

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 590 504**

51 Int. Cl.:

C07D 213/81	(2006.01)	A01N 35/08	(2006.01)
C07D 213/82	(2006.01)	A01N 43/04	(2006.01)
C07D 239/28	(2006.01)	C07C 233/66	(2006.01)
C07D 239/30	(2006.01)	C07C 233/67	(2006.01)
C07D 241/24	(2006.01)		
C07D 305/08	(2006.01)		
C07D 405/10	(2006.01)		
C07D 405/12	(2006.01)		
C07D 405/14	(2006.01)		
C07D 407/12	(2006.01)		

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **06.03.2013 PCT/EP2013/054461**
- 87 Fecha y número de publicación internacional: **03.10.2013 WO13143811**
- 96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **06.03.2013 E 13707636 (0)**
- 97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **13.07.2016 EP 2831046**

54 Título: **N-ciclilamidas como nematocidas**

30 Prioridad:

26.03.2012 EP 12161190

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

22.11.2016

73 Titular/es:

**SYNGENTA PARTICIPATIONS AG (100.0%)
Werk Rosental Schwarzwaldallee 215
4058 Basel, CH**

72 Inventor/es:

**O'SULLIVAN, ANTHONY, CORNELIUS;
LOISELEUR, OLIVIER;
STAIGER, ROMAN;
LUKSCH, TORSTEN y
PITTERNA, THOMAS**

74 Agente/Representante:

LEHMANN NOVO, María Isabel

ES 2 590 504 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

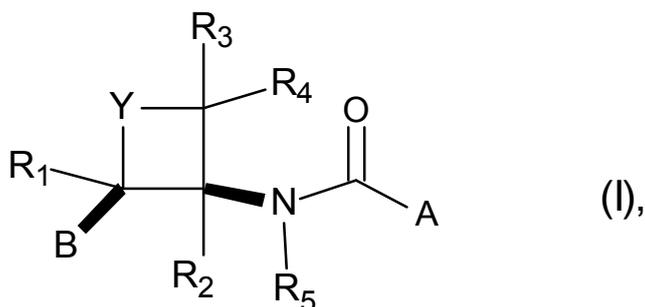
N-ciclilamidas como nematocidas

La presente invención se refiere a compuestos ciclobutilcarboxámidos novedosos, un proceso para la preparación de estos compuestos y su uso como nematocidas.

- 5 Por ejemplo, en WO 09/043784, WO06/122952, WO06/122955, WO05/103006, WO05/103004 y WO04/014842 se describen cicloalquilcarboxamidas.

Se acaban de caracterizar ciclobutilcarboxamidas novedosas caracterizadas por un anillo ciclobutílico sustituido en *cis*, que presentan una buena actividad nematocida.

Por lo tanto, la presente invención se refiere a compuestos de fórmula I



10

donde

Y es O, C=O o CR₁₂R₁₃;

- 15 A es un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros que contiene de 1 a 3 heteroátomos, cada uno seleccionado independientemente entre oxígeno, nitrógeno y azufre, o un anillo fenílico, estando el anillo heteroaromático o el anillo fenílico opcionalmente sustituido con uno o más R₆;

R₆ es, independientemente de los demás, halógeno, ciano, alquilo C1-C4, haloalquilo C1-C4, alcoxi C1-C4, haloalcoxi C1-C4, haloalquiltio C1-C4, (alcoxi C1-C4)-(alquilo C1-C4) o (haloalcoxi C1-C4)-(alquilo C1-C4);

R₁, R₂, R₃, R₄, R₁₂ y R₁₃ son, independientemente unos de otros, hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C1-C4, alcoxi C1-C4 o haloalquilo C1-C4;

- 20 R₅ es hidrógeno, metoxi o hidroxilo;

B es fenilo sustituido con uno o más R₈;

R₈ es, independientemente de los demás, halógeno, ciano o un grupo -L-R₉, donde cada L es, independientemente de los demás, un enlace, -O-, -OC(O)-, -NR₇-, -NR₇CO-, -NR₇S(O)_n-, -S(O)_n-, -S(O)_nNR₇-, -COO- o CONR₇-;

n es 0, 1 o 2;

- 25 R₇ es hidrógeno, alquilo C1-C4, haloalquilo C1-C4, bencilo o fenilo, donde el bencilo y el fenilo no están sustituidos o están sustituidos con halógeno, ciano, alquilo C1-C4 o haloalquilo C1-C4;

- 30 R₉ es, independientemente de los demás, alquilo C1-C6, que no está sustituido o está sustituido con uno o más R₁₀, cicloalquilo C3-C6, que no está sustituido o está sustituido con uno o más R₁₀, bicicloalquilo C6-C14, que no está sustituido o está sustituido con uno o más R₁₀, alquenilo C2-C6, que no está sustituido o está sustituido con uno o más R₁₀, alquinilo C2-C6, que no está sustituido o está sustituido con uno o más R₁₀, fenilo, que no está sustituido o está sustituido con R₁₀, o heteroarilo, que no está sustituido o está sustituido con uno o más R₁₀;

R₁₀ es, independientemente de los demás, halógeno, ciano, alquilo C1-C4, haloalquilo C1-C4, alcoxi C1-C4, haloalcoxi C1-C4, alquiltio C1-C4, haloalquiltio C1-C4, alqueniloxi C3-C6 o alquiniloxi C3-C6;

donde B y A-CO-NR₅ están en *cis* uno respecto del otro en el anillo de cuatro miembros,

- 35 y tautómeros/isómeros/enantiómeros de estos compuestos.

- Los compuestos de fórmula (I) y, cuando sea apropiado, los tautómeros de estos, en cada caso en forma libre o en forma salina, pueden estar presentes en forma de uno de los isómeros que son posibles o como una mezcla de estos, por ejemplo, en forma de isómeros puros tales como enantiómeros y/o diastereómeros, o como mezclas de isómeros tales como mezclas de enantiómeros, por ejemplo, racematos, mezclas de diastereómeros o mezclas de racematos, dependiendo del número, la configuración absoluta y relativa de los átomos de carbono asimétricos que estén presentes en la molécula y/o dependiendo de la configuración de los dobles enlaces no aromáticos que estén presentes en la molécula; la invención se refiere a los isómeros puros y también a todas las mezclas de isómeros que sean posibles, y se sobreentenderá en cada caso con este sentido en lo expuesto anteriormente y en lo sucesivo en la presente, incluso cuando no se mencionen detalles estereoquímicos específicamente en cada caso. Por consiguiente, esta invención contempla todos estos isómeros y tautómeros, y sus mezclas en todas las proporciones, así como también las formas isotópicas tales como los compuestos deuterados. Por ejemplo, los compuestos de la invención pueden contener uno o más átomos de carbono asimétricos, por ejemplo, en el grupo $-CR^3R^4-$ o Y en $-CR^{12}CR^{13}-$ o en sus sustituyentes, y los compuestos de fórmula (I) pueden existir como enantiómeros (o como parejas de diastereoisómeros) o como mezclas de estos.
- 15 La invención también contempla sales y *N*-óxidos de cada compuesto de fórmula (I).
- Un experto en la técnica también se dará cuenta de que debido a que en el entorno y en condiciones fisiológicas las sales de los compuestos químicos están en equilibrio con sus formas no salinas correspondientes, las sales comparten la utilidad biológica de las formas no salinas.
- 20 Por consiguiente, una gran variedad de sales de compuestos de la invención (y principios activos utilizados combinados con los principios activos de la invención) pueden ser útiles para controlar plagas de invertebrados y parásitos de animales. Entre las sales agrícola y/o fisiológicamente tolerables se encuentran las sales de adición de ácido con ácidos inorgánicos u orgánicos tales como el ácido bromhídrico, clorhídrico, nítrico, fosfórico, sulfúrico, acético, butírico, fumárico, láctico, maleico, malónico, oxálico, propiónico, salicílico, tartárico, 4-toluenosulfónico o valérico.
- 25 Entre las sales agrícola y/o fisiológicamente tolerables que son adecuadas también se pueden encontrar las sales de aquellos cationes que no afectan de forma adversa a la acción pesticida y/o parasiticida de los compuestos de fórmula (I). Por consiguiente, los cationes especialmente adecuados son los iones de los metales alcalinos, incluidos el sodio, potasio y litio, de los metales alcalinotérreos, incluidos el calcio y magnesio, y de los metales de transición, incluidos el manganeso, cobre, hierro, zinc, cobalto, plomo, plata, níquel y también amonio o amonio orgánico, incluidos el monoalquilamonio, dialquilamonio, trialquilamonio, tetraalquilamonio, monoalquenilamonio, dialquenilamonio, trialquenilamonio, monoalquinilamonio, dialquinilamonio, monoalcanolamonio, dialcanolamonio, (cicloalquil C5-C6)amonio, piperidinio, morfolinio, pirrolidinio o bencilamonio, además los iones de fosfonio, los iones de sulfonio, preferentemente los iones de tri(alquil C1-C4)sulfonio y sulfoxonio, preferentemente tri(alquil C1-C4)sulfoxonio.
- 35 Los grupos alquilo (ya sea solos o como parte de un grupo más grande, tal como alcoxi-, alquilsulfanil-, alquilsulfinil-, alquilsulfonil-, alquilcarbonil- o alcoxycarbonil-) pueden estar en forma de una cadena recta o ramificada y son, por ejemplo, metilo, etilo, 1-propilo, prop-2-ilo, 1-butilo, but-2-ilo o 2-metilprop-2-ilo. El grupo alquilo (ya sea solo o como parte de un grupo más grande, tal como alcoxi-, alquilsulfanil-, alquilsulfinil-, alquilsulfonil-, alquilcarbonil- o alcoxycarbonil-), en cada realización de la invención, es preferentemente alquilo C1-C3, más preferentemente alquilo C1-C2, especialmente un grupo metilo. En el caso de alcoxi, algunos ejemplos son metoxi, etoxi, propoxi, *n*-butoxi, isobutoxi y también sus grupos isoméricos; preferentemente, independiente de otras realizaciones, metoxi y etoxi, especialmente metoxi.
- 40 Los grupos alquenilo pueden estar en forma de cadenas lineales o ramificadas y pueden tener, cuando proceda, la configuración *E* o *Z*. Algunos ejemplos son vinilo y alilo. El grupo alquenilo, en cada realización de la invención, es preferentemente un grupo alquenilo C2-C3, más preferentemente un grupo vinilo o alilo.
- 45 Los grupos alquinilo pueden estar en forma de cadenas lineales o ramificadas. Algunos ejemplos son etinilo y propargilo. El grupo alquinilo, en cada realización de la invención, es preferentemente un grupo alquinilo C2-C3, más preferentemente un grupo propargilo.
- Halógeno equivale a flúor, cloro, bromo o yodo; halógeno, en cada realización de la invención, equivale a flúor, cloro o bromo; especialmente a flúor o cloro.
- 50 Los grupos haloalquilo (ya sea solos o como parte de un grupo más grande, tal como haloalcoxi-, haloalquilsulfanil-, haloalquilsulfinil- o haloalquilsulfonil-) son grupos alquilo que están sustituidos con uno o más átomos halógenos idénticos o diferentes y son, por ejemplo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorodifluorometilo y 2,2,2-trifluoroetilo. El grupo haloalquilo (ya sea solo o como parte de un grupo más grande, tal como haloalcoxi-, haloalquilsulfanil-, haloalquilsulfinil- o haloalquilsulfonil-), en cada realización de la invención, es preferentemente trifluorometilo. En el caso de haloalcoxi, algunos ejemplos son fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 1,1,2,2-tetrafluoroetoxi, 2-fluoroetoxi, 2-cloroetoxi, 2,2-difluoroetoxi y 2,2,2-tricloroetoxi; preferentemente difluorometoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloroetoxi y trifluorometoxi.
- 55

- Los grupos cicloalquilo son monocíclicos y son, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo. El grupo cicloalquilo C3-C6, en cada realización de la invención, es preferentemente un cicloalquilo C3-C5, más preferentemente un grupo cicloalquilo C3-C4, especialmente un grupo cicloalquilo C3. Cuando se indique que un resto cicloalquilo está sustituido, el resto cicloalquilo estará sustituido preferentemente con de uno a cuatro sustituyentes, más preferentemente con de uno a tres sustituyentes, tal como uno o dos sustituyentes, especialmente con un sustituyente.
- Alcoxycarbonilo equivale, por ejemplo, a metoxycarbonilo, etoxycarbonilo, propoxycarbonilo, isopropoxycarbonilo, *n*-butoxycarbonilo, isobutoxycarbonilo, *sec*-butoxycarbonilo y *tert*-butoxycarbonilo; se prefieren metoxycarbonilo, etoxycarbonilo e isopropoxycarbonilo.
- Un grupo alquilsulfanilo es, por ejemplo, metilsulfanilo, etilsulfanilo, propilsulfanilo, isopropilsulfanilo, *n*-butilsulfanilo, isobutilsulfanilo, *sec*-butilsulfanilo y *tert*-butilsulfanilo. Algunos ejemplos de haloalquilsulfanilo son sustituyentes clorados y/o fluorados de este, tales como difluorometilsulfanilo, trifluorometilsulfanilo, clorodifluorometilsulfanilo y 2,2,2-trifluoroetilsulfanilo.
- Alquilsulfínulo equivale a, por ejemplo, metilsulfínulo, etilsulfínulo, propilsulfínulo, isopropilsulfínulo, *n*-butilsulfínulo, isobutilsulfínulo, *sec*-butilsulfínulo y *tert*-butilsulfínulo. Algunos ejemplos de haloalquilsulfínulo son sustituyentes clorados y/o fluorados de este, tales como difluorometilsulfínulo, trifluorometilsulfínulo, clorodifluorometilsulfínulo y 2,2,2-trifluoroetilsulfínulo.
- Un grupo alquilsulfonilo es, por ejemplo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, propilsulfonilo, isopropilsulfonilo, *n*-butilsulfonilo, isobutilsulfonilo, *sec*-butilsulfonilo y *tert*-butilsulfonilo. Algunos ejemplos de haloalquilsulfonilo son sustituyentes clorados y/o fluorados de este, tales como difluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo, clorodifluorometilsulfonilo y 2,2,2-trifluoroetilsulfonilo.
- Alcoxialquilo equivale a, por ejemplo, metoximetilo, 2-metoxietilo, etoximetilo, 2-etoxietilo, *n*-propoximetilo, *n*-propoxi-2-etilo, isopropoximetilo y 1-isopropoxietilo. El grupo alcoxialquilo, en cada realización de la invención, es preferentemente un (alcoxi C1-C4)-(alquilo C1-C4), más preferentemente un (alcoxi C1-C2)metilo, tal como grupos metoximetilo y etoximetilo.
- Los grupos arilo (ya sea solos o como parte de un grupo más grande, tal como arilalquilen-) son sistemas anulares aromáticos que pueden ser mono-, bi- o tricíclicos. Los ejemplos de estos anillos incluyen fenilo, naftilo, antraceno, indenilo o fenantreno. Los grupos arilo preferidos son fenilo y naftilo, siendo el fenilo el más preferido.
- Algunos ejemplos de cicloalquilcarbonilo son ciclopropilcarbonilo, ciclobutilcarbonilo, ciclopentilcarbonilo y ciclohexilcarbonilo; se prefieren ciclopropilcarbonilo y ciclobutilcarbonilo.
- Algunos ejemplos de cicloalcoxycarbonilo son ciclopropiloxycarbonilo, ciclobutiloxycarbonilo, ciclopentiloxycarbonilo y ciclohexiloxycarbonilo; se prefieren ciclopropiloxycarbonilo y ciclobutiloxycarbonilo.
- El término "heteroarilo" se refiere a sistemas anulares aromáticos que contienen al menos un heteroátomo y están constituidos por un único anillo o por dos anillos condensados. Preferentemente, los anillos únicos contendrán hasta 3 heteroátomos y los sistemas bicíclicos hasta 5 heteroátomos que se seleccionarán preferentemente entre nitrógeno, oxígeno y azufre. Los ejemplos de estos grupos incluyen furilo, tienilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, benzofurilo, bencisofurilo, benzotienilo, bencisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, bencisotiazolilo, benzoxazolilo, bencisoxazolilo, bencimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazol, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo e indolizínulo.
- Es posible que los compuestos de fórmula I tengan otros centros estereoquímicos, ya sea en el carbono portador de R3 y R4, o cuando Y es CR12R13, o en uno de los sustituyentes. Entonces otros isómeros son posibles. La invención contempla todos estos isómeros y sus mezclas.
- Los compuestos de fórmula I pueden presentarse en formas tautoméricas diferentes. La invención contempla todas estas formas tautoméricas y sus mezclas.
- Preferentemente, A es un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido, que contiene, preferentemente, un átomo de oxígeno o uno o dos átomos de nitrógeno, tal como furilo, piridilo, pirimidinilo, pirazinilo y piridazinilo, en particular piridilo, o A es preferentemente un fenilo opcionalmente sustituido. En una realización de cualquier realización de A, A tiene de 1 a 3, preferentemente 1 o 2 sustituyentes R6.
- Más preferentemente, A es un anillo heteroaromático de 6 miembros opcionalmente sustituido, que contiene 1 o 2 átomos de nitrógeno (p. ej., piridilo, pirimidinilo, pirazinilo y piridazinilo, en particular piridilo) o A es preferentemente un fenilo opcionalmente sustituido.

Los sustituyentes preferidos (R6), independientemente unos de otros e independientemente del tipo de anillo, se seleccionan entre alquilo C1-C4, haloalquilo C1-C4 (en particular di- y trifluorometilo), haloalcoxi C1-C4, ciano y halógeno, en particular trifluorometilo, fluoro y cloro.

5 Se prefiere que A, independientemente de otras realizaciones, sea piridilo, pirimidinilo, pirazinilo o fenilo, que puede no estar sustituido o estar sustituido con uno o dos sustituyentes R6, que se pueden seleccionar independientemente entre cloro, fluoro, trifluorometilo, metilo, bromo y ciano.

El punto o los puntos de unión preferidos de estos sustituyentes es en *orto* respecto al punto de unión de A a C(O)NR5.

10 Los ejemplos preferidos de A, independiente de otras realizaciones, son 2,6-difluorofenilo (A1); 3-cloro-2-pirazinilo (A2); 3-trifluorometil-2-piridilo (A3); 2-trifluorometil-3-piridilo (A5); 2-trifluorometilfenilo (A6); 2-cloro-3-piridilo (A7); 3-metil-2-piridilo (A11); 2-metil-3-piridilo (A22); 3-metil-2-pirazinilo (A24); 3-bromo-2-pirazinilo (A25); 3-trifluorometil-2-pirazinilo (A26); y 2-cianofenilo (A29).

15 El A particularmente preferido, independiente de otras realizaciones, se selecciona entre 3-cloro-2-pirazinilo (A2); 3-trifluorometil-2-piridilo (A3); 2-trifluorometil-3-piridilo (A5); 2-trifluorometilfenilo (A6); 2-cloro-3-piridilo (A7); 3-metil-2-pirazinilo (A24); 3-bromo-2-pirazinilo (A25); y 3-trifluorometil-2-pirazinilo (A26).

El A especialmente preferido, independiente de otras realizaciones, se selecciona entre 3-cloro-2-pirazinilo (A2); 3-trifluorometil-2-piridilo (A3); 2-trifluorometil-3-piridilo (A5); 2-trifluorometilfenilo (A6); 2-cloro-3-piridilo (A7); y 3-trifluorometil-2-pirazinilo (A26); convenientemente 3-cloro-2-pirazinilo (A2); 2-trifluorometil-3-piridilo (A5); 2-trifluorometilfenilo (A6); y 3-trifluorometil-2-pirazinilo (A26).

20 Preferentemente, Y es O o CR₁₂R₁₃, donde R₁₂ y R₁₃ son, independientemente uno del otro, hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C1-C4 o haloalquilo C1-C4. En una realización, independiente de otras realizaciones, R₁₂ y R₁₃ son ambos hidrógeno.

Preferentemente, R₁, R₂, R₃ y R₄ son, independientemente unos de otros, hidrógeno, halógeno, alquilo C1-C4 o haloalquilo C1-C4. En una realización, independiente de otras realizaciones, R₁, R₂, R₃ y R₄ son cada uno hidrógeno.

25 En una realización, cuando Y es CR₁₂R₁₃, cinco o seis de R₁, R₂, R₃, R₄, R₁₂ y R₁₃ son hidrógeno. En una realización preferida, Y es CR₁₂R₁₃, entonces R₁, R₃, R₄, R₁₂ y R₁₃ son cada uno hidrógeno, y R₂ es ciano o alcoxi C1-C4, tal como metoxi.

En una realización, cuando Y es O, R₁, R₂, R₃ y R₄ son cada uno hidrógeno.

Preferentemente, R₅ es hidrógeno.

30 B es fenilo sustituido con sustituyentes (R8). En un caso, B tiene de 1 a 3 sustituyentes R8. Preferentemente, el sustituyente R8, independientemente de los demás, se selecciona entre halógeno, ciano, alquilo C1-C4, alcoxi C1-C4, haloalquilo C1-C4, haloalcoxi C1-C4, alquiltio C1-C4, haloalquiltio C1-C4, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, (haloalquil C1-C4)-(cicloalquilo C3-C6), fenilo, fenoxi, ciclopentiloxi, alilo, propargilo, aliloxi, propargiloxi, sulfóxido de alquilo C1-C4, sulfóxido de haloalquilo C1-C4, alquilsulfonilo C1-C4, haloalquilsulfonilo C1-C4, alquilsulfonilamino C1-C4, propargilsulfonilamino, ciclopropilsulfonamino, ciclobutilsulfonamino, ciclopentilsulfonamino, fenilsulfonamino, piridilsulfonamino, piridilo, imidazolilo, piridiloxi, fenilcarbonilo, fenoxicarbonilo, fenilcarboniloxi, piridilcarbonilo, piridiloxicarbonilo, piridilcarboniloxi, (alcoxi C1-C4)carbonilo, (alquil C1-C4)carboniloxi, ciclopentiloxicarbonilo, aliloxicarbonilo, propargiloxicarbonilo, alilcarboniloxi, propargilcarboniloxi, alquilamino C1-C4, ciclopentilamino, fenilaminosulfonilo, (alquil C1-C4)aminosulfonilo, ciclopentilaminosulfonilo, piridilaminosulfonilo, alilaminosulfonilo, propargilaminosulfonilo, fenilamino, piridilamino, alilamino, propargilamino, fenilaminocarbonilo, piridilaminocarbonilo, ciclopentilaminocarbonilo, fenilcarbonilamino, piridilcarbonilamino, alilcarbonilamino y propargilcarbonilamino, donde estos sustituyentes, independientes unos de otros, pueden no estar sustituidos, o, cuando sea posible, pueden estar sustituidos a su vez con uno o más sustituyentes (R10). El sustituyente R10, seleccionado independientemente de los demás, se selecciona preferentemente entre alquilo C1-C4, alcoxi C1-C4, haloalquilo C1-C4, alquiltio C1-C4 y halógeno.

45 En una realización, independiente de otras realizaciones, B es un fenilo sustituido con de 1 a 3 sustituyentes, seleccionados independientemente entre halógeno, ciano, haloalquilo C1-C4, haloalcoxi C1-C4 y cicloalquilo C3-C6. En una realización preferida, los sustituyentes se seleccionan independientemente entre bromo, cloro, fluoro, trifluorometilo, difluorometoxi, trifluorometoxi y ciclopropilo.

50 En un grupo de compuestos preferidos de fórmula I, B es un fenilo, sustituido con de 1 a 3 sustituyentes, seleccionados independientemente entre halógeno, ciclopropilo, (haloalquil C1-C4)ciclopropilo, haloalquilo C1-C4 y haloalcoxi C1-C4, A es un fenilo, furilo, piridilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo, dichos anillos, independientemente unos de otros, no están sustituidos o están sustituidos con de 1 a 3 sustituyentes, seleccionados independientemente, entre alquilo C1-C4, haloalquilo C1-C4, alcoxi C1-C4, haloalcoxi C1-C4, ciano y halógeno, Y es O o CH₂, y R₁, R₂,

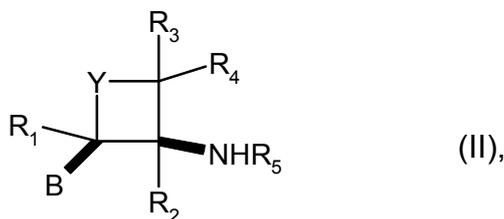
5 R3, R4 y R5 son hidrógeno. En este grupo de compuestos de fórmula I, B es especialmente un fenilo sustituido con de 1 a 3 sustituyentes, seleccionados independientemente entre fluoro, cloro, bromo, trifluorometilo y trifluorometoxi. En este grupo de compuestos de fórmula I, A es especialmente un fenilo, piridilo, pirazinilo o pirimidinilo, dichos anillos, independientemente unos de otros, no están sustituidos o están sustituidos con de 1 a 3 sustituyentes, seleccionados independientemente entre fluoro, metilo y trifluorometilo.

10 En otro grupo de compuestos preferidos de fórmula I, B es un fenilo sustituido con de 1 a 3 sustituyentes, seleccionados independientemente entre fluoro, cloro, trifluorometilo, ciclopropilo, trifluorometilciclopropilo, difluorometoxi o trifluorometoxi, A es un fenilo, piridilo o pirazinilo, dichos anillos, independientemente unos de otros, no están sustituidos o están sustituidos con de 1 a 3 sustituyentes, seleccionados independientemente entre cloro, bromo, fluoro, metilo, ciano y trifluorometilo, Y es O o CH₂, y R1, R2, R3, R4 y R5 son hidrógeno. Más preferentemente en este grupo de compuestos de fórmula I, B es especialmente un fenilo sustituido con de 1 a 3 sustituyentes, seleccionados independientemente entre fluoro, cloro, difluorometoxi o trifluorometoxi, A es especialmente un fenilo, pirazinilo o piridilo, dichos anillos, independientemente unos de otros, están sustituidos con de 1 a 3 sustituyentes, seleccionados independientemente entre cloro, fluoro, metilo y trifluorometilo.

15 En un grupo especialmente preferido de compuestos de fórmula I, B es un fenilo sustituido con de 1 a 3 sustituyentes, seleccionados independientemente entre halógeno, haloalquilo C1-C4 y haloalcoxi C1-C4; A es fenilo, piridilo o pirazinilo, dichos anillos, independientemente unos de otros, están monosustituidos con un halógeno o haloalquilo C1-C4; Y es O o CH₂; y R1, R2, R3, R4 y R5 son hidrógeno. Más preferentemente en este grupo de compuestos de fórmula I, B es especialmente un fenilo sustituido con de 1 a 2 sustituyentes, seleccionados independientemente entre fluoro, cloro, trifluorometilo, difluorometoxi y trifluorometoxi; A es especialmente un fenilo, pirazinilo o piridilo, dichos anillos están monosustituidos con sustituyentes seleccionados entre cloro, fluoro o trifluorometilo.

20 En una realización particularmente preferida, un compuesto de fórmula I es en el que Y es CH₂; B es un fenilo mono- o disustituido con halógeno; R1-R5 son cada uno hidrógeno y A se selecciona entre fenilo, pirazinilo o piridilo, cada uno de los cuales está mono- o disustituido, independientemente de los demás, con sustituyentes seleccionados independientemente entre halógeno y haloalquilo C1-C4, preferentemente A está monosustituido.

