxalato de tetrametilamonio	De acuerdo con el ensayo
25	I	formiato de tetrametilamonio	De acuerdo con el ensayo
26	I	hidrogenofosfato de tetrametilamonio	De acuerdo con el ensayo
27	I	dihidrogenofosfato de tetrametilamonio	De acuerdo con el ensayo
28	I	sulfato de tetraetilamonio	De acuerdo con el ensayo
29	I	lactato de tetraetilamonio	De acuerdo con el ensayo
30	I	nitrate de tetraetilamonio	De acuerdo con el ensayo
31	I	tiosulfato de tetraetilamonio	De acuerdo con el ensayo
32	I	tiocianato de tetraetilamonio	De acuerdo con el ensayo

(continuación)

nº	Principio activo	Sal	Potenciador de penetración
33	I	citrato de tetraetilamonio	De acuerdo con el ensayo
34	I	oxalato de tetraetilamonio	De acuerdo con el ensayo
35	I	formiato de tetraetilamonio	De acuerdo con el ensayo
36	I	hidrogenofosfato de tetraetilamonio	De acuerdo con el ensayo
37	I	dihidrogenofosfato de tetraetilamonio	De acuerdo con el ensayo

- 5 Los compuestos de acuerdo con la invención pueden, a determinadas concentraciones o dosis de aplicación, usarse dado el caso también como herbicidas, protectores, reguladores del crecimiento o agentes para mejorar las propiedades de la planta, o como microbicidas, por ejemplo como fungicidas, antimicóticos, bactericidas, viricidas (incluidos agentes contra viroides) o como agentes contra MLO (organismos similares a micoplasma) y RLO (organismos similares a rickettsia). Si es apropiado, pueden emplearse también como intermedios o precursores para la síntesis de otros principios activos.
- 10 Los principios activos pueden convertirse en las formulaciones habituales tales como soluciones, emulsiones, polvos humectables, suspensiones basadas en agua o en aceite, polvos, agentes de espolvoreo, pastas, polvos solubles, gránulos solubles, gránulos dispersables, concentrados de suspensión-emulsión, compuestos naturales impregnados con principio activo, compuestos sintéticos impregnados con principio activo, fertilizantes y también microencapsulaciones en sustancias poliméricas.
- 15 Estas formulaciones se producen de forma conocida, por ejemplo mezclando los principios activos con diluyentes, es decir disolventes líquidos y/o vehículos sólidos, dado el caso con el uso de tensioactivos, es decir emulsionantes y/o dispersantes y/o agentes de formación de espuma. Las formulaciones se producen en plantas adecuadas o, si no, antes o durante la aplicación.
- 20 Son adecuadas para uso como coadyuvantes sustancias que son adecuadas para conferir al propio agente y/o a preparaciones derivadas de ello (por ejemplo, licores para pulverizar, revestimientos de semillas) propiedades particulares tales como propiedades técnicas determinadas y/o también propiedades biológicas particulares. Coadyuvantes típicos incluyen: diluyentes, disolventes y vehículos.
- 25 Diluyentes adecuados son, por ejemplo, agua, líquidos químicos orgánicos polares y no polares, por ejemplo de las clases de los hidrocarburos aromáticos y no aromáticos (tales como parafinas, alquilbencenos, alquilnaftalenos, clorobencenos), de los alcoholes y polioles (que pueden, si fuera apropiado, estar sustituidos, eterificados o esterificados), de las cetonas (tales como acetona, ciclohexanona), ésteres (incluidos grasas y aceites) y (poli)éteres; aminas, amidas, lactamas (como la N-alquilpirrolidona) y lactonas, no sustituidas y sustituidas, sulfonas y sulfóxidos (tales como dimetilsulfóxido).
- 30 Si el diluyente usado es agua, también es posible emplear, por ejemplo, disolventes orgánicos como codisolventes. Esencialmente, disolventes líquidos adecuados son: compuestos aromáticos, tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, compuestos aromáticos clorados o hidrocarburos alifáticos clorados, tales como clorobencenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano o parafinas, por ejemplo, fracciones de petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoholes tales como butanol o glicol y también sus éteres y ésteres, cetonas, tales como acetona, metilacetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, disolventes fuertemente polares, tales como dimetilsulfóxido, y también agua.
- 35 Vehículos sólidos adecuados son:
- 40 por ejemplo sales de amonio y polvos de rocas naturales, tales como caolines, arcillas, talco, creta, cuarzo, atapulgita, montmorillonita o tierra de diatomeas, y polvos de rocas sintéticos, tales como sílice finamente dividido, alúmina y silicatos, vehículos sólidos útiles para gránulos incluyen: por ejemplo, piedras trituradas y fraccionadas naturales tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita y también gránulos sintéticos de polvos inorgánicos y orgánicos, así como gránulos de material orgánico como papel, serrín, cáscaras de coco, mazorcas de maíz y tallos de tabaco; emulsionantes y/o formadores de espuma útiles incluyen: por ejemplo, emulsionantes no ionógenos y aniónicos, tales como ésteres de ácido graso de polioxietileno, éteres de alcohol graso de polioxietileno, por ejemplo alquilarilpoliglicoléteres, sulfonatos de alquilo, sulfatos de alquilo, sulfonatos de arilo y también hidrolizados de proteína; son dispersantes adecuados
- 45 sustancias no iónicas y/o iónicas, por ejemplo de las clases de los éteres alcohólicos POE y/o POP, ésteres de ácidos y/o POP-POE, éteres de alquilarilo y/o POP-POE, productos de adición de grasas y/o POP-POE, derivados de poli-POE y/o POP, productos de adición de azúcar o sorbitán-POE y/o POP, sulfatos de alquilo o arilo, sulfonatos y fosfatos o los correspondientes productos de adición de éter-PO. Además oligómeros o polímeros adecuados, por ejemplo los derivados de monómeros vinílicos, de ácido acrílico, de EO y/o PO solos o
- 50 en combinación con, por ejemplo, (poli)alcoholes o (poli)aminas. Es también posible usar lignina y sus derivados de ácido sulfónico, celulosa modificada o no modificada, ácidos sulfónicos aromáticos y/o alifáticos y también sus

productos de adición con formaldehído.

En las formulaciones pueden usarse agentes de adherencia tales como carboximetilcelulosa y polímeros naturales y sintéticos en forma de polvos, gránulos o látex, tales como goma arábiga, poli(alcohol vinílico) y poli(acetato de vinilo) o fosfolípidos naturales tales como cefalinas y lecitinas, y fosfolípidos sintéticos.

- 5 Es posible usar colorantes tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo óxido de hierro, óxido de titanio y azul de Prusia, y colorantes orgánicos, tales como colorantes de alizarina, colorantes azoicos y colorantes de ftalocianina metálica y oligonutrientes tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

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

- 10 Pueden también encontrarse estabilizantes, tales como crioestabilizantes, conservantes, antioxidantes, fotoestabilizantes y/u otros agentes que mejoran la estabilidad química y/o física.

Las formulaciones generalmente comprenden del 0,01 al 98 % en peso de principio activo, preferentemente del 0,5 al 90 %.

- 15 Los principios activos de acuerdo con la invención se pueden usar como tales o en formulaciones de los mismos, incluyendo en una mezcla con uno o más fungicidas, bactericidas, acaricidas, nematocidas, insecticidas, agentes microbiológicos, fertilizantes, atrayentes, fitotónicos, esterilizantes, agentes sinérgicos, protectores, semioquímicos y/o reguladores del crecimiento de las plantas adecuados, con el objeto de, por ejemplo, ampliar el espectro de acción, prolongar la duración de la acción, aumentar la velocidad de acción, prevenir la repulsión o prevenir la evolución de resistencias. Además, tales combinaciones pueden mejorar el crecimiento de las plantas y la tolerancia a factores abióticos tales como, por ejemplo, altas o bajas temperaturas, la sequía o a mayores niveles de agua o a la salinidad del suelo. También se puede mejorar el comportamiento de la floración y producción de frutos, optimizar la capacidad de germinación y formación de raíces y aumentar el rendimiento de las cosechas, modular la maduración, aumentar la calidad y/o el valor nutricional de los productos cosechados, prolongar la vida útil de almacenamiento y/o mejorar la facilidad de procesado de los productos cosechados. En general, combinando los principios activos de acuerdo con la invención y las parejas de mezcla, se obtienen efectos sinérgicos, es decir, la actividad de la mezcla en cuestión es mayor que la actividad de los componentes individuales. En general, las combinaciones se pueden usar no solo en premezclas, mezclas en depósito y mezclas listas para usar sino también en aplicaciones en semillas.
- 20
- 25

Ejemplos particularmente favorables de parejas de mezcla son los siguientes compuestos:

- 30 Insecticidas/acaricidas/nematocidas:

Los principios activos especificados en el presente documento por su nombre común se conocen y describen, por ejemplo, en el manual sobre pesticidas ("The Pesticide Manual", 14ª Ed., British Crop Protection Council 2006) o pueden encontrarse en internet (por ejemplo <http://www.alanwood.net/pesticides>).

- 35 (1) Inhibidores de la acetilcolinesterasa (ACE), tales como por ejemplo carbamatos, por ejemplo alanicarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbarilo, carbofurano, carbosulfano, etiofencarb, fenobucarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, triazamato, trimetacarb, XMC y xililcarb; u organofosfatos, por ejemplo acefato, azametifos, azinfos (-metilo, -etilo), cadusafos, cloretoxifos, clorfenvinfos, clorfenvinfos, clormefos, clorpirifos (-metilo), coumafos, cianofos, demeton-S-metilo, diazinona, diclorvos/DDVP, dicrotofos, dimetoato, dimetolvinfos, disulfoton, EPN, etion, etoprofos, famfur, fenamifos, fenitrotion, fention, fostiazato, heptenofos, isofenfos, isopropilo, salicilato de O-(metoxiaminotio-fosforilo), isoxation, malation, mecarbam, metamidofos, metidation, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemeton-metilo, paration (-metilo), fentoato, forato, fosalona, fosmet, fosfamidona, foxim, pirimifos (-metilo), profenofos, propetamfos, protiofos, piraclfos, piridafention, quinalfos, sulfotep, tebupirimfos, temefos, terbufos, tetraclorvinfos, tiometon, triazofos, triclofon y vamidotion;
- 40
- 45

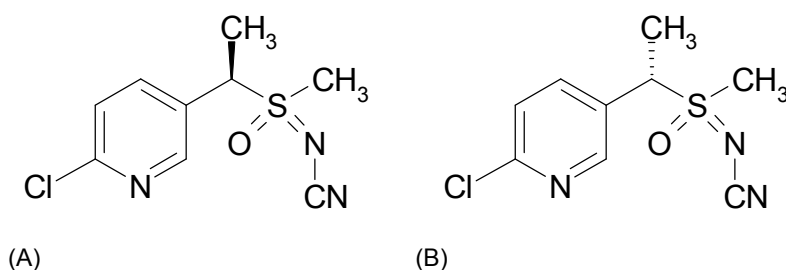
(2) Antagonistas de los canales de cloro dependientes de GABA, tales como por ejemplo organocloros, por ejemplo clordano y endosulfan (alfa-); o fiproles (fenilpirazoles), por ejemplo etiprol, fipronilo, pirafuprol y piriprol.

- 50 (3) Moduladores de los canales de sodio/bloqueantes de canales de sodio dependientes de voltaje, tales como por ejemplo piretroides, por ejemplo acrinatrina, aletrina (d-cis-trans, d-trans), bifentrina, bioaletrina, bioaletrin S-ciclopentenilo, bioresmetrina, cicloprotrina, ciflutrina (beta-), cihalotrina (gamma-, lambda-), cipermetrina (alfa-, beta-, zeta-), cifenotrina [isómero (1R)-trans], deltametrina, dimeflutrina, empentrina [isómero (EZ)-(1R)], esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flumetrina, fluvalinato (tau-), halfenprox, imiprotrina, metoflutrina, permetrina, fenotrina [isómero (1R)-trans], praletrina, proflutrina, piretrinas (piretrum), resmetrina, RU 15525, silafluofeno, teflutrina, tetrametrina [isómero (1R)], tralometrina, transflutrina y ZXI 8901;
- 55

DDT o metoxicloro.