Los compuestos de fórmula I se pueden preparar haciendo reaccionar un compuesto de fórmula II



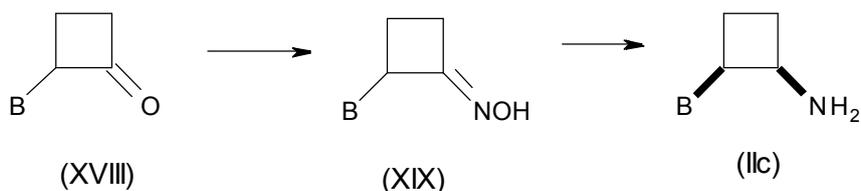
en donde B, Y, R₁, R₂, R₃, R₄ y R₅ son como se definen de acuerdo con la fórmula I; con un agente acilante de fórmula III

30 A-C(=O)-R* (III),

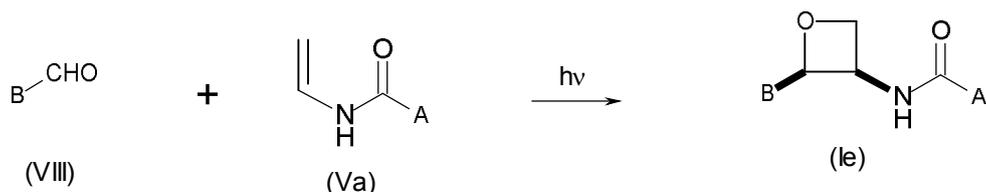
en donde A es como se define de acuerdo con la fórmula I, y R* es halógeno, hidroxilo o alcoxi C₁₋₆, preferentemente cloro, en presencia de una base, tal como trietilamina, base de Hunig, bicarbonato de sodio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, piridina o quinolina, pero preferentemente trietilamina, y generalmente un disolvente, tal como éter dietílico, TBME, THF, diclorometano, cloroformo, DMF o NMP, durante entre 10 minutos y 48 horas, preferentemente de 12 a 24 horas, y entre 0 °C y reflujo, preferentemente de 20 a 25 °C.

35 Cuando R* es hidroxilo, se puede utilizar un agente de acoplamiento, tal como hexafluorofosfato de benzotriazol-1-iloxitris(dimetilamino)fosfonio, cloruro del ácido bis-(2-oxo-3-oxazolidinil)fosfínico (BOP-Cl), N,N'-diciclohexilcarbodiimida (DCC) o 1,1'-carbonildiimidazol (CDI).

40 Los compuestos de fórmula IIc en donde B es como se define de acuerdo con la fórmula I, Y es CH₂, y R1, R2, R3 y R4 son H se pueden preparar a partir de la cetona XVIII. Esto se puede conseguir mediante la conversión en la oxima XIX y su reducción. D. E. Nichols *et al.* (J. Med. Chem. 1984, 27, 1108-11) describen métodos para esta reducción. Ciertos métodos pueden proporcionar isómeros *trans* como subproductos.



Los compuestos de fórmula 1e se pueden preparar mediante la cicloadición 2+2 de aldehídos de fórmula (VIII) y enamidas de fórmula (Va). Esto se puede conseguir con ayuda de radiación UV tal como describieron Bach *et al.* (Journal of Organic Chemistry (1999), 64(4), 1265-1273). Pueden ir acompañados de sus isómeros *trans*



5

Para preparar todos los demás compuestos de fórmula I funcionalizados de acuerdo con las definiciones de A, B, R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, y R₁₂ y R₁₃ existen numerosos métodos estándar conocidos, tales como alquilación, halogenación, acilación, amidación, oximación, oxidación y reducción. La elección de los métodos de preparación que son adecuados depende de las propiedades (reactividad) de los sustituyentes en los intermedios.

10 Estas reacciones pueden llevarse a cabo convenientemente en un disolvente.

Estas reacciones pueden llevarse a cabo convenientemente a distintas temperaturas.

Estas reacciones pueden llevarse a cabo convenientemente en una atmósfera inerte.

15 Los reactivos pueden hacerse reaccionar en presencia de una base. Algunos ejemplos de bases adecuadas son hidróxidos de metales alcalinos o metales alcalinotérreos, hidruros de metales alcalinos o metales alcalinotérreos, amidas de metales alcalinos o metales alcalinotérreos, alcóxidos de metales alcalinos o metales alcalinotérreos, acetatos de metales alcalinos o metales alcalinotérreos, carbonatos de metales alcalinos o metales alcalinotérreos, dialquilamidas de metales alcalinos o metales alcalinotérreos o alquilsililamidas, alquilaminas, alquilendiaminas de metales alcalinos o metales alcalinotérreos, cicloalquilaminas saturadas o insaturadas *N*-alquiladas o libres, heterociclos básicos, hidróxidos de amonio y aminas carbocíclicas. Algunos ejemplos que pueden mencionarse son

20 hidróxido de sodio, hidruro de sodio, amida de sodio, metóxido de sodio, acetato de sodio, carbonato de sodio, *tert*-butóxido de potasio, hidróxido de potasio, carbonato de potasio, hidruro de potasio, diisopropilamida de litio, bis(trimetilsilil)amida de potasio, hidruro de calcio, trietilamina, diisopropiletilamina, trietilendiamina, ciclohexilamina, *N*-ciclohexil-*N,N*-dimetilamina, *N,N*-dietilanilina, piridina, 4-(*N,N*-dimetilamino)piridina, quinuclidina, *N*-metilmorfolina, hidróxido de benciltrimetilamonio y 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno (DBU).

25 Los reactivos pueden hacerse reaccionar entre sí como tales, es decir, sin añadir un disolvente o diluyente. Sin embargo, en la mayoría de los casos, es conveniente añadir un disolvente o diluyente inerte, o una mezcla de estos. Si la reacción se lleva a cabo en presencia de una base, las bases que se emplean en exceso, tales como trietilamina, piridina, *N*-metilmorfolina o *N,N*-dietilanilina, también pueden actuar como disolventes o diluyentes.

30 La reacción se lleva a cabo convenientemente a una temperatura comprendida en el rango de aproximadamente -80 °C a aproximadamente +140 °C, preferentemente de aproximadamente -30 °C a aproximadamente +100 °C, en muchos casos en el rango comprendido entre la temperatura ambiente y aproximadamente +80 °C.

Un compuesto de fórmula (I) puede convertirse de una manera conocida en otro compuesto de fórmula (I) mediante el reemplazo de uno o más sustituyentes del compuesto de partida de fórmula (I) de la forma habitual por otro(s) sustituyente(s) de acuerdo con la invención.

35 Dependiendo de la elección de las condiciones de reacción y los materiales de partida que sean adecuados en cada caso, es posible, por ejemplo, en un paso de reacción reemplazar solamente un sustituyente por otro sustituyente de acuerdo con la invención, o varios sustituyentes pueden ser reemplazados por otros sustituyentes de acuerdo con la invención en el mismo paso de reacción.

40 Las sales de los compuestos de fórmula (I) pueden prepararse de un modo conocido *per se*. Por lo tanto, por ejemplo, se obtienen sales de adición de ácidos de los compuestos de fórmula (I) por tratamiento con un ácido adecuado o un reactivo de intercambio iónico adecuado y se obtienen sales con bases por tratamiento con una base adecuada o con un reactivo de intercambio iónico adecuado. Una sal se selecciona dependiendo de su tolerancia para el uso del

compuesto, tal como tolerancia agrícola o fisiológica.

5 Las sales de los compuestos de fórmula (I) pueden convertirse de la forma habitual en los compuestos I libres, sales de adición de ácidos, por ejemplo, por tratamiento con un compuesto básico adecuado o con un reactivo de intercambio iónico adecuado y sales con bases, por ejemplo, por tratamiento con un ácido adecuado o con un reactivo de intercambio iónico adecuado.

10 Las sales de los compuestos de fórmula (I) pueden convertirse de una forma conocida en otras sales de los compuestos de fórmula (I), sales de adición de ácidos, por ejemplo, en otras sales de adición de ácidos, por ejemplo, por tratamiento de una sal de ácido inorgánico, tal como clorhidrato, con una sal metálica adecuada, tal como una sal de sodio, bario o plata, de un ácido, por ejemplo, con acetato de plata, en un disolvente adecuado en el que una sal inorgánica que forma, por ejemplo, cloruro de plata, es insoluble y de este modo precipita en la mezcla de reacción.

Dependiendo del procedimiento o las condiciones de reacción, los compuestos de fórmula (I), que tienen propiedades formadoras de sales, pueden obtenerse en forma libre o en forma de sales.

15 Las mezclas de diastereómeros o mezclas de racematos de los compuestos de fórmula (I), en forma libre o en forma salina, que pueden obtenerse dependiendo de los materiales de partida y los procedimientos seleccionados, pueden separarse de un modo conocido para obtener los diastereómeros o racematos puros en función de las diferencias fisicoquímicas de los componentes, por ejemplo, mediante cristalización, destilación y/o cromatografía fraccionada.

20 Las mezclas de enantiómeros, tales como racematos, que pueden obtenerse de forma similar pueden resolverse para obtener los enantiómeros ópticos mediante métodos conocidos, por ejemplo, mediante recristalización a partir de un disolvente ópticamente activo, mediante cromatografía en adsorbentes quirales, por ejemplo, cromatografía líquida de alta resolución (HPLC) en acetilcelulosa, con la ayuda de microorganismos adecuados, mediante escisión con enzimas inmovilizadas específicas, mediante la formación de compuestos de inclusión, por ejemplo, utilizando éteres corona quirales, en donde solamente un enantiómero está en forma de complejo, o mediante conversión en sales diastereoméricas, por ejemplo, haciendo reaccionar un racemato del producto final básico con un ácido ópticamente activo, tal como un ácido carboxílico, por ejemplo, ácido canfórico, tartárico o málico, o ácido sulfónico, por ejemplo, ácido canforsulfónico, y separando la mezcla de diastereómeros que puede obtenerse de esta manera, por ejemplo, mediante cristalización fraccionada en función de sus diferentes solubilidades para proporcionar los diastereómeros, de donde puede liberarse el enantiómero deseado por acción de agentes adecuados, por ejemplo, agentes básicos.

25 Pueden obtenerse diastereómeros o enantiómeros puros de acuerdo con la invención no solamente separando mezclas de isómeros adecuadas, sino también mediante métodos generalmente conocidos de síntesis diastereoselectiva o enantioselectiva, por ejemplo, llevando a cabo el proceso de acuerdo con la invención con materiales de partida que tengan una estereoquímica adecuada.

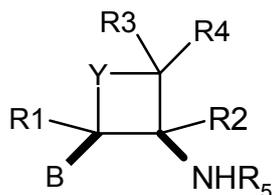
30 Pueden prepararse *N*-óxidos haciendo reaccionar un compuesto de la fórmula (I) con un agente oxidante adecuado, por ejemplo, el aducto de H₂O₂/urea en presencia de un ácido anhídrido, por ejemplo, anhídrido trifluoroacético. Hay constancia de tales oxidaciones en la bibliografía, por ejemplo, en J. Med. Chem., 32 (12), 2561-73, 1989, o WO 00/15615, o C. White, Science, vol. 318, p.783, 2007.

Puede ser conveniente aislar o sintetizar en cada caso el isómero biológicamente más eficaz, por ejemplo, el enantiómero o diastereómero, o mezcla de isómeros, por ejemplo, mezcla de enantiómeros o mezcla de diastereómeros, si los componentes individuales tienen una actividad biológica diferente.

40 Los compuestos de fórmula (I) y, cuando corresponda, sus tautómeros, en cada caso en forma libre o en forma salina, también se pueden obtener, si corresponde, en forma de hidratos y/o pueden incluir otros disolventes, por ejemplo, los que se hayan podido emplear para la cristalización de los compuestos presentes en forma sólida.

La invención se refiere además a compuestos intermediarios de fórmulas (II) y (XIXa), que pueden utilizarse en la preparación de los compuestos de fórmula (I).

Por lo tanto, la presente invención proporciona un compuesto de fórmula (II)



(II)

45

donde

Y es O, C=O o CR₁₂R₁₃;

R₁, R₂, R₃, R₄, R₁₂ y R₁₃ son, independientemente unos de otros, hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄,

5 R₅ es hidrógeno, metoxi o hidroxilo,

B es fenilo sustituido con uno o más R₈,

R₈ es, independientemente de los demás, halógeno, ciano o un grupo -L-R₉, donde cada L es, independientemente de los demás, un enlace, -O-, -OC(O)-, -NR₇-, -NR₇CO-, -NR₇S(O)_n-, -S(O)_n-, -S(O)_nNR₇-, -COO- o CONR₇-,

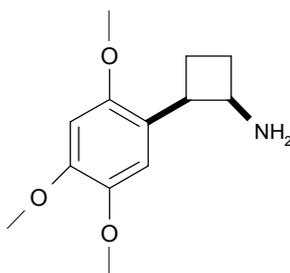
n es 0, 1 o 2,

10 R₇ es hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, bencilo o fenilo, donde el bencilo y el fenilo no están sustituidos o están sustituidos con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄,

R₉ es, independientemente de los demás, alquilo C₁-C₆, que no está sustituido o está sustituido con uno o más R₁₀, cicloalquilo C₃-C₆, que no está sustituido o está sustituido con uno o más R₁₀, bicicloalquilo C₆-C₁₄, que no está sustituido o está sustituido con uno o más R₁₀, alqueno C₂-C₆, que no está sustituido o está sustituido con uno o más R₁₀, alquino C₂-C₆, que no está sustituido o está sustituido con uno o más R₁₀, fenilo, que no está sustituido o está sustituido con R₁₀, o heteroarilo, que no está sustituido o está sustituido con uno o más R₁₀,

15

R₁₀ es, independientemente de los demás, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquenoiloxi C₃-C₆ o alquinoiloxi C₃-C₆, siempre que el B y A-CO-NR₅ estén en *cis* uno respecto del otro en el anillo de cuatro miembros, donde el compuesto de fórmula



20

se excluye.

En una realización preferida, cualquier sustituyente preferido de fórmula (I) en relación con cada uno de B, Y, R₁, R₂, R₃, R₄ y R₅ es también un sustituyente preferido, independiente de la fórmula (I), para la fórmula (II) en el contexto de B, Y, R₁, R₂, R₃, R₄ y R₅ respectivamente.

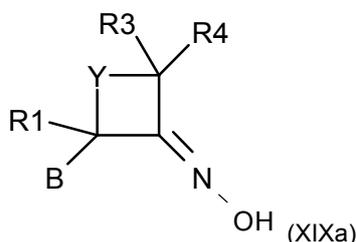
25 Especialmente Y es CH₂, R₁-R₅ son cada uno hidrógeno y B es un fenilo, sustituido con de 1 a 3 sustituyentes, seleccionados independientemente entre halógeno, ciclopropilo, (haloalquil C₁-C₄)ciclopropilo, haloalquilo C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄.

En una realización particular, Y es CH₂, R₁-R₅ son cada uno hidrógeno y B es un fenilo sustituido con de 1 a 3 sustituyentes, seleccionados independientemente entre fluoro, cloro, trifluorometilo, ciclopropilo, trifluorometilciclopropilo y trifluorometoxi.

30

En una realización particularmente preferida, Y es CH₂, R₁-R₅ son cada uno hidrógeno y B es un fenilo mono- o disustituido con halógeno.

La presente invención proporciona además un compuesto de fórmula (XIXa)



donde

Y es O, C=O o CR₁₂R₁₃;

R₁, R₃ y R₄ son, independientemente unos de otros, hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄,

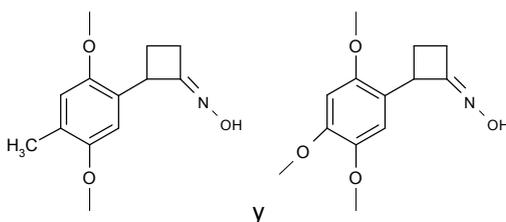
B es fenilo sustituido con uno o más R₈,

- 5 R₈ es, independientemente de los demás, halógeno, ciano o un grupo -L-R₉, donde cada L es, independientemente de los demás, un enlace, -O-, -OC(O)-, -NR₇-, -NR₇CO-, -NR₇S(O)_n-, -S(O)_n-, -S(O)_nNR₇-, -COO- o CONR₇-,
n es 0, 1 o 2,

R₇ es hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, bencilo o fenilo, donde el bencilo y el fenilo no están sustituidos o están sustituidos con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄,

- 10 R₉ es, independientemente de los demás, alquilo C₁-C₆, que no está sustituido o está sustituido con uno o más R₁₀, cicloalquilo C₃-C₆, que no está sustituido o está sustituido con uno o más R₁₀, bicicloalquilo C₆-C₁₄, que no está sustituido o está sustituido con uno o más R₁₀, alqueno C₂-C₆, que no está sustituido o está sustituido con uno o más R₁₀, alquino C₂-C₆, que no está sustituido o está sustituido con uno o más R₁₀, fenilo, que no está sustituido o está sustituido con R₁₀, o heteroarilo, que no está sustituido o está sustituido con uno o más R₁₀,

- 15 R₁₀ es, independientemente de los demás, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquenoiloxi C₃-C₆ o alquinoiloxi C₃-C₆, siempre que el B y A-CO-NR₅ estén en *cis* uno respecto del otro en el anillo de cuatro miembros; donde los compuestos de fórmulas



se excluyen.

- 20 En una realización preferida, cualquier sustituyente preferido de fórmula (I) en relación con cada uno de B, Y, R₁, R₃ y R₄ es también un sustituyente preferido, independiente de la fórmula (I), para la fórmula (XIXa) en el contexto de B, Y, R₁, R₃ y R₄ respectivamente.

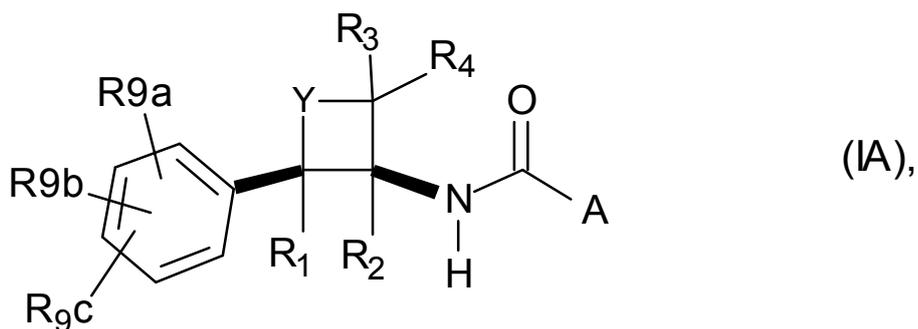
- 25 Especialmente Y es CH₂, R₁, R₃ y R₄ son cada uno hidrógeno, y B es un fenilo, sustituido con de 1 a 3 sustituyentes, seleccionados independientemente entre halógeno, ciclopropilo, (haloalquil C₁-C₄)ciclopropilo, haloalquilo C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄.

En una realización particular, Y es CH₂, R₁, R₃ y R₄ son cada uno hidrógeno, y B es un fenilo sustituido con de 1 a 3 sustituyentes, seleccionados independientemente entre fluoro, cloro, trifluorometilo, ciclopropilo, trifluorometilciclopropilo y trifluorometoxi.

- 30 En una realización particularmente preferida, Y es CH₂, R₁, R₃ y R₄ son cada uno hidrógeno, y B es un fenilo mono- o disustituido con halógeno.

Tablas 1-33: Compuestos de fórmula IA

La invención se ilustra además proporcionando los siguientes compuestos individuales de fórmula (IA) enumerados a continuación en las Tablas 1-33.



5 Cada una de las Tablas 1-33, que siguen a la Tabla Y a continuación, proporcionan 163 compuestos de fórmula (IA) en donde Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} y R_{9c} son los sustituyentes definidos en la Tabla Y y A es el sustituyente definido en la Tabla 1-33 relevante. Por lo tanto, la Tabla 1 individualiza 163 compuestos de fórmula (IA), donde para cada fila de la Tabla Y, el sustituyente A es como se define en la Tabla 1; de forma similar, la Tabla 2 individualiza 163 compuestos de fórmula (IA), donde para cada fila de la Tabla Y, el sustituyente A es como se define en la Tabla 2; y así sucesivamente para las Tablas 3-33.

Tabla Y

Compuesto N.º	Y	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R _{9a}	R _{9b}	R _{9c}
Y.001	CH ₂	H	H	H	H	4-Cl	H	H
Y.002	CH ₂	Me	H	H	H	4-Cl	H	H
Y.003	CH ₂	nPr	H	H	H	4-Cl	H	H
Y.004	CH ₂	F	H	H	H	4-Cl	H	H
Y.005	CH ₂	CN	H	H	H	4-Cl	H	H
Y.006	CH ₂	CF ₃	H	H	H	4-Cl	H	H
Y.007	CH ₂	H	Me	H	H	4-Cl	H	H
Y.008	CH ₂	H	nPr	H	H	4-Cl	H	H
Y.009	CH ₂	H	F	H	H	4-Cl	H	H
Y.010	CH ₂	H	CN	H	H	4-Cl	H	H
Y.011	CH ₂	H	CF ₃	H	H	4-Cl	H	H
Y.012	CH ₂	H	Me	Me	H	4-Cl	H	H
Y.013	CH ₂	H	nPr	nPr	H	4-Cl	H	H
Y.014	CH ₂	H	F	F	H	4-Cl	H	H
Y.015	CH ₂	H	CN	CN	H	4-Cl	H	H
Y.016	CH ₂	H	CF ₃	CF ₃	H	4-Cl	H	H
Y.017	CH ₂	H	H	H	Me	4-Cl	H	H
Y.018	CH ₂	H	H	H	nPr	4-Cl	H	H
Y.019	CH ₂	H	H	H	F	4-Cl	H	H
Y.020	CH ₂	H	H	H	CN	4-Cl	H	H
Y.021	CH ₂	H	H	H	CF ₃	4-Cl	H	H
Y.022	CHMe	H	H	H	H	4-Cl	H	H
Y.023	CHnPr	H	H	H	H	4-Cl	H	H
Y.024	CHF	H	H	H	H	4-Cl	H	H
Y.025	CHCN	H	H	H	H	4-Cl	H	H

ES 2 590 504 T3

Compuesto N.º	Y	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R _{9a}	R _{9b}	R _{9c}
Y.026	CHCF ₃	H	H	H	H	4-Cl	H	H
Y.027	CMe ₂	H	H	H	H	4-Cl	H	H
Y.028	O	H	H	H	H	4-Cl	H	H
Y.029	CH ₂	H	H	H	H	2-Cl	H	H
Y.030	CH ₂	H	H	H	H	4-OBn	H	H
Y.031	CH ₂	H	H	H	H	4-F	H	H
Y.032	CH ₂	H	H	H	H	4-OCHF ₂	H	H
Y.033	CH ₂	H	H	H	H	2-Cl	4-Br	H
Y.034	CH ₂	H	H	H	H	2-Cl	4-Cl	H
Y.035	CH ₂	H	H	H	H	2-F	4-Cl	H
Y.036	CH ₂	H	H	H	H	4-CF ₃	H	H
Y.037	CH ₂	H	H	H	H	3-F	4-Cl	H
Y.038	CH ₂	H	H	H	H	4-OCF ₃	H	H
Y.039	CH ₂	H	H	H	H	4-Br	H	H
Y.040	CH ₂	H	H	H	H	4-CN	H	H
Y.041	CH ₂	H	H	H	H	2-CF ₃	4-F	H
Y.042	CH ₂	H	H	H	H	2-Br	4-F	H
Y.043	CH ₂	H	H	H	H	4-SMe	H	H
Y.044	CH ₂	H	H	H	H	4-cPr	H	H
Y.045	CH ₂	H	H	H	H	4-S(O)Me	H	H
Y.046	CH ₂	H	H	H	H	4-S(O) ₂ Me	H	H
Y.047	CH ₂	H	H	H	H	2-F	4-F	H
Y.048	CH ₂	H	H	H	H	2-Cl	4-F	H
Y.049	CH ₂	H	H	H	H	4-(imidazol-1-ilo)	H	H
Y.050	CH ₂	H	H	H	H	2-F	4-F	6-F
Y.051	CH ₂	H	H	H	H	4-metilo	H	H
Y.052	CH ₂	H	H	H	H	4-ciclopentilo	H	H
Y.053	CH ₂	H	H	H	H	4-alilo	H	H
Y.054	CH ₂	H	H	H	H	4-propargilo	H	H
Y.055	CH ₂	H	H	H	H	4-(4-clorofenilo)	H	H
Y.056	CH ₂	H	H	H	H	4-(3,5-dicloropirid-2-ilo)	H	H
Y.057	CH ₂	H	H	H	H	4-metoxi	H	H
Y.058	CH ₂	H	H	H	H	4-ciclopentiloxi	H	H
Y.059	CH ₂	H	H	H	H	4-aliloxi	H	H
Y.060	CH ₂	H	H	H	H	4-propargiloxi	H	H
Y.061	CH ₂	H	H	H	H	4-(4-clorofenil)oxi	H	H
Y.062	CH ₂	H	H	H	H	4-(3,5-dicloropirid-2-il)oxi	H	H
Y.063	CH ₂	H	H	H	H	4-metoxicarbonilo	H	H
Y.064	CH ₂	H	H	H	H	4-ciclopentiloxicarbonilo	H	H
Y.065	CH ₂	H	H	H	H	4-aliloxicarbonilo	H	H

ES 2 590 504 T3

Compuesto N.º	Y	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R _{9a}	R _{9b}	R _{9c}
Y.066	CH ₂	H	H	H	H	4-propargiloxicarbonilo	H	H
Y.067	CH ₂	H	H	H	H	4-(4-clorofenil)oxicarbonilo	H	H
Y.068	CH ₂	H	H	H	H	4-(3,5-dicloropirid-2-il)oxicarbonilo	H	H
Y.069	CH ₂	H	H	H	H	4-metilamino	H	H
Y.070	CH ₂	H	H	H	H	4-ciclopentilamino	H	H
Y.071	CH ₂	H	H	H	H	4-alilamino	H	H
Y.072	CH ₂	H	H	H	H	4-propargilamino	H	H
Y.073	CH ₂	H	H	H	H	4-(4-clorofenil)amino	H	H
Y.074	CH ₂	H	H	H	H	4-(3,5-dicloropirid-2-il)amino	H	H
Y.075	CH ₂	H	H	H	H	4-metil- <i>N</i> -fenilamino	H	H
Y.076	CH ₂	H	H	H	H	4-ciclopentil- <i>N</i> -fenilamino	H	H
Y.077	CH ₂	H	H	H	H	4-alil- <i>N</i> -fenilamino	H	H
Y.078	CH ₂	H	H	H	H	4-propargil- <i>N</i> -fenilamino	H	H
Y.079	CH ₂	H	H	H	H	4-(4-clorofenil)- <i>N</i> -fenilamino	H	H
Y.080	CH ₂	H	H	H	H	4-(3,5-dicloropirid-2-il) - <i>N</i> -fenilamino	H	H
Y.081	CH ₂	H	H	H	H	4-metil- <i>N</i> -metilamino	H	H
Y.082	CH ₂	H	H	H	H	4-ciclopentil- <i>N</i> -metilamino	H	H
Y.083	CH ₂	H	H	H	H	4-alil- <i>N</i> -metilamino	H	H
Y.084	CH ₂	H	H	H	H	4-propargil- <i>N</i> -metilamino	H	H
Y.085	CH ₂	H	H	H	H	4-(4-clorofenil) - <i>N</i> -metilamino	H	H
Y.086	CH ₂	H	H	H	H	4-(3,5-dicloropirid-2-il) - <i>N</i> -metilamino	H	H
Y.087	CH ₂	H	H	H	H	4-metilaminocarbonilo	H	H
Y.088	CH ₂	H	H	H	H	4-ciclopentilaminocarbonilo	H	H
Y.089	CH ₂	H	H	H	H	4-alilaminocarbonilo	H	H
Y.090	CH ₂	H	H	H	H	4-propargilaminocarbonilo	H	H
Y.091	CH ₂	H	H	H	H	4-(4-clorofenil)aminocarbonilo	H	H
Y.092	CH ₂	H	H	H	H	4-(3,5-dicloropirid-2-il)aminocarbonilo	H	H

ES 2 590 504 T3

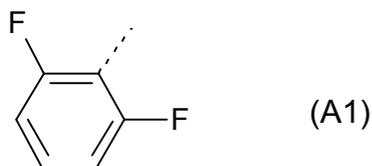
Compuesto N.º	Y	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R _{9a}	R _{9b}	R _{9c}
Y.093	CH ₂	H	H	H	H	4-metil- <i>N</i> -metilaminocarbonilo	H	H
Y.094	CH ₂	H	H	H	H	4-ciclopentil- <i>N</i> -metilaminocarbonilo	H	H
Y.095	CH ₂	H	H	H	H	4-alil- <i>N</i> -metilaminocarbonilo	H	H
Y.096	CH ₂	H	H	H	H	4-propargil- <i>N</i> -metilaminocarbonilo	H	H
Y.097	CH ₂	H	H	H	H	4-(4-clorofenil) - <i>N</i> -metilaminocarbonilo	H	H
Y.098	CH ₂	H	H	H	H	4-(3,5-dicloropirid-2-il) - <i>N</i> -metilaminocarbonilo	H	H
Y.099	CH ₂	H	H	H	H	4-metilaminosulfonilo	H	H
Y.100	CH ₂	H	H	H	H	4-ciclopentilaminosulfonilo	H	H
Y.101	CH ₂	H	H	H	H	4-alilaminosulfonilo	H	H
Y.102	CH ₂	H	H	H	H	4-propargilaminosulfonilo	H	H
Y.103	CH ₂	H	H	H	H	4-(4-clorofenil)aminosulfonilo	H	H
Y.104	CH ₂	H	H	H	H	4-(3,5-dicloropirid-2-il)aminosulfonilo	H	H
Y.105	CH ₂	H	H	H	H	4-metilsulfonilo	H	H
Y.106	CH ₂	H	H	H	H	4-ciclopentilsulfonilo	H	H
Y.107	CH ₂	H	H	H	H	4-alilsulfonilo	H	H
Y.108	CH ₂	H	H	H	H	4-propargilsulfonilo	H	H
Y.109	CH ₂	H	H	H	H	4-(4-clorofenil)sulfonilo	H	H
Y.110	CH ₂	H	H	H	H	4-(3,5-dicloropirid-2-il)sulfonilo	H	H
Y.111	CH ₂	H	H	H	H	4-metilsulfonilamino	H	H
Y.112	CH ₂	H	H	H	H	4-ciclopentilsulfonilamino	H	H
Y.113	CH ₂	H	H	H	H	4-alilsulfonilamino	H	H
Y.114	CH ₂	H	H	H	H	4-propargilsulfonilamino	H	H
Y.115	CH ₂	H	H	H	H	4-(4-clorofenil)sulfonilamino	H	H
Y.116	CH ₂	H	H	H	H	4-(3,5-dicloropirid-2-il)sulfonilamino	H	H
Y.117	CH ₂	H	H	H	H	4-metilsulfonil- <i>N</i> -metilamino	H	H

ES 2 590 504 T3

Compuesto N.º	Y	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R _{9a}	R _{9b}	R _{9c}
Y.118	CH ₂	H	H	H	H	4-ciclopentilsulfonil- <i>N</i> -metilamino	H	H
Y.119	CH ₂	H	H	H	H	4-alilsulfonil- <i>N</i> -metilamino	H	H
Y.120	CH ₂	H	H	H	H	4-propargilsulfonil- <i>N</i> -metilamino	H	H
Y.121	CH ₂	H	H	H	H	4-(4-clorofenil)sulfonil- <i>N</i> -metilamino	H	H
Y.122	CH ₂	H	H	H	H	4-(3,5-dicloropirid-2-il)sulfonil- <i>N</i> -metilamino	H	H
Y.123	CH ₂	H	H	H	H	4-acetoxi	H	H
Y.124	CH ₂	H	H	H	H	4-ciclopentilcarboniloxi	H	H
Y.125	CH ₂	H	H	H	H	4-alilcarboniloxi	H	H
Y.126	CH ₂	H	H	H	H	4-propargilcarboniloxi	H	H
Y.127	CH ₂	H	H	H	H	4-(4-clorofenil)carboniloxi	H	H
Y.128	CH ₂	H	H	H	H	4-(3,5-dicloropirid-2-il)carboniloxi	H	H
Y.129	CH ₂	H	H	H	H	4-acetamido	H	H
Y.130	CH ₂	H	H	H	H	4-ciclopentilcarbonilamino	H	H
Y.131	CH ₂	H	H	H	H	4-alilcarbonilamino	H	H
Y.132	CH ₂	H	H	H	H	4-propargilcarbonilamino	H	H
Y.133	CH ₂	H	H	H	H	4-(4-clorofenil)carbonilamino	H	H
Y.134	CH ₂	H	H	H	H	4-(3,5-dicloropirid-2-il)carbonilamino	H	H
Y.136	O	H	H	H	H	2-Cl	H	H
Y.137	O	H	H	H	H	4-OBn	H	H
Y.138	O	H	H	H	H	4-F	H	H
Y.139	O	H	H	H	H	4-OCHF ₂	H	H
Y.140	O	H	H	H	H	2-Cl	4-Br	H
Y.141	O	H	H	H	H	2-Cl	4-Cl	H
Y.142	O	H	H	H	H	2-F	4-Cl	H
Y.143	O	H	H	H	H	4-CF ₃	H	H
Y.144	O	H	H	H	H	3-F	4-Cl	H
Y.145	O	H	H	H	H	4-OCF ₃	H	H
Y.146	O	H	H	H	H	4-Br	H	H
Y.147	O	H	H	H	H	4-CN	H	H

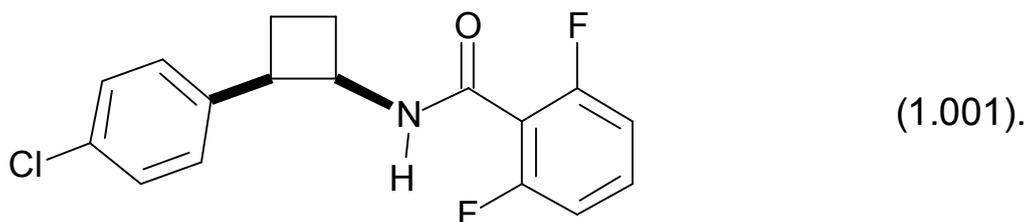
Compuesto N.º	Y	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R _{9a}	R _{9b}	R _{9c}
Y.148	O	H	H	H	H	2-CF ₃	4-F	H
Y.149	O	H	H	H	H	2-Br	4-F	H
Y.150	O	H	H	H	H	4-SMe	H	H
Y.151	O	H	H	H	H	4-cPr	H	H
Y.152	O	H	H	H	H	4-S(O)Me	H	H
Y.153	O	H	H	H	H	4-S(O)2Me	H	H
Y.154	O	H	H	H	H	2-F	4-F	H
Y.155	O	H	H	H	H	2-Cl	4-F	H
Y.156	O	H	H	H	H	4-(imidazol-1-ilo)	H	H
Y.157	O	H	H	H	H	2-F	4-F	6-F
Y.158	O	H	H	H	H	4-metilo	H	H
Y.159	O	H	H	H	H	4-ciclopentilo	H	H
Y.160	O	H	H	H	H	4-alilo	H	H
Y.161	O	H	H	H	H	4-propargilo	H	H
Y.162	O	H	H	H	H	4-(4-clorofenilo)	H	H
Y.163	O	H	H	H	H	4-(3,5-dicloropirid-2-ilo)	H	H

La Tabla 1 proporciona 163 compuestos de fórmula (IA), donde A es

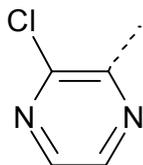


(2,6-difluorofenilo) donde la línea punteada indica el punto de unión del grupo A al grupo amida, e Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} y R_{9c} son como se definen en cada fila de la Tabla Y. Por ejemplo, el compuesto 1.001 tiene la siguiente estructura:

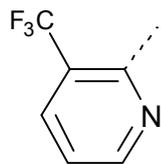
5



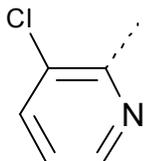
La Tabla 2 proporciona 163 compuestos de fórmula (IA) donde A es 3-cloro-2-pirazinilo (A2), e Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} y R_{9c} son como se definen en cada fila de la Tabla Y.



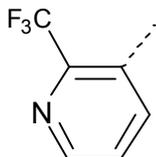
10 La Tabla 3 proporciona 163 compuestos de fórmula (IA) donde A es 3-trifluorometil-2-piridilo (A3), e Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} y R_{9c} son como se definen en cada fila de la Tabla Y.



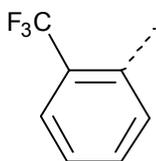
La Tabla 4 proporciona 163 compuestos de fórmula (IA) donde A es 3-cloro-2-piridilo (A4), e Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} y R_{9c} son como se definen en cada fila de la Tabla Y.



5 La Tabla 5 proporciona 163 compuestos de fórmula (IA) donde A es 2-trifluorometil-3-piridilo (A5), e Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} y R_{9c} son como se definen en cada fila de la Tabla Y.

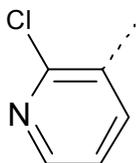


La Tabla 6 proporciona 163 compuestos de fórmula (IA) donde A es 2-trifluorometilfenilo (A6), e Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} y R_{9c} son como se definen en cada fila de la Tabla Y.



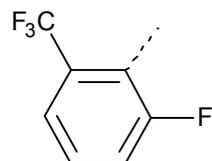
10

La Tabla 7 proporciona 163 compuestos de fórmula (IA) donde A es 2-cloro-3-piridilo (A7), e Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} y R_{9c} son como se definen en cada fila de la Tabla Y.

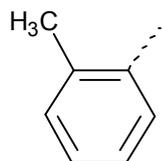


15

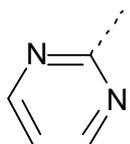
La Tabla 8 proporciona 163 compuestos de fórmula (IA) donde A es 2-fluoro-6-trifluorometilfenilo (A8), e Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} y R_{9c} son como se definen en cada fila de la Tabla Y.



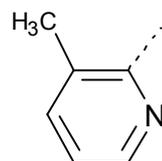
La Tabla 9 proporciona 163 compuestos de fórmula (IA) donde A es 2-tolilo (A9), e Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} y R_{9c} son como se definen en cada fila de la Tabla Y.



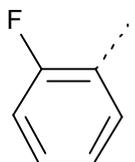
La Tabla 10 proporciona 163 compuestos de fórmula (IA) donde A es 2-pirimidinilo (A10), e Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} y R_{9c} son como se definen en cada fila de la Tabla Y.



5 La Tabla 11 proporciona 163 compuestos de fórmula (IA) donde A es 3-metil-2-piridilo (A11), e Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} y R_{9c} son como se definen en cada fila de la Tabla Y.

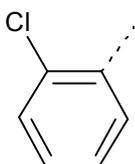


La Tabla 12 proporciona 163 compuestos de fórmula (IA) donde A es 2-fluorofenilo (A12), e Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} y R_{9c} son como se definen en cada fila de la Tabla Y.



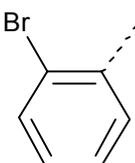
10

La Tabla 13 proporciona 163 compuestos de fórmula (IA) donde A es 2-clorofenilo (A13), e Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} y R_{9c} son como se definen en cada fila de la Tabla Y.

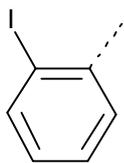


15

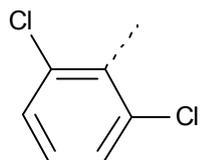
La Tabla 14 proporciona 163 compuestos de fórmula (IA) donde A es 2-bromofenilo (A14), e Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} y R_{9c} son como se definen en cada fila de la Tabla Y.



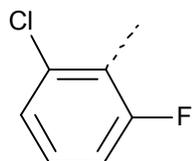
La Tabla 15 proporciona 163 compuestos de fórmula (IA) donde A es 2-yodofenilo (A15), e Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} y R_{9c} son como se definen en cada fila de la Tabla Y.



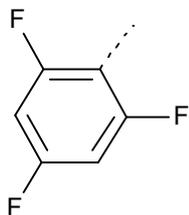
La Tabla 16 proporciona 163 compuestos de fórmula (IA) donde A es 2,6-diclorofenilo (A16), e Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} y R_{9c} son como se definen en cada fila de la Tabla Y.



5 La Tabla 17 proporciona 163 compuestos de fórmula (IA) donde A es 2-cloro-6-fluorofenilo (A17), e Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} y R_{9c} son como se definen en cada fila de la Tabla Y.

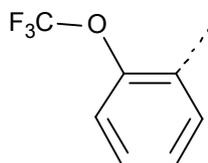


La Tabla 18 proporciona 163 compuestos de fórmula (IA) donde A es 2,4,6-trifluorofenilo (A18), e Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} y R_{9c} son como se definen en cada fila de la Tabla Y.



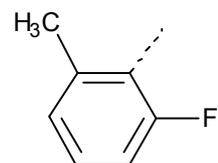
10

La Tabla 19 proporciona 163 compuestos de fórmula (IA) donde A es 2-trifluorometoxifenilo (A19), e Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} y R_{9c} son como se definen en cada fila de la Tabla Y.

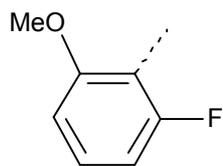


15

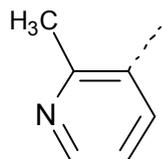
La Tabla 20 proporciona 163 compuestos de fórmula (IA) donde A es 2-fluoro-6-metilfenilo (A20), e Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} y R_{9c} son como se definen en cada fila de la Tabla Y.



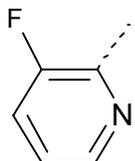
La Tabla 21 proporciona 163 compuestos de fórmula (IA) donde A es 2-fluoro-6-metoxifenilo (A21), e Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} y R_{9c} son como se definen en cada fila de la Tabla Y.



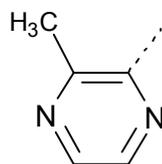
La Tabla 22 proporciona 163 compuestos de fórmula (IA) donde A es 2-metil-3-piridilo (A22), y R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_{9a} , R_{9b} y R_{9c} son como se definen en cada fila de la Tabla Y.



5 La Tabla 23 proporciona 163 compuestos de fórmula (IA) donde A es 3-fluoro-2-piridilo (A23), e Y , R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_{9a} , R_{9b} y R_{9c} son como se definen en cada fila de la Tabla Y.

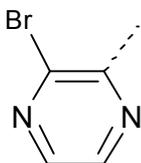


La Tabla 24 proporciona 163 compuestos de fórmula (IA) donde A es 3-metil-2-pirazinilo (A24), e Y , R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_{9a} , R_{9b} y R_{9c} son como se definen en cada fila de la Tabla Y.



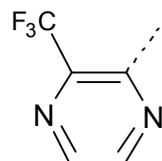
10

La Tabla 25 proporciona 163 compuestos de fórmula (IA) donde A es 3-bromo-2-pirazinilo (A25), e Y , R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_{9a} , R_{9b} y R_{9c} son como se definen en cada fila de la Tabla Y.

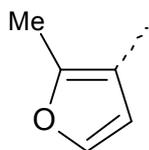


15

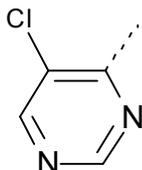
La Tabla 26 proporciona 163 compuestos de fórmula (IA) donde A es 3-trifluorometil-2-pirazinilo (A26), e Y , R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_{9a} , R_{9b} y R_{9c} son como se definen en cada fila de la Tabla Y.



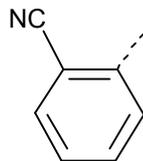
La Tabla 27 proporciona 163 compuestos de fórmula (IA) donde A es 2-metil-3-furilo (A27), e Y , R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_{9a} , R_{9b} y R_{9c} son como se definen en cada fila de la Tabla Y.



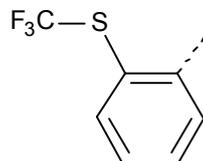
La Tabla 28 proporciona 163 compuestos de fórmula (IA) donde A es 5-cloro-4-pirimidinilo (A28), e Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} y R_{9c} son como se definen en cada fila de la Tabla Y.



- 5 La Tabla 29 proporciona 163 compuestos de fórmula (IA) donde A es 2-cianofenilo (A29), e Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} y R_{9c} son como se definen en cada fila de la Tabla Y.

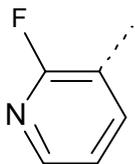


La Tabla 30 proporciona 163 compuestos de fórmula (IA) donde A es 2-trifluorometiltiofenilo (A30), e Y, R₁, R₂,

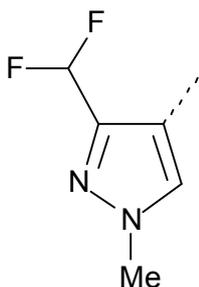


R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} y R_{9c} son como se definen en cada fila de la Tabla Y.

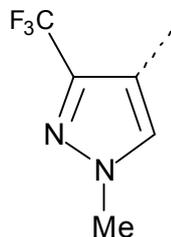
- 10 La Tabla 31 proporciona 163 compuestos de fórmula (IA) donde A es 2-fluoro-3-piridilo (A31), e Y, R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} y R_{9c} son como se definen en cada fila de la Tabla Y.



La Tabla 32 proporciona 163 compuestos de fórmula (IA) donde A es 3-(difluorometil)-1-metilpirazol-4-ilo (A32), y R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} y R_{9c} son como se definen en cada fila de la Tabla Y.



La Tabla 33 proporciona 163 compuestos de fórmula (IA) donde A es 3-(trifluorometil)-1-metilpirazol-4-ilo (A33), y R₁, R₂, R₃, R₄, R_{9a}, R_{9b} y R_{9c} son como se definen en cada fila de la Tabla Y.



5 Los ejemplos de fórmula (II) proporcionados son aquellos en los que los sustituyentes B, Y, R₁, R₂, R₃, R₄ y R₅ en la fórmula (II) se corresponden con cada fila de la Tabla Y anterior en el contexto de la fórmula (Ia). Así, por ejemplo, un compuesto de fórmula (II) en el contexto de la fila Y.001 sería en el que B es 4-clorofenilo; Y es CH₂; y R₁-R₅ son cada uno hidrógeno.

10 Los ejemplos de fórmula (XIXa) proporcionados son aquellos en los que los sustituyentes B, Y, R₁, R₂, R₃ y R₄ en la fórmula (XIXa) se corresponden con cada fila de la Tabla Y anterior en el contexto de la fórmula (Ia). Así, por ejemplo, un compuesto de fórmula (XIXa) en el contexto de la fila Y.001 sería en el que B es 4-clorofenilo; Y es CH₂; y R₁-R₄ son cada uno hidrógeno.

Se ha descubierto que un compuesto de fórmula (I) controla el daño provocado por una plaga y/u hongos.

En una realización, se puede utilizar un compuesto de fórmula (I) en la agricultura.

15 Por lo tanto, la invención se refiere además a un método para controlar el daño y/o las pérdidas de producción debidos a una plaga y/u hongos que comprende aplicar a la plaga, a un emplazamiento de la plaga o a una planta susceptible de ser atacada por la plaga y/u hongos, o a un material de propagación vegetal una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula (I).

20 Los compuestos de acuerdo con la invención se pueden emplear para controlar, es decir, contener o exterminar, plagas y/u hongos que se manifiestan particularmente en plantas, especialmente en plantas útiles y ornamentales en agricultura, en horticultura y en bosques, o en órganos, tales como frutas, flores, follaje, tallos, tubérculos, semillas o raíces de dichas plantas y, en algunos casos, incluso los órganos de las plantas que se forman posteriormente se mantienen protegidos contra estas plagas.

25 Los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la invención son principios activos valiosos a nivel preventivo y/o curativo en el campo del control de plagas, incluso con tasas de aplicación bajas, que se pueden emplear contra plagas y hongos resistentes a pesticidas, dichos compuestos de fórmula (I) tienen un espectro biocida muy favorable y son bien tolerados por especies de sangre caliente, peces y plantas.

30 Los compuestos de acuerdo con la invención pueden actuar contra todas o alguna de las etapas del desarrollo de plagas animales normalmente sensibles, pero también resistentes, tales como insectos o representantes del orden de los ácaros. La actividad insecticida o acaricida de los compuestos de acuerdo con la invención puede manifestarse directamente, es decir, en la destrucción de las plagas, la cual se produce inmediatamente o poco tiempo después, por ejemplo, durante la ecdisis, o indirectamente, por ejemplo, en una tasa reducida de oviposición y/o eclosión, correspondiendo una actividad satisfactoria a una tasa de destrucción (mortalidad) de al menos un 50-60%.

35 Se acaba de descubrir que los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la invención presentan, a efectos prácticos, una gama de actividades con muchas ventajas para proteger animales y plantas útiles contra el ataque y daño de los nematodos. Por consiguiente, la presente invención también proporciona una composición nematicida que comprende compuestos de la invención, tales como de fórmula (I).

40 Los compuestos de fórmula (I) son especialmente útiles para controlar nematodos. Por lo tanto, en otro aspecto, la invención también se refiere a un método para controlar el daño a plantas o partes de estas provocado por nematodos parasitarios de plantas (nematodos endo-, semiendo- y ectoparasitarios), especialmente nematodos parasitarios de plantas tales como nematodos noduladores de las raíces, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica*, *Meloidogyne arenaria* y otras especies *Meloidogyne*; nematodos quísticos, *Globodera rostochiensis* y otras especies *Globodera*; *Heterodera avenae*, *Heterodera glycines*, *Heterodera schachtii*, *Heterodera trifolii* y otras especies *Heterodera*; nematodos galígenos, especies *Anguina*; nematodos del tallo y las hojas, especies *Aphelenchoides*; nematodos de picadura, *Eelionolaimus longicaudatus* y otras especies *Belonolaimus*; nematodos del pino, *Bursaphelenchus xylophilus* y otras especies *Bursaphelenchus*; nematodos anillados, especies *Criconema*, especies *Criconemella*, especies *Criconemoides*, especies *Mesocriconema*; nematodos del tallo y bulbo, *Ditylenchus destructor*,

5 *Ditylenchus dipsaci* y otras especies *Ditylenchus*; nematodos de punzón, especies *Dolichodorus*; nematodos de espiral, *Heliocotylenchus multinctus* y otras especies *Helicotylenchus*; nematodos de vaina y envolventes, especies *Hemicyclophora* y especies *Hemicriconemoides*; especies *Hirshmanniella*; nematodos lanza, especies *Hoploaimus*; falsos nematodos noduladores de las raíces, especies *Nacobbus*; nematodos aguja, *Longidorus elongatus* y otras especies *Longidorus*; nematodos alfiler, especies *Pratylenchus*; nematodos de lesiones, *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus curvatus*, *Pratylenchus goodeyi* y otras especies *Pratylenchus*; nematodos excavadores, *Radopholus similis* y otras especies *Radopholus*; nematodos reniformes, *Rotylenchus robustus*, *Rotylenchus reniformis* y otras especies *Rotylenchus*; especies *Scutellonema*; nematodos de raíz corta y gruesa, *Trichodorus primitivus* y otras especies *Trichodorus*, especie *Paratrichodorus*; nematodos atrofiados, *Tylenchorhynchus claytoni*, *Tylenchorhynchus dubius* y otras especies *Tylenchorhynchus*; nematodos de los cítricos, especie *Tylenchulus*; nematodos daga, especie *Xiphinema*; y otras especies de nematodos parasitarios de plantas, tales como *Subanguina* spp., *Hypsoerine* spp., *Macroposthonia* spp., *Melinius* spp., *Punctodera* spp. y *Quinisulcius* spp.

10 Particularmente, las especies de nematodos *Meloidogyne* spp., *Heterodera* spp., *Rotylenchus* spp. y *Pratylenchus* spp. pueden controlarse con compuestos de la invención.