- (4) Agonistas de los receptores nicotínicos de acetilcolina, tales como por ejemplo neonicotinoides, por ejemplo acetamiprid, clotianidina, dinotefurano, imidacloprid, nitenpiram, tiacloprid, tiametoxam o nicotina; o
- 5 (5) Moduladores alostéricos (agonistas) de los receptores de acetilcolina, tales como por ejemplo espinosinas, por ejemplo espinetoram y espinosad.
- (6) Activadores de los canales de cloro, tales como por ejemplo avermectinas/milbemecinas, por ejemplo abamectina, benzoato de emamectina, lepimectina y milbemectina.
- (7) Análogos de hormonas juveniles, por ejemplo hidropreno, kinopreno, metopreno; o fenoxicarb; piriproxifeno.
- 10 (8) Principios activos con mecanismos de acción desconocidos o inespecíficos, tales como por ejemplo fumigantes, por ejemplo bromuro de metilo y otros haluros de alquilo; o cloropicrina; fluoruro de sulfurilo; bórax; tartar emético.
- (9) Bloqueantes de alimentación selectivos, por ejemplo pimetrozina o flonicamid.
- (10) Inhibidores de crecimiento de ácaros, por ejemplo clofentezina, diflovidazina, hexitiazox, etoxazol.
- 15 (11) Disruptores microbianos de membranas del intestino de insectos, por ejemplo *Bacillus thuringiensis* subespecie *israelensis*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* subespecie *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subespecie *kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* subespecie *tenebrionis*, y proteínas de plantas BT, por ejemplo Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry2Ab, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34/35Ab1.
- 20 (12) Inhibidores de la fosforilación oxidativa, disruptores del ATP, tales como por ejemplo diafentiuuron; o compuestos de organoestaño, por ejemplo azociclotina, cihexatina, óxido de fenbutatina; o propargita; tetradifon.
- (13) Desacopladores de la fosforilación oxidativa que actúan interrumpiendo el gradiente de protones H, por ejemplo clorfenapir y DNOC.
- 25 (14) Antagonistas de receptores de acetilcolina nicotínicos, tales por ejemplo bensultap, cartap (clorhidrato), tiociclam y tiosultap (sodio).
- (15) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 0, tales como por ejemplo benzoilureas, por ejemplo bistrifluron, clorfluazuron, diflubenzuron, flucicloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron y triflumuron.
- (16) Inhibidores de biosíntesis de quitina, de tipo 1, tales como por ejemplo buprofezina.
- 30 (17) Principios activos disruptores de la muda, tales como por ejemplo ciromazina.
- (18) Agonistas/disruptores de ecdisona, tales como por ejemplo diacilhidrazinas, por ejemplo cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida y tebufenozida.
- (19) Agonistas octopaminérgicos, por ejemplo amitraz.
- 35 (20) Inhibidores del Complejo III de transporte de electrones, tales como, por ejemplo, hidrametilnona; acequinocilo; fluacropirim.
- (21) Inhibidores de transporte de electrones del complejo I, por ejemplo del grupo de los acaricidas METI, por ejemplo fenazaquina, fenpiroximato, pirimidifeno, piridabeno, tebufenpirad, tolfenpirad; o rotenona (Derris).
- (22) Bloqueantes de canales de sodio dependientes de voltaje, por ejemplo indoxacarb; metaflumizona.
- 40 (23) Inhibidores de acetil-CoA carboxilasa, tales como, por ejemplo, derivados de ácido tetrónico, por ejemplo espiroclifeno y espiromesifeno; o derivados de ácido tetrámico, por ejemplo espirotetramat.
- (24) Inhibidores del transporte de electrones del complejo IV, tales como, por ejemplo fosfinas, por ejemplo fosfuro de aluminio, fosfuro de calcio, fosfina, fosfuro de cinc; o cianuro.
- (25) Inhibidores de transporte de electrones del complejo II, por ejemplo cienopirafeno.
- 45 (28) Efectores del receptor de rianodina, tales como, por ejemplo, diamidas, por ejemplo clorantraniliprol (Rynaxypyr), ciantraniliprol (Cyazypyr) y flubendiamida.

Principios activos adicionales con mecanismo de acción desconocido, por ejemplo azadiractina, amidoflumet, benzoximato, bifenazato, cinometionat, criolita, ciflumetofeno, dicofol, fluensulfona (5-cloro-2-[(3,4,4-trifluorobut-3-en-1-il)sulfonil]-1,3-tiazol), flufenerim, piridalilo y pirifluquinazona; además preparados basados en *Bacillus firmus* (I-1582, BioNeem, Votivo) o los siguientes compuestos activos conocidos 4-[[[(6-bromopirid-3-il)metil](2-fluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento WO 2007/115644), 4-[[[(6-fluoropirid-3-il)metil](2,2-difluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento WO 2007/115644), 4-[[[(2-cloro-1,3-tiazol-5-il)metil](2-fluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento WO 2007/115644), 4-[[[(6-cloropirid-3-il)metil](2-fluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento WO 2007/115644), 4-[[[(6-cloro-5-fluoropirid-3-il)metil](metil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento WO 2007/115643), 4-[[[(5,6-dicloropirid-3-il)metil](2-fluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento WO 2007/115646), 4-[[[(6-cloro-5-fluoropirid-3-il)metil](ciclopropil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento WO 2007/115643), 4-[[[(6-cloropirid-3-il)metil](ciclopropil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento EP-A-0 539 588), 4-[[[(6-cloropirid-3-il)metil](metil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento EP-A-0 539 588), [(6-cloropiridin-3-il)metil](metil)-óxido- λ^4 -sulfanilidencianamida (conocida por el documento WO 2007/149134), [1-(6-cloropiridin-3-il)etil](metil)-óxido- λ^4 -sulfanilidencianamida (conocida por el documento WO 2007/149134) y sus diastereómeros (A) y (B)



(también conocida por el documento WO 2007/149134), [(6-trifluorometilpiridin-3-il)metil](metil)-óxido- λ^4 -sulfanilidencianamida (conocida por el documento WO 2007/095229), sulfoxaflor (también conocido por el documento WO 2007/149134), 11-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-12-hidroxi-1,4-dioxa-9-azadispiro[4.2.4.2]tetradec-11-en-10-ona, (conocida por el documento WO 2006/089633), 3-(4'-fluoro-2,4-dimetilbifenil-3-il)-4-hidroxi-8-oxa-1-azaspiro[4.5]dec-3-en-2-ona (conocida por el documento WO 2008/067911) y 1-[2-dimetil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfonil]fenil]-3-(trifluorometil)-1H-1,2,4-triazol-5-amina (conocida por el documento WO 2006/043635).

Fungicidas:

(1) Inhibidores de la biosíntesis de ergosterol, tales como por ejemplo aldimorf, azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, diclobutrazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M, dodemorf, acetato de dodemorf, epoxiconazol, etaconazol, fenarimol, fenbuconazol, fenhexamid, fenpropidina, fenpropimorf, fluquinconazol, flurprimidol, flusilazol, flutriafol, furconazol, furconazol-cis, hexaconazol, imazalilo, sulfato de imazalilo, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanilo, naftifina, nuarimol, oxpoconazol, paclobutrazol, pefurazoato, penconazol, piperalina, procloraz, propiconazol, protioconazol, piributicarb, pirifenox, quinconazol, simeconazol, espiroxamina, tebuconazol, terbinafina, tetraconazol, triadimefón, triadimenol, tridemorf, triflumizol, triforina, triticonazol, uniconazol, uniconazol-p, viniconazol, voriconazol, 1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)cicloheptanol, 1-(2,2-dimetil-2,3-dihidro-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato de metilo, N'-{5-(difluorometil)-2-metil-4-[3-(trimetilsilil)propoxi]fenil}-N-etil-N-metilimidoformamida, N-etil-N-metil-N'-{2-metil-5-(trifluorometil)-4-[3-(trimetilsilil)propoxi]fenil}imidoformamida y O-[1-(4-metoxifenoxi)-3,3-dimetilbutan-2-il]-1H-imidazol-1-carbotioato.

(2) Inhibidores de la respiración (inhibidores de la cadena respiratoria), tales como por ejemplo bixafeno, boscalid, carboxina, diflumetorim, fenfuram, fluopiram, flutolanilo, fluxapiraxad, furametpir, furmeciclox, isopirazam mezcla de racemato sin-epimérico 1RS,4SR,9RS y racemato anti-epimérico 1RS,4SR,9SR, isopirazam (racemato anti-epimérico), isopirazam (enantiómero anti-epimérico 1R,4S,9S), isopirazam (enantiómero anti-epimérico 1S,4R,9R), isopirazam (racemato sin-epimérico 1RS,4SR,9RS), isopirazam (enantiómero sin-epimérico 1R,4S,9R), isopirazam (enantiómero sin-epimérico 1S,4R,9S), mepronilo, oxicarboxina, penflufeno, pentiopirad, sedaxano, tifluzamida, 1-metil-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil]-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida, 3-(difluorometil)-1-metil-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil]-1H-pirazol-4-carboxamida, 3-(difluorometil)-N-[4-fluoro-2-(1,1,2,3,3,3-hexafluoropropoxi)fenil]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida y N-[1-(2,4-diclorofenil)-1-metoxipropan-2-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida.

(3) Inhibidores de la respiración (inhibidores de la cadena respiratoria) en el complejo III, tales como por ejemplo ametocradina, amisulbrom, azoxistrobina, ciazofamid, dimoxistrobina, enestrobirina, famoxadona, fenamidona, fluoxastrobina, kresoxim-metilo, metominostrobin, orisastrobina, picoxistrobina, piraclostrobina, pirametostrobin, piraxistrobina, piribencarb, trifloxistrobina, (2E)-2-(2-[[[6-(3-cloro-2-metilfenoxi)-5-fluoropirimidin-4-il]oxi]fenil]-2-(metoxiimino)-N-metiletanamida, (2E)-2-(metoxiimino)-N-metil-2-(2-[[[(1E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etilideno]amino]oxi]metil]fenil)etanamida, (2E)-2-(metoxiimino)-N-metil-2-[2-[(E)-{1-[3-

- (trifluorometil)fenil]etoxi]imino]metil]fenil]etanamida, (2E)-2-{2-[[[(1E)-1-(3-[(E)-1-fluoro-2-feniletetil]oxi]fenil)etilideno]amino]oxi]metil]fenil]-2-(metoxiimino)-N-metiletanamida, (2E)-2-{2-[[[(2E,3E)-4-(2,6-diclorofenil)but-3-en-2-ilideno]amino]oxi]metil]fenil]-2-(metoxiimino)-N-metiletanamida, 2-cloro-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)piridina-3-carboxamida, 5-metoxi-2-metil-4-(2-[[[(1E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etilideno]amino]oxi]metil]fenil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-ona, (2E)-2-{2-[[[ciclopropil[(4-metoxifenil)imino]metil]sulfanil]metil]fenil]-3-metoxiprop-2-enoato de metilo, N-(3-etil-3,5,5-trimetilciclohexil)-3-(formilamino)-2-hidroxibenzamida, 2-{2-[[[2,5-dimetilfenoxi]metil]fenil]-2-metoxi-N-metilacetamida y (2R)-2-{2-[[[2,5-dimetilfenoxi]metil]fenil]-2-metoxi-N-metilacetamida.
- (4) Inhibidores de la mitosis y de la división celular, tales como por ejemplo benomilo, carbendazim, clorfenazol, dietofencarb, etaboxam, fluopicolida, fuberidazol, pencicuron, tiabendazol, tiofanato-metilo, tiofanato, zoxamida, 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina y 3-cloro-5-(6-cloropiridin-3-il)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)piridazina.
- (5) Compuestos capaces de tener una acción en múltiples sitios, tales como por ejemplo, caldo bordelés, captafol, captán, clorotalonilo, formulaciones de cobre tales como hidróxido de cobre, naftenato de cobre, óxido de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre, diclofluanida, ditianona, dodina, dodina base libre, ferbam, fluorofolpet, folpet, guazatina, acetato de guazatina, iminocadina, albesilato de iminocadina, triacetato de iminocadina, mancozeb, mancozeb, maneb, metiram, metiram cinc, oxina-cobre, propamidina, propineb, azufre y preparaciones de azufre, tales como por ejemplo polisulfuro de calcio, tiram, tolifluanida, zineb y ziram.
- (6) Inductores de resistencia, tales como por ejemplo, acibenzolar-S-metilo, isotianilo, probenazol y tiadinilo.
- (7) Inhibidores de la biosíntesis de proteínas y aminoácidos, tales como por ejemplo, andoprim, blasticidina-S, ciprodinilo, kasugamicina, kasugamicina clorhidrato hidrato, mepanipirim y pirimetanilo.
- (8) Inhibidores de la producción de ATP, tales como por ejemplo, acetato de fentin, cloruro de fentin, hidróxido de fentin y siltiofam.
- (9) Inhibidores de la síntesis de pared celular, tales como por ejemplo bentiavalicarb, dimetomorf, flumorf, iprovalicarb, mandipropamid, polioxinas, polioxorim, validamicina A y valifenalato.
- (10) Inhibidores de la síntesis de lípidos y de la síntesis de membrana, tales como por ejemplo bifenilo, cloroneb, diclorán, edifenfos, etridiazol, iodocarb, iprobenfos, isoprotilolano, propamocarb, clorhidrato de propamocarb, protiocarb, pirazofos, quintozeno, tecnazeno y tolclofos-metilo.
- (11) Inhibidores de la biosíntesis de melanina, tales como por ejemplo carpropamida, diclocimet, fenoxanil, ftalida, piroquilona y triciclazol.
- (12) Inhibidores de la síntesis de ácidos nucleicos, tales como por ejemplo benalaxilo, benalaxilo-M (kiralaxilo), bupirimato, clozilacon, dimetirimol, etirimol, furalaxilo, himexazol, metalaxilo, metalaxilo-M (mefonoxam), ofurace, oxadixilo y ácido oxolínico.
- (13) Inhibidores de la transducción de señales, tales como por ejemplo clozolinato, fenciclonilo, fludioxonilo, iprodiona, procimidona, quinoxifeno y vinclozolina.
- (14) Desacopladores, tales como, por ejemplo, binapacril, dinocap, ferimzona, fluazinam y meptildinocap.
- (15) Otros compuestos, tales como por ejemplo bentiazol, betoxazina, capsimicina, carvona, cinometionat, clazafenona, cufraneb, ciflufenamid, cimoxanilo, ciprosulfamida, dazomet, debacarb, diclorofeno, diclomezina, difenzocuat, metilsulfato de difenzocuat, difenilamina, ecomato, fenpirazamina, flumetover, fluoroimida, flusulfamida, flutianilo, fosetil-aluminio, fosetil-calcio, fosetil-sodio, hexaclorobenceno, irumamicina, metasulfocarb, isotiocianato de metilo, metrafenona, mildiomicina, natamicina, dimetilditiocarbamato de níquel, nitrotal-isopropilo, octilnina, oxamocarb, oxifentiina, pentaclorofenol y sus sales, fenotrina, ácido fosforoso y sus sales, propamocarb-fosetilato, propanosina-sodio, proquinazid, pirrolnitrina, tebufloquina, tecloftalam, tolnifanida, triazóxido, triclamida, zarilamid, 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, 1H-imidazol-1-carboxilato de 1-(4-metoxifenoxi)-3,3-dimetilbutan-2-ilo, 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)piridina, 2,3-dibutil-6-clorotieno[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona, 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(5R)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il)etanona, 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(5S)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il)etanona, 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-[4-(5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il)etanona, 2-butoxi-6-yodo-3-propil-4H-cromen-4-ona, 2-cloro-5-[2-cloro-1-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-4-metil-1H-imidazol-5-il]piridina, 2-fenilfenol y sus sales, 3,4,5-tricloropiridina-2,6-dicarbonitrilo, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetil-1,2-oxazolidin-3-il]piridina, 3-cloro-5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-metilpiridazina, 4-(4-clorofenil)-5-(2,6-difluorofenil)-3,6-dimetilpiridazina, 5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-tiol, 5-cloro-N'-fenil-N'-(prop-2-in-1-il)tiofeno-2-