15 Algunos ejemplos de las plagas de animales son:

- del orden de los ácaros, por ejemplo,

20 *Acalitus* spp., *Aculus* spp., *Acaricalus* spp., *Aceria* spp., *Acarus* siro, *Amblyomma* spp., *Argas* spp., *Boophilus* spp., *Brevipalpus* spp., *Bryobia* spp., *Calipitimerus* spp., *Chorioptes* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Dermatophagoides* spp., *Eotetranychus* spp., *Eriophyes* spp., *Hemitarsonemus* spp., *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Olygonychus* spp., *Ornithodoros* spp., *Polyphagotarsonne latus*, *Panonychus* spp., *Phyllocoptura oleivora*, *Phytonemus* spp., *Polyphagotarsonemus* spp., *Psoroptes* spp., *Rhipicephalus* spp., *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., *Steneotarsonemus* spp., *Tarsonemus* spp. y *Tetranychus* spp.;

- del orden de los anopluros, por ejemplo,

Haematopinus spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Pemphigus* spp. y *Phylloxera* spp.;

25 - del orden de los coleópteros, por ejemplo,

30 *Agriotes* spp., *Amphimallon majale*, *Anomala orientalis*, *Anthonomus* spp., *Aphodius* spp., *Astylus atromaculatus*, *Ataenius* spp., *Atomaria linearis*, *Chaetocnema tibialis*, *Cerotoma* spp., *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp., *Cotinis nitida*, *Curculio* spp., *Cyclocephala* spp., *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., *Diloboderus abderus*, *Epilachna* spp., *Eremnus* spp., *Heteronychus arator*, *Hypothenemus hampei*, *Lagria vilosa*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Lissorhoptrus* spp., *Liogenys* spp., *Maecolaspis* spp., *Maladera castanea*, *Megascelis* spp., *Melighetes aeneus*, *Melolontha* spp., *Myochrous armatus*, *Oryzaephilus* spp., *Otiorynchus* spp., *Phyllophaga* spp., *Phlyctinus* spp., *Popillia* spp., *Psylliodes* spp., *Rhyssomatus aubtilis*, *Rhizopertha* spp., *Scarabeidae*, *Sitophilus* spp., *Sitotroga* spp., *Somaticus* spp., *Sphenophorus* spp., *Sternechus subsignatus*, *Tenebrio* spp., *Tribolium* spp. y *Trogoderma* spp.;

- del orden de los dípteros, por ejemplo,

35 *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Antherigona soccata*, *Bactrocea oleae*, *Bibio hortulanus*, *Bradysia* spp., *Calliphora erythrocephala*, *Ceratitis* spp., *Chrysomyia* spp., *Culex* spp., *Cuterebra* spp., *Dacus* spp., *Delia* spp., *Drosophila melanogaster*, *Fannia* spp., *Gastrophilus* spp., *Geomyza tripunctata*, *Glossina* spp., *Hypoderma* spp., *Hyppobosca* spp., *Liriomyza* spp., *Lucilia* spp., *Melanagromyza* spp., *Musca* spp., *Oestrus* spp., *Orseolia* spp., *Oscinella frit*, *Pegomyia hyoscyami*, *Phorbia* spp., *Rhagoletis* spp., *Rivelia quadrifasciata*, *Scatella* spp., *Sciara* spp., *Stomoxys* spp., *Tabanus* spp., *Tannia* spp. y *Tipula* spp.;

40 - del orden de los hemípteros, por ejemplo,

45 *Acanthocoris scabrator*, *Acrosternum* spp., *Adelphocoris lineolatus*, *Amblypelta nitida*, *Bathycoelia thalassina*, *Blissus* spp., *Cimex* spp., *Clavigralla tomentosicollis*, *Creontiades* spp., *Distantiella theobroma*, *Dichelops furcatus*, *Dysdercus* spp., *Edessa* spp., *Euchistus* spp., *Eurydema pulchrum*, *Eurygaster* spp., *Halyomorpha halys*, *Horcias nobillellus*, *Leptocoris* spp., *Lygus* spp., *Margarodes* spp., *Murgantia histrionic*, *Neomegalotomus* spp., *Nesidiocoris tenuis*, *Nezara* spp., *Nysius simulans*, *Oebalus insularis*, *Piesma* spp., *Piezodorus* spp., *Rhodnius* spp., *Sahlbergella singularis*, *Scaptocoris castanea*, *Scotinophara* spp., *Thyanta* spp., *Triatoma* spp., *Vatiga illudens*;

- del orden de los hemípteros, por ejemplo,

50 *Acyrtosium pisum*, *Adalgas* spp., *Agalliana ensigera*, *Agonoscena targionii*, *Aleurodicus* spp., *Aleurocanthus* spp., *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus floccosus*, *Aleyrodes brassicae*, *Amarasca biguttula*, *Amritodus atkinsoni*, *Aonidiella* spp., *Aphididae*, *Aphis* spp., *Aspidiotus* spp., *Aulacorthum solani*, *Bactericera cockerelli*, *Bemisia* spp., *Brachycaudus* spp., *Brevicoryne brassicae*, *Cacopsylla* spp., *Cavariella aegopodii* Scop., *Ceroplaster* spp.,

- Chrysomphalus aonidium*, *Chrysomphalus dictyospermi*, *Cicadella* spp., *Cofana spectra*, *Cryptomyzus* spp., *Cicadulina* spp., *Coccus hesperidum*, *Dalbulus maidis*, *Dialeurodes* spp., *Diaphorina citri*, *Diuraphis noxia*, *Dysaphis* spp., *Empoasca* spp., *Eriosoma larigerum*, *Erythroneura* spp., *Gascardia* spp., *Glycaspis brimblecombei*, *Hyadaphis pseudobrassicae*, *Hyalopterus* spp., *Hyperomyzus pallidus*, *Idioscopus clypealis*, *Jacobiasca lybica*, *Laodelphax* spp.,
5 *Lecanium corni*, *Lepidosaphes* spp., *Lopaphis erysimi*, *Lyogenys maidis*, *Macrosiphum* spp., *Mahanarva* spp., *Metcalfa pruinosa*, *Metopolophium dirhodum*, *Myndus crudus*, *Myzus* spp., *Neotoxoptera* sp., *Nephotettix* spp., *Nilaparvata* spp., *Nippolachnus piri* Mats, *Odonaspis ruthae*, *Oregma lanigera* Zehnter, *Parabemisia myricae*, *Paratrioza cockerelli*, *Parlatoria* spp., *Pemphigus* spp., *Peregrinus maidis*, *Perkinsiella* spp., *Phorodon humuli*, *Phylloxera* spp., *Planococcus* spp., *Pseudaulacaspis* spp., *Pseudococcus* spp., *Pseudatomoscelis seriatus*, *Psylla* spp., *Pulvinaria aethiopica*,
10 *Quadraspidiotus* spp., *Quesada gigas*, *Recilia dorsalis*, *Rhopalosiphum* spp., *Saissetia* spp., *Scaphoideus* spp., *Schizaphis* spp., *Sitobion* spp., *Sogatella furcifera*, *Spissistilus festinus*, *Tarophagus Proserpina*, *Toxoptera* spp., *Trialeurodes* spp., *Tridiscus sporoboli*, *Trionymus* spp., *Trioza erytraeae*, *Unaspis citri*, *Zygina flammigera*, *Zyginidia scutellaris*;
- del orden de los himenópteros, por ejemplo,
- 15 *Acromyrmex*, *Arge* spp., *Atta* spp., *Cephus* spp., *Diprion* spp., *Diprionidae*, *Gilpinia polytoma*, *Hoplocampa* spp., *Lasius* spp., *Monomorium pharaonis*, *Neodiprion* spp., *Pogonomyrmex* spp., *Slenopsis invicta*, *Solenopsis* spp. y *Vespa* spp.;
- del orden de los isópteros, por ejemplo,
- Coptotermes* spp., *Cornitermes cumulans*, *Incisitermes* spp., *Macrotermes* spp., *Mastotermes* spp., *Microtermes* spp., *Reticulitermes* spp. y *Solenopsis geminate*;
- 20 - del orden de los lepidópteros, por ejemplo,
- Acleris* spp., *Adoxophyes* spp., *Aegeria* spp., *Agrotis* spp., *Alabama argillaceae*, *Amylois* spp., *Anticarsia gemmatalis*, *Archips* spp., *Argyresthia* spp., *Argyrotaenia* spp., *Autographa* spp., *Bucculatrix thurberiella*, *Busseola fusca*, *Cadra cautella*, *Carposina nipponensis*, *Chilo* spp., *Choristoneura* spp., *Chrysoteuchia topiaria*, *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocrocis* spp., *Cnephasia* spp., *Cochylys* spp., *Coleophora* spp., *Colias lesbia*, *Cosmophila flava*, *Crambus* spp.,
25 *Crocidolomia binotalis*, *Cryptophlebia leucotreta*, *Cydalima perspectalis*, *Cydia* spp., *Diaphania perspectalis*, *Diatraea* spp., *Diparopsis castanea*, *Earias* spp., *Eldana saccharina*, *Ephestia* spp., *Epinotia* spp., *Estigmene acrea*, *Etiella zinckinella*, *Eucosma* spp., *Eupoecilia ambiguella*, *Euproctis* spp., *Euxoa* spp., *Feltia jaculiferia*, *Grapholita* spp., *Hedya nubiferana*, *Heliothis* spp., *Hellula undalis*, *Herpetogramma* spp., *Hyphantria cunea*, *Keiferia lycopersicella*, *Lasmopalpus lignosellus*, *Leucoptera scitella*, *Lithocollethis* spp., *Lobesia botrana*, *Loxostege bifidalis*, *Lymantria* spp., *Lyonetia* spp.,
30 *Malacosoma* spp., *Mamestra brassicae*, *Manduca sexta*, *Mythimna* spp., *Noctua* spp., *Operophtera* spp., *Orniodes indica*, *Ostrinia nubilalis*, *Pammene* spp., *Pandemis* spp., *Panolis flammea*, *Papaipema nebris*, *Pectinophora gossypiella*, *Perileucoptera coffeella*, *Pseudaletia unipuncta*, *Phthorimaea operculella*, *Pieris rapae*, *Pieris* spp., *Plutella xylostella*, *Prays* spp., *Pseudoplusia* spp., *Rachiplusia nu*, *Richia albicosta*, *Scirpophaga* spp., *Sesamia* spp., *Sparganothis* spp., *Spodoptera* spp., *Sylepta derogate*, *Synanthedon* spp., *Thaumetopoea* spp., *Tortrix* spp., *Trichoplusia ni*, *Tuta absoluta* e *Yponomeuta* spp.;
- 35 - del orden de los malófagos, por ejemplo,
- Damalinea* spp. y *Trichodectes* spp.;
- del orden de los ortópteros, por ejemplo,
- Blatta* spp., *Blattella* spp., *Gryllotalpa* spp., *Leucophaea maderae*, *Locusta* spp., *Neocurtilla hexadactyla*, *Periplaneta* spp., *Scapteriscus* spp. y *Schistocerca* spp.;
- 40 - del orden de los psocópteros, por ejemplo,
- Liposcelis* spp.;
- del orden de los sifonápteros, por ejemplo,
- Ceratophyllus* spp., *Ctenocephalides* spp. y *Xenopsylla cheopis*;
- 45 - del orden de los tisanópteros, por ejemplo,
- Calliothrips phaseoli*, *Frankliniella* spp., *Heliothrips* spp., *Hercinothrips* spp., *Parthenothrips* spp., *Scirtothrips aurantii*, *Sericothrips variabilis*, *Taeniothrips* spp., *Thrips* spp.;
- del orden de los tisanuros, por ejemplo,
- Lepisma saccharina*.

En otro aspecto, la invención también se puede referir a un método para controlar o prevenir la infestación de plantas útiles por parte de microorganismos fitopatógenos, en el que se aplica un compuesto de fórmula (I) como principio activo a las plantas, a partes de estas o a su emplazamiento. Los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la invención se caracterizan por su actividad, por ser bien tolerados por las plantas y por ser ecológicos. Presentan unas propiedades curativas, preventivas y sistémicas muy útiles, y se emplean para proteger numerosas plantas útiles. Los compuestos de fórmula I se pueden emplear para inhibir o exterminar las enfermedades que se desarrollan en plantas o partes de plantas (frutos, flores, hojas, tallos, tubérculos, raíces) de diferentes plantas útiles, a la vez que protegen también las partes de las plantas que crecen más tarde, p. ej., frente a microorganismos fitopatógenos. También es posible emplear los compuestos de fórmula (I) como agentes de recubrimiento para tratar el material de propagación vegetal, en particular las semillas (frutos, tubérculos, granos) y esquejes vegetales (p. ej., arroz), para la protección contra infecciones fúngicas, así como contra hongos fitopatógenos que existen en la tierra.

Los ejemplos de hongos incluyen: hongos imperfectos (por ejemplo *Botrytis*, *Pyricularia*, *Helminthosporium*, *Fusarium*, *Septoria*, *Cercospora* y *Alternaria*); basidiomicetos (por ejemplo, *Rhizoctonia*, *Hemileia*, *Puccinia*); las clases de ascomicetos (por ejemplo, *Venturia* y *Erysiphe*, *Podosphaera*, *Monilinia*, *Uncinula*); clases de oomicetos (por ejemplo, *Phytophthora*, *Pythium*, *Plasmopara*); cigomicetos (por ejemplo, *Rhizopus* spp.); familia *Phakopsoraceae*, particularmente los del género *Phakopsora*, por ejemplo, *Phakopsora pachyrhizi*, que también se denomina roya asiática de la soja, y los de la familia *Pucciniaceae*, particularmente los del género *Puccinia* tales como *Puccinia graminis*, que también se conoce como roya del tallo o roya negra, la cual representa una enfermedad problemática en plantas de cereales, y *Puccinia recondita*, también conocida como roya parda.

Entre las plantas y las posibles enfermedades de estas plantas protegidas por el método de acuerdo con la presente invención pueden mencionarse:

- trigo, en lo que respecta al control de las siguientes enfermedades seminales: fusariosis (*Microdochium nivale* y *Fusarium roseum*), carbón hediondo (*Tilletia caries*, *Tilletia controversa* o *Tilletia indica*), septoriosis (*Septoria nodorum*) y carbón volador;
- trigo, en lo que respecta al control de las siguientes enfermedades de las partes aéreas de la planta: cercosporiosis de los cereales (*Tapesia yellundae*, *Tapesia acuiformis*), pietín (*Gaeumannomyces graminis*), tizón del pie (*F. culmorum*, *F. graminearum*), manchas negras (*Rhizoctonia cerealis*), oídio (*Erysiphe graminis forma specie tritici*), royas (*Puccinia striiformis* y *Puccinia recondita*) y septoriosis (*Septoria tritici* y *Septoria nodorum*);
- trigo y cebada, en lo que respecta al control de enfermedades bacterianas y víricas, por ejemplo, mosaico amarillo de la cebada; - cebada, en lo que respecta al control de las siguientes enfermedades seminales: helmintosporiosis reticular (*Pyrenophora graminea*, *Pyrenophora teres* y *Cochliobolus sativus*), carbón volador (*Ustilago nuda*) y fusariosis (*Microdochium nivale* y *Fusarium roseum*);
- cebada, en lo que respecta al control de las siguientes enfermedades de las partes aéreas de la planta: cercosporiosis de los cereales (*Tapesia yellundae*), helmintosporiosis reticular (*Pyrenophora teres* y *Cochliobolus sativus*), oídio (*Erysiphe graminis forma specie hordei*), roya parda (*Puccinia hordei*) y mancha foliar (*Rhynchosporium secalis*);
- papa, en lo que respecta al control de enfermedades de los tubérculos (en particular, *Helminthosporium solani*, *Phoma tuberosa*, *Rhizoctonia solani*, *Fusarium solani*), mildiú (*Phytophthora infestans*) y ciertos virus (virus Y);
- papa, en lo que respecta al control de las siguientes enfermedades del follaje: añublo temprano (*Alternaria solani*), mildiú (*Phytophthora infestans*);
- algodón, en lo que respecta al control de las siguientes enfermedades de las plantas jóvenes que emergen a partir de las semillas: marchitamiento fúngico y pudrición del cuello (*Rhizoctonia solani*, *Fusarium oxysporum*) y pudrición negra de las raíces (*Thielaviopsis basicola*);
- plantas productoras de proteínas, por ejemplo, arvejas, en lo que respecta al control de las siguientes enfermedades seminales: antracnosis (*Ascochyta pisi*, *Mycosphaerella pinodes*), fusariosis (*Fusarium oxysporum*), moho gris (*Botrytis cinerea*) y mildiú (*Peronospora pisi*);
- plantas oleaginosas, por ejemplo, colza, en lo que respecta al control de las siguientes enfermedades seminales: *Phoma lingam*, *Alternaria brassicae* y *Sclerotinia sclerotiorum*;
- maíz, en lo que respecta al control de las enfermedades seminales: (*Rhizopus* sp., *Penicillium* sp., *Trichoderma* sp., *Aspergillus* sp. y *Gibber ellafujikuroi*);
- lino, en lo que respecta al control de la enfermedad seminal: *Alternaria linicola*;
- árboles, en lo que respecta al control del marchitamiento fúngico (*Fusarium oxysporum*, *Rhizoctonia solani*);

- arroz, en lo que respecta al control de las siguientes enfermedades de las partes aéreas: piculariosis (*Magnaporthe grisea*), rizoctoniosis (*Rhizoctonia solani*);
- 5 - plantas leguminosas, en lo que respecta al control de las siguientes enfermedades seminales o de plantas jóvenes que emergen de las semillas: marchitamiento fúngico y pudrición del cuello (*Fusarium oxysporum*, *Fusarium roseum*, *Rhizoctonia solani*, *Pythium* sp.);
- 10 - plantas leguminosas, en lo que respecta al control de las siguientes enfermedades de las partes aéreas: moho gris (*Botrytis* sp.), oídios (en particular *Erysiphe cichoracearum*, *Sphaerotheca fuliginea* y *Leveillula taurica*), fusariosis (*Fusarium oxysporum*, *Fusarium roseum*), mancha foliar (*Cladosporium* sp.), manchas foliares por alternaria (*Alternaria* sp.), antracnosis (*Colletotrichum* sp.), septoriosis (*Septoria* sp.), pecas negras (*Rhizoctonia solani*), mildiús (por ejemplo, *Bremia lactucae*, *Peronospora* sp., *Pseudoperonospora* sp., *Phytophthora* sp.);
- arboles frutales, en lo que respecta a enfermedades de las partes aéreas: enfermedad por monilia (*Monilia fructigenae*, *M. laxa*), moteado (*Venturia inaequalis*), oídio (*Podosphaera leucotricha*); - vid, en lo que respecta al control de enfermedades del follaje: en particular el moho gris (*Botrytis cinerea*), oídio (*Uncinula necator*), pudrición negra (*Guignardia biwelli*) y mildiú (*Plasmopara viticola*);
- 15 - remolacha, en lo que respecta a las siguientes enfermedades de las partes aéreas: cercosporosis (*Cercospora beticola*), oídio (*Erysiphe beticola*), mancha foliar (*Ramularia beticola*).

La composición fungicida de acuerdo con la presente invención también puede usarse contra enfermedades fúngicas que pueden desarrollarse sobre o dentro de la madera. El término "madera" se refiere a todos los tipos de especies de madera y todos los tipos de procesamiento de esta madera para la construcción, por ejemplo, madera sólida, madera de alta densidad, madera laminada y madera contrachapada. El método para el tratamiento de la madera de acuerdo con la invención consiste principalmente en ponerla en contacto con uno o más compuestos de la presente invención, o una composición de acuerdo con la invención; esto incluye, por ejemplo, la aplicación directa, pulverización, inmersión, inyección o cualquier otro medio adecuado.

20

Los compuestos de la presente invención son eficaces para controlar plagas de nematodos, insectos y ácaros y/o patógenos fúngicos de plantas agronómicas, tanto en crecimiento como cosechadas. Cuando se emplean solos, también pueden usarse combinados con otros agentes activos biológicos usados en la agricultura tales como uno o más nematocidas, insecticidas, acaricidas, fungicidas, bactericidas, activadores de plantas, molusquicidas y feromonas (ya sean químicas o biológicas). La mezcla de compuestos de la invención o las composiciones de estos en la forma de uso como pesticidas con otros pesticidas frecuentemente resulta en un espectro de acción pesticida más amplio. Por ejemplo, los compuestos de fórmula (I) de esta invención pueden usarse eficazmente de forma conjunta o combinados con piretroides, neonicotinoides, macrólidos, diamidas, fosfatos, carbamatos, ciclodienos, formamidas, compuestos fenólicos estánicos, hidrocarburos clorados, benzoilfenilureas, pirroles y similares.

25

30

La actividad de las composiciones de acuerdo con la invención se puede ampliar considerablemente y se puede adaptar a las circunstancias predominantes mediante la adición de, por ejemplo, uno más agentes activos como insecticidas, acaricidas, nematocidas y/o fungicidas. Las combinaciones de los compuestos de fórmula (I) con otros agentes activos como insecticidas, acaricidas, nematocidas y/o fungicidas también pueden presentar otras ventajas sorprendentes, las cuales también se pueden describir, en un sentido más amplio, como actividad sinérgica. Por ejemplo, una mejor tolerancia por parte de las plantas, una menor fitotoxicidad, permiten controlar plagas u hongos en los diferentes estadios de su desarrollo, o un mejor comportamiento durante su producción, por ejemplo, durante la molienda o la mezcla, durante su almacenamiento o durante su uso.

35

40

Se pretende que la siguiente lista de pesticidas, los cuales pueden usarse junto con los compuestos de acuerdo con la invención, ilustre las posibles combinaciones a modo de ejemplo.

Se prefiere la siguiente combinación de los compuestos de fórmula (I) con otros compuestos activos (la abreviatura "TX" se refiere a "un compuesto seleccionado entre los 163 compuestos de cada una de las Tablas 1-33 de la presente invención"):

45

un adyuvante seleccionado del grupo de sustancias constituido por aceites de petróleo (nombre alternativo) (628) + TX,

un acaricida seleccionado del grupo de sustancias constituido por 1,1-bis(4-clorofenil)-2-etoxietanol (nombre de la IUPAC) (910) + TX, benzenosulfonato de 2,4-diclorofenilo (nombre de la IUPAC/Chemical Abstracts) (1059) + TX, 2-fluoro-N-metil-N-1-naftilacetamida (nombre de la IUPAC) (1295) + TX, sulfona 4-clorofenil fenilica (nombre de la IUPAC) (981) + TX, abamectina (1) + TX, acequinocilo (3) + TX, acetoprol [CCN] + TX, acrinatrina (9) + TX, aldicarb (16) + TX, aldoxicarb (863) + TX, alfa-cipermetrina (202) + TX, amiditió (870) + TX, amidoflumet [CCN] + TX, amidotioato (872) + TX, amitón (875) + TX, hidrogenooxalato de amitón (875) + TX, amitraz (24) + TX, aramita (881) + TX, óxido arsenioso (882) + TX, AVI 382 (código de compuesto) + TX, AZ 60541 (código de compuesto) + TX, azinfós-etilo (44) + TX, azinfós-metilo (45) + TX, azobenceno (nombre de la IUPAC) (888) + TX, azociclotina (46) + TX,

50

55

azotoato (889) + TX, benomilo (62) + TX, benoxafós (nombre alternativo) [CCN] + TX, benzoximato (71) + TX, benzoato de bencilo (nombre de la IUPAC) [CCN] + TX, bifenazato (74) + TX, bifentrina (76) + TX, binapacril (907) + TX, brofenvalerato (nombre alternativo) + TX, bromocicleno (918) + TX, bromofós (920) + TX, bromofós-etilo (921) + TX, bromopropilato (94) + TX, buprofezina (99) + TX, butocarboxim (103) + TX, butoxicarboxim (104) + TX,

5 butilpiridabeno (nombre alternativo) + TX, polisulfuro de calcio (nombre de la IUPAC) (111) + TX, camfeclor (941) + TX, carbanolato (943) + TX, carbarilo (115) + TX, carbofurano (118) + TX, carbofenotión (947) + TX, CGA 50'439 (código de desarrollo) (125) + TX, quinometionato (126) + TX, clorbensida (959) + TX, clordimeform (964) + TX, clorhidrato de clordimeform (964) + TX, clorfenapir (130) + TX, clorfenetol (968) + TX, clorfensón (970) + TX, clorfensulfuro (971) + TX, clorfenvinfos (131) + TX, clorobenzilato (975) + TX, cloromebuform (977) + TX,

10 clorometiurón (978) + TX, cloropropilato (983) + TX, clorpirifós (145) + TX, clorpirifós-metilo (146) + TX, clortiofós (994) + TX, cinerina I (696) + TX, cinerina II (696) + TX, cinerinas (696) + TX, clofentezina (158) + TX, closantel (nombre alternativo) [CCN] + TX, coumafós (174) + TX, crotamitón (nombre alternativo) [CCN] + TX, crotoxi-fós (1010) + TX, cufraneb (1013) + TX, ciantoato (1020) + TX, ciflumetofeno (N.º de Registro CAS: 400882-07-7) + TX, cihalotrina (196) + TX, cihexatina (199) + TX, cipermetrina (201) + TX, DCPM (1032) + TX, DDT (219) + TX, demefión (1037) + TX, demefión-O (1037) + TX, demefión-S (1037) + TX, demetón (1038) + TX, demetón-metilo (224) + TX, demetón-O (1038) + TX, demetón-O-metilo (224) + TX, demetón-S (1038) + TX, demetón-S-metilo (224) + TX, demetón-S-metilsulfona (1039) + TX, diafentiurón (226) + TX, dialifós (1042) + TX, diazinona (227) + TX, diclofluanida (230) + TX, diclorvos (236) + TX, diclifós (nombre alternativo) + TX, dicofol (242) + TX, dicrotofós (243) + TX, dienoclor (1071) + TX, dimefox (1081) + TX, dimetoato (262) + TX, dinactina (nombre alternativo) (653) + TX, dinex (1089) + TX, dinex-diclexina (1089) + TX, dinobutón (269) + TX, dinocap (270) + TX, dinocap-4 [CCN] + TX, dinocap-6 [CCN] + TX, dinocetón (1090) + TX, dinopentón (1092) + TX, dinosulfón (1097) + TX, dinoterbón (1098) + TX, dioxatión (1102) + TX, sulfona difenilica (nombre de la IUPAC) (1103) + TX, disulfiram (nombre alternativo) [CCN] + TX, disulfotón (278) + TX, DNOC (282) + TX, dofenapina (1113) + TX, doramectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, endosulfano (294) + TX, endotión (1121) + TX, EPN (297) + TX, eprinomectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, etión (309) + TX, etoato-metilo (1134) + TX, etoxazol (320) + TX, etrimfós (1142) + TX, fenazaflor (1147) + TX, fenazaquina (328) + TX, óxido de fenbutatina (330) + TX, fenotiocarb (337) + TX, fenpropatrina (342) + TX, fenpirad (nombre alternativo) + TX, fenpiroximato (345) + TX, fensón (1157) + TX, fentri-fanilo (1161) + TX, fenvalerato (349) + TX, fipronilo (354) + TX, fluacripirim (360) + TX, fluazurón (1166) + TX, flubenzimina (1167) + TX, fluciclo-xurón (366) + TX, flucitrinato (367) + TX, fluenetilo (1169) + TX, flufenoxurón (370) + TX, flumetrina (372) + TX, fluorbensida (1174) + TX,

20 flupiradifurona + TX, fluvalinato (1184) + TX, FMC 1137 (código de desarrollo) (1185) + TX, formetanato (405) + TX, clorhidrato de formetanato (405) + TX, formotión (1192) + TX, formparanato (1193) + TX, gamma-HCH (430) + TX, gliodina (1205) + TX, halfenprox (424) + TX, heptenofós (432) + TX, ciclopropanocarboxilato de hexadecilo (nombre de la IUPAC/Chemical Abstracts) (1216) + TX, hexitiazox (441) + TX, yodometano (nombre de la IUPAC) (542) + TX, isocarbofós (nombre alternativo) (473) + TX, O-(metoxiaminotiofosforil)salicilato de isopropilo (nombre de la IUPAC) (473) + TX, ivermectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, jasmolina I (696) + TX, jasmolina II (696) + TX, jodfenfós (1248) + TX, lindano (430) + TX, lufenurón (490) + TX, malatión (492) + TX, malonobeno (1254) + TX, mecarbam (502) + TX, mefosfolano (1261) + TX, mesulfeno (nombre alternativo) [CCN] + TX, metacrifós (1266) + TX, metamidofós (527) + TX, metadación (529) + TX, metiocarb (530) + TX, metomil (531) + TX, bromuro de metilo (537) + TX, metolcarb (550) + TX, mevinfós (556) + TX, mexacarbato (1290) + TX, milbemectina (557) + TX, oxima de milbemectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, mipafox (1293) + TX, monocrotofós (561) + TX, morfotión (1300) + TX, moxidectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, naled (567) + TX, NC-184 (código de compuesto) + TX, NC-512 (código de compuesto) + TX, nifluridida (1309) + TX, nikkomicinas (nombre alternativo) [CCN] + TX, nitrilacarb (1313) + TX, complejo de nitrilacarb y cloruro de zinc 1:1 (1313) + TX, NNI-0101 (código de compuesto) + TX, NNI-0250 (código de compuesto) + TX, ometoato (594) + TX, oxamilo (602) + TX, oxideprofós (1324) + TX, oxidisulfotón (1325) + TX, pp'-DDT (219) + TX, paratión (615) + TX, permetrina (626) + TX, aceites del petróleo (nombre alternativo) (628) + TX, fenkaptón (1330) + TX, fentoato (631) + TX, forato (636) + TX, fosalona (637) + TX, fosfolán (1338) + TX, fosmet (638) + TX, fosfamidón (639) + TX, foxim (642) + TX, pirimifós-metilo (652) + TX, policloroterpeneos (nombre tradicional) (1347) + TX, polinactinas (nombre alternativo) (653) + TX, proclonol (1350) + TX, profenofós (662) + TX, promacilo (1354) + TX, propargita (671) + TX, propetamfós (673) + TX, prolonox (678) + TX, protidación (1360) + TX, protoato (1362) + TX, piretrina I (696) + TX, piretrina II (696) + TX, piretrinas (696) + TX, piridabeno (699) + TX, piridafentión (701) + TX, pirimidifeno (706) + TX, pirimitato (1370) + TX, quinalfós (711) + TX, quintiofós (1381) + TX, R-1492 (código de desarrollo) (1382) + TX, RA-17 (código de desarrollo) (1383) + TX, rotenona (722) + TX, escradán (1389) + TX, sebufós (nombre alternativo) + TX, selamectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, SI-0009 (código de compuesto) + TX, sofamida (1402) + TX, espirodiclofeno (738) + TX, espiromesifeno (739) + TX, SSI-121 (código de desarrollo) (1404) + TX, sulfiram (nombre alternativo) [CCN] + TX, sulfuramida (750) + TX, sulfotep (753) + TX, azufre (754) + TX, SZI-121 (código de desarrollo) (757) + TX, tau-fluvalinato (398) + TX, tebufenpirad (763) + TX, TEPP (1417) + TX, terbam (nombre alternativo) + TX, tetraclorvinfós (777) + TX, tetradifón (786) + TX, tetranactina (nombre alternativo) (653) + TX, tetrasul (1425) + TX, tiafenox (nombre alternativo) + TX, tiocarboxima (1431) + TX, tiofanox (800) + TX, tiometón (801) + TX, tioquinox (1436) + TX, turingiensina (nombre alternativo) [CCN] + TX, triamifós (1441) + TX,

55 triarateno (1443) + TX, triazofós (820) + TX, triazurón (nombre alternativo) + TX, triclorfón (824) + TX, trifenofós (1455) + TX, trinactina (nombre alternativo) (653) + TX, vamidotión (847) + TX, vaniliprol [CCN] e YI-5302 (código de compuesto) + TX,

60 un algicida seleccionado del grupo de sustancias constituido por betoxazina [CCN] + TX, dioctanoato de cobre

(nombre de la IUPAC) (170) + TX, sulfato de cobre (172) + TX, cibutrina [CCN] + TX, diclona (1052) + TX, diclorofeno (232) + TX, endotal (295) + TX, fentina (347) + TX, cal hidratada [CCN] + TX, nabam (566) + TX, quinoclamina (714) + TX, quinonamida (1379) + TX, simazina (730) + TX, acetato de trifenilestaño (nombre de la IUPAC) (347) e hidróxido de trifenilestaño (nombre de la IUPAC) (347) + TX,

5 un antihelmíntico seleccionado del grupo de sustancias constituido por abamectina (1) + TX, crufofomato (1011) + TX, doramectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, emamectina (291) + TX, benzoato de emamectina (291) + TX, eprinomectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, ivermectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, oxima de milbemicina (nombre alternativo) [CCN] + TX, moxidectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, piperazina [CCN] + TX, selamectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, espinosad (737) y tiofanato (1435) + TX,

10 un avicida seleccionado del grupo de sustancias constituido por cloralosa (127) + TX, endrina (1122) + TX, fentiión (346) + TX, piridin-4-amina (nombre de la IUPAC) (23) y estircina (745) + TX,

un bactericida seleccionado del grupo de sustancias constituido por 1-hidroxi-1*H*-piridin-2-tiona (nombre de la IUPAC) (1222) + TX, 4-(quinoxalin-2-ilamino)benzenosulfonamida (nombre de la IUPAC) (748) + TX, sulfato de 8-hidroxiquinolina (446) + TX, bronopol (97) + TX, dioctanoato de cobre (nombre de la IUPAC) (170) + TX, hidróxido de cobre (nombre de la IUPAC) (169) + TX, cresol [CCN] + TX, diclorofeno (232) + TX, dipiritiona (1105) + TX, dodicina (1112) + TX, fenaminosulf (1144) + TX, formaldehído (404) + TX, hidrargafeno (nombre alternativo) [CCN] + TX, kasugamicina (483) + TX, clorhidrato de kasugamicina hidratada (483) + TX, níquel bis(dimetilditiocarbamato) (nombre de la IUPAC) (1308) + TX, nitrapirina (580) + TX, octilnona (590) + TX, ácido oxolínico (606) + TX, oxitetraciclina (611) + TX, hidroxiquinolinsulfato de potasio (446) + TX, probenazol (658) + TX, estreptomina (744) + TX, sesquisulfato de estreptomina (744) + TX, tecloftalam (766) + TX, y tiomersal (nombre alternativo) [CCN] + TX,

un agente biológico seleccionado del grupo de sustancias constituido por *Adoxophyes orana* GV (nombre alternativo) (12) + TX, *Agrobacterium radiobacter* (nombre alternativo) (13) + TX, *Amblyseius* spp. (nombre alternativo) (19) + TX, *Anagrapha falcifera* NPV (nombre alternativo) (28) + TX, *Anagrus atomus* (nombre alternativo) (29) + TX, *Aphelinus abdominalis* (nombre alternativo) (33) + TX, *Aphidius colemani* ((nombre alternativo) (34) + TX, *Aphidoletes aphidimyza* (nombre alternativo) (35) + TX, *Autographa californica* NPV (nombre alternativo) (38) + TX, *Bacillus firmus* (nombre alternativo) (48) + TX, *Bacillus sphaericus* Neide (nombre científico) (49) + TX, *Bacillus thuringiensis Berliner* (nombre científico) (51) + TX, *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai* (nombre científico) (51) + TX, *Bacillus thuringiensis* subsp. *israelensis* (nombre científico) (51) + TX, *Bacillus thuringiensis* subsp. *japonensis* (nombre científico) (51) + TX, *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki* (nombre científico) (51) + TX, *Bacillus thuringiensis* subsp. *tenebrionis* (nombre científico) (51) + TX, *Beauveria bassiana* (nombre alternativo) (53) + TX, *Beauveria brongniartii* (nombre alternativo) (54) + TX, *Chrysoperla carnea* (nombre alternativo) (151) + TX, *Cryptolaemus montrouzieri* (nombre alternativo) (178) + TX, *Cydia pomonella* GV (nombre alternativo) (191) + TX, *Dacnusa sibirica* (nombre alternativo) (212) + TX, *Diglyphus isaea* (nombre alternativo) (254) + TX, *Encarsia formosa* (nombre científico) (293) + TX, *Eretmocerus eremicus* (nombre alternativo) (300) + TX, *Helicoverpa zea* NPV (nombre alternativo) (431) + TX, *Heterorhabditis bacteriophora* and *H. megidis* (nombre alternativo) (433) + TX, *Hippodamia convergens* (nombre alternativo) (442) + TX, *Leptomastix dactylopii* (nombre alternativo) (488) + TX, *Macrolophus caliginosus* (nombre alternativo) (491) + TX, *Mamestra brassicae* NPV (nombre alternativo) (494) + TX, *Metaphycus helvolus* (nombre alternativo) (522) + TX, *Metarhizium anisopliae* var. *acridum* (nombre científico) (523) + TX, *Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae* (nombre científico) (523) + TX, *Neodiprion sertifer* NPV y *N. lecontei* NPV (nombre alternativo) (575) + TX, *Orius* spp. (nombre alternativo) (596) + TX, *Paecilomyces fumosoroseus* (nombre alternativo) (613) + TX, *Pasteuria penetrans* + TX, *Pasteuria thornei* + TX, *Pasteuria nishizawae* + TX, *Pasteuria ramosa* + TX, *Phytoseiulus persimilis* (nombre alternativo) (644) + TX, virus de la polihedrosis nuclear multicapsídico por *Spodoptera exigua* (nombre científico) (741) + TX, *Steinernema bibionis* (nombre alternativo) (742) + TX, *Steinernema carpocapsae* (nombre alternativo) (742) + TX, *Steinernema feltiae* (nombre alternativo) (742) + TX, *Steinernema glaseri* (nombre alternativo) (742) + TX, *Steinernema riobrave* (nombre alternativo) (742) + TX, *Steinernema riobrave* (nombre alternativo) (742) + TX, *Steinernema scapterisci* (nombre alternativo) (742) + TX, *Steinernema* spp. (nombre alternativo) (742) + TX, *Trichogramma* spp. (nombre alternativo) (826) + TX, *Typhlodromus occidentalis* (nombre alternativo) (844) y *Verticillium lecanii* (nombre alternativo) (848) + TX,

un esterilizante del suelo seleccionado del grupo de sustancias constituido por yodometano (nombre de la IUPAC) (542) y bromuro de metilo (537) + TX,

50 un quimioesterilizante seleccionado del grupo de sustancias constituido por afolato [CCN] + TX, bisazir (nombre alternativo) [CCN] + TX, busulfán (nombre alternativo) [CCN] + TX, diflubenzurón (250) + TX, dimatif (nombre alternativo) [CCN] + TX, hemel [CCN] + TX, hempa [CCN] + TX, metepa [CCN] + TX, metiotepa [CCN] + TX, afolato de metilo [CCN] + TX, morzid [CCN] + TX, penflurón (nombre alternativo) [CCN] + TX, tepa [CCN] + TX, tiohempa (nombre alternativo) [CCN] + TX, tiotepa (nombre alternativo) [CCN] + TX, tretamina (nombre alternativo) [CCN] y uredepa (nombre alternativo) [CCN] + TX,

una feromona de insecto seleccionada del grupo de sustancias constituido por acetato de (*E*)-dec-5-en-1-ilo con (*E*)-dec-5-en-1-ol (nombre de la IUPAC) (222) + TX, acetato de (*E*)-tridec-4-en-1-ilo (nombre de la IUPAC) (829) + TX, (*E*)-6-metilhept-2-en-4-ol (nombre de la IUPAC) (541) + TX, acetato de (*E,Z*)-tetradeca-4,10-dien-1-ilo (nombre de la

IUPAC) (779) + TX, acetato de (Z)-dodec-7-en-1-ilo (nombre de la IUPAC) (285) + TX, (Z)-hexadec-11-enal (nombre de la IUPAC) (436) + TX, acetato de (Z)-hexadec-11-en-1-ilo (nombre de la IUPAC) (437) + TX, acetato de (Z)-hexadec-13-en-11-in-1-ilo (nombre de la IUPAC) (438) + TX, (Z)-icos-13-en-10-ona (nombre de la IUPAC) (448) + TX, (Z)-tetradec-7-en-1-al (nombre de la IUPAC) (782) + TX, (Z)-tetradec-9-en-1-ol (nombre de la IUPAC) (783) + TX, acetato de (Z)-tetradec-9-en-1-ilo (nombre de la IUPAC) (784) + TX, acetato de (7E,9Z)-dodeca-7,9-dien-1-ilo (nombre de la IUPAC) (283) + TX, acetato de (9Z,11E)-tetradeca-9,11-dien-1-ilo (nombre de la IUPAC) (780) + TX, acetato de (9Z,12E)-tetradeca-9,12-dien-1-ilo (nombre de la IUPAC) (781) + TX, 14-metiloctadec-1-eno (nombre de la IUPAC) (545) + TX, 4-metilnonan-5-ol con 4-metilnonan-5-ona (nombre de la IUPAC) (544) + TX, alfa-multistriatina (nombre alternativo) [CCN] + TX, brevicomina (nombre alternativo) [CCN] + TX, codlelure (nombre alternativo) [CCN] + TX, codlemona (nombre alternativo) (167) + TX, cue lure (nombre alternativo) (179) + TX, disparlure (277) + TX, acetato de dodec-8-en-1-ilo (nombre de la IUPAC) (286) + TX, acetato de dodec-9-en-1-ilo (nombre de la IUPAC) (287) + TX, dodeca-8 + TX, acetato de 10-dien-1-ilo (nombre de la IUPAC) (284) + TX, dominicalure (nombre alternativo) [CCN] + TX, 4-metiloctanoato de etilo (nombre de la IUPAC) (317) + TX, eugenol (nombre alternativo) [CCN] + TX, frontalina (nombre alternativo) [CCN] + TX, gosiplure (nombre alternativo) (420) + TX, grandlure (421) + TX, grandlure I (nombre alternativo) (421) + TX, grandlure II (nombre alternativo) (421) + TX, grandlure III (nombre alternativo) (421) + TX, grandlure IV (nombre alternativo) (421) + TX, hexalure [CCN] + TX, ipsdienol (nombre alternativo) [CCN] + TX, ipsenol (nombre alternativo) [CCN] + TX, japonilure (nombre alternativo) (481) + TX, lineatina (nombre alternativo) [CCN] + TX, litlure (nombre alternativo) [CCN] + TX, looplure (nombre alternativo) [CCN] + TX, medlure [CCN] + TX, ácido megatomoico (nombre alternativo) [CCN] + TX, eugenol metílico (nombre alternativo) (540) + TX, muscalure (563) + TX, acetato de octadeca-2,13-dien-1-ilo (nombre de la IUPAC) (588) + TX, acetato de octadeca-3,13-dien-1-ilo (nombre de la IUPAC) (589) + TX, orfralure (nombre alternativo) [CCN] + TX, orictalure (nombre alternativo) (317) + TX, ostromona (nombre alternativo) [CCN] + TX, siglure [CCN] + TX, sordidina (nombre alternativo) (736) + TX, sulcatol (nombre alternativo) [CCN] + TX, acetato de tetradec-11-en-1-ilo (nombre de la IUPAC) (785) + TX, trimedlure (839) + TX, trimedlure A (nombre alternativo) (839) + TX, trimedlure B₁ (nombre alternativo) (839) + TX, trimedlure B₂ (nombre alternativo) (839) + TX, trimedlure C (nombre alternativo) (839) y trunc-call (nombre alternativo) [CCN] + TX,

un repelente de insectos seleccionado del grupo de sustancias constituido por 2-(octiltio)etanol (nombre de la IUPAC) (591) + TX, butopironoxilo (933) + TX, butoxi(polipropilenglicol) (936) + TX, adipato de dibutilo (nombre de la IUPAC) (1046) + TX, ftalato de dibutilo (1047) + TX, succinato de dibutilo (nombre de la IUPAC) (1048) + TX, dietiltoluidamida [CCN] + TX, carbato de dimetilo [CCN] + TX, ftalato de dimetilo [CCN] + TX, etilhexanodiol (1137) + TX, hexamida [CCN] + TX, metoquina-butilo (1276) + TX, metilneodecanamida [CCN] + TX, oxamato [CCN] y picaridina [CCN] + TX,

un insecticida seleccionado del grupo de sustancias constituido por 1-dicloro-1-nitroetano (nombre de la IUPAC/Chemical Abstracts) (1058) + TX, 1,1-dicloro-2,2-bis(4-etilfenil)etano (nombre de la IUPAC) (1056), + TX, 1,2-dicloropropano (nombre de la IUPAC/Chemical Abstracts) (1062) + TX, 1,2-dicloropropano con 1,3-dicloropropeno (nombre de la IUPAC) (1063) + TX, 1-bromo-2-cloroetano (nombre de la IUPAC/Chemical Abstracts) (916) + TX, acetato de 2,2,2-tricloro-1-(3,4-diclorofenil)etilo (nombre de la IUPAC) (1451) + TX, fosfato metílico de 2,2-diclorovinilo y 2-etilsulfinito (nombre de la IUPAC) (1066) + TX, dimetilcarbamato de 2-(1,3-ditiolan-2-il)fenilo (nombre de la IUPAC/ Chemical Abstracts) (1109) + TX, tiocianato de 2-(2-butoxi)etilo (nombre de la IUPAC/Chemical Abstracts) (935) + TX, metilcarbamato de 2-(4,5-dimetil-1,3-dioxolan-2-il)fenilo (nombre de la IUPAC/ Chemical Abstracts) (1084) + TX, 2-(4-cloro-3,5-xililoxi)etanol (nombre de la IUPAC) (986) + TX, fosfato dietílico de 2-clorovinilo (nombre de la IUPAC) (984) + TX, 2-imidazolidona (nombre de la IUPAC) (1225) + TX, 2-isovalerilindan-1,3-diona (nombre de la IUPAC) (1246) + TX, metilcarbamato de 2-metil(prop-2-inil)aminofenilo (nombre de la IUPAC) (1284) + TX, laurato de 2-tiocianatoetilo (nombre de la IUPAC) (1433) + TX, 3-bromo-1-cloroprop-1-eno (nombre de la IUPAC) (917) + TX, dimetilcarbamato de 3-metil-1-fenilpirazol-5-ilo (nombre de la IUPAC) (1283) + TX, metilcarbamato de 4-metil(prop-2-inil)amino-3,5-xililo (nombre de la IUPAC) (1285) + TX, dimetilcarbamato de 5,5-dimetil-3-oxociclohex-1-enilo (nombre de la IUPAC) (1085) + TX, abamectina (1) + TX, acefato (2) + TX, acetamiprid (4) + TX, acetión (nombre alternativo) [CCN] + TX, acetoprol [CCN] + TX, acrinatrina (9) + TX, acrilonitrilo (nombre de la IUPAC) (861) + TX, alanicarb (15) + TX, aldicarb (16) + TX, aldoxicarb (863) + TX, aldrina (864) + TX, aletrina (17) + TX, alosamidina (nombre alternativo) [CCN] + TX, alixicarb (866) + TX, alfa-cipermetrina (202) + TX, alfa-ecdisona (nombre alternativo) [CCN] + TX, fosfuro de aluminio (640) + TX, amiditió (870) + TX, amidotioato (872) + TX, aminocarb (873) + TX, amitón (875) + TX, hidrogenooxalato de amitón (875) + TX, amitraz (24) + TX, anabasina (877) + TX, atidatió (883) + TX, AVI 382 (código de compuesto) + TX, AZ 60541 (código de compuesto) + TX, azadiractina (nombre alternativo) (41) + TX, azametifós (42) + TX, azinfós-etilo (44) + TX, azinfós-metilo (45) + TX, azotoato (889) + TX, endotoxinas delta de *Bacillus thuringiensis* (nombre alternativo) (52) + TX, hexafluorosilicato de bario (nombre alternativo) [CCN] + TX, polisulfuro de bario (nombre de la IUPAC/Chemical Abstracts) (892) + TX, bartrina [CCN] + TX, Bayer 22/190 (código de desarrollo) (893) + TX, Bayer 22408 (código de desarrollo) (894) + TX, bendiocarb (58) + TX, benfurcarb (60) + TX, bensultap (66) + TX, beta-ciflutrina (194) + TX, beta-cipermetrina (203) + TX, bifentrina (76) + TX, bioaletrina (78) + TX, isómero S-ciclopentenílico de la bioaletrina (nombre alternativo) (79) + TX, bioetanometrina [CCN] + TX, biopermetrina (908) + TX, biorresmetrina (80) + TX, éter bis(2-cloroetilico) (nombre de la IUPAC) (909) + TX, bistriflurón (83) + TX, borax (86) + TX, brofenvalerato (nombre alternativo) + TX, bromfenvinfós (914) + TX, bromocicleno (918) + TX, bromo-DDT (nombre alternativo) [CCN] + TX, bromofós (920) + TX, bromofós-etilo (921) + TX, bufencarb (924) + TX, buprofenzina (99) + TX, butacarb (926) + TX, butatofós (927) + TX, butocarboxim (103) + TX, butonato (932) + TX, butoxicarboxim (104) + TX, butilpiridabeno (nombre alternativo) + TX, cadusafós (109) + TX,

arseniato de calcio [CCN] + TX, cianuro de calcio (444) + TX, polisulfuro de calcio (nombre de la IUPAC) (111) + TX, camfeclor (941) + TX, carbanolato (943) + TX, carbarilo (115) + TX, carbofurano (118) + TX, disulfuro de carbono (nombre de la IUPAC/Chemical Abstracts) (945) + TX, tetracloruro de carbono (nombre de la IUPAC) (946) + TX, carbofenotión (947) + TX, carbosulfán (119) + TX, cartap (123) + TX, clorhidrato de cartap (123) + TX, cevadina (nombre alternativo) (725) + TX, clorbicicleno (960) + TX, clordano (128) + TX, clordecona (963) + TX, clordimeform (964) + TX, clorhidrato de clordimeform (964) + TX, cloretoxifós (129) + TX, clorfenapir (130) + TX, clorfenvinfós (131) + TX, clorfluazurón (132) + TX, clormefós (136) + TX, cloroformo [CCN] + TX, cloropicrina (141) + TX, clorfoxim (989) + TX, clorprazofós (990) + TX, clorpirifós (145) + TX, clorpirifós-metilo (146) + TX, clortiofós (994) + TX, cromafenozida (150) + TX, cinerina I (696) + TX, cinerina II (696) + TX, cinerinas (696) + TX, cis-resmetrina (nombre alternativo) + TX, cismetrina (80) + TX, clocitrina (nombre alternativo) + TX, cloetocarb (999) + TX, closantel (nombre alternativo) [CCN] + TX, clotianidina (165) + TX, acetoarsenito de cobre [CCN] + TX, arseniato de cobre [CCN] + TX, oleato de cobre [CCN] + TX, coumafós (174) + TX, coumitoato (1006) + TX, crotamitón (nombre alternativo) [CCN] + TX, crotoxifós (1010) + TX, crufomato (1011) + TX, criolito (nombre alternativo) (177) + TX, CS 708 (código de desarrollo) (1012) + TX, cianofenfós (1019) + TX, cianofós (184) + TX, ciantoato (1020) + TX, cicletrina [CCN] + TX, cicloprotrina (188) + TX, cicluftrina (193) + TX, cihalotrina (196) + TX, cipermetrina (201) + TX, cifenotrina (206) + TX, ciromazina (209) + TX, citioato (nombre alternativo) [CCN] + TX, *d*-limoneno (nombre alternativo) [CCN] + TX, *d*-tetrametrina (nombre alternativo) (788) + TX, DAEP (1031) + TX, dazomet (216) + TX, DDT (219) + TX, decarbofurano (1034) + TX, deltametrina (223) + TX, demefión (1037) + TX, demefión-O (1037) + TX, demefión-S (1037) + TX, demetón (1038) + TX, demetón-metilo (224) + TX, demetón-O (1038) + TX, demetón-O-metilo (224) + TX, demetón-S (1038) + TX, demetón-S-metilo (224) + TX, demetón-S-metilsulfona (1039) + TX, diafentiurón (226) + TX, dialifós (1042) + TX, diamidafós (1044) + TX, diazinona (227) + TX, dicaptón (1050) + TX, diclofentión (1051) + TX, diclorvos (236) + TX, diclifós (nombre alternativo) + TX, dicresilo (nombre alternativo) [CCN] + TX, dicrotofós (243) + TX, diciclanilo (244) + TX, dieldrina (1070) + TX, fosfato dietílico de 5-metilpirazol-3-ilo (nombre de la IUPAC) (1076) + TX, diflubenzurón (250) + TX, dilor (nombre alternativo) [CCN] + TX, dimeflutrina [CCN] + TX, dimefox (1081) + TX, dimetán (1085) + TX, dimetoato (262) + TX, dimetrina (1083) + TX, dimetilvinfós (265) + TX, dimetilán (1086) + TX, dinex (1089) + TX, dinex-diclexina (1089) + TX, dinoprop (1093) + TX, dinosam (1094) + TX, dinoseb (1095) + TX, dinotefurano (271) + TX, diofenolán (1099) + TX, dioxabenzofós (1100) + TX, dioxacarb (1101) + TX, dioxatión (1102) + TX, disulfotón (278) + TX, diticrofós (1108) + TX, DNOC (282) + TX, doramectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, DSP (1115) + TX, ecdisterona (nombre alternativo) [CCN] + TX, EI 1642 (código de desarrollo) (1118) + TX, emamectina (291) + TX, benzoato de emamectina (291) + TX, EMPC (1120) + TX, empentrina (292) + TX, endosulfano (294) + TX, endotión (1121) + TX, endrina (1122) + TX, EPBP (1123) + TX, EPN (297) + TX, epofenonano (1124) + TX, eprinomectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, esfenvalerato (302) + TX, etafós (nombre alternativo) [CCN] + TX, etiofencarb (308) + TX, etión (309) + TX, etiprol (310) + TX, etoato-metilo (1134) + TX, etopofós (312) + TX, formiato de etilo (nombre de la IUPAC) [CCN] + TX, etil-DDD (nombre alternativo) (1056) + TX, dibromuro de etileno (316) + TX, dicloruro de etileno (nombre químico) (1136) + TX, óxido de etileno [CCN] + TX, etofenprox (319) + TX, etrimfós (1142) + TX, EXD (1143) + TX, famfur (323) + TX, fenamifós (326) + TX, fenazaflor (1147) + TX, fenclorfós (1148) + TX, fenetacarb (1149) + TX, fenflutrina (1150) + TX, fenitrotión (335) + TX, fenobucarb (336) + TX, fenoxacrim (1153) + TX, fenoxicarb (340) + TX, fenpiritrina (1155) + TX, fenpropatrina (342) + TX, fenpirad (nombre alternativo) + TX, fensulfotión (1158) + TX, fentiión (346) + TX, fentiión-etilo [CCN] + TX, fenvalerato (349) + TX, fipronilo (354) + TX, flonicamid (358) + TX, flubendiamida (N.º de Registro CAS: 272451-65-7) + TX, flucofurón (1168) + TX, flucicloxurón (366) + TX, flucitratino (367) + TX, fluenetilo (1169) + TX, flufenerim [CCN] + TX, flufenoxurón (370) + TX, flufenprox (1171) + TX, flumetrina (372) + TX, flualinato (1184) + TX, FMC 1137 (código de desarrollo) (1185) + TX, fonofós (1191) + TX, formetanato (405) + TX, clorhidrato de formetanato (405) + TX, formotión (1192) + TX, formparanato (1193) + TX, fosmetilán (1194) + TX, fospirato (1195) + TX, fostiazato (408) + TX, fostietán (1196) + TX, furatiocarb (412) + TX, furetrina (1200) + TX, gamma-cihalotrina (197) + TX, gamma-HCH (430) + TX, guazatina (422) + TX, acetatos de guazatina (422) + TX, GY-81 (código de desarrollo) (423) + TX, halfenprox (424) + TX, halofenozida (425) + TX, HCH (430) + TX, HEOD (1070) + TX, heptaclor (1211) + TX, heptenofós (432) + TX, heterofós [CCN] + TX, hexaflumurón (439) + TX, HHDN (864) + TX, hidrametilnona (443) + TX, cianuro de hidrógeno (444) + TX, hidropreno (445) + TX, hiquincarb (1223) + TX, imidacloprid (458) + TX, imiprotrina (460) + TX, indoxacarb (465) + TX, yodometano (nombre de la IUPAC) (542) + TX, IPSP (1229) + TX, isazofós (1231) + TX, isobenzán (1232) + TX, isocarbofós (nombre alternativo) (473) + TX, isodrina (1235) + TX, isofenfós (1236) + TX, isolano (1237) + TX, isoprocarb (472) + TX, *O*-(metoxiaminotiofosforil)salicilato de isopropilo (nombre de la IUPAC) (473) + TX, isoprotilano (474) + TX, isotioato (1244) + TX, isoxatión (480) + TX, ivermectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, jasmolina I (696) + TX, jasmolina II (696) + TX, jodfenfós (1248) + TX, hormona juvenil I (nombre alternativo) [CCN] + TX, hormona juvenil II (nombre alternativo) [CCN] + TX, hormona juvenil III (nombre alternativo) [CCN] + TX, keleván (1249) + TX, kinopreno (484) + TX, lambda-cihalotrina (198) + TX, arseniato de plomo [CCN] + TX, lepimectina (CCN) + TX, leptofós (1250) + TX, lindano (430) + TX, lirimfós (1251) + TX, lufenurón (490) + TX, litidatión (1253) + TX, metilcarbamato de *m*-cumenilo (nombre de la IUPAC) (1014) + TX, fosfuro de magnesio (nombre de la IUPAC) (640) + TX, malatión (492) + TX, malonobeno (1254) + TX, mazidox (1255) + TX, mecarbam (502) + TX, mecarfón (1258) + TX, menazón (1260) + TX, mefosfolano (1261) + TX, cloruro mercurioso (513) + TX, mesulfenfós (1263) + TX, metaflumizona (CCN) + TX, metam (519) + TX, metam-potasio (nombre alternativo) (519) + TX, metam-sodio (519) + TX, metacrifós (1266) + TX, metamidofós (527) + TX, fluoruro de metanosulfonilo (nombre de la IUPAC/Chemical Abstracts) (1268) + TX, metidatión (529) + TX, metiocarb (530) + TX, metocrotofós (1273) + TX, metomil (531) + TX, metopreno (532) + TX, metoquina-butilo (1276) + TX, metotrina (nombre alternativo) (533) +