sulfonohidrazida, 5-metil-6-octil[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, (2Z)-3-amino-2-ciano-3-fenilprop-2-enoato de etilo, N-(4-clorobencil)-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]propanamida, N-[(4-clorofenil)(ciano)metil]-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]propanamida, N-[(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)metil]-2,4-dicloropiridina-3-carboxamida, N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloropiridina-3-carboxamida, N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2-fluoro-4-iodopiridina-3-carboxamida, N-[(E)-[(ciclopropilmetoxi)imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-fenilacetamida, N-[(Z)-[(ciclopropilmetoxi)imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-fenilacetamida, N-metil-2-(1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-N-(1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il)-1,3-tiazol-4-carboxamida, 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]-1,3-tiazol-4-carboxamida, N-metil-2-(1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-N-[(1S)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il]-1,3-tiazol-4-carboxamida, {6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilideno]amino]oxi]metil]piridin-2-il}carbamato de pentilo, ácido fenazina-1-carboxílico, quinolin-8-ol y sulfato de quinolin-8-ol (2:1).

(16) Otros compuestos, tales como por ejemplo 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[2'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, N-(4'-clorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, N-(2',4'-diclorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, 3-(difluorometil)-1-metil-N-[4'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, N-(2',5'-difluorobifenil-2-il)-1-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida, 3-(difluorometil)-1-metil-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, 5-fluoro-1,3-dimetil-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, 2-cloro-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]piridina-3-carboxamida, 3-(difluorometil)-N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, 3-(difluorometil)-N-(4'-etinilbifenil-2-il)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, N-(4'-etinilbifenil-2-il)-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, 2-cloro-N-(4'-etinilbifenil-2-il)piridina-3-carboxamida, 2-cloro-N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]piridina-3-carboxamida, 4-(difluorometil)-2-metil-N-[4'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1,3-tiazol-5-carboxamida, 5-fluoro-N-[4'-(3-hidroxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, 2-cloro-N-[4'-(3-hidroxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]piridina-3-carboxamida, 3-(difluorometil)-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, 5-fluoro-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, 2-cloro-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]piridina-3-carboxamida, (5-bromo-2-metoxi-4-metilpiridin-3-il)(2,3,4-trimetoxi-6-metilfenil)metanona y N-[2-(4-[[3-(4-clorofenil)prop-2-in-1-il]oxi]-3-metoxifenil)etil]-N2-(metilsulfonil)valinamida.

30 Todas las parejas de mezcla de las clases (1) a (16) mencionadas pueden formar sales, cuando sea apropiado con bases o ácidos adecuados, siempre que sean capaces de hacer tal cosa sobre la base de sus grupos funcionales.

Es también posible una mezcla con otros principios activos conocidos, tales como herbicidas, fertilizantes, reguladores del crecimiento, protectores, productos semioquímicos, o si no con agentes que mejoren las propiedades de la planta.

35 Cuando se usan como insecticidas, los principios activos de acuerdo con la invención además pueden estar presentes en sus formulaciones disponibles comercialmente y en las formas de uso, preparadas a partir de estas formulaciones, en forma de una mezcla con agentes sinérgicos. Los agentes sinérgicos son compuestos que aumentan la acción de los principios activos, sin que sea necesario que el agente sinérgico añadido sea activo por sí mismo.

40 Cuando se usan como insecticidas, los principios activos de acuerdo con la invención pueden además estar presentes en sus formulaciones disponibles comercialmente y en las formas de uso preparadas a partir de dichas formulaciones, en forma de una mezcla con inhibidores que reducen la degradación del principio activo después del uso en el entorno de la planta, sobre la superficie de partes de plantas o en tejidos vegetales.

45 El contenido del principio activo de las formas de uso preparadas a partir de las formulaciones disponibles comerciales puede variar dentro de márgenes amplios. La concentración del principio activo de las formas de aplicación puede variar del 0,00000001 al 95 % en peso del principio activo, preferentemente del 0,00001 al 1 % en peso.

La aplicación se realiza de una forma habitual apropiada para las formas de aplicación.

50 Todas las plantas y partes de plantas pueden tratarse de acuerdo con la invención. Se entiende que plantas significa, en el presente documento, todas las plantas y poblaciones de plantas, tales como plantas salvajes deseadas y no deseadas o plantas de cultivo, (incluidas las plantas de cultivo naturales). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que pueden obtenerse mediante los procedimientos de cultivo y optimización convencionales o por procedimientos biotecnológicos y de ingeniería genética o mediante combinaciones de estos procedimientos, incluidas las plantas transgénicas e incluidas las variedades de plantas que pueden estar o no protegidas por los derechos de propiedad varietal. Por partes de plantas debe entenderse que significa todas las partes y órganos aéreos o subterráneos de las plantas, tales como brote, hoja, flor y raíz, pudiendo mencionarse como ejemplos hojas, espinas, tallos, troncos, flores, cuerpos fructíferos, frutos y semillas y también raíces, tubérculos y rizomas. Las partes de las plantas también incluyen el material recolectado y el material de propagación vegetativa y generativa, por ejemplo plantones, tubérculos, rizomas, esquejes y semillas.

El tratamiento de acuerdo con la invención de las plantas y partes de plantas con los principios activos se realiza directamente o dejando actuar los compuestos en sus alrededores, hábitat o espacio de almacenamiento mediante los procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo, mediante inmersión, pulverización, evaporación, nebulización, dispersión, embadurnado, inyección y en el caso de material de propagación, en particular en el caso de semillas, también mediante aplicación de una o más capas.

Como ya se ha mencionado anteriormente, es posible tratar todas las plantas y sus partes de acuerdo con la invención. En una forma de realización preferente, se tratan especies de plantas silvestres y variedades de plantas cultivadas o las obtenidas mediante procedimientos de reproducción biológicos convencionales, tales como entrecruzamiento o fusión con protoplastos, y sus partes. En otra forma de realización preferida se tratan plantas transgénicas y variedades de plantas obtenidos mediante ingeniería genética, si es adecuado en combinación con procedimientos convencionales (Genetically Modified Organisms), y sus plantas. Los términos "partes" o "partes de plantas" y "partes de la planta" se han explicado anteriormente.

Más preferentemente, las plantas de las variedades de plantas que están disponibles comercialmente o en uso se tratan de acuerdo con la invención. Se entiende que variedades de plantas significa plantas con propiedades nuevas ("rasgos") y que se han obtenido mediante cultivo convencional, mediante mutagénesis o mediante técnicas de ADN recombinante. Estas pueden ser variedades, biotipos y genotipos.

Dependiendo de las especies de plantas o de las variedades de plantas, de su localización y condiciones de crecimiento (tierras, clima, periodo vegetativo, alimentación), el tratamiento de acuerdo con la invención puede provocar también efectos superaditivos ("sinérgicos"). Por ejemplo, las posibilidades incluyen dosis de aplicación reducidas y/o ampliaciones del espectro de actividad y/o un aumento de la actividad de las sustancias y agentes que se usan según la invención, mejor crecimiento de las plantas, mayor tolerancia a temperaturas altas o bajas, mayor tolerancia a la sequía o a niveles de salinidad en agua o suelo, mayor floración, mayor facilidad de recolección, maduración acelerada, mayores rendimientos de cosecha, mayor calidad y/o un mayor valor nutricional de los productos recolectados, mayor duración en almacenamiento y/o capacidad de procesamiento de los productos recolectados, que exceden los efectos que normalmente deben esperarse.

Las plantas o las variedades de plantas transgénicas (obtenidas mediante ingeniería genética) que se tratan con preferencia de acuerdo con la invención incluyen todas las plantas que, mediante la modificación mediante ingeniería genética, recibieron material genético que confiere propiedades útiles ("rasgos") particularmente ventajosas a estas plantas. Ejemplos de dichas características son mejor crecimiento de las plantas, mayor tolerancia a temperaturas altas o bajas, mayor tolerancia a la sequía o a niveles de salinidad del agua o el suelo, mayor floración, mayor facilidad de recolección, maduración acelerada, mayores rendimientos de la cosecha, calidad más alta y/o un mayor valor nutricional de los productos recolectados, mayor vida útil de almacenamiento y/o mejor capacidad de procesamiento de los productos recolectados. Ejemplos adicionales y particularmente enfatizados de dichas propiedades son una mejor defensa de las plantas contra plagas animales y microbianas, tales como contra insectos, ácaros, hongos fitopatógenos, bacterias y/o virus, y también mayor tolerancia de las plantas a determinados principios activos herbicidas. Ejemplos de plantas transgénicas que pueden mencionarse son las plantas de cultivo importantes, tales como cereales (trigo, arroz), maíz, soja, patatas, remolacha azucarera, tomates, guisantes y otras variedades de vegetales, algodón, tabaco, colza y también plantas frutales (con frutos como manzanas, peras, cítricos y uvas) y se enfatiza particularmente en el maíz, soja, patata, algodón, tabaco y colza. Las características ("rasgos") sobre las que se enfatiza son, en particular, la mayor resistencia de las plantas frente a insectos, arácnidos, nematodos y caracoles gracias a toxinas formadas en las plantas, en particular las formadas en las plantas mediante el material genético procedente de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo, por medio de los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF también de sus combinaciones) (denominadas a continuación como "plantas Bt"). Las características ("rasgos") sobre los que también se pone particular énfasis son la defensa mejorada de las plantas contra hongos, bacterias y virus por resistencia sistémica adquirida (SAR), sistemina, fitoalexinas, facilitadores y genes de resistencia y las proteínas y toxinas expresadas correspondientemente. Las características ("rasgos") que se enfatizan adicionalmente de forma particular son la mayor tolerancia de las plantas a determinados principios activos herbicidas, por ejemplo imidazolinonas, sulfonilureas, glifosato o fosfotricina (por ejemplo el gen "PAT"). Los genes que confieren las características ("rasgos") deseadas en cuestión también pueden estar presentes combinados entre sí en las plantas transgénicas. Los ejemplos de "plantas Bt" incluyen variedades de maíz, variedades de algodón, variedades de soja y variedades de patata que se comercializan con los nombres comerciales de YIELD GARD® (por ejemplo maíz, algodón, soja), KnockOut® (por ejemplo maíz), StarLink® (por ejemplo maíz), Bollgard® (algodón), Nucotn® (algodón) y NewLeaf® (patata). Los ejemplos de plantas tolerantes a herbicidas que pueden mencionarse son variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja que se venden con los nombres comerciales de Roundup Ready® (tolerancia a glifosato, por ejemplo maíz, algodón, semillas de soja), Liberty Link® (tolerancia a fosfotricina, por ejemplo colza), IMI® (tolerancia a imidazolinonas) y STS® (tolerancia a sulfonilureas, por ejemplo maíz). Las plantas resistentes a herbicidas (plantas reproducidas de forma convencional para la tolerancia a herbicida) que pueden mencionarse incluyen las variedades que se venden con el nombre Clearfield® (por ejemplo maíz). Por supuesto, estas afirmaciones también se aplican a las variedades de plantas cultivadas que tienen estas características ("rasgos") genéticas o las que todavía están por desarrollar; plantas que se desarrollarán o comercializarán en el futuro.