TX, metoxiclor (534) + TX, metoxifeno (535) + TX, bromuro de metilo (537) + TX, isotiocianato de metilo (543) + TX, metilcloroformo (nombre alternativo) [CCN] + TX, cloruro de metileno [CCN] + TX, metoflutrina [CCN] + TX, metolcarb (550) + TX, metoxadiazona (1288) + TX, mevinfós (556) + TX, mexacarbato (1290) + TX, milbemectina (557) + TX, oxima de milbemicina (nombre alternativo) [CCN] + TX, mipafox (1293) + TX, mirex (1294) + TX, monocrotófos (561) + TX, morfotión (1300) + TX, moxidectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, naftalofós (nombre alternativo) [CCN] + TX, naled (567) + TX, naftaleno (nombre de la IUPAC/Chemical Abstracts) (1303) + TX, NC-170 (código de desarrollo) (1306) + TX, NC-184 (código de compuesto) + TX, nicotina (578) + TX, sulfato de nicotina (578) + TX, nifluridida (1309) + TX, nitenpiram (579) + TX, nitiazina (1311) + TX, nitrilcarb (1313) + TX, complejo de nitrilcarb y cloruro de zinc 1:1 (1313) + TX, NNI-0101 (código de compuesto) + TX, NNI-0250 (código de compuesto) + TX, nornicotina (nombre tradicional) (1319) + TX, novalurón (585) + TX, noviflumurón (586) + TX, etilfosfonotioato de O-5-dicloro-4-iodofenilo y O-etilo (nombre de la IUPAC) (1057) + TX, fosforotioato de O,O-dietilo y O-4-metil-2-oxo-2H-cromen-7-ilo (nombre de la IUPAC) (1074) + TX, fosforotioato de O,O-dietilo y O-6-metil-2-propilpirimidin-4-ilo (nombre de la IUPAC) (1075) + TX, ditiopirofosfato de O,O,O',O'-tetrapropilo (nombre de la IUPAC) (1424) + TX, ácido oleico (nombre de la IUPAC) (593) + TX, ometoato (594) + TX, oxamilo (602) + TX, oxidemetón-metilo (609) + TX, oxideprofós (1324) + TX, oxidisulfotón (1325) + TX, pp'-DDT (219) + TX, para-diclorobenceno [CCN] + TX, paratión (615) + TX, paratión-metilo (616) + TX, penflurón (nombre alternativo) [CCN] + TX, pentaclorofenol (623) + TX, laurato de pentaclorofenilo (nombre de la IUPAC) (623) + TX, permetrina (626) + TX, aceites del petróleo (nombre alternativo) (628) + TX, PH 60-38 (código de desarrollo) (1328) + TX, fenkaptón (1330) + TX, fenotrina (630) + TX, fentoato (631) + TX, forato (636) + TX, fosalona (637) + TX, fosfolán (1338) + TX, fosmet (638) + TX, fosniclor (1339) + TX, fosfamidón (639) + TX, fosfina (nombre de la IUPAC) (640) + TX, foxim (642) + TX, foxim-metilo (1340) + TX, pirimetafós (1344) + TX, pirimicarb (651) + TX, pirimifós-etilo (1345) + TX, pirimifós-metilo (652) + TX, isómeros de policlorodociclopentadieno (nombre de la IUPAC) (1346) + TX, policloroterpenos (nombre tradicional) (1347) + TX, arsenito de potasio [CCN] + TX, tiocianato de potasio [CCN] + TX, praletrina (655) + TX, precoceno I (nombre alternativo) [CCN] + TX, precoceno II (nombre alternativo) [CCN] + TX, precoceno III (nombre alternativo) [CCN] + TX, primidofós (1349) + TX, profenofós (662) + TX, proflutrina [CCN] + TX, promacilo (1354) + TX, promecarb (1355) + TX, propafós (1356) + TX, propetamfós (673) + TX, propoxur (678) + TX, protidación (1360) + TX, protiofós (686) + TX, protoato (1362) + TX, protrifenbute [CCN] + TX, pimetrozina (688) + TX, piraclófós (689) + TX, pirazofós (693) + TX, piresmetrina (1367) + TX, piretrina I (696) + TX, piretrina II (696) + TX, piretrinas (696) + TX, piridabeno (699) + TX, piridalilo (700) + TX, piridafentión (701) + TX, pirimidifeno (706) + TX, pirimitato (1370) + TX, piriproxifeno (708) + TX, cuasia (nombre alternativo) [CCN] + TX, quinalfós (711) + TX, quinalfós-metilo (1376) + TX, quintión (1380) + TX, quintiofós (1381) + TX, R-1492 (código de desarrollo) (1382) + TX, rafxanida (nombre alternativo) [CCN] + TX, resmetrina (719) + TX, rotenona (722) + TX, RU 15525 (código de desarrollo) (723) + TX, RU 25475 (código de desarrollo) (1386) + TX, riania (nombre alternativo) (1387) + TX, rianodina (nombre tradicional) (1387) + TX, sabadilla (nombre alternativo) (725) + TX, escradán (1389) + TX, sebufós (nombre alternativo) + TX, selamectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, SI-0009 (código de compuesto) + TX, SI-0205 (código de compuesto) + TX, SI-0404 (código de compuesto) + TX, SI-0405 (código de compuesto) + TX, silafluofeno (728) + TX, SN 72129 (código de desarrollo) (1397) + TX, arsenito de sodio [CCN] + TX, cianuro de sodio (444) + TX, fluoruro de sodio (nombre de la IUPAC/Chemical Abstracts) (1399) + TX, hexafluorosilicato de sodio (1400) + TX, pentaclorofenóxido de sodio (623) + TX, selenato de sodio (nombre de la IUPAC) (1401) + TX, tiocianato de sodio [CCN] + TX, sofamida (1402) + TX, espinosad (737) + TX, espiromesifeno (739) + TX, espirotetramat (CCN) + TX, sulcofurón (746) + TX, sulcofurón-sodio (746) + TX, sulfluramida (750) + TX, sulfotep (753) + TX, fluoruro de sulfurilo (756) + TX, sulprofós (1408) + TX, aceites de alquitrán (nombre alternativo) (758) + TX, tau-fluvalinato (398) + TX, tazimcarb (1412) + TX, TDE (1414) + TX, tebufenozida (762) + TX, tebufenpirad (763) + TX, tebupirimfós (764) + TX, teflubenzurón (768) + TX, teflutrina (769) + TX, temefós (770) + TX, TEPP (1417) + TX, teraletrina (1418) + TX, terbam (nombre alternativo) + TX, terbufós (773) + TX, tetracloroetano [CCN] + TX, tetraclorvinfós (777) + TX, tetrametrina (787) + TX, theta-cipermetrina (204) + TX, tiacloprid (791) + TX, tifenox (nombre alternativo) + TX, tiametoxam (792) + TX, ticrofós (1428) + TX, tiocarboxima (1431) + TX, tiociclam (798) + TX, hidrógenooxalato de tiociclam (798) + TX, tiodicarb (799) + TX, tiofanox (800) + TX, tiometón (801) + TX, tionazina (1434) + TX, tiosultap (803) + TX, tiosultap-sodio (803) + TX, turingiensina (nombre alternativo) [CCN] + TX, tolfenpirad (809) + TX, tralometrina (812) + TX, transflutrina (813) + TX, transpermetrina (1440) + TX, triamifós (1441) + TX, triazamato (818) + TX, triazofós (820) + TX, triazurón (nombre alternativo) + TX, triclorfón (824) + TX, triclormetafós-3 (nombre alternativo) [CCN] + TX, tricloronat (1452) + TX, trifenofós (1455) + TX, triflumurón (835) + TX, trimetacarb (840) + TX, tripreno (1459) + TX, vamidotión (847) + TX, vaniliprol [CCN] + TX, veratridina (nombre alternativo) (725) + TX, veratrina (nombre alternativo) (725) + TX, XMC (853) + TX, xililcarb (854) + TX, YI-5302 (código de compuesto) + TX, zeta-cipermetrina (205) + TX, zetametrina (nombre alternativo) + TX, fosfuro de zinc (640) + TX, zolapofós (1469) y ZXI 8901 (código de desarrollo) (858) + TX, ciantraniliprol [736994-63-19] + TX, clorantraniliprol [500008-45-7] + TX, cienopirafeno [560121-52-0] + TX, ciflumetofeno [400882-07-7] + TX, pirifluquinazól [337458-27-2] + TX, espinetoram [187166-40-1 + 187166-15-0] + TX, espirotetramat [203313-25-1] + TX, sulfoxaflor [946578-00-3] + TX, flufiprol [704886-18-0] + TX, meperflutrina [915288-13-0] + TX, tetrametilflutrina [84937-88-2] + TX,

60 un moluscicida seleccionado del grupo de sustancias constituido por óxido de bis(tributilestaño) (nombre de la IUPAC) (913) + TX, bromoacetamida [CCN] + TX, arseniato de calcio [CCN] + TX, cloetocarb (999) + TX, acetoarsenito de cobre [CCN] + TX, sulfato de cobre (172) + TX, fentina (347) + TX, fosfato férrico (nombre de la IUPAC) (352) + TX, metaldehído (518) + TX, metiocarb (530) + TX, niclosamida (576) + TX, niclosamida-olamina

- (576) + TX, pentaclorofenol (623) + TX, pentaclorofenóxido de sodio (623) + TX, tazimcarb (1412) + TX, tiodicarb (799) + TX, óxido de tributilestaño (913) + TX, trifenmorf (1454) + TX, trimetacarb (840) + TX, acetato de trifenilestaño (nombre de la IUPAC) (347) e hidróxido de trifenilestaño (nombre de la IUPAC) (347) + TX, piriprol [394730-71-3] + TX,
- 5 un nematocida seleccionado del grupo de sustancias constituido por AKD-3088 (código de compuesto) + TX, 1,2-dibromo-3-cloropropano (nombre de la IUPAC/Chemical Abstracts) (1045) + TX, 1,2-dicloropropano (nombre de la IUPAC/Chemical Abstracts) (1062) + TX, 1,2-dicloropropano con 1,3-dicloropropeno (nombre de la IUPAC) (1063) + TX, 1,3-dicloropropeno (233) + TX, 1,1-dióxido de 3,4-diclorotetrahidrotifeno (nombre de la IUPAC/Chemical Abstracts) (1065) + TX, 3-(4-clorofenil)-5-metilrodanina (nombre de la IUPAC) (980) + TX, ácido 5-metil-6-tioxo-1,3,5-tiadiazinan-3-ilacético (nombre de la IUPAC) (1286) + TX, 6-isopentenilaminopurina (nombre alternativo) (210) + TX, abamectina (1) + TX, acetoprol [CCN] + TX, alanicarb (15) + TX, aldicarb (16) + TX, aldoxicarb (863) + TX, AZ 60541 (código de compuesto) + TX, benclotiaz [CCN] + TX, benomilo (62) + TX, butilpiridabeno (nombre alternativo) + TX, cadusafós (109) + TX, carbofurano (118) + TX, disulfuro de carbono (945) + TX, carbosulfán (119) + TX, cloropicrina (141) + TX, clorpirifós (145) + TX, cloetocarb (999) + TX, citocininas (nombre alternativo) (210) + TX, dazomet (216) + TX, DBCP (1045) + TX, DCIP (218) + TX, diamidafós (1044) + TX, diclofentión (1051) + TX, diclifós (nombre alternativo) + TX, dimetoato (262) + TX, doramectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, emamectina (291) + TX, benzoato de emamectina (291) + TX, eprinomectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, etoprofós (312) + TX, dibromuro de etileno (316) + TX, fenamifós (326) + TX, fenpirad (nombre alternativo) + TX, fensulfotión (1158) + TX, fostiazato (408) + TX, fostietán (1196) + TX, furfural (nombre alternativo) [CCN] + TX, GY-81 (código de desarrollo) (423) + TX, heterofós [CCN] + TX, yodometano (nombre de la IUPAC) (542) + TX, isamidofós (1230) + TX, isazofós (1231) + TX, ivermectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, kinetina (nombre alternativo) (210) + TX, mecarfón (1258) + TX, metam (519) + TX, metam-potasio (nombre alternativo) (519) + TX, metam-sodio (519) + TX, bromuro de metilo (537) + TX, isotiocianato de metilo (543) + TX, oxima de milbemicina (nombre alternativo) [CCN] + TX, moxidectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, composición de *Myrothecium verrucaria* (nombre alternativo) (565) + TX, NC-184 (código de compuesto) + TX, oxamilo (602) + TX, forato (636) + TX, fosfamidón (639) + TX, fosfocarb [CCN] + TX, sebufós (nombre alternativo) + TX, selamectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, espinosad (737) + TX, terbam (nombre alternativo) + TX, terbufós (773) + TX, tetraclorotiofeno (nombre de la IUPAC/ Chemical Abstracts) (1422) + TX, tiafenox (nombre alternativo) + TX, tionazina (1434) + TX, triazofós (820) + TX, triazurón (nombre alternativo) + TX, xilenoles [CCN] + TX, YI-5302 (código de compuesto) y zeatina (nombre alternativo) (210) + TX, fluensulfona [318290-98-1] + TX,
- un inhibidor de la nitrificación seleccionado del grupo de sustancias constituido por etilxantato potásico [CCN] y nitrapirina (580) + TX,
- un activador vegetal seleccionado del grupo de sustancias constituido por acibenzolar (6) + TX, acibenzolar-S-metilo (6) + TX, probenazol (658) y extracto de *Reynoutria sachalinensis* (nombre alternativo) (720) + TX,
- 35 un roenticida seleccionado del grupo de sustancias constituido por 2-isovalerilindan-1,3-diona (nombre de la IUPAC) (1246) + TX, 4-(quinoxalin-2-ilamino)benzenosulfonamida (nombre de la IUPAC) (748) + TX, alfa-clorohidrina [CCN] + TX, fosfuro de aluminio (640) + TX, antu (880) + TX, óxido arsenioso (882) + TX, carbonato de bario (891) + TX, bistiosemi (912) + TX, brodifacoum (89) + TX, bromadiolona (91) + TX, brometalina (92) + TX, cianuro de calcio (444) + TX, cloralose (127) + TX, clorofacinona (140) + TX, colecalciferol (nombre alternativo) (850) + TX, coumaclor (1004) + TX, coumafurilo (1005) + TX, coumatetralilo (175) + TX, crimidina (1009) + TX, difenacoum (246) + TX, difetialona (249) + TX, difacinona (273) + TX, ergocalciferol (301) + TX, flocoumafeno (357) + TX, fluoroacetamida (379) + TX, flupropadina (1183) + TX, clorhidrato de flupropadina (1183) + TX, gamma-HCH (430) + TX, HCH (430) + TX, cianuro de hidrógeno (444) + TX, yodometano (nombre de la IUPAC) (542) + TX, lindano (430) + TX, fosfuro de magnesio (nombre de la IUPAC) (640) + TX, bromuro de metilo (537) + TX, norbormida (1318) + TX, fosacetim (1336) + TX, fosfina (nombre de la IUPAC) (640) + TX, fósforo [CCN] + TX, pindona (1341) + TX, arsenito de potasio [CCN] + TX, pirinurón (1371) + TX, escilirosida (1390) + TX, arsenito de sodio [CCN] + TX, cianuro de sodio (444) + TX, fluoroacetato de sodio (735) + TX, estriquina (745) + TX, sulfato de talio [CCN] + TX, warfarina (851) y fosfuro de zinc (640) + TX,
- 50 un sinergista seleccionado del grupo de sustancias constituido por piperonilato de 2-(2-butoxi)etilo (nombre de la IUPAC) (934) + TX, 5-(1,3-benzodioxol-5-il)-3-hexilciclohex-2-enona (nombre de la IUPAC) (903) + TX, farnesol con nerolidol (nombre alternativo) (324) + TX, MB-599 (código de desarrollo) (498) + TX, MGK 264 (código de desarrollo) (296) + TX, butóxido de piperonilo (649) + TX, piprotal (1343) + TX, isómero de propilo (1358) + TX, S421 (código de desarrollo) (724) + TX, sesamex (1393) + TX, sesasmolina (1394) y sulfóxido (1406) + TX,
- 55 un repelente de animales seleccionado del grupo de sustancias constituido por antraquinona (32) + TX, cloralose (127) + TX, naftenato de cobre [CCN] + TX, oxiclورو de cobre (171) + TX, diazinona (227) + TX, dicitopentadieno (nombre químico) (1069) + TX, guazatina (422) + TX, acetatos de guazatina (422) + TX, metiocarb (530) + TX, piridin-4-amina (nombre de la IUPAC) (23) + TX, tiram (804) + TX, trimetacarb (840) + TX, naftenato de zinc [CCN] y ziram (856) + TX,
- un virucida seleccionado del grupo de sustancias constituido por imanina (nombre alternativo) [CCN] y ribavirina

(nombre alternativo) [CCN] + TX,

un protector de lesiones seleccionado del grupo de sustancias constituido por óxido de mercurio (512) + TX, octilina (590) y tiofanato-metilo (802) + TX,

5 y compuestos biológicamente activos seleccionados del grupo constituido por azaconazol [60207-31-0] + TX, bitertanol [70585-36-3] + TX, bromuconazol [116255-48-2] + TX, ciproconazol [94361-06-5] + TX, difenoconazol [119446-68-3] + TX, diniconazol [83657-24-3] + TX, epoxiconazol [106325-08-0] + TX, fenbuconazol [114369-43-6] + TX, fluquinconazol [136426-54-5] + TX, flusilazol [85509-19-9] + TX, flutriafol [76674-21-0] + TX, hexaconazol [79983-71-4] + TX, imazalilo [35554-44-0] + TX, imibenconazol [86598-92-7] + TX, ipconazol [125225-28-7] + TX, metconazol [125116-23-6] + TX, miclobutanilo [88671-89-0] + TX, pefurazoato [101903-30-4] + TX, penconazol [66246-88-6] + TX, protioconazol [178928-70-6] + TX, pirifenox [88283-41-4] + TX, procloraz [67747-09-5] + TX, propiconazol [60207-90-1] + TX, simeconazol [149508-90-7] + TX, tebuconazol [107534-96-3] + TX, tetraconazol [112281-77-3] + TX, triadimefón [43121-43-3] + TX, triadimenol [55219-65-3] + TX, triflumizol [99387-89-0] + TX, triticonazol [131983-72-7] + TX, ancimidol [12771-68-5] + TX, fenarimol [60168-88-9] + TX, nuarimol [63284-71-9] + TX, bupirimato [41483-43-6] + TX, dimetirimol [5221-53-4] + TX, etirimol [23947-60-6] + TX, dodemorf [1593-77-7] + TX, fenpropidina [67306-00-7] + TX, fenpropimorf [67564-91-4] + TX, espiroxamina [118134-30-8] + TX, tridemorf [81412-43-3] + TX, ciprodinilo [121552-61-2] + TX, mepanipirim [110235-47-7] + TX, pirimetanilo [53112-28-0] + TX, fenpiclonilo [74738-17-3] + TX, fludioxonilo [131341-86-1] + TX, benalaxilo [71626-11-4] + TX, furalaxilo [57646-30-7] + TX, metalaxilo [57837-19-1] + TX, R-metalaxilo [70630-17-0] + TX, ofurace [58810-48-3] + TX, oxadixilo [77732-09-3] + TX, benomilo [17804-35-2] + TX, carbendazim [10605-21-7] + TX, debacarb [62732-91-6] + TX, fuberidazol [3878-19-1] + TX, tiabendazol [148-79-8] + TX, clozolinato [84332-86-5] + TX, diclozolina [24201-58-9] + TX, iprodiona [36734-19-7] + TX, miclozolina [54864-61-8] + TX, procimidona [32809-16-8] + TX, vinclozolina [50471-44-8] + TX, boscalida [188425-85-6] + TX, carboxina [5234-68-4] + TX, fenfuram [24691-80-3] + TX, flutolanilo [66332-96-5] + TX, mepronilo [55814-41-0] + TX, oxicarboxina [5259-88-1] + TX, pentiopirad [183675-82-3] + TX, tifulzamida [130000-40-7] + TX, guazatina [108173-90-6] + TX, dodina [2439-10-3] [112-65-2] (base libre) + TX, iminoctadina [13516-27-3] + TX, azoxistrobina [131860-33-8] + TX, dimoxistrobina [149961-52-4] + TX, enestrobirina {Proc. BCPC, Int. Congr., Glasgow, 2003, 1, 93} + TX, fluoxastrobina [361377-29-9] + TX, kresoxim-metilo [143390-89-0] + TX, metominostrobin [133408-50-1] + TX, trifloxistrobina [141517-21-7] + TX, orisastrobina [248593-16-0] + TX, picoxistrobina [117428-22-5] + TX, piraclostrobina [175013-18-0] + TX, ferbam [14484-64-1] + TX, mancozeb [8018-01-7] + TX, maneb [12427-38-2] + TX, metiram [9006-42-2] + TX, propineb [12071-83-9] + TX, tiram [137-26-8] + TX, zineb [12122-67-7] + TX, ziram [137-30-4] + TX, captafol [2425-06-1] + TX, captán [133-06-2] + TX, diclofluanid [1085-98-9] + TX, fluoroimida [41205-21-4] + TX, folpet [133-07-3] + TX, toliifluanid [731-27-1] + TX, caldo bordelés [8011-63-0] + TX, hidróxido de cobre [20427-59-2] + TX, oxiclورو de cobre [1332-40-7] + TX, sulfato de cobre [7758-98-7] + TX, óxido de cobre [1317-39-1] + TX, mancobre [53988-93-5] + TX, oxina-cobre [10380-28-6] + TX, dinocap [131-72-6] + TX, nitrotal-isopropilo [10552-74-6] + TX, edifenfós [17109-49-8] + TX, iprobenfós [26087-47-8] + TX, isoprotiolano [50512-35-1] + TX, fosdifeno [36519-00-3] + TX, pirazofós [13457-18-6] + TX, tolclofós-metilo [57018-04-9] + TX, acibenzolar-S-metilo [135158-54-2] + TX, anilazina [101-05-3] + TX, bentiaivalcarb [413615-35-7] + TX, blasticidina-S [2079-00-7] + TX, quinometionato [2439-01-2] + TX, cloroneb [2675-77-6] + TX, clorotalonilo [1897-45-6] + TX, ciflufenamid [180409-60-3] + TX, cimoxanilo [57966-95-7] + TX, diclona [117-80-6] + TX, diclocimet [139920-32-4] + TX, diclomezina [62865-36-5] + TX, diclorán [99-30-9] + TX, dietofencarb [87130-20-9] + TX, dimetomorf [110488-70-5] + TX, SYP-LI90 (Flumorf) [211867-47-9] + TX, ditianón [3347-22-6] + TX, etaboxam [162650-77-3] + TX, etridiazol [2593-15-9] + TX, famoxadona [131807-57-3] + TX, fenamidona [161326-34-7] + TX, fenoxanilo [115852-48-7] + TX, fentina [668-34-8] + TX, ferimzóna [89269-64-7] + TX, fluazinam [79622-59-6] + TX, fluopicolida [239110-15-7] + TX, flusulfamida [106917-52-6] + TX, fenhexamid [126833-17-8] + TX, fosetil-aluminio [39148-24-8] + TX, himexazol [10004-44-1] + TX, iprovalicarb [140923-17-7] + TX, IKF-916 (Ciazofamid) [120116-88-3] + TX, kasugamicina [6980-18-3] + TX, metasulfocarb [66952-49-6] + TX, metrafenona [220899-03-6] + TX, pencicurón [66063-05-6] + TX, ftálica [27355-22-2] + TX, polioxinas [11113-80-7] + TX, probenazol [27605-76-1] + TX, propamocarb [25606-41-1] + TX, proquinazid [189278-12-4] + TX, piroquilon [57369-32-1] + TX, quinoxifeno [124495-18-7] + TX, quitozeno [82-68-8] + TX, azufre [7704-34-9] + TX, tiadinilo [223580-51-6] + TX, triazóxido [72459-58-6] + TX, triciclazol [41814-78-2] + TX, triforina [26644-46-2] + TX, validamicina [37248-47-8] + TX, zoxamida (RH7281) [156052-68-5] + TX, mandipropamid [374726-62-2] + TX, isopirazam [881685-58-1] + TX, sedaxano [874967-67-6] + TX, (9-diclorometileno-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il)amida del ácido 3-difluorometil-1-metil-1*H*-pirazole-4-carboxílico (descrito en WO 2007/048556) + TX, [2-(2,4-diclorofenil)-2-metoxi-1-metiletil]amida del ácido 3-difluorometil-1-metil-1*H*-pirazol-4-carboxílico (descrita en WO 2008/148570) + TX, 1-[4-[4-[(5*S*)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)-1*H*-pirazol-1-il]etanona + TX, 1-[4-[4-[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)-1*H*-pirazol-1-il]etanona [1003318-67-9], ambas descritas en WO 2010/123791, WO 2008/013925, WO 2008/013622 y WO 2011/051243 página 20) + TX y (3',4',5'-trifluorobifenil-2-il)amida del ácido 3-difluorometil-1-metil-1*H*-pirazol-4-carboxílico (descrita en WO 2006/087343) + TX.