- Las plantas indicadas pueden tratarse de forma particularmente ventajosa de acuerdo con la invención con los compuestos de la fórmula general I o con las mezclas de principio activo de acuerdo con la invención. Los intervalos preferidos mencionados anteriormente para los principios activos y mezclas también son aplicables al tratamiento de estas plantas. El tratamiento de plantas con los compuestos o mezclas indicados especialmente en el presente texto es particularmente destacado.
- Los principios activos de acuerdo con la invención son activos no sólo contra plagas de plantas, de la higiene y de productos almacenados, sino también en el sector veterinario contra parásitos animales (ectoparásitos y endoparásitos), tales como garrapatas duras y blandas, aradores de la sarna, trombídidos, moscas (picadoras y chupadoras), larvas de moscas parásitas, piojos, liendres del cabello, liendres de las plumas y pulgas. Estos parásitos incluyen:
- Del orden de los anoplúridos, por ejemplo, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp. y *Solenopotes* spp.
- Del orden de los malofágidos y los subórdenes *Amblycerina* e *Ischnocerina*, por ejemplo, *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp. y *Felicola* spp.
- Del orden de los dípteros y los subórdenes *Nematocera* y *Brachycera*, por ejemplo, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp., *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides* spp., *Chrysops* spp., *Hybomitra* spp., *Atylotus* spp., *Tabanus* spp., *Haematopota* spp., *Philipomyia* spp., *Braula* spp., *Musca* spp., *Hydrotaea* spp., *Stomoxys* spp., *Haematobia* spp., *Morellia* spp., *Fannia* spp., *Glossina* spp., *Calliphora* spp., *Lucilia* spp., *Chrysomyia* spp., *Wohlfahrtia* spp., *Sarcophaga* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Gasterophilus* spp., *Hippobosca* spp., *Lipoptena* spp., *Melophagus* spp..
- Del orden de los sifonaptéridos, por ejemplo *Pulex* spp., *Ctenocephalides* spp., *Xenopsylla* spp., *Ceratophyllus* spp.
- Del orden de los heteroptéridos, por ejemplo, *Cimex* spp., *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp.
- Del orden de los blatáridos, por ejemplo, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blattella germanica*, *Supella* spp.
- De la subclase de los ácaros (*Acarina*) y de los órdenes *Meta-* y *Mesostigmata*, por ejemplo, *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., *Ixodes* spp., *Amblyomma* spp., *Boophilus* spp., *Dermacentor* spp., *Haemophysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Rhipicephalus* spp., *Dermanyssus* spp., *Raillietia* spp., *Pneumonyssus* spp., *Sternostoma* spp., *Varroa* spp..
- Del orden de los actinédidos (*Prostigmata*) y acarídidos (*Astigmata*), por ejemplo, *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Ornithocheyletia* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Listrophorus* spp., *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp., *Laminosioptes* spp..
- Los principios activos de acuerdo con la invención de la fórmula (I) son también adecuados para controlar artrópodos que atacan al ganado agrícola tal como, por ejemplo, ganado vacuno, ovejas, cabras, caballos, cerdos, asnos, camellos, búfalos, conejos, pollos, pavos, patos, gansos, abejas, otros animales domésticos tales como, por ejemplo, perros, gatos, aves de jaula, peces de acuario y animales experimentales tales como, por ejemplo, hámsteres, conejillos de Indias, ratas y ratones. El control de estos artrópodos desea reducir los casos de muertes y menor productividad (de carne, leche, lana, cueros, huevos, miel etc.), de tal forma que sea más económico y que se haga posible el mantenimiento animal más económico y simple por el uso de los principios activos de la invención.
- Los principios activos de acuerdo con la invención se usan en el sector veterinario y en la cría de animales de un modo conocido mediante administración entérica en forma de, por ejemplo, comprimidos, cápsulas, pociones, brebajes, gránulos, pastas, bolos, procedimientos a través de la alimentación, supositorios, mediante administración parenteral, como por ejemplo por inyecciones (intramusculares, subcutáneas, intravenosas, intraperitoneales y otras), implantes, administración nasal, mediante aplicación dérmica en forma de por ejemplo inmersión o baño (mojadura), pulverización (espray), vertido (unción dorsal puntual y continua), lavado y empolvado, así como con ayuda de artículos moldeados que contienen principios activos, como collares, crotales para las orejas o el rabo, brazaletes para las extremidades, ronzales, dispositivos de marcado etc.
- Cuando se usan en ganado, aves de corral, animales domésticos etc., los principios activos de la fórmula (I) pueden aplicarse en forma de formulaciones (por ejemplo polvos, emulsiones, agentes fluidizables) que comprenden los principios activos en una cantidad del 1 al 80 % en peso, bien directamente bien después de diluirlas entre 100 y 10.000 veces, o pueden usarse como baño químico.
- También se ha encontrado que los compuestos de la invención tienen una fuerte acción insecticida contra insectos que destruyen los materiales industriales.

ES 2 575 566 T3

Ejemplos preferidos pero no limitantes incluyen los insectos siguientes:

5 escarabajos, tales como *Hylotrupes bajulus*, *Chlorophorus pilosus*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinus pecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Ernobius mollis*, *Priobium carpini*, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*, *Lyctus planicollis*, *Lyctus linearis*, *Lyctus pubescens*, *Trogoxylon aequale*, *Minthes rugicollis*, *Xyleborus spec.*, *Tryptodendron spec.*, *Apate monachus*, *Bostrychus capucins*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxylon spec.*, *Dinoderus minutus*;

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

10 termitas, tales como *Kaloterme flavicollis*, *Cryptotermes brevis*, *Heterotermes indicola*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes santonensis*, *Reticulitermes lucifugus*, *Mastotermes darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis*, *Coptotermes formosanus*;

 pececillos de plata, tales como *Lepisma saccharina*.

Los materiales industriales en la presente relación se entiende que se refieren a materiales inanimados, tales como, preferentemente, plásticos, adhesivos, colas, papeles y cartones, cuero, madera, productos de madera procesada y composiciones de revestimiento.

15 Los agentes listos para usarse pueden comprender, dado el caso, otros insecticidas y, dado el caso, uno o más fungicidas.

Respecto a posibles parejas de mezcla adicionales se hace referencia a los insecticidas y fungicidas mencionados anteriormente.

20 Además, los compuestos de acuerdo con la invención pueden usarse para proteger objetos que están en contacto con agua marina o salobre, en particular cascos de barcos, tamices, redes, edificios, instalaciones de atraque y sistemas de señalización, de la formación de incrustación.

Además, los compuestos de acuerdo con la invención pueden usarse solos o en combinaciones con otros principios activos como composiciones antiincrustantes.

25 Los principios activos son también adecuados para controlar plagas animales en el sector doméstico, en el sector de la higiene y en la protección de productos almacenados, en especial insectos, arácnidos y ácaros, que se encuentran en los espacios cerrados, tales como por ejemplo, domicilios, naves industriales, oficinas, cabinas de vehículos y similares. Estos se pueden usar para controlar estas plagas solos o combinados con otros principios activos y agentes auxiliares en productos insecticidas domésticos. Son efectivos contra especies sensibles y resistentes y contra todos los estadios de desarrollo. Estas plagas incluyen:

30 Del orden de los escorpiones, por ejemplo, *Buthus occitanus*.

 Del orden de los ácaros, por ejemplo, *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Bryobia spp.*, *Dermanyssus gallinae*, *Glyciphagus domesticus*, *Ornithodoros moubat*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Trombicula alfreddugesi*, *Neutrombicula autumnalis*, *Dermatophagoides pteronissimus*, *Dermatophagoides forinae*.

 Del orden de las arañas, por ejemplo, *Aviculariidae*, *Araneidae*.

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

5 Del orden de los dípteros, por ejemplo, Aedes aegypti, Aedes albopictus, Aedes taeniorhynchus, Anopheles spp., Calliphora erythrocephala, Chrysozona pluvialis, Culex quinquefasciatus, Culex pipiens, Culex tarsalis, Drosophila spp., Fannia canicularis, Musca domestica, Phlebotomus spp., Sarcophaga carnaria, Simulium spp., Stomoxys calcitrans, Tipula paludosa.

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

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

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

15 Del orden de los anopluros, por ejemplo, Pediculus humanus capitis, Pediculus humanus corporis, Pemphigus spp., Phylloera vastatrix, Phthirus pubis.

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

20 En el campo de los insecticidas domésticos, estos se usan solos o en combinación con otros principios activos adecuados, tales como ésteres de ácido fosfórico, carbamatos, piretroides, neonicotinoides, reguladores del crecimiento o principios activos de otras clases conocidas de insecticidas.

25 Se usan en aerosoles, productos de pulverización sin presión, por ejemplo pulverizadores de bomba y atomizadores, sistemas automáticos de nebulización, nebulizadores, espumas, geles, productos de vaporización con placas de vaporización de celulosa o plástico, vaporizadores de líquido, vaporizadores de gel y membrana, vaporizadores por propulsión, sistemas de vaporización carentes de energía o pasivos, papeles antipolillas, bolsitas antipolillas y geles antipolillas, en forma de gránulos o polvos, en cebos para dispersar o en trampas con cebo.

Descripción de los procedimientos de preparación y productos intermedios

Ejemplos de preparación

Ejemplo nº III: (III-2)

Síntesis de 1-bromo-3-difluorometoxi-6-metilnilina

30 Se disuelve 1-difluorometoxi-6-metilnilina (2,00 g, 11,5 mmol) en 10 ml de DMF y se enfría usando un baño de agua. Se añaden, poco a poco, 2,26 g (12,7 mmol) de N-bromosuccinimida, y la mezcla se agita a 100 °C durante 30 min. Después de enfriar hasta temperatura ambiente, la mezcla de reacción se vierte sobre hielo-agua, después de lo cual se forma un precipitado. El precipitado se separa, se añade solución saturada de bicarbonato sódico a las aguas madres y se extrae la mezcla con diclorometano (3 veces). Las fases orgánicas reunidas se secan sobre sulfato sódico y, si se considera necesario, se separan por cromatografía sobre gel de sílice. (logP: 2,84; MH⁺: 252, RMN de ¹H (400 MHz, DMSO, , ppm): 2,10 (s, 3H), 4,94, (s, 2H), 7,06 (t, 1H), 7,06 (m, 2H).

35

Ejemplo nº III: (III-3)

Síntesis de 1-ciano-3-difluorometoxi-6-metilnilina

40 Se carga inicialmente 1-bromo-3-difluorometoxi-6-metilnilina (1,70 g, 6,74 mmol) en 7 ml de DMF, y se añade cianuro de cobre (I) (0,79 g, 8,76 mmol). La reacción se agita a 150 °C durante la noche. Después de enfriar hasta temperatura ambiente, se elimina el DMF a presión reducida y se añaden al residuo 15 ml de agua y etilendiamina (3,6 ml, 53,9 mmol). La mezcla se agita entonces a temperatura ambiente durante 1 hora. La mezcla de reacción se acidifica entonces hasta pH = 5 usando ácido clorhídrico y se extrae la fase acuosa con acetato de etilo (6 veces). Las fases orgánicas reunidas se secan sobre sulfato sódico y luego se purifican por cromatografía sobre gel de sílice. (logP: 1,90; MH⁺: 199, RMN de ¹H (400 MHz, DMSO, , ppm): 2,12 (s, 3H), 5,91, (s, 2H), 7,10 (t, 1H), 7,20 (m, 2H).

45

Ejemplo nº VI:

Síntesis de 2-amino-2-metil-N-(metilsulfonil)benzamida

50 Se disuelven 20 g (128 mmol) de ácido 2-amino-3-metilbenzoico en 600 ml de diclorometano y se añaden entonces bajo argón 10,98 g (115 mmol) de metanosulfonamida, 24,40 g (154 mmol) de 1-etil-3-(3-

5 dimetilaminopropil)carbodiimida y 15,68 g (128 mmol) de 4-(dimetilamino)piridina. La reacción se agita a temperatura ambiente durante 16 h, el disolvente se elimina por destilación y el residuo se recoge en acetato de etilo y agua. La fase de acetato de etilo se lava cuatro veces con una solución 1 N de ácido clorhídrico y luego, en cada caso, una vez con agua y una solución concentrada de cloruro sódico. Después de secar sobre sulfato sódico, el producto deseado se obtiene por purificación cromatográfica.
(logP: 1,10; MH⁺: 229; RMN de ¹H (400 MHz, DMSO, , ppm): 2,11 (s, 3H), 3,35 (s, 3H), 6,49 (t, 1H), 7,19 (d, 1H), 7,52 (d, 1H), 8,19 (s ancho, 3H).

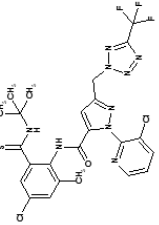
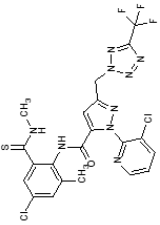
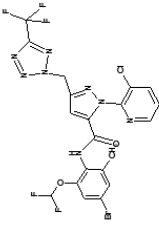
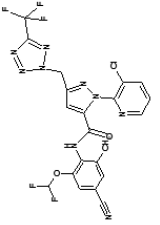
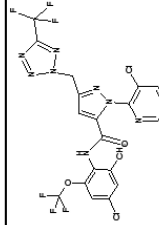
Ejemplos de preparación

10 Los procedimientos de preparación descritos antes se pueden usar para obtener los compuestos de la fórmula (I), algunos de los cuales pueden estar presentes como regioisómeros. Con respecto a los datos de RMN, la tabla siguiente presenta los desplazamientos químicos y las intensidades de señal correspondientes, por ejemplo, para el compuesto 1:

15 Señal 1:
8,46; 0,700; para 8,46 ppm (desplazamiento químico), 0,700 (intensidad de señal);
Señal 2:
8,45; 0,340; para 8,45 ppm (desplazamiento químico), 0,340 (intensidad de señal);
solo los compuestos n.º 6, 7, 31 y 36 son de acuerdo con la invención

Nº	Estructura	log P	MH+	RMN
1		3,35		(8,46;0,700),(8,45;0,340),(8,45;0,310),(8,10;0,320),(8,10;0,280),(8,08;0,340),(8,08;0,290),(7,90;0,390),(7,56;0,300),(7,55;0,300),(7,54;0,290),(7,53;0,260),(7,18;0,190),(5,55;1,100),(3,20;0,220),(3,18;0,290),(3,17;0,560),(3,12;123,220),(3,08;0,190),(3,07;0,230),(2,66;2,730),(2,54;0,180),(2,53;2,240),(2,51;1,080),(2,50;17,000),(2,49;33,560),(2,49;46,100),(2,48;32,650),(2,48;16,000),(2,32;0,200),(2,32;0,260),(2,31;0,270),(2,17;0,830),(1,97;0,170),(-0,00;2,980)
2		3,69	727	(8,496;2,49),(8,494;2,56),(8,488;2,61),(8,486;2,59),(8,482;0,39),(8,477;0,35),(8,474;0,34),(8,139;2,59),(8,137,2,58),(8,126;2,91),(8,123;2,63),(8,114;0,36),(8,112;0,35),(8,079;3,12),(8,076;3,59),(7,826;3,29),(7,823;3,28),(7,421;2,73),(7,414;2,96),(7,408;2,64),(7,403;0,49),(7,400;2,92),(7,390;0,34),(7,198;3,51),(7,140;0,41),(6,110;13,50),(5,961;1,28),(3,336;0,27),(3,275;2,38),(2,740;0,85),(2,624;2,21),(2,170;0,39),(2,139;18,58),(1,957,0,38),(1,953;0,68),(1,949;11,85),(1,945;22,57),(1,941;32,82),(1,937;22,29),(1,933;11,57),(0,005;0,90),(-0,000;31,98),(-0,006;1,05)
3		3,16	619	
4		3,39	804	(9,048;0,27),(8,487;1,50),(8,485;1,57),(8,479;1,59),(8,477;1,56),(8,139;1,76),(8,136;1,77),(8,125;1,86),(8,123,1,75),(7,832;1,41),(7,831;1,51),(7,828;1,83),(7,827;1,67),(7,803;1,83),(7,802;1,84),(7,800;1,53),(7,422;1,84),(7,414;1,83),(7,409;1,74),(7,401;1,74),(7,232;3,36),(6,112;7,25),(3,097;13,50),(2,193;9,84),(2,156;1,37),(2,139;0,46),(1,957;0,32),(1,953;0,50),(1,949;9,20),(1,945;17,02),(1,941;24,85),(1,937;17,51),(1,933;8,82),(0,005;0,43),(-0,000;15,20),(-0,006;0,45)
5		2,47	584	(12,011;0,53),(11,997;0,49),(10,292;0,40),(10,284;0,37),(8,477;4,04),(8,473;4,16),(8,465;4,30),(8,461;4,03),(8,155;3,89),(8,151;3,89),(8,134;4,40),(8,131;4,09),(7,610;4,25),(7,598,4,12),(7,590;3,93),(7,578;3,92),(7,450,2,00),(7,440;10,89),(7,362;1,17),(7,344;1,63),(7,280;2,06),(7,261;2,90),(7,242;1,19),(6,316;14,55),(5,747,3,22),(4,221;0,40),(4,204;0,40),(3,718;0,36),(3,532;0,32),(3,410;0,98),(3,398;1,50),(3,376;2,06),(3,305;7,17,88),(3,191;0,45),(3,004;16,00),(2,678;1,04),(2,674;1,92),(2,669;2,60),(2,664;1,89),(2,660;0,95),(2,592;0,60),(2,539;4,93),(2,522;10,23),(2,517;16,19),(2,509;147,65),(2,504;274,53),(2,500;357,88),(2,496;240,55),(2,491;109,83),(2,336;0,86),(2,331;1,80),(2,327;2,40),(2,322;1,68),(2,318;0,77),(2,235;14,15),(2,069;1,80),(1,987;0,80),(1,908;1,31),(1,398;0,33),(1,266;0,60),(1,248;1,28),(1,237;0,93),(1,230;0,78),(1,177;0,41),(1,175;0,56),(1,108;0,37),(1,091;0,75),(1,073;0,38),(0,008;1,20),(-0,000;28,51),(-0,008;0,88)

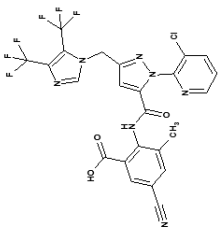
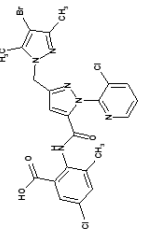
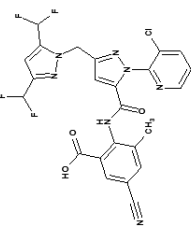
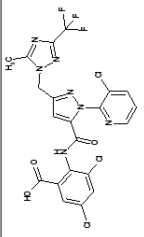
(continuación)

Nº	Estructura	log P	MH+	RMN
6		4,33	612	(10,111;1,25),(9,123;0,95),(8,473;0,81),(8,470;0,86),(8,462;0,88),(8,458;0,84),(8,160;0,80),(8,156;0,79),(8,140;0,89),(8,136;0,82),(7,606;0,83),(7,595;0,80),(7,586;0,77),(7,574;0,76),(7,330;0,92),(7,324;0,97),(7,297;2,38),(7,055;1,00),(7,049;0,96),(6,314;3,49),(4,039;0,36),(4,021;0,36),(3,306;163,96),(2,522;0,91),(2,509;13,19),(2,505;24,47),(2,500;31,77),(2,496;22,05),(2,491;10,52),(2,128;4,53),(1,987;1,57),(1,398;1,31),(1,360;16,00),(1,193;0,47),(1,175;0,88),(1,157;0,44),(-0,000;0,86)
7		3,42	570	(10,175;1,40),(10,163;1,39),(10,074;4,24),(8,477;3,08),(8,473;3,24),(8,465;3,35),(8,461;3,17),(8,154;2,94),(8,150;2,88),(8,134;3,32),(8,130;3,03),(7,600;3,08),(7,588;3,09),(7,580;2,90),(7,568;2,85),(7,388;3,31),(7,338;7,329),(7,382;3,44),(7,286;8,25),(7,108;3,56),(7,102;3,41),(6,304;12,11),(6,286;0,35),(6,084;0,41),(3,305;210,51),(2,986;10,23),(2,974;10,17),(2,674;0,41),(2,669;0,51),(2,664;0,39),(2,539;0,84),(2,522;2,67),(2,509;28,96),(2,504;52,32),(2,500;67,09),(2,496;46,08),(2,491;21,79),(2,331;0,37),(2,327;0,51),(2,322;0,43),(2,157;16,00),(2,069;8,08),(-0,000;1,40)
8		3,77	606	(10,039;2,19),(8,462;2,60),(8,458;2,67),(8,450;2,80),(8,447;2,69),(8,118;2,55),(8,115;2,61),(8,098;2,79),(8,094;2,76),(7,975;1,05),(7,584;2,78),(7,572;2,80),(7,564;2,73),(7,552;2,63),(7,388;2,80),(7,384;3,12),(7,329;2,01),(7,276;2,86),(7,217;2,13),(7,033;4,30),(6,849;2,14),(6,271;11,84),(4,064;0,95),(4,047;3,01),(4,029;2,97),(4,011;0,96),(3,316;0,36),(3,301;0,38),(3,298;0,36),(3,283;0,38),(3,248;0,47),(3,232;0,55),(3,178;1,63),(3,124;919,42),(3,067;0,56),(3,049;0,33),(2,668;0,39),(2,663;0,72),(2,658;0,97),(2,654;0,62),(2,648;0,39),(2,562;0,38),(2,527;4,55),(2,511;3,37),(2,498;53,81),(2,493;106,17),(2,489;146,19),(2,484;102,80),(2,480;49,95),(2,320;0,61),(2,316;0,92),(2,311;0,62),(2,158;16,00),(2,041;0,64),(1,974;13,30),(1,948;0,62),(1,246;0,35),(1,195;3,72),(1,177;7,23),(1,168;0,83),(1,160;3,76),(-0,000;2,51)
9		2,85	554	
10		4	581	(10,408;1,93),(8,489;1,77),(8,485;1,98),(8,477;1,93),(8,473;1,96),(8,186;1,76),(8,182;1,87),(8,165;2,01),(8,161;1,92),(7,624;1,95),(7,612;1,84),(7,604;1,82),(7,592;1,84),(7,475;1,37),(7,474;1,43),(7,470;1,84),(7,468;1,71),(7,428;1,26),(7,372;3,86),(7,061;0,26),(6,329;5,29),(3,430;0,41),(3,330;363,32),(3,290;0,26),(3,280;0,46),(2,676;0,23),(2,671;0,31),(2,667;0,22),(2,542;1,48),(2,525;0,90),(2,520;1,29),(2,511;15,94),(2,507;35,69),(2,502;50,30),(2,497;36,51),(2,493;16,78),(2,334;0,22),(2,329;0,30),(2,325;0,23),(2,190;8,00),(2,124;0,72),(1,236;0,31),(0,876;0,22),(-0,000;1,99)

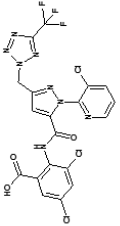
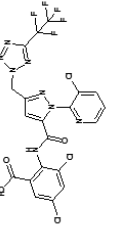
(continuación)

Nº	Estructura	log P	MH+	RMN
11		4,57	713	(9,05;0,710),(8,45;1,410),(8,44;1,560),(8,43;1,550),(8,43;1,600),(8,02;1,240),(8,02;1,410),(8,01;1,510),(8,01;1,550),(7,97;1,480),(7,97;1,620),(7,95;1,710),(7,95;1,690),(7,82;1,360),(7,81;1,390),(7,81;1,360),(7,49;1,680),(7,48;1,670),(7,47;1,610),(7,46;1,540),(7,21;2,060),(7,01;1,500),(5,68;4,600),(5,44;1,170),(3,76;16,000),(2,15;5,700),(2,14;8,680),(1,97;0,670),(1,96;1,000),(1,94;1,970),(1,94;2,970),(1,93;2,110),(1,93;1,090),(1,20;0,430)
12		2,2	542	(8,47;10,330),(8,46;6,080),(8,46;2,250),(8,46;4,810),(8,45;4,750),(8,03;1,020),(7,99;1,040),(7,98;4,360),(7,98;4,570),(7,97;1,250),(7,96;4,940),(7,96;4,740),(7,83;9,170),(7,83;10,690),(7,82;1,170),(7,72;7,280),(7,71;6,980),(7,62;1,390),(7,61;1,590),(7,51;1,250),(7,51;4,910),(7,50;0,750),(7,50;1,430),(7,50;4,830),(7,49;1,640),(7,49;4,660),(7,48;0,710),(7,48;1,330),(7,48;4,630),(7,47;2,130),(7,47;1,820),(7,10;0,650),(7,09;1,040),(7,08;2,500),(7,04;0,620),(6,96;3,860),(6,83;7,230),(6,69;3,600),(5,65;1,120),(5,56;16,000),(3,28;8,600),(2,68;0,790),(2,67;0,800),(2,66;0,630),(2,27;0,620),(2,12;0,930),(2,11;1,480),(2,11;1,910),(2,10;1,440),(2,09;0,910),(1,97;0,670),(1,96;23,420),(1,96;6,180),(1,95;93,190),(1,95;185,840),(1,94;271,210),(1,93;187,180),(1,93;9,560),(1,92;5,620),(1,91;1,570),(1,89;0,640),(1,78;0,650),(1,77;1,160),(1,77;1,620),(1,76;1,180),(1,76;0,660),(0,69;0,740),(0,68;1,210),(0,68;0,730),(0,67;1,080),(0,66;0,940),(0,66;0,630),(0,46;0,820),(0,46;0,860),(0,45;0,880),(0,45;0,960),(0,44;0,970),(0,01;1,310),(0,00;47,800),(0,01;2,040)
13		3,36	632	(8,468;2,41),(8,465;2,54),(8,457;2,52),(8,453;2,56),(8,134;2,46),(8,133;2,52),(8,129;2,64),(8,128;2,52),(7,99;6,255),(7,992;2,60),(7,976;2,84),(7,972;2,75),(7,786;2,32),(7,784;2,50),(7,781;2,53),(7,780;2,33),(7,519;2,98),(7,507;2,86),(7,499;2,73),(7,487;2,72),(7,234;7,17),(6,127;0,50),(6,116;13,16),(3,643;0,50),(2,519;0,52),(2,211;16,00),(1,952;16,28),(1,945;33,48),(1,939;49,81),(1,933;34,83),(1,927;18,22),(1,914;0,93),(1,894;0,42),(1,888;0,39),(1,882;0,34),(1,819;0,36),(1,811;0,32),(1,802;0,75),(1,794;0,33),(1,786;0,35),(1,774;0,36),(1,768;0,43),(1,270;0,46),(0,000;15,35),(0,009;0,69)
14		2,65	532	(8,469;2,40),(8,465;2,59),(8,457;2,56),(8,453;2,62),(8,129;2,59),(8,127;2,72),(8,124;2,88),(8,123;2,80),(7,99;6,243),(7,992;2,54),(7,975;2,73),(7,971;2,71),(7,780;2,24),(7,778;2,49),(7,775;2,55),(7,773;2,37),(7,517;2,89),(7,506;2,82),(7,497;2,69),(7,485;2,60),(7,242;7,10),(6,105;12,93),(2,555;0,99),(2,208;16,00),(1,964;1,64),(1,952;4,97),(1,946;9,94),(1,940;14,60),(1,934;10,01),(1,927;5,06),(1,803;0,37),(0,000;4,08)
15		4,4	727	(8,480;3,53),(8,476;3,37),(8,468;3,83),(8,464;3,38),(8,136;2,23),(8,133;3,85),(8,130;3,00),(8,116;2,56),(8,11;3,4,30),(8,109;3,16),(7,896;3,20),(7,763;4,54),(7,761;6,11),(7,757;4,53),(7,754;5,55),(7,714;3,11),(7,680;5,00),(7,598;2,68),(7,596;3,31),(7,585;3,25),(7,578;2,63),(7,576;3,14),(7,566;2,50),(7,565;3,06),(7,208;1,97),(7,190;2,73),(5,775;7,99),(5,741;5,05),(3,474;0,47),(3,454;0,60),(3,305;95,48),(3,179;0,65),(3,160;0,51),(2,674;0,86),(2,669;1,14),(2,665;0,88),(2,660;0,51),(2,592;0,38),(2,585;0,39),(2,539;1,94),(2,523;4,88),(2,509;63,24),(2,505;1,680),(2,500;151,02),(2,496;102,17),(2,491;47,61),(2,332;0,73),(2,327;0,99),(2,322;0,67),(2,069;15,00),(1,186;1,34),(0,008;0,46),(0,000;9,69),(0,008;0,36)