Las referencias entre corchetes tras los principios activos, p. ej. [3878-19-1], se refieren al número de registro del Chemical Abstracts. Los componentes de las mezclas descritos anteriormente son conocidas. Cuando los principios activos están incluidos en "The Pesticide Manual" [The Pesticide Manual - A World Compendium; decimotercera edición; Editor: C. D. S. Tomlin; Consejo Británico de Protección de los Cultivos], se describen en este con el número

de entrada que se indica entre paréntesis anteriormente en la presente para el compuesto particular, por ejemplo, el compuesto "abamectina" se describe con el número de entrada (1). Cuando se añade "[CCN]" anteriormente en la presente a un compuesto particular, el compuesto en cuestión está incluido en "Compendium of Pesticide Common Names", que se puede consultar en internet [A. Wood; Compendium of Pesticide Common Names, Copyright © 1995-2004], por ejemplo, el compuesto "acetoprol" se describe en la dirección de internet <http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html>.

Se hace referencia a la mayoría de los principios activos descritos anteriormente en la presente mediante el denominado "nombre común", utilizándose el "nombre común ISO" u otro "nombre común" relevante en casos individuales. Si la denominación no es un "nombre común", la naturaleza de la denominación empleada en su lugar se indica entre paréntesis para el compuesto particular; en ese caso, se emplea el nombre de la IUPAC, el nombre de la IUPAC/Chemical Abstracts, un "nombre químico", un "nombre tradicional", un "nombre de compuesto" o un "código de desarrollo" o, si no se emplea ninguna de estas denominaciones ni ningún "nombre común", se empleará un "nombre alternativo". "N.º de Registro CAS" significa "número de registro del Chemical Abstracts".

La proporción másica de dos ingredientes cualquiera en cada combinación se selecciona para proporcionar, por ejemplo, la acción sinérgica deseada. En general, la proporción másica variaría dependiendo del ingrediente específico y de cuántos ingredientes estén presentes en la combinación. Generalmente, la proporción másica entre dos ingredientes cualquiera en cualquier combinación de la presente invención, independientemente de los demás, está comprendida entre 100:1 y 1:100, incluidas 99:1, 98:2, 97:3, 96:4, 95:5, 94:6, 93:7, 92:8, 91:9, 90:10, 89:11, 88:12, 87:13, 86:14, 85:15, 84:16, 83:17, 82:18, 81:19, 80:20, 79:21, 78:22, 77:23, 76:24, 75:25, 74:26, 73:27, 72:28, 71:29, 70:30, 69:31, 68:32, 67:33, 66:34, 65:45, 64:46, 63:47, 62:48, 61:49, 60:40, 59:41, 58:42, 57:43, 56:44, 55:45, 54:46, 53:47, 52:48, 51:49, 50:50, 49:51, 48:52, 47:53, 46:54, 45:55, 44:56, 43:57, 42:58, 41:59, 40:60, 39:61, 38:62, 37:63, 36:64, 35:65, 34:66, 33:67, 32:68, 31:69, 30:70, 29:71, 28:72, 27:73, 26:74, 25:75, 24:76, 23:77, 22:78, 21:79, 20:80, 19:81, 18:82, 17:83, 16:84, 15:85, 14:86, 13:87, 12:88, 11:89, 10:90, 9:91, 8:92, 7:93, 6:94, 5:95, 4:96, 3:97, 2:98, hasta 1:99. Las proporciones másicas preferidas entre dos componentes cualquiera de la presente invención están comprendidas entre 75:1 y 1:75, más preferentemente entre 50:1 y 1:50, especialmente entre 25:1 y 1:25, convenientemente entre 10:1 y 1:10, tal como entre 5:1 y 1:5, por ejemplo, entre 1:3 y 3:1. Se sobreentenderá que las proporciones de mezcla incluyen, por un lado, proporciones másicas y además, por otro lado, proporciones molares.

Los ejemplos de métodos de aplicación para los compuestos de la invención y composiciones de estos, es decir, los métodos para controlar plagas/hongos en la agricultura, son pulverización, atomización, espolvoreación, cepillado, revestimiento, dispersión o vertido - que deben seleccionarse para adecuarse a las circunstancias prevalentes.

Un método de aplicación preferido en la agricultura es la aplicación al follaje de las plantas (aplicación foliar), siendo posible seleccionar la frecuencia y tasa de aplicación para hacer coincidir el peligro de infestación con la plaga/hongos en cuestión. Como alternativa, el principio activo puede llegar a las plantas a través del sistema de raíces (acción sistémica), mediante aplicación del compuesto al emplazamiento de las plantas, por ejemplo, mediante la aplicación de una composición líquida del compuesto al suelo (mediante empapado) o mediante aplicación de una forma sólida del compuesto en forma de gránulos al suelo (aplicación en el suelo). En el caso de arrozales, dichos gránulos pueden introducirse en el campo de arroz inundado.

Las tasas de aplicación por hectárea típicas son generalmente de 1 a 2000 g de principio activo por hectárea, en particular de 10 a 1000 g/ha, preferentemente de 10 a 600 g/ha, tal como de 50 a 300 g/ha.

Los compuestos de la invención y las composiciones de estos también son adecuados para proteger el material de propagación vegetal, por ejemplo, semillas tales como frutas, tubérculos o granos, o plantas de vivero, contra las plagas del tipo mencionado anteriormente. El material de propagación se puede tratar con el compuesto antes de plantarlo, por ejemplo, se pueden tratar las semillas antes de sembrarlas. Como alternativa, el compuesto también se puede aplicar a los granos de las semillas (recubrimiento), ya sea empapando los granos en una composición líquida o aplicando una capa de una composición sólida. También es posible aplicar las composiciones cuando el material de propagación se planta en el sitio de aplicación, por ejemplo, en el surco para la semilla durante la perforación. Estos métodos de tratamiento para el material de propagación vegetal y el material de propagación vegetal tratado de este modo son otros aspectos de la invención. Las tasas de tratamiento típicas dependerán de la planta y la plaga/hongos que se deseen controlar y generalmente están comprendidas entre 1 y 200 gramos por 100 kg de semillas, preferentemente entre 5 y 150 gramos por 100 kg de semillas, tal como entre 10 y 100 gramos por 100 kg de semillas.

El término "semilla" abarca semillas y propágulos vegetales de todo tipo, incluidos, sin carácter limitante, semillas propiamente dichas, trozos de semillas, brotes nuevos, marlos, bulbos, frutos, tubérculos, granos, rizomas, esquejes, brotes cortados y similares, y en una realización preferida se refiere a semillas propiamente dichas.

La presente invención también comprende semillas recubiertas o tratadas con un compuesto de fórmula I o que lo contienen. La expresión "recubiertas o tratadas con y/o que contienen" generalmente significa que el principio activo se encuentra mayoritariamente en la superficie de las semillas en el momento de la aplicación, aunque una mayor o menor parte del principio puede penetrar en el material seminal, dependiendo del método de aplicación. Cuando dicho producto seminal se (re)planta, puede absorber el principio activo. En una realización, la presente invención

proporciona un material de propagación vegetal adherido a un compuesto de fórmula (I). Además, se proporciona en la presente una composición que comprende un material de propagación vegetal tratado con un compuesto de fórmula (I).

5 El tratamiento de las semillas comprende todas las técnicas de tratamiento de semillas conocidas en la técnica, tal como el revestimiento de semillas, recubrimiento de semillas, espolvoreo de semillas, remojo de semillas y granulado de semillas. La aplicación del compuesto fórmula I para el tratamiento de las semillas puede llevarse a cabo mediante cualquiera de los métodos conocidos, tales como pulverización o espolvoreo de las semillas antes de la siembra o durante la siembra/plantación de las semillas.

10 Las plantas diana adecuadas son, en particular, cereales tales como trigo, cebada, centeno, avena, arroz, maíz o sorgo; remolacha tal como remolacha azucarera o forrajera; fruta, por ejemplo, fruta pomácea, pomos o frutas del bosque, tal como manzanas, peras, ciruelas, duraznos, almendras, cerezas o bayas, por ejemplo, frutillas, frambuesas o moras; plantas leguminosas tales como porotos, lentejas, arvejas o soja; plantas oleaginosas tales como la colza oleaginosa, mostaza, amapolas, aceitunas, girasoles, coco, ricino, cacao o maníes; cucurbitáceas tales como calabazas, pepinos o melones; plantas de fibra tales como algodón, lino, cáñamo o yute; frutos cítricos tales como naranjas, limones, pomelos o tangerinas; hortalizas tales como espinaca, lechuga, espárrago, repollos, zanahorias, cebollas, tomates, papas o pimientos morrones; lauráceas tales como palta, canela o alcanfor; y también tabaco, nueces, café, berenjenas, caña de azúcar, té, pimienta, vid, lúpulos, la familia de los plátanos, plantas de látex y ornamentales (tales como flores y pastos gramíneos o césped).

20 En una realización, la planta se selecciona entre cereales, maíz, soja, arroz, caña de azúcar, hortalizas y plantas oleaginosas.

Se debe sobreentender que el término "planta" también incluye las plantas que se han transformado mediante el uso de técnicas de ADN recombinante, las cuales permiten sintetizar una o más toxinas que actúan selectivamente, según se conocen, por ejemplo, a partir de bacterias que producen toxinas, especialmente las del género *Bacillus*.

25 Las toxinas que pueden ser expresadas por estas plantas transgénicas incluyen, por ejemplo, proteínas insecticidas de *Bacillus cereus* o *Bacillus popilliae*; o proteínas insecticidas de *Bacillus thuringiensis* tales como δ -endotoxinas, p. ej., Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 o Cry9C, o proteínas insecticidas vegetativas (Vip), p. ej., Vip1, Vip2, Vip3 o Vip3A; o proteínas insecticidas de nematodos que colonizan bacterias, por ejemplo, *Photorhabdus* spp. o *Xenorhabdus* spp., tales como *Photorhabdus luminescens*, *Xenorhabdus nematophilus*; toxinas producidas por animales tales como toxinas de escorpiones, toxinas de arácnidos, toxinas de avispas y otras neurotoxinas específicas de insectos; toxinas producidas por hongos tales como toxinas de estreptomicetos, lectinas de plantas tales como lectinas de arvejas, lectinas de cebada o lectinas de la campanilla de invierno; aglutininas; inhibidores de proteinasas tales como inhibidores de la tripsina, inhibidores de la serina-proteasa, inhibidores de la patatina, cistatina, papaína; proteínas que desactivan ribosomas (RIP, por sus siglas en inglés) tales como ricina, RIP del maíz, abrina, lufina, saporina o briodina; enzimas que participan en el metabolismo de esteroides tales como 3-hidroxiesteroidoxidasas, ecdiesteroido-UDP-glicosiltransferasa, colesterol-oxidasas, inhibidores de la ecdisona, HMG-COA-reductasa, bloqueadores de los canales iónicos tales como los bloqueadores de los canales del sodio o el calcio, esterasa de la hormona juvenil, receptores de hormonas diuréticas, estilbeno-sintasa, bibencilo-sintasa, quitinasas y glucanasas.

40 En el contexto de la presente invención se deben sobreentender como δ -endotoxinas, por ejemplo, Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 o Cry9C, o proteínas insecticidas vegetativas (Vip), por ejemplo, Vip1, Vip2, Vip3 o Vip3A, expresamente también las toxinas híbridas, toxinas truncadas y toxinas modificadas. Las toxinas híbridas se producen por recombinación mediante una nueva combinación de diferentes dominios de estas proteínas (remítase, por ejemplo, a WO 02/15701). Existe constancia de toxinas truncadas, por ejemplo, una toxina Cry1Ab truncada. En el caso de las toxinas modificadas, se reemplaza uno o más aminoácidos de la toxina natural. En estas sustituciones de aminoácidos, preferentemente se insertan en la toxina secuencias de reconocimiento de proteasas artificiales, como, por ejemplo, en el caso de Cry3A055, se inserta una secuencia de reconocimiento de la catepsina G en una toxina Cry3A (remítase a WO 03/018810).

Se describen ejemplos de estas toxinas o plantas transgénicas capaces de sintetizar estas toxinas en, por ejemplo, EP-A-0 374 753, WO 93/07278, WO 95/34656, EP-A-0 427 529, EP-A-451 878 y WO 03/052073.

50 Los procesos para preparar estas plantas transgénicas son generalmente conocidos por los expertos en la técnica y se describen, por ejemplo, en las publicaciones mencionadas previamente. Los ácidos desoxirribonucleicos de tipo CryI y su preparación se describen, por ejemplo, en WO 95/34656, EP-A-0 367 474, EP-A-0 401 979 y WO 90/13651.

La toxina contenida en las plantas transgénicas les confiere tolerancia a insectos dañinos. Estos insectos pueden pertenecer a cualquier grupo taxonómico de insectos, pero suelen pertenecer especialmente al grupo de los escarabajos (coleópteros), insectos con dos alas (dípteros) y mariposas (lepidópteros).

55 Se conocen plantas transgénicas que contienen uno o más genes que codifican una resistencia insecticida y expresan una o más toxinas, y algunas de ellas se pueden adquirir de proveedores comerciales. Algunos ejemplos de estas

plantas son: YieldGard® (variedad del maíz que expresa una toxina Cry1Ab); YieldGard Rootworm® (variedad del maíz que expresa una toxina Cry3Bb1); YieldGard Plus® (variedad del maíz que expresa una toxina Cry1Ab y una toxina Cry3Bb1); Starlink® (variedad del maíz que expresa una toxina Cry9C); Herculex I® (variedad del maíz que expresa una toxina Cry1Fa2 y la enzima fosfinotricina-*N*-acetiltransferasa (PAT) para obtener tolerancia al herbicida glufosinato de amonio); NuCOTN 33B® (variedad del algodón que expresa una toxina Cry1Ac); Bollgard I® (variedad del algodón que expresa una toxina Cry1Ac); Bollgard II® (variedad del algodón que expresa una toxina Cry1Ac y una toxina Cry2Ab); VipCot® (variedad del algodón que expresa una toxina Vip3A y una toxina Cry1Ab); NewLeaf® (variedad de la papa que expresa una toxina Cry3A); NatureGard®, Agrisure® GT Advantage (rasgo tolerante al glifosato GA21), Agrisure® CB Advantage (rasgo del gusano barrenador del maíz (CB, por sus siglas en inglés) Bt11) y Protecta®.

Otros ejemplos de estas plantas transgénicas son:

1. **Maíz Bt11** de Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, Francia, número de registro C/FR/96/05/10. Consiste en *Zea mays* que se ha modificado genéticamente para que sea resistente al ataque del gusano barrenador del maíz europeo (*Ostrinia nubilalis* y *Sesamia nonagrioides*) mediante la expresión transgénica de una toxina Cry1Ab truncada. El maíz Bt11 también expresa transgénicamente la enzima PAT para obtener tolerancia al herbicida glufosinato de amonio.

2. **Maíz Bt176** de Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, Francia, número de registro C/FR/96/05/10. Consiste en *Zea mays* que se ha modificado genéticamente para que sea resistente al ataque del gusano barrenador del maíz europeo (*Ostrinia nubilalis* y *Sesamia nonagrioides*) mediante la expresión transgénica de una toxina Cry1Ab. El maíz Bt176 también expresa transgénicamente la enzima PAT para obtener tolerancia al herbicida glufosinato de amonio.

3. **Maíz MIR604** de Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, Francia, número de registro C/FR/96/05/10. Consiste en maíz que se ha modificado para que sea resistente a insectos mediante la expresión transgénica de una toxina Cry3A modificada. Esta toxina es Cry3A055 modificada mediante la inserción de una secuencia de reconocimiento de la proteasa catépsina G. La preparación de estas plantas de maíz transgénicas se describe en WO 03/018810.

4. **Maíz MON 863** de Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Bruselas, Bélgica, número de registro C/DE/02/9. MON 863 expresa una toxina Cry3Bb1 y presenta resistencia a ciertos insectos coleópteros.

5. **Algodón IPC 531** de Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Bruselas, Bélgica, número de registro C/ES/96/02.

6. **Maíz 1507** de Pioneer Overseas Corporation, Avenue Tedesco, 7 B-1160 Bruselas, Bélgica, número de registro C/NL/00/10. Consiste en maíz modificado genéticamente para que exprese la proteína Cry1F, con el fin de obtener resistencia a ciertos insectos lepidópteros, y para que exprese la proteína PAT, con el fin de obtener tolerancia al herbicida glufosinato de amonio.

7. **Maíz NK603 × MON 810** de Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Bruselas, Bélgica, número de registro C/GB/02/M3/03. Consiste en variedades de maíz híbridas cultivadas de forma selectiva con métodos convencionales mediante el cruce de las variedades modificadas genéticamente NK603 y MON 810. El maíz NK603 × MON 810 expresa transgénicamente la proteína CP4 EPSPS, obtenida de la cepa CP4 de *Agrobacterium sp.*, la cual confiere tolerancia al herbicida Roundup® (contiene glifosato), y también expresa una toxina Cry1Ab obtenida de *Bacillus thuringiensis subesp. kurstaki*, la cual proporciona tolerancia a ciertos lepidópteros, incluido el gusano barrenador europeo del maíz.

Generalmente, un compuesto de la presente invención se emplea en forma de una composición (por ejemplo, formulación) que contiene un portador. Un compuesto de la invención y composiciones de este se pueden emplear de distintas formas, tales como dispensador en aerosol, suspensión de cápsulas, concentrado para nebulización en frío, polvo espolvoreable, concentrado emulsionable, emulsión de aceite en agua, emulsión de agua en aceite, gránulo encapsulado, gránulo fino, concentrado fluido para el tratamiento de las semillas, gas (a presión), producto generador de gas, gránulo, concentrado para nebulización en caliente, macrogránulo, microgránulo, polvo dispersable en aceite, concentrado fluido miscible en aceite, líquido miscible en aceite, pasta, barritas cilíndricas para plantas, polvo para el tratamiento en seco de las semillas, revestimiento de las semillas con un pesticida, concentrado soluble, polvo soluble, solución para el tratamiento de las semillas, concentrado en suspensión (concentrado fluido), líquido de volumen ultrabajo (lvu), suspensión de volumen ultrabajo (lvu), gránulos o comprimidos dispersables en agua, polvo dispersable en agua para el tratamiento en suspensión, gránulos o comprimidos solubles en agua, polvo soluble en agua para el tratamiento de semillas y polvo humectable.

Una formulación típicamente comprende un portador líquido o sólido y opcionalmente uno o más auxiliares de

5 formulación habituales, que pueden ser auxiliares sólidos o líquidos, por ejemplo, aceites vegetales no epoxidados o epoxidados (por ejemplo, aceite de coco, aceite de colza o aceite de soja epoxidado), antiespumantes, por ejemplo, aceite de silicona, conservantes, arcillas, compuestos inorgánicos, reguladores de la viscosidad, tensioactivos, aglutinantes y/o adherentes. La composición también puede comprender un fertilizante, un donante de micronutrientes u otros preparados que influyan en el crecimiento de las plantas, así como una combinación que contenga el compuesto de la invención con uno o más agentes biológicamente activos adicionales, tales como bactericidas, fungicidas, nematocidas, activadores vegetales, acaricidas e insecticidas.

Por lo tanto, la presente invención también proporciona una composición que comprende un compuesto de la invención y un portador agronómico, y opcionalmente uno o más auxiliares de formulación habituales.

10 Las composiciones se preparan de forma conocida *per se*, en ausencia de auxiliares, por ejemplo, moliendo, tamizando y/o comprimiendo un compuesto sólido de la presente invención y, en presencia de al menos un auxiliar, por ejemplo, mezclando íntimamente y/o moliendo el compuesto de la presente invención con el auxiliar (o los auxiliares). En el caso de los compuestos sólidos de la invención, la molienda/trituración de los compuestos permite obtener un tamaño de partícula específico. Estos procesos para preparar las composiciones y el uso de los compuestos de la invención para preparar estas composiciones son también un aspecto de la invención.

15 Los ejemplos de composiciones para su uso en la agricultura son concentrados emulsionables, concentrados en suspensión, microemulsiones, productos dispersables en aceite, soluciones que se pueden rociar o diluir directamente, pastas untables, emulsiones diluidas, polvos solubles, polvos dispersables, polvos humectables, polvos, gránulos o encapsulaciones en sustancias poliméricas, que comprenden – al menos – un compuesto de acuerdo con la invención, y el tipo de composiciones se seleccionará de modo que se ajuste a los objetivos previstos y las circunstancias prevalentes.

20 Los ejemplos de portadores líquidos adecuados son hidrocarburos aromáticos no hidrogenados o parcialmente hidrogenados, preferentemente las fracciones de C₈ a C₁₂ de alquilbencenos, tales como mezclas de xileno, naftalenos alquilados o tetrahidronaftaleno, hidrocarburos alifáticos o cicloalifáticos, tales como parafinas o ciclohexano, alcoholes tales como etanol, propanol o butanol, glicoles y sus éteres y ésteres tales como propilenglicol, éter dipropilenglicólico, etilenglicol o éter etilenglicol monometílico o éter etilenglicol monoetilico, cetonas, tales como ciclohexanona, isoforona o alcohol diacetónico, disolventes polares fuertes, tales como *N*-metilpirrolid-2-ona, sulfóxido de dimetilo o *N,N*-dimetilformamida, agua, aceites vegetales no epoxidados o epoxidados, tales como aceites de colza, ricino, coco o soja y silicona no epoxidados o epoxidados.

25 Los ejemplos de portadores sólidos que se usan, por ejemplo, para polvos o polvos dispersables son, por regla general, minerales naturales molidos tales como calcita, talco, caolín, montmorillonita o atapulgita. Con el fin de mejorar las propiedades físicas también es posible añadir sílices altamente dispersadas o polímeros absorbentes altamente dispersados. Los portadores adsorbentes particulados adecuados para gránulos son de tipo poroso, tal como pumita, ladrillo roto, sepiolita o bentonita, y los materiales portadores no absorbentes adecuados son calcita o arena. Además, pueden utilizarse un gran número de materiales granulados de naturaleza inorgánica u orgánica, especialmente dolomita o residuos vegetales pulverizados.

30 Los compuestos tensioactivos adecuados son, dependiendo del tipo de principio activo que se desee formular, tensioactivos o mezclas de tensioactivos no iónicos, catiónicos y/o aniónicos que tienen buenas propiedades emulsionantes, dispersantes o humectantes. Los tensioactivos mencionados a continuación deben considerarse solamente como ejemplos; en la bibliografía relevante se describen un gran número de tensioactivos adicionales que comúnmente se utilizan en la técnica de formulación y que son adecuados de acuerdo con la invención.

35 Los tensioactivos no iónicos adecuados son, especialmente, derivados de tipo éter poliglicólico de alcoholes alifáticos o cicloalifáticos, de ácidos grasos saturados o insaturados, o de alquilfenoles que pueden contener de aproximadamente 3 a aproximadamente 30 grupos de tipo éter glicólico y de aproximadamente 8 a aproximadamente 20 átomos de carbono en el radical hidrocarburo (ciclo)alifático, o de aproximadamente 6 a aproximadamente 18 átomos de carbono en el resto alquilo de los alquilfenoles. También son adecuados los aductos de óxido de polietileno solubles en agua con polipropilenglicol, etilendiaminopolipropilenglicol o alquilpolipropilenglicol que contienen de 1 a aproximadamente 10 átomos de carbono en la cadena de tipo alquilo, y de aproximadamente 20 a aproximadamente 250 grupos de tipo éter etilenglicólico y de aproximadamente 10 a aproximadamente 100 grupos de tipo éter propilenglicólico. Normalmente, los compuestos mencionados anteriormente contienen de 1 a aproximadamente 5 unidades de etilenglicol por unidad de propilenglicol. Los ejemplos que pueden mencionarse son nonilfenoxipolietoxietanol, éter poliglicólico de aceite de ricino, aductos de polipropilenglicol/óxido de polietileno, tributifenoxipolietoxietanol, polietilenglicol u octilfenoxipolietoxietanol. También son adecuados los ésteres de ácidos grasos de sorbitán polioxi-etilenado, tales como trioleato de sorbitán polioxi-etilenado.

40 Los tensioactivos catiónicos son, especialmente, sales de amonio cuaternario que generalmente tienen al menos un radical alquilo de aproximadamente 8 a aproximadamente 22 átomos de C como sustituyentes y, como sustituyentes adicionales, radicales (no halogenados o halogenados) de tipo alquilo inferior o hidroxialquilo o bencilo. Las sales se presentan preferentemente en forma de haluros, metilsulfatos o etilsulfatos. Los ejemplos son cloruro de

esteariltrimetilamonio y bromuro de bencilbis(2-cloroetil)etilamonio.

Los ejemplos de tensioactivos aniónicos adecuados son jabones solubles en agua o compuestos tensioactivos sintéticos solubles en agua. Los ejemplos de jabones adecuados son las sales alcalinas, alcalinotérreas o amónicas (sustituidas o no sustituidas) de ácidos grasos que contienen de aproximadamente 10 a aproximadamente 22 átomos de C, tales como las sales sódicas o potásicas del ácido esteárico, oleico o de mezclas de ácidos grasos naturales que se obtienen, por ejemplo, a partir de aceite de coco o de pino; también deben mencionarse los tauratos metílicos del ácido graso. Sin embargo, se emplean más frecuentemente tensioactivos sintéticos, en particular sulfonatos grasos, sulfatos grasos, derivados de benzimidazol sulfonados o sulfonatos de alquilarilo. Por regla general, los sulfonatos grasos y sulfatos grasos están presentes como sales alcalinas, alcalinotérreas o amónicas (sustituidas o no sustituidas) y generalmente contienen un radical alquilo de aproximadamente 8 a aproximadamente 22 átomos de C, debiéndose sobreentender que alquilo también incluye el resto alquilo de radicales acilo; los ejemplos que pueden mencionarse son las sales sódicas o cálcicas del ácido lignosulfónico, del éster dodecilsulfúrico o de una mezcla de sulfatos de alcoholes grasos preparada a partir de ácidos grasos naturales. Este grupo también incluye las sales de los ésteres sulfúricos y ácidos sulfónicos de aductos de alcohol graso/óxido de etileno. Los derivados de benzimidazol sulfonados contienen preferentemente 2 grupos sulfonilo y un radical de tipo ácido graso de aproximadamente 8 a aproximadamente 22 átomos de C. Los ejemplos de alquilarilsulfonatos son las sales sódicas, cálcicas o trietanolamónicas del ácido dodecylbencenosulfónico, ácido dibutilnaftalenosulfónico, o de un condensado de ácido naftalenosulfónico y formaldehído. También son posibles fosfatos adecuados tales como sales del éster fosfórico de un aducto de óxido de *p*-nonilfenol/(4-14)etileno, o fosfolípidos.