(continuación)

Nº	Estructura	log P	MH+	RMN
16		2,63	597	(10,543;3,97),(8,480;2,72),(8,476;2,92),(8,468;2,90),(8,464;2,83),(8,412;6,59),(8,137;2,71),(8,134;2,68),(8,117;2,89),(8,113;2,73),(7,854;4,76),(7,851;4,72),(7,817;3,99),(7,814;3,18),(7,592;2,94),(7,581;2,96),(7,572;3,23),(7,560;4,39),(7,195;4,45),(5,635;7,86),(3,307;987,97),(3,218;0,37),(2,674;0,96),(2,669;1,33),(2,665;1,05),(2,522;6,18),(2,509;78,30),(2,504;145,43),(2,500;189,32),(2,496;131,46),(2,491;64,26),(2,336;0,57),(2,331;0,94),(2,327;1,32),(2,322;1,06),(2,164;15,00),(1,987;0,41),(1,398;1,27),(-0,000;5,42)
17		3,16	579	(8,479;1,63),(8,475;1,74),(8,467;1,76),(8,464;1,71),(8,143;1,58),(8,139;1,58),(8,123;1,73),(8,119;1,61),(7,612;1,92),(7,606;2,39),(7,591;1,69),(7,579;1,66),(7,571;1,67),(7,558;3,07),(7,551;1,84),(7,070;3,75),(5,381;6,89),(3,409;0,46),(3,399;0,56),(3,304;221,48),(2,674;0,57),(2,669;0,74),(2,664;0,58),(2,539;1,53),(2,504;79,11),(2,500;99,67),(2,496;69,97),(2,331;0,59),(2,327;0,76),(2,322;0,57),(2,279;13,44),(2,148;10,29),(2,129;15,00),(2,069;12,29),(-0,000;19,02),(-0,008;1,02)
18		2,62	562	(8,449;3,14),(8,446;3,10),(8,441;3,19),(8,439;3,04),(8,108;4,84),(8,105;4,75),(7,972;3,08),(7,970;2,97),(7,958;3,26),(7,956;3,05),(7,763;4,55),(7,761;4,32),(7,760;4,35),(7,485;3,14),(7,477;3,08),(7,472;2,96),(7,464;2,88),(7,166;2,40),(7,077;5,01),(7,027;8,81),(6,988;2,51),(6,905;2,47),(6,869;4,78),(6,814;5,11),(6,723;2,58),(5,591;16,00),(2,194;24,90),(1,964;9,11),(1,947;1,45),(1,943;2,80),(1,939;4,11),(1,935;2,81),(1,931;1,43),(0,000;0,35)
19		2,68	574	(8,452;1,41),(8,450;1,53),(8,445;1,49),(8,442;1,54),(7,971;1,40),(7,969;1,43),(7,958;1,51),(7,956;1,49),(7,826;2,76),(7,822;3,01),(7,696;2,56),(7,692;2,48),(7,492;1,50),(7,484;1,49),(7,479;1,44),(7,471;1,42),(7,076;3,63),(5,585;0,33),(5,502;7,95),(2,523;16,00),(2,362;0,86),(1,965;1,58),(1,949;2,43),(1,944;4,77),(1,940;7,01),(1,936;4,82),(1,932;2,47),(0,000;0,68)

(continuación)

Nº	Estructura	log P	MH+	RMN
20		2,75	527	(11,301;1,49),(10,134;1,23),(8,485;2,75),(8,481;2,87),(8,473;3,02),(8,469;3,06),(8,462;1,24),(8,454;1,13),(8,450;1,04),(8,159;2,56),(8,156;2,59),(8,139;3,76),(8,135;2,95),(8,122;1,14),(8,119;0,96),(7,609;2,71),(7,597;3,57),(7,588;2,89),(7,576;3,31),(7,565;0,97),(7,413;1,52),(7,406;1,73),(7,391;1,62),(7,384;1,78),(7,355;2,83),(7,328;6,41),(7,284;0,76),(7,258;0,64),(7,077;0,57),(7,071;0,54),(7,056;0,60),(6,310;13,41),(5,747;3,10),(3,721;0,67),(3,534;1,92),(3,516;2,03),(3,497;0,53),(3,494;0,51),(3,480;0,52),(3,468;0,51),(3,445;0,67),(3,431;0,85),(3,300;11,12,09),(3,277;44,28),(3,172;0,89),(3,159;0,77),(3,146;0,69),(3,127;0,58),(3,096;0,46),(3,084;0,48),(3,075;0,48),(3,036;0,44),(2,673;2,74),(2,669;3,55),(2,664;2,68),(2,592;1,30),(2,539;11,03),(2,508;2,16),(2,504;376,55),(2,500;466,24),(2,495;320,17),(2,377;0,56),(2,360;0,48),(2,331;2,61),(2,326;3,34),(2,322,52),(2,187;0,48),(2,153;15,00),(2,095;0,43),(2,069;2,28),(2,049;0,47),(1,237;1,37),(1,182;0,87),(0,454;1,03),(0,433;0,98),(0,157;1,29),(0,146;1,45),(0,008;5,72),(0,000;90,02),(0,008;3,96)
21		3,04	561	(8,488;3,67),(8,484;3,96),(8,476;4,11),(8,473;3,85),(8,467;1,31),(8,156;3,95),(8,152;3,62),(8,135;4,28),(8,132,81),(7,919;1,49),(7,914;1,69),(7,898;2,21),(7,841;1,26),(7,769;6,49),(7,763;5,83),(7,613;3,54),(7,608;1,57),(7,601;3,56),(7,596;1,90),(7,593;3,43),(7,588;1,44),(7,581;3,29),(7,576;1,12),(7,391;5,31),(7,336;2,05),(6,317;15,00),(6,310;5,29),(5,746;5,40),(3,754;0,32),(3,750;0,33),(3,720;0,33),(3,708;0,41),(3,641;0,45),(3,635;0,46),(3,623;0,47),(3,602;0,54),(3,583;0,59),(3,557;0,74),(3,535;0,84),(3,524;0,93),(3,310;884,46),(3,189;1,64),(3,118;0,75),(3,033;0,42),(3,021;0,38),(2,993;0,32),(2,708;0,33),(2,674;2,12),(2,670;2,78),(2,665;2,06),(2,539;9,02),(2,509;170,46),(2,505;299,28),(2,500;373,79),(2,496;257,60),(2,331;2,11),(2,327;2,77),(2,322;1,96),(2,311;0,40),(2,123;5,77),(2,069;1,28),(2,050;0,36),(1,236;1,47),(0,008;2,74),(0,000;51,75),(0,008;2,64)
22		3,44	591	(10,337;0,74),(8,487;2,56),(8,483;2,61),(8,475;2,72),(8,471;2,53),(8,157;2,48),(8,154;2,36),(8,137;2,74),(8,133;2,45),(7,635;2,92),(7,629;3,48),(7,608;2,53),(7,596;2,54),(7,588;2,55),(7,576;5,60),(7,570;2,98),(7,363;5,41),(6,347;9,90),(5,746;8,76),(3,321;1,63),(2,541;0,58),(2,507;10,01),(2,502;12,35),(2,498;8,54),(2,168;15,00),(0,000;2,38)
23		3,37	611	(10,668;0,49),(8,487;3,40),(8,483;3,70),(8,475;3,71),(8,471;3,70),(8,152;3,33),(8,149;3,41),(8,132;3,74),(8,128;3,57),(7,926;4,21),(7,920;4,53),(7,771;6,44),(7,764;6,05),(7,610;3,57),(7,599;3,48),(7,590;3,36),(7,579;3,29),(7,407;5,76),(6,346;15,00),(5,747;6,89),(3,304;51,37),(2,673;0,53),(2,669;0,70),(2,665;0,56),(2,539;2,27),(2,509;40,44),(2,505;71,73),(2,500;90,56),(2,496;63,19),(2,332;0,47),(2,327;0,63),(2,322;0,44),(2,069;0,40),(1,237;0,34),(0,008;1,20),(0,000;19,74),(0,000;0,93)
24		3,52	630/632	(10,334;0,76),(8,486;2,57),(8,482;2,66),(8,474;2,75),(8,470;2,59),(8,157;2,49),(8,153;2,43),(8,137;2,76),(8,133;2,52),(7,762;2,98),(7,756;3,55),(7,707;3,39),(7,701;2,91),(7,608;2,55),(7,596;2,51),(7,588;2,42),(7,576;2,36),(7,360;5,23),(6,345;9,99),(5,747;8,77),(3,315;1,97),(2,541;0,72),(2,510;6,36),(2,506;11,29),(2,502;14,21),(2,497;9,87),(2,164;15,00),(0,000;2,91)

(continuación)

Nº	Estructura	log P	MH+	RMN
25		2,55	543	(10,776;0,31),(10,769;0,31),(8,486;3,39),(8,482;3,50),(8,474;3,60),(8,470;3,41),(8,152;3,30),(8,148;3,23),(8,132;3,64),(8,128;3,34),(7,908;3,66),(7,902;3,84),(7,766;6,24),(7,760;5,73),(7,664;2,60),(7,609;3,39),(7,597;3,33),(7,589;3,22),(7,577;3,11),(7,533;5,51),(7,402;2,86),(7,362;6,66),(6,246;15,00),(5,747;6,14),(3,305;3,1,28),(2,673;0,46),(2,669;0,57),(2,664;0,47),(2,539;2,83),(2,504;60,47),(2,500;75,62),(2,496;52,81),(2,331;0,41),(2,327;0,52),(2,322;0,39),(2,069;0,38),(0,008;0,87),(0,000;14,61),(0,000;0,72)
26		3,03	560	(8,531;6,37),(8,486;3,59),(8,482;3,85),(8,474;3,87),(8,471;3,72),(8,148;3,48),(8,145;3,47),(8,128;3,90),(8,125;3,62),(7,900;3,04),(7,894;3,14),(7,761;6,71),(7,755;6,19),(7,606;3,61),(7,594;3,58),(7,585;3,42),(7,574;3,35),(7,278;5,86),(5,954;15,00),(5,746;2,58),(3,311;21,14),(2,674;0,99),(2,669;1,27),(2,665;1,00),(2,539;4,04),(2,509;73,52),(2,505;129,39),(2,500;162,09),(2,496;112,35),(2,332;0,90),(2,327;1,15),(2,323;0,91),(2,069;0,47),(1,237;0,64),(0,000;22,15),(0,008;1,04)
27		3,26	632	(10,349;0,36),(8,528;4,44),(8,481;2,53),(8,477;2,70),(8,469;2,73),(8,465;2,67),(8,151;2,44),(8,147;2,48),(8,130;2,73),(8,127;2,58),(7,913;3,19),(7,908;3,51),(7,832;3,22),(7,828;3,00),(7,600;2,55),(7,589;2,53),(7,580;2,44),(7,568;2,36),(7,227;5,04),(5,945;10,10),(5,746;4,51),(3,451;0,31),(3,432;0,40),(3,307;23,37),(2,669;0,31),(2,539;4,21),(2,509;18,51),(2,504;33,05),(2,500;41,84),(2,496;29,23),(2,118;15,00),(0,008;0,40),(0,000;6,83),(0,000;0,32)
28		2,69	560	(9,067;6,08),(8,487;3,41),(8,483;3,60),(8,475;3,66),(8,471;3,51),(8,150;3,35),(8,146;3,33),(8,130;3,72),(8,126;6,34),(7,897;3,47),(7,891;3,67),(7,763;6,59),(7,757;6,02),(7,605;3,47),(7,594;3,41),(7,585;3,28),(7,574;3,20),(7,273;7,00),(5,891;15,00),(5,747;5,49),(3,306;36,06),(2,674;0,51),(2,669;0,64),(2,664;0,49),(2,539;3,87),(2,509;37,22),(2,504;66,40),(2,500;81,98),(2,496;56,59),(2,331;0,43),(2,327;0,57),(2,322;0,42),(1,237;0,36),(0,008;0,86),(0,000;14,57),(0,000;0,65)
29		3,33	539	(10,258;2,47),(8,489;1,87),(8,485;1,95),(8,477;2,00),(8,473;1,91),(8,170;1,76),(8,167;1,76),(8,150;1,97),(8,146;1,82),(7,616;1,85),(7,604;1,83),(7,596;1,77),(7,584;1,70),(7,426;0,76),(7,419;1,36),(7,406;1,93),(7,397;1,85),(7,385;1,60),(7,376;1,07),(7,369;5,14),(6,324;7,61),(6,297;0,32),(6,292;0,32),(5,747;1,60),(3,700;15,00),(3,304;324,81),(2,674;0,43),(2,669;0,54),(2,665;0,41),(2,539;2,69),(2,509;32,50),(2,504;56,34),(2,500;69,97),(2,496;48,40),(2,331;0,41),(2,327;0,52),(2,322;0,40),(2,203;10,52),(2,069;0,84),(0,008;0,47),(0,000;7,91),(0,000;0,41)

(continuación)

Nº	Estructura	log P	MH+	RMN
30		3,05	541	(10,285;1,76),(8,485;2,54),(8,482;2,66),(8,474;2,72),(8,470;2,57),(8,160;2,44),(8,156;2,43),(8,140;2,71),(8,136;2,51),(7,627;2,91),(7,621;3,56),(7,609;2,69),(7,598;2,62),(7,589;2,64),(7,578;5,63),(7,572;3,07),(7,347;5,60),(6,315;10,27),(5,746;4,35),(3,308;82,20),(2,674;0,43),(2,669;0,52),(2,539;2,68),(2,505;50,56),(2,500;61,98),(2,496;43,91),(2,331;0,38),(2,327;0,48),(2,323;0,42),(2,164;15,00),(2,069;0,53)(-0,000;11,15),(-0,008;0,66),
31		3,75	603	(10,33;0,99), (9,45;0,79), (8,48;0,73), (8,47;0,78), (8,47;0,79), (8,47;0,79), (8,17;0,61), (8,17;0,62), (8,16;0,66), (8,15;0,64), (7,73;0,89), (7,73;0,89), (7,73;0,89), (7,61;0,58), (7,60;0,59), (7,59;0,59), (7,48;0,91), (7,48;0,89), (7,32;1,54), (6,33;2,69), (3,34;48,74), (3,32;0,91), (2,61;0,42), (2,52;0,62), (2,52;0,79), (2,52;0,80), (2,51;23,66), (2,51;52,68), (2,50;73,24), (2,50;52,62), (2,50;23,65), (2,39;0,40), (2,18;3,73), (1,37;16,00), (0,01;0,75), (0,00;25,20), (-0,01;0,74)
32		2,56	542	(10,08;2,31), (8,47;1,92), (8,46;2,05), (8,45;2,08), (8,45;2,01), (8,18;1,91), (8,16;2,13), (8,16;1,97), (7,76;1,41), (7,74;1,55), (7,74;1,52), (7,61;2,01), (7,60;1,97), (7,59;1,91), (7,58;1,88), (7,51;1,21), (7,50;1,70), (7,42;1,68), (7,40;2,52), (7,38;1,16), (7,36;5,82), (7,21;4,42), (6,32;8,17), (4,06;1,21), (4,04;3,62), (4,02;3,65), (4,00;1,23), (3,35;0,36), (3,31;190,09), (3,29;1,05), (2,94;15,05), (2,78;11,33), (2,52;0,95), (2,51;13,05), (2,50;24,25), (2,50;31,60), (2,50;21,80), (2,49;10,41), (2,17;11,30), (2,13;0,83), (2,07;0,38), (1,99;16,00), (1,96;12,65), (1,91;1,66), (1,40;0,49), (1,19;4,39), (1,17;8,69), (1,16;4,27), (0,00;1,64)
33		2,9	5556	(10,14;0,65), (8,48;1,41), (8,48;1,50), (8,47;1,61), (8,47;1,58), (8,19;1,11), (8,19;1,12), (8,18;1,22), (8,18;1,17), (7,69;0,65), (7,68;0,72), (7,62;1,18), (7,61;1,13), (7,60;1,13), (7,60;1,15), (7,56;0,56), (7,54;0,67), (7,44;0,39), (7,43;0,65), (7,42;0,35), (7,38;1,27), (7,16;0,37), (7,16;0,37), (6,33;4,21), (4,05;1,14), (4,03;3,51), (4,02;3,56), (4,01;1,16), (3,35;410,42), (3,33;1,64), (2,62;0,57), (2,61;0,40), (2,52;1,20), (2,52;1,53), (2,52;1,50), (2,51;28,88), (2,51;63,35), (2,50;86,53), (2,50;62,83), (2,50;28,17), (2,39;2,24), (2,39;2,66), (2,38;3,05), (2,36;0,49), (2,35;0,48), (2,29;0,41), (2,16;6,11), (2,13;1,11), (2,08;0,77), (1,99;16,00), (1,19;4,65), (1,17;9,99), (1,16;4,43), (0,00;7,03)

(continuación)

Nº	Estructura	log P	MH+	RMN
34		3,35	519	(10,29;3,39), (8,48;2,66), (8,47;2,86), (8,46;2,88), (8,46;2,81), (8,16;2,62), (8,16;2,64), (8,14;2,90), (8,14;2,74), (7,61;2,79), (7,60;2,74), (7,59;2,63), (7,58;2,57), (7,45;1,94), (7,44;2,38), (7,42;1,81), (7,40;2,53), (7,38;6,68), (7,30;2,31), (7,28;3,43), (7,26;1,41), (6,32;10,84), (3,32;133,99), (2,94;1,85), (2,78;3,03), (2,77;5,38), (2,75;5,47), (2,73;1,69), (2,51;7,93), (2,51;14,69), (2,50;19,13), (2,50;13,50), (2,49;6,63), (2,20;16,00), (2,10;0,41), (1,96;1,58), (1,07;0,35), (0,95;5,84), (0,93;12,25), (0,91;5,56), (0,00;1,05)
35		3,33	531	(10,35;3,56), (8,47;2,71), (8,47;2,86), (8,46;2,89), (8,46;2,79), (8,16;2,68), (8,16;2,66), (8,14;2,98), (8,14;2,74), (7,61;2,84), (7,60;2,77), (7,59;2,66), (7,58;2,58), (7,45;1,89), (7,43;4,06), (7,41;2,73), (7,37;7,12), (7,33;2,50), (7,31;3,34), (7,30;1,37), (6,32;11,15), (3,32;198,19), (2,94;0,62), (2,78;0,49), (2,54;0,33), (2,51;9,66), (2,51;17,62), (2,50;22,68), (2,50;15,73), (2,49;7,55), (2,35;0,47), (2,34;1,02), (2,33;1,18), (2,32;1,82), (2,31;1,15), (2,30;1,10), (2,30;1,12), (2,29;0,52), (2,20;16,00), (1,96;0,53), (0,95;0,88), (0,94;2,36), (0,93;3,79), (0,93;3,19), (0,92;3,26), (0,92;1,67), (0,91;0,93), (0,90;2,28), (0,89;3,30), (0,88;2,29), (0,88;2,08), (0,87;3,51), (0,86;1,58), (0,85;0,85), (0,00;1,21)
36		3,73	662	(10,19;1,46), (10,19;1,46), (10,09;4,38), (9,17;0,68), (8,48;3,27), (8,47;3,40), (8,47;3,53), (8,46;3,46), (8,16;2,94), (8,16;2,96), (8,15;3,17), (8,14;3,04), (7,68;3,24), (7,68;3,36), (7,60;3,00), (7,59;2,92), (7,58;2,93), (7,35;3,37), (7,35;3,37), (7,29;7,57), (6,31;12,11), (4,05;0,42), (4,03;1,28), (4,02;1,28), (4,01;0,43), (3,37;0,68), (3,35;463,47), (3,33;0,81), (3,33;2,04), (3,27;2,63), (2,97;10,47), (2,96;9,98), (2,93;3,38), (2,62;0,34), (2,61;0,47), (2,61;0,33), (2,53;1,73), (2,52;0,71), (2,52;0,93), (2,52;0,97), (2,51;24,53), (2,51;53,08), (2,50;72,75), (2,50;52,73), (2,50;24,03), (2,39;4,34), (2,12;16,00), (2,11;0,46), (1,99;5,66), (1,40;0,83), (1,23;0,47), (1,19;1,52), (1,17;3,07), (1,16;1,51), (0,01;0,47), (0,00;14,79), (-0,01;0,44)

Procedimientos analíticos:

Los valores logP indicados en la tabla anterior y en los ejemplos de preparación se determinaron de acuerdo con la directiva de la CE 79/831 Anexo V.A8 mediante HPLC (Cromatografía líquida de alto rendimiento) en columnas de fase inversa (C 18), con los procedimientos siguientes:

5 La determinación de CL-EM en un intervalo ácido se lleva a cabo a pH de 2,7 usando eluyentes de ácido fórmico acuoso al 0,1 % y acetonitrilo (contiene ácido fórmico al 0,1 %); un gradiente lineal de acetonitrilo al 10 % a acetonitrilo al 95 %.

10 Se llevó a cabo la calibración usando alcan-2-onas no ramificadas (con de 3 a 16 átomos de carbono) con valores de logP conocidos (los valores de logP se determinaron mediante tiempos de retención usando interpolación lineal entre dos alcanonas sucesivas).

Los valores de lambda máx se determinaron en los máximos de las señales cromatográficas usando el espectro UV de 200 nm a 400 nm.

Las señales MH⁺ se determinaron usando un sistema Agilent MSD con IEP e ionización positiva o negativa.

15 Los espectros de RMN se determinaron con un aparato Bruker Avance 400 provisto de un cabezal de sonda de flujo (volumen 60 µl). El disolvente usado fue d₆-DMSO, empleándose tetrametilsilano (0,00 ppm) como referencia. Los ejemplos de la tabla anterior se recogieron en d₆-DMSO como disolvente, con la salvedad de los Ejemplos n.º 2, 4, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 14, 18 y 19, que se recogieron en CD₃CN como disolvente. La temperatura de medida es de 303K cuando el disolvente usado es d₆-DMSO y 298K cuando el disolvente usado es CD₃CN.

En casos individuales, las muestras se midieron usando un Bruker Avance II 600 o III 600.

20 **Ejemplos de uso**

Ejemplo 1:

Prueba en *Boophilus microplus* (inyección BOOPMI)

Disolvente: dimetilsulfóxido

25 Para preparar una preparación adecuada de principio activo, se mezclan 10 mg de principio activo con 0,5 ml de diluyente, y el concentrado se diluye con diluyente a la concentración deseada.

La solución de principio activo se inyecta en el abdomen (*Boophilus microplus*), y se traspasan los animales a placas y se almacenan en una sala aclimatada. El control de la eficacia se realiza por deposición de huevos fértiles.

Después de 7 días, se determina la eficacia en %. 100 % significa que ninguna de las garrapatas puso huevos fértiles.

30 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación presentan una actividad del 100 % a una dosis de aplicación de 10 µg/animal: 6, 7

Ejemplo 2:

Ensayo de *Lucilia cuprina* (LUCICU)

Disolvente: dimetilsulfóxido

35 Para preparar una preparación adecuada de principio activo, se mezclan 10 mg de principio activo con 0,5 ml de dimetilsulfóxido, y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Los recipientes que contenían carne de caballo tratada con la preparación de principio activo a la concentración deseada se colonizan con aproximadamente 20 larvas de *Lucilia cuprina*.

40 Después de 2 días se determinan las muertes en %. 100 % significa que todas las larvas han muerto; el 0 % significa que ninguna de las larvas ha muerto.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100 % a una dosis de aplicación de 100 ppm: 6, 7, 8, 9

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 90 % a una dosis de aplicación de 100 ppm: 12

45

Ejemplo 3:

Ensayo de *Musca domestica* (MUSCDO)

Disolvente: dimetilsulfóxido

5 Para preparar una preparación adecuada de principio activo, se mezclan 10 mg de principio activo con 0,5 ml de dimetilsulfóxido, y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Se colonizan recipientes que contenían una esponja tratada con la preparación de principio activo a la concentración deseada con *Musca domestica* adulta.

Después de 2 días se determina las muertes en %. 100 % significa que todas las moscas han muerto; 0 % significa que ninguna de las moscas ha muerto.

10 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 90 % a una dosis de aplicación de 100 ppm: 6

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 80 % a una dosis de aplicación de 100 ppm: 9

15 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 90 % a una dosis de aplicación de 20 ppm: 7

Ejemplo 4:

Ensayo de *Spodoptera frugiperda* (tratamiento de pulverización SPODFR)

20	Disolventes:	78,0	partes en peso de acetona
		1,5	partes en peso de dimetilformamida
	Emulsionante:	0,5	partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

Para preparar una preparación adecuada de principio activo, se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades indicadas de disolventes y emulsionante, y el concentrado se diluye con agua con emulsionante a la concentración deseada.

25 Se pulverizaron discos de hojas de maíz (*Zea mays*) con una preparación de principio activo a la concentración deseada, después de secar, se colonizaron con orugas de gusano soldado (*Spodoptera frugiperda*).

Después de 7 días se determina el efecto en %. 100 % quiere decir que todas las orugas han muerto; 0 % quiere decir que ninguna de las orugas ha muerto.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación presentan una actividad del 100 % a una dosis de aplicación de 500 g/ha: 12

30 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación presentan una actividad del 100 % a una dosis de aplicación de 100 g/ha: 2, 3, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 13, 14, 26, 29, 35, 36

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación presentan una actividad del 83 % a una dosis de aplicación de 100 g/ha: 21, 27, 30, 31

Ejemplo 5:

35 **Ensayo de *Phaedon* (tratamiento de pulverización PHAECO)**

40	Disolventes:	78,0	partes en peso de acetona
		1,5	partes en peso de dimetilformamida
	Emulsionante:	0,5	partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

40 Para preparar una preparación adecuada de principio activo, se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades indicadas de disolventes y emulsionante, y el concentrado se diluye con agua con emulsionante a la concentración deseada.

Se pulverizan discos de col china (*Brassica pekinensis*) con una preparación de principio activo a la concentración deseada y, tras secar, se colonizan con larvas de escarabajo de la mostaza (*Phaedon cochleariae*).

45 Después de 7 días se determina la actividad en %. 100 % quiere decir que todas las larvas de escarabajo han muerto; 0 % quiere decir que ninguna de las larvas de escarabajo ha muerto.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación presentan una actividad del 100 % a una dosis de aplicación de 500 g/ha: 12

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación presentan una actividad del 100 % a una dosis de aplicación de 100 g/ha: 2, 6, 7, 8, 9, 13, 16, 21, 22, 23, 26, 28, 31, 36

- 5 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación presentan una actividad del 83 % a una dosis de aplicación de 100 g/ha: 15, 24, 29

Ejemplo 6:

Ensayo de Myzus (tratamiento de pulverización MYZUPE)

10	Disolventes:	78	partes en peso de acetona
		1,5	partes en peso de dimetilformamida
	Emulsionante:	0,5	partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

Para preparar una preparación adecuada de principio activo, se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades indicadas de disolventes y emulsionante, y el concentrado se diluye con agua con emulsionante a la concentración deseada.

- 15 Discos de hojas de col china (*Brassica pekinensis*) infestadas con todos los estadios del pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*) se rocían con una preparación del principio activo de la concentración deseada.

Después de 6 días se determina el efecto en %. 100 % significa que todos los pulgones han muerto; 0 % significa que ninguno de los pulgones ha muerto.

- 20 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación presentan una actividad del 100 % a una dosis de aplicación de 100 g/ha: 7, 28, 36

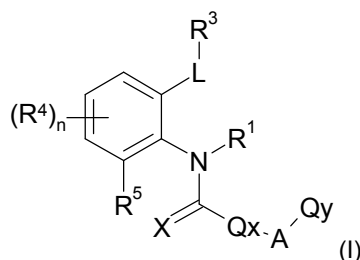
En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación presentan una actividad del 90 % a una dosis de aplicación de 100 g/ha: 9, 24, 26, 31

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación presentan una actividad del 80 % a una dosis de aplicación de 100 g/ha: 13, 14, 19, 30, 2

25

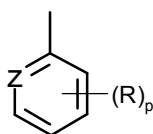
REIVINDICACIONES

1. Compuestos de la fórmula general (I),



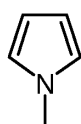
en la que

- 5 L representa C(=K)NR²-,
 X representa O,
 K representa S,
 R¹ representa hidrógeno,
 R² representa hidrógeno, metilo,
 10 R³ representa hidrógeno, alquilo C₁-C₄ (metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo o terc-butilo), ciclo-propilo, ciclo-butilo, ciano-alquilo C₁-C₃ (cianometilo, 1-cianoetilo, 2-cianoetilo, 1-ciano-n-propilo, 2-ciano-n-propilo, 3-ciano-n-propilo, 1-ciano-iso-propilo, 2-ciano-iso-propilo), difluorometilo, trifluorometilo, fenilo, piridilo,
 R⁴ representa hidrógeno, metilo, trifluorometilo, ciano, flúor, cloro, bromo, yodo o trifluorometoxi. Además, dos
 15 radicales R⁴ adyacentes representan -(CH₂)₄- o -(CH=CH-)₂-,
 n representa de 0 a 3,
 R⁵ representa metilo, flúor, cloro, bromo o yodo,
 Q_x representa pirazol, pirrol, tiazol, piridimina que está monosustituido con el grupo

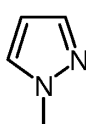


- 20 A representa -CH₂-, -CH(CH₃), C(CH₃)₂-, -CH₂CH₂-, -CH(CN)-, -CH₂O- o -C(=O)-CH₂-,
 R independientemente representa flúor, cloro o bromo,
 p representa 1,
 Z representa N, CCl o CH,
 25 Q_y representa un anillo de 5 o 6 miembros heteroaromático dado el caso mono- o polisustituido de la serie Q-36 a Q-40, Q43, Q-58 a Q-59, Q62, Q63, un sistema de anillo de 9 miembros condensado heterobíciclico y aromático Q-54 a Q-56 así como un anillo de 5 miembros heterocíclico Q-60 a Q-61, pudiendo seleccionarse los sustituyentes, independientemente uno de otro, de alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₂, halógeno, ciano, hidroxilo, nitro o haloalcoxi C₁-C₂,

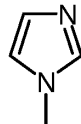
- 30 o en el que los sustituyentes, independientemente uno de otro, se pueden seleccionar de fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, pudiendo estar el fenilo o el anillo dado el caso mono- o polisustituidos con sustituyentes iguales o distintos con alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalqueno C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, halógeno, CN, NO₂, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄,



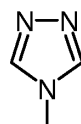
Q-36



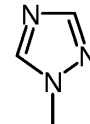
Q-37



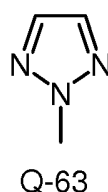
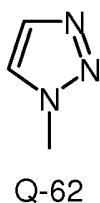
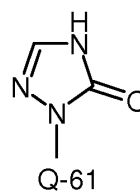
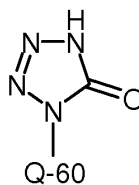
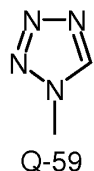
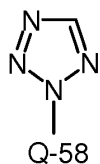
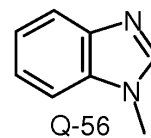
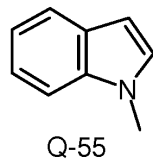
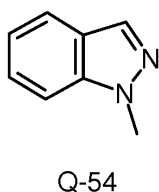
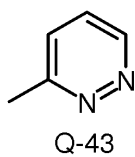
Q-38



Q-39



Q-40

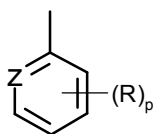


2. Compuestos de la fórmula general (I) de acuerdo con la reivindicación 1 en la que

- 5 L representa C(=K)NR²-,
 X representa O,
 K representa S,
 R¹ representa hidrógeno,
 R² representa hidrógeno, metilo,
 10 R³ representa hidrógeno, metilo, etilo, iso-propilo, ciclo-propilo, terc-butilo, difluorometilo, trifluorometilo o cianometilo,
 R⁴ representa cloro, flúor o bromo,
 R⁴ representa además yodo o ciano,

dos radicales R⁴ adyacentes representan -(CH=CH)₂-,

- 15 n representa de 0 a 3,
 R⁵ representa metilo o cloro,
 Q_x representa pirazol, pirrol, tiazol, pirimidina, que está monosustituido con el grupo



- 20 A representa CH₂, CH(CH₃), -CH₂O- o -C(=O)-CH₂-,
 R representa cloro,
 p representa 1,
 Z representa N, CCl o CH,
 25 Q_y representa un anillo heteroaromático dado el caso mono- o polisustituido de forma igual o diferente de la serie Q-37, Q-38, Q-39, Q-40, Q-43, Q-58, Q-59, Q-62 y Q-63 así como un anillo de 5 miembros heterocíclico Q-60 pudiendo seleccionarse los sustituyentes independientemente uno de otro de metilo, etilo, ciclo-propilo, terc-butilo, cloro, flúor, yodo, bromo, ciano, nitro, difluorometilo, trifluorometilo, pentafluoroetilo, n-heptafluoropropilo e iso-heptafluoropropilo

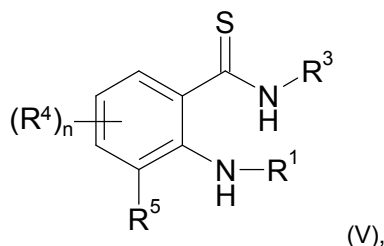
- o en el que los sustituyentes, independientemente uno de otro, se pueden seleccionar de fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, pudiéndose seleccionar los sustituyentes, independientemente uno de otro, de metilo, etilo, ciclo-propilo, terc-butilo, cloro, flúor, yodo, bromo, ciano, nitro, difluorometilo, trifluorometilo, pentafluoroetilo, n-heptafluoropropilo e iso-heptafluoropropilo.

- 30 3. Mezclas de compuestos de la fórmula general (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 2, en la que Q_y representa Q-62 y Q-63, siendo la relación de un compuesto de la fórmula (I) en la que Q_y representa Q-62 a un

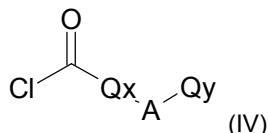
compuesto de la fórmula (I) en la que Qy representa Q63 de 60:40 a 99:1.

4. Mezclas de compuestos de la fórmula general (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 2, en la que Qy representa Q58 y Q59, siendo la relación de un compuesto de la fórmula (I) en la que Qy representa Q58 a un compuesto de la fórmula (I) en la que Qy representa Q59 de 60:40 a 99:1.

5. Procedimiento para preparar compuestos de la fórmula general (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 2, **caracterizado porque**
(C) anilinas de la fórmula (V)

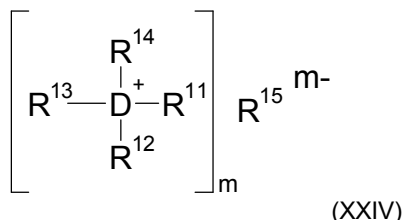


- 10 en la que R¹, R³, R⁴, R⁵ y n tienen los significados dados antes
se hacen reaccionar con, por ejemplo, cloruros de ácido carboxílico de la fórmula (IV)



en la que Qx, A y Qy tienen los significados dados antes,
en presencia de un agente de condensación.

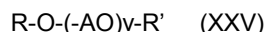
- 15 6. Composiciones que contienen al menos un compuesto de la fórmula (I) o una mezcla de compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 4 así como al menos una sal de la fórmula (XXIV)



en la que

- 20 D representa nitrógeno o fósforo,
R¹¹, R¹², R¹³ y R¹⁴ representan, independientemente unos de otros, hidrógeno o en cada caso alquilo C₁-C₈ dado el caso sustituido o alquileo C₁-C₈ mono- o poliinsaturado, dado el caso sustituido, seleccionándose los sustituyentes de halógeno, nitro y ciano,
m representa 1, 2, 3 o 4,
R¹⁵ representa un anión inorgánico u orgánico.

- 25 7. Composiciones que contienen al menos un compuesto de la fórmula (I) o una mezcla de compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 4 así como al menos un potenciador de penetración de la fórmula (XXV)



en la que

- 30 R representa un alquilo de cadena lineal o ramificada con de 4 a 20 átomos de carbono,
R' representa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, i-butilo, t-butilo, n-pentilo o n-hexilo,
AO representa un radical óxido de etileno, un radical óxido de propileno, un radical óxido de butileno o mezclas de radicales óxido de etileno y óxido de propileno o radicales óxido de butileno y
V representa números de 2 a 30.

8. Composiciones que contienen al menos un compuesto de la fórmula (I) o una mezcla de compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 4 o una composición de acuerdo con las reivindicaciones 6 o 7 así como también al menos otro insecticida, fungicida, bactericida, acaricida, nematocida y/o un regulador del crecimiento de las plantas.
- 5 9. Composiciones agroquímicas que contienen al menos un compuesto de la fórmula (I) o una mezcla de compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 4 o una composición de acuerdo con una de las reivindicaciones 6 a 8, así como también diluyentes y/o tensioactivos.
- 10 10. Procedimiento para la preparación de composiciones agroquímicas, **caracterizado porque** al menos un compuesto de la fórmula general (I) o una mezcla de compuestos de la fórmula general (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 4 o una composición de acuerdo con una de las reivindicaciones 6 a 8 se mezcla con diluyentes y/o tensioactivos.
11. Uso de un compuesto de la fórmula general (I) o de una mezcla de compuestos de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 4 o de una composición de acuerdo con una de las reivindicaciones 6 a 9 para combatir plagas animales.
- 15 12. Procedimiento para combatir plagas animales, **caracterizado porque** un compuesto de la fórmula general (I) o una mezcla de compuestos de la fórmula general (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 4 o una composición de acuerdo con una de las reivindicaciones 6 a 9 se deja actuar en plagas animales y/u hongos fitopatógenos y/o su hábitat y/o semillas.