Por regla general, las composiciones comprenden de un 0.1 a un 99%, especialmente de un 0.1 a un 95% de compuesto de acuerdo con la presente invención y de un 1 a un 99.9%, especialmente de un 5 a un 99.9% de al menos un portador sólido o líquido, siendo posible por regla general que de un 0 a un 25%, especialmente de un 0.1 a un 20% de la composición corresponda a tensioactivos (el % en cada caso significa porcentaje en peso). Si bien las composiciones concentradas tienden a ser preferidas para artículos comerciales, el usuario final, por regla general, emplea composiciones diluidas que básicamente tienen concentraciones más bajas del principio activo. Las composiciones preferidas tienen, en particular, las composiciones que se indican a continuación (% = porcentaje en peso):

Concentrados emulsionables:

principio activo: entre un 1 y un 95%, preferentemente entre un 5 y un 20%

tensioactivo: entre un 1 y un 30%, preferentemente entre un 10 y un 20%

disolvente: entre un 5 y un 98%, preferentemente entre un 70 y un 85%

Polvos:

principio activo: entre un 0.1 y un 10%, preferentemente entre un 0.1 y un 1%

portador sólido: entre un 99.9 y un 90%, preferentemente entre un 99.9 y un 99%

Concentrados en suspensión y concentrados fluidos:

principio activo: entre un 5 y un 75%, preferentemente entre un 10 y un 50%

agua: entre un 94 y un 24%, preferentemente entre un 88 y un 30%

tensioactivo: entre un 1 y un 40%, preferentemente entre un 2 y un 30%

Polvos humectables:

principio activo: entre un 0.5 y un 90%, preferentemente entre un 1 y un 80%

tensioactivo: entre un 0.5 y un 20%, preferentemente entre un 1 y un 15%

portador sólido: entre un 5 y un 99%, preferentemente entre un 15 y un 98%

Granulados:

principio activo: entre un 0.5 y un 30%, preferentemente entre un 3 y un 15%

portador sólido: entre un 99.5 y un 70%, preferentemente entre un 97 y un 85%

Ejemplos de formulación (% = porcentaje en peso):

Ejemplo F1: Concentrados en emulsión a) b) c)

ES 2 590 504 T3

	Principio activo		25%	40%	50%		
	Dodecibencenosulfonato de calcio	5%	8%	6%			
	Éter polietilenglicólico de aceite de ricino (36 mol de OE)		5 %	-	-		
5	Éter tributilfenoxipolietilenglicólico (30 mol de OE)				-	12%	4%
	Ciclohexanona				-	15%	20%
	Mezcla de xileno		65%	25%	20%		
10	Se pueden preparar emulsiones de cualquier concentración deseada a partir de estos concentrados diluyendo con agua.						
	<u>Ejemplo F2: Soluciones</u>		a)	b)	c)	d)	
	Principio activo		80%	10%	5%	95%	
	Éter etilenglicol monometílico		20%	-	-	-	
15	Polietilenglicol PM 400				-	70%	-
	N-Metilpirrolid-2-ona	-	20%	-	-		
	Aceite de coco epoxidado	-	-	1%	5%		
	Éter de petróleo (rango de ebullición: 160-190°)	-	-	94%	-		
20	Las soluciones son adecuadas para utilizarlas en forma de microgotas.						
	<u>Ejemplo F3: Gránulos</u>		a)	b)	c)	d)	
	Principio activo		5%	10%	8%	21%	
	Caolín			94%	-	79%	54%
25	Sílice altamente dispersada	1%	-	13%	7%		
	Atapulgita		-	90%	-	18%	
	El principio activo se disuelve en diclorometano, la solución se pulveriza sobre el portador o los portadores y el disolvente se evapora subsecuentemente al vacío.						
	<u>Ejemplo F4: Polvos</u>		a)	b)			
30	Principio activo		2%	5%			
	Sílice altamente dispersada	1%	5%				
	Talco			97%	-		
	Caolín			-	90%		
	Los polvos listos para usar se obtienen mediante la mezcla íntima de los portadores y el principio activo.						
35	<u>Ejemplo F5: Polvos humectables</u>		a)	b)	c)		
	Principio activo		25%	50%	75%		
	Lignosulfonato de sodio		5%	5%	-		

ES 2 590 504 T3

	Laurilsulfato de sodio	3%	-	5%	
	Diisobutilnaftalenosulfonato de sodio		-	6%	10%
5	Éter octilfenoxipolietilenglicólico (7-8 mol de OE)		-	2%	-
	Sílice altamente dispersada	5%	10%	10%	
	Caolín		62%	27%	-

10 El principio activo se mezcla con los aditivos y la mezcla se muele bien en un molino adecuado. Esto proporciona polvos humectables que pueden diluirse con agua para proporcionar suspensiones de cualquier concentración deseada.

Ejemplo F6: Gránulos extrusores

	Principio activo	10%
	Lignosulfonato de sodio	2%
	Carboximetilcelulosa	1%
15	Caolín	87%

El principio activo se mezcla con los aditivos y la mezcla se muele, se humedece con agua, se extruye, se granula y se seca en una corriente de aire.

Ejemplo F7: Gránulos recubiertos

	Principio activo	3%
20	Polietilenglicol (PM 200)	3%
	Caolín	94%

En una mezcladora, el principio activo finamente molido se aplica uniformemente al caolín, que se ha humedecido con el polietilenglicol. Esto proporciona gránulos recubiertos exentos de polvo.

Ejemplo F8: Concentrado en suspensión

25	Principio activo	40%
	Etilenglicol	10%
	Éter nonilfenoxipolietilenglicólico (15 mol de OE)	6%
	Lignosulfonato de sodio	10%
	Carboximetilcelulosa	1%
30	Solución acuosa de formaldehído al 37%	
	0.2%	
	Aceite de silicona (solución acuosa al 75%)	
	0.8%	
	Agua	32%

35 El principio activo finamente molido se mezcla íntimamente con los aditivos. Se pueden preparar suspensiones de cualquier concentración deseada a partir de este concentrado en suspensión resultante diluyendo con agua.

Ejemplo F9: Polvos para el tratamiento de semillas en seco

	principio activo	a)	b)	c)
		25%	50%	75%

aceite mineral ligero	5%	5%	5%
ácido silícico muy disperso	5%	5%	-
caolín	65%	40%	-
talco	-	-	20%

La combinación se mezcla debidamente con los adyuvantes y la mezcla se muele debidamente en un molino adecuado, para obtener polvos que se pueden emplear directamente en el tratamiento de semillas.

Ejemplo F10: Concentrado emulsionable

principio activo	10%
éter octilfenólico de polietilenglicol (4-5 mol de óxido de etileno)	3%
dodecibencenosulfonato de calcio	3%
éter poliglicólico de aceite de ricino (35 mol de óxido de etileno)	4%
ciclohexanona	30%
mezcla de xileno	50%

Las emulsiones de cualquier dilución requerida, que se pueden utilizar en la protección de plantas, se pueden obtener a partir de este concentrado por dilución con agua.

5 Ejemplo F11: Concentrado fluido para el tratamiento de semillas

principios activos	40%
propilenglicol	5%
copolímero de OE/OP en butanol	2%
triestirenofenol con 10-20 moles de OE	2%
1,2-bencisotiazolin-3-ona (en forma de una solución al 20% en agua)	0.5%
sal cálcica de pigmento monoazo	5%
aceite de silicona (en forma de una emulsión al 75% en agua)	0.2%
agua	45.3%

La combinación finamente molida se mezcla íntimamente con los adyuvantes, para obtener un concentrado en suspensión, a partir del cual se pueden obtener suspensiones de cualquier dilución deseada diluyéndolo con agua. Utilizando estas diluciones, se pueden tratar tanto plantas vivas como el material de propagación vegetal y se pueden proteger contra infestaciones de microorganismos mediante pulverización, vertido o inmersión.

10 Los ejemplos de los tipos de formulación foliar para las composiciones de premezcla son los siguientes:

GR: Gránulos

PH: polvos humectables

GD: gránulos dispersables en agua (polvos)

GS: gránulos solubles en agua

15 SL: concentrados solubles

CE: concentrados emulsionables

EAg: emulsiones de aceite en agua

ME: microemulsión

CS: concentrado en suspensión acuosa

20 SC: suspensión acuosa de cápsulas

DO: concentrado en suspensión a base de aceite, y

ES 2 590 504 T3

ES: suspoemulsión acuosa.

En cambio, los ejemplos de tipos de formulación para el tratamiento de semillas para las composiciones de premezcla son:

HS: polvos humectables para el tratamiento de semillas en suspensión

5 SS: solución para el tratamiento de semillas

ES: emulsiones para el tratamiento de semillas

FS: concentrado en suspensión para tratamiento de semillas

GD: gránulos dispersables en agua y

SC: suspensión acuosa de cápsulas.

10 Los ejemplos de los tipos de formulación adecuados para las composiciones de mezcla en tanque incluyen soluciones, emulsiones diluidas, suspensiones o una mezcla de estas, y polvos.

Al igual que con la naturaleza de las formulaciones, los métodos de la aplicación, tales como foliación, empapado, pulverización, atomización, espolvoreo, dispersión, revestimiento o vertido, se eligen de conformidad con los objetivos deseados y las circunstancias prevalentes.

15 Las composiciones de mezcla en tanque generalmente se preparan diluyendo con un disolvente (por ejemplo, agua) una o más de las composiciones de premezcla que contienen diferentes pesticidas y opcionalmente otros auxiliares.

Los portadores y adyuvantes adecuados pueden ser sólidos o líquidos y son las sustancias que se emplean habitualmente en la tecnología de formulación, p. ej., sustancias minerales naturales o regeneradas, disolventes, dispersantes, agentes humectantes, adherentes, espesantes, aglutinantes o fertilizantes.

20 Generalmente, una formulación de mezcla en tanque para la aplicación foliar o al suelo comprende de un 0.1 a un 20%, especialmente de un 0.1 a un 15% de los ingredientes deseados, y de un 99.9 a un 80%, especialmente de un 99.9 a un 85% de auxiliares sólidos o líquidos (incluido, por ejemplo, un disolvente tal como el agua), donde los auxiliares pueden ser un tensioactivo en una cantidad de un 0 a un 20%, especialmente de un 0.1 a un 15%, en función de la formulación de mezcla en tanque.

25 Una formulación típica de premezcla para la aplicación foliar comprende de un 0.1 a un 99.9%, especialmente de un 1 a un 95% de los ingredientes deseados y de un 99.9 a un 0.1%, especialmente de un 99 a un 5% de un adyuvante sólido o líquido (incluido, por ejemplo, un disolvente tal como el agua), donde los auxiliares pueden ser un tensioactivo en una cantidad de un 0 a un 50%, especialmente de un 0.5 a un 40%, en función de la formulación de premezcla.

30 Normalmente, una formulación típica de mezcla en tanque para una aplicación para el tratamiento de semillas comprende de un 0.25 a un 80%, especialmente de un 1 a un 75% de los ingredientes deseados y de un 99.75 a un 20%, especialmente de un 99 a un 25% de auxiliares sólidos o líquidos (incluido, por ejemplo, un disolvente tal como el agua), donde los auxiliares pueden ser un tensioactivo en una cantidad de un 0 a un 40%, especialmente de un 0.5 a un 30%, en función de la formulación de mezcla en tanque.

35 Normalmente, una formulación de premezcla para una aplicación para el tratamiento de semillas comprende de un 0.5 a un 99.9%, especialmente de un 1 a un 95% de los ingredientes deseados y de un 99.5 a un 0.1%, especialmente de un 99 a un 5% de un adyuvante sólido o líquido (incluido, por ejemplo, un disolvente tal como el agua), donde los auxiliares pueden ser un tensioactivo en una cantidad de un 0 a un 50%, especialmente de un 0.5 a un 40%, en función de la formulación de premezcla.

40 Aunque los productos comerciales se formulen preferentemente como concentrados (p. ej., composición de premezcla (formulación)), el usuario final normalmente empleará formulaciones diluidas (p. ej., composición de mezcla en tanque).

45 Las formulaciones de premezcla para el tratamiento de semillas preferidas son los concentrados en suspensión acuosa. La formulación puede aplicarse a las semillas utilizando técnicas y máquinas de tratamiento convencionales, tales como técnicas en lecho fluidizado, el método de trituración con rodillo, dispositivos para el tratamiento rotoestático de semillas y dispositivos para el recubrimiento en tambor. También pueden ser útiles otros métodos, tales como lechos con surtidores. Las semillas se pueden presurizar antes del recubrimiento. Después del recubrimiento, las semillas generalmente se secan y luego se transfieren a una máquina de medición del tamaño para seleccionar su tamaño. Este tipo de procedimientos se conocen en la técnica.

50 En general, las composiciones de premezcla de la invención contienen de un 0.5 a un 99.9 especialmente de un 1 a un 95, convenientemente de un 1 a un 50% en masa de los ingredientes deseados y de un 99.5 a un 0.1, especialmente

de un 99 a un 5% en masa de un adyuvante sólido o líquido (incluido, por ejemplo, un disolvente tal como el agua) donde los auxiliares (o adyuvantes) pueden ser un tensioactivo en una cantidad de un 0 a un 50, especialmente de un 0.5 a un 40% en masa, en función de la masa de la formulación de premezcla.

5 Un compuesto de fórmula (I) se encuentra, en una realización preferida independiente de cualquier otra realización, en forma de una composición para tratar (o proteger) un material de propagación vegetal, donde dicha composición protectora del material de propagación vegetal comprende además un agente colorante. La composición o mezcla protectora del material de propagación vegetal también puede comprender al menos un polímero seleccionado entre polímeros peliculígenos hidrosolubles e hidrodispersables que mejoren la adherencia de los principios activos al material de propagación vegetal tratado; dicho polímero generalmente tiene un peso molecular medio comprendido entre al menos 10 000 y aproximadamente 100 000.

Las combinaciones de la presente invención (es decir, aquellas que comprenden un compuesto de la presente invención y uno o más agentes activos biológicos adicionales) pueden aplicarse simultánea o secuencialmente.

15 En el caso en el que los ingredientes de una combinación se apliquen secuencialmente (es decir, uno después del otro), los ingredientes se aplican secuencialmente con un período razonable de separación entre ellos para lograr el efecto biológico, tal como algunas horas o días. El orden de aplicación de los ingredientes de la combinación, es decir, si los compuestos de fórmula (I) deberían aplicarse primero o no, no es esencial para llevar a cabo la presente invención.

20 En el caso en el que los ingredientes de las combinaciones se apliquen simultáneamente en la presente invención, estos pueden aplicarse como una composición que contiene la combinación, en cuyo caso (A) el compuesto de fórmula (I) y el o los ingredientes adicionales de las combinaciones pueden obtenerse de fuentes de formulación separadas y mezclarse (lo que se conoce como mezcla en tanque, lista para aplicar, caldo de pulverización o suspensión), o (B) el compuesto de fórmula (I) y el o los ingredientes adicionales pueden obtenerse como una única fuente de mezcla de formulación (conocida como premezcla, mezcla lista, concentrado o producto formulado).

25 En una realización, independiente de otras realizaciones, un compuesto de acuerdo con la presente invención se aplica como una combinación. Por lo tanto, la presente invención también proporciona una composición que comprende un compuesto de acuerdo con la invención tal como se describe en la presente y uno o más agentes activos biológicos adicionales y opcionalmente uno o más auxiliares de formulación habituales; que puede estar en forma de una composición de mezcla en tanque o premezcla.

30 Como alternativa a la propia acción sinérgica con respecto a la actividad biológica, las combinaciones de acuerdo con la invención también pueden tener sorprendentes propiedades convenientes que también pueden describirse, en un sentido más amplio, como actividad sinérgica. Algunos ejemplos de tales propiedades convenientes que se pueden mencionar son: un comportamiento conveniente durante la formulación y/o la aplicación, por ejemplo, durante la trituración, el tamizado, la emulsificación, disolución o dosificación; una mayor estabilidad de almacenamiento; una mayor estabilidad ante la luz; una degradabilidad más conveniente; un comportamiento toxicológico y/o ecotoxicológico mejorado; o cualquier otra ventaja conocida por un experto en la técnica.

Los compuestos de la presente invención se emplean preferentemente en la agricultura como un nematocida.

40 Los compuestos de la presente invención también pueden tener aplicación en otros campos, tales como uno o más de los siguientes: la protección de artículos almacenados y almacenes, la protección de materias primas (tales como madera y textiles), recubrimientos para pisos y edificios, y en la gestión de la higiene - especialmente la protección de humanos, animales domésticos y ganado productivo contra plagas. Por lo tanto, la invención también proporciona composiciones pesticidas para dichos usos y métodos para estos usos. La composición debería ser modificada para su uso en una aplicación en particular y un experto en la técnica será capaz de proporcionar dichas composiciones para cualquier uso particular.

45 En el sector de la higiene, las composiciones de acuerdo con la invención son activas contra ectoparásitos tales como garrapatas duras, garrapatas blandas, ácaros de la sarna, ácaros de las cosechas, moscas (masticadoras y chupadoras), larvas de moscas parasitarias, piojos, piojos de pelo, piojos de aves y pulgas.

Algunos ejemplos de dichos parásitos son:

- del orden de los anopluros: *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp. y *Phtirus* spp., *Solenopotes* spp.
- del orden de los malófagos: *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 de los subórdenes de los nematóceros y los braquíceros, 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., *Chrysomya* spp., *Wohlfahrtia* spp., *Sarcophaga* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Gasterophilus* spp., *Hippobosca* spp., *Lipoptena* spp. y *Melophagus* spp.

- del orden de los sifonápteros, por ejemplo, *Pulex* spp., *Ctenocephalides* spp., *Xenopsylla* spp., *Ceratophyllus* spp.

- del orden de los heterópteros, por ejemplo, *Cimex* spp., *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp.

5 - del orden de los blatarios, por ejemplo, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blattelagermanica* y *Supella* spp.

- de la subclase de los ácaros (acáridos) 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. y *Varroa* spp.

10 - de los órdenes de los actinédidos (*Prostigmata*) y ascarídidos (*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. y *Laminosioptes* spp.

15 Las composiciones de acuerdo con la invención son también adecuadas para la protección contra la infestación de insectos en el caso de materiales tales como madera, textiles, plásticos, adhesivos, pegamentos, pinturas, papel y cartulina, cuero, revestimientos de pisos y edificios. Las composiciones de acuerdo con la invención se pueden utilizar, por ejemplo, contra las siguientes plagas: escarabajos tales como *Hylotrupes bajulus*, *Chlorophorus pilosis*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinuspecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Ernobius mollis*, *Priobium carpini*, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*, *Lyctus planicollis*, *Lyctus linearis*, *Lyctus pubescens*, *Trogoxylon aequale*, *Minthesrugicollis*,
20 *Xyleborus* spec., *Tryptodendron* spec., *Apate monachus*, *Bostrychus capucins*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxylon* spec. y *Dinoderus minutus*, y también himenópteros tales como *Sirex juvencus*, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus* y *Urocerus augur*, y termitas tales como *Kaloterme flavicollis*, *Cryptotermes brevis*, *Heterotermes indicola*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes santonensis*, *Reticulitermes lucifugus*, *Mastotermes darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis* y *Coptotermes formosanus*, y tisanuros tales como *Lepisma saccharina*.

25 Los métodos de aplicación para aplicar un compuesto o una composición de este a artículos almacenados, almacenes, materias primas (tales como madera y textiles), recubrimientos para pisos y edificios, y en la gestión de la higiene son conocidos en la técnica.

30 La invención también proporciona compuestos (I) para su uso en un método para tratar, curar, controlar, prevenir y proteger animales de sangre caliente, incluidos los seres humanos y peces, contra la infestación e infección por helmintos, arácnidos y artrópodos endo- y ectoparasitarios que comprende administrar o aplicar por vía oral, tópica o parenteral a dichos animales una cantidad eficaz como antihelmítico, acaricida, o endo- o ectoparasiticida del compuesto de fórmula (I).

35 Las composiciones (I) para su uso en un método son particularmente útiles para controlar y prevenir infestaciones e infecciones por helmintos, nematodos, acáridos y artrópodos endo- o ectoparasitarios en animales de sangre caliente tales como ganado vacuno, ovejas, cerdos, camellos, ciervos, caballos, aves de corral, peces, conejos, cabras, visones, zorros, chinchillas, perros y gatos, así como seres humanos.

40 En el contexto del control y la prevención de infestación e infecciones en animales de sangre caliente, los compuestos de la invención son especialmente útiles para el control de helmintos y nematodos. Algunos ejemplos de helmintos son los integrantes de la clase *Trematoda*, comúnmente conocidos como trematodos o gusanos platelmintos, en particular los miembros de los géneros *Fasciola*, *Fascioloides*, *Paramphistomu*, *Dicrocoelium*, *Eurytrema*, *Ophisthorchis*, *Fasciolopsis*, *Echinostoma* y *Paragonimus*. Los nematodos que pueden controlarse con los compuestos de fórmula (I) incluyen los géneros *Haemonchus*, *Ostertagia*, *Cooperia*, *Oesphagastomu*, *Nematodirus*, *Dictyocaulus*, *Trichuris*, *Dirofilaria*, *Ancylostoma*, *Ascaris* y similares.

45 El compuesto de esta invención también puede controlar infestaciones de artrópodos endoparasitarios tales como larvas del ganado y estro del estómago. Además, las infestaciones por ácaros y artrópodos ectoparasitarios en animales de sangre caliente y peces, incluidos los piojos masticadores, piojos chupadores, estros, moscas masticadoras, moscas muscoides, moscas, larvas de moscas miasóticas, jejenes, mosquitos, pulgas, ácaros, garrapatas, estros nasales, falsas garrapatas y niguas, pueden ser controladas, prevenidas o eliminadas mediante los compuestos de la presente invención. Los piojos masticadores incluyen los miembros del orden de los malófagos tales como *Bovicola bovis*, *Trichodectes canis* y *Damilina ovis*. Los piojos chupadores incluyen los miembros del orden de los anopluros tales como *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus suis*, *Linognathus vituli* y *Solenopotes capillatus*. Las moscas picadoras incluyen los miembros del orden *Haematobia*. Las garrapatas incluyen *Boophilus*, *Rhipicephalus*, *Ixodes*, *Hyalomma*, *Amblyomma* y *Dermacentor*. Los compuestos de la invención también pueden usarse para controlar ácaros que son parásitos en mamíferos de sangre caliente y aves de corral, incluidos los ácaros
55 de los órdenes de los acariformes y parasitiformes.

5 Para la administración oral a animales de sangre caliente, los compuestos de la invención pueden formularse como piensos para animales, premezclas de pienso para animales, concentrados de pienso para animales, píldoras, soluciones, pastas, suspensiones, soluciones para la administración oral, geles, comprimidos, bolos y cápsulas. Además, los compuestos de la invención pueden administrarse a los animales en el agua que beben. Para la administración oral, la forma farmacéutica elegida debería proporcionar al animal entre aproximadamente 0.01 mg/kg y 100 g de compuesto de la invención/kg de peso corporal del animal al día.

10 Como alternativa, los compuestos de la invención pueden administrarse a los animales por vía parenteral, por ejemplo, mediante inyección intrarruminal, intramuscular, intravenosa o subcutánea. Los compuestos de la invención pueden dispersarse o disolverse en un portador fisiológicamente aceptable para la inyección subcutánea. Como alternativa, los compuestos de la invención pueden formularse en un implante para la administración subcutánea. Además, los compuestos de la invención pueden administrarse por vía transdérmica a los animales. Para la administración parenteral, la forma farmacéutica elegida debería proporcionar al animal entre aproximadamente 0.01 mg/kg y 100 g de compuesto de la invención/kg de peso corporal del animal al día.

15 Los compuestos de la invención también pueden aplicarse por vía tópica a los animales en forma de baños, polvos, collares, medallones, aerosoles y formulaciones de unción dorsal continua. Para la aplicación tópica, los baños y aerosoles normalmente contienen entre aproximadamente 0.5 ppm y 5000 ppm, y preferentemente entre aproximadamente 1 ppm y 3000 ppm del compuesto de la invención. Además, los compuestos de la invención pueden formularse como etiquetas para las orejas de los animales, en particular cuadrúpedos, tales como ganado vacuno y ovino.

20 Los compuestos de la invención también pueden emplearse combinados o junto con uno o más compuestos parasiticidas adicionales (para ampliar su espectro de acción) incluidos, sin carácter limitante, antihelmínticos tales como bencimidazoles, piperazina, levamisol, pirantel, praziquantel y similares; endectocidas tales como avermectinas, milbemicinas y similares; ectoparasiticidas tales como arilpirroles, organofosfatos, carbamatos, inhibidores del ácido gamabutírico incluidos fipronilo, piretroides, espinosads, imidacloprid y similares; reguladores del crecimiento de los insectos tales como piriproxifeno, ciromazina y similares; e inhibidores de la quitina-sintasa tales como benzoilureas, incluido el flufenoxurón.

30 Las composiciones parasiticidas de la presente invención incluyen una cantidad eficaz como parasiticida de un compuesto de la invención o combinaciones de este mezclada con uno o más portadores inertes, sólidos o líquidos fisiológicamente tolerables conocidos en la práctica medicinal veterinaria para la administración oral, percutánea y tópica. Estas composiciones pueden comprender otros aditivos tales como estabilizantes, antiespumantes, reguladores de la viscosidad, aglutinantes y adherentes, mientras que los productos comerciales se formularán preferentemente como concentrados. El usuario final normalmente empleará formulaciones diluidas.

35 Las composiciones de acuerdo con la presente invención también pueden emplearse para la preparación de una composición útil para tratar, es decir, curar o prevenir, enfermedades fúngicas humanas y animales tales como, por ejemplo, micosis, dermatosis, enfermedades provocadas por *Trichophyton* y candidiasis o enfermedades provocadas por *Aspergillus* spp., por ejemplo, *Aspergillus fumigatus*.

En una realización, independiente de otras realizaciones cualesquiera, un compuesto de fórmula (I) es un compuesto antihelmíntico.

40 En una realización, independiente de otras realizaciones cualesquiera, un compuesto de fórmula (I) es un compuesto pesticida, preferentemente un compuesto nematicida.

En cada aspecto y realización de la invención, "consiste esencialmente" y las inflexiones del término constituyen una realización preferida de "que comprende" y sus inflexiones, y "consiste en" y sus inflexiones constituyen una realización preferida de "que consiste esencialmente en" y sus inflexiones.

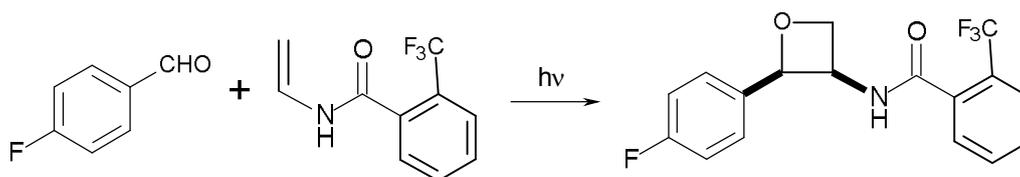
45 La divulgación de la presente solicitud proporciona cada una de las combinaciones de las realizaciones divulgadas en la presente.

Los siguientes Ejemplos sirven para ilustrar la invención, pero sin limitarla. Las temperaturas se proporcionan en grados Celsius; y las proporciones de las mezclas de disolventes se proporcionan en partes por volumen.

Ejemplos

Ejemplos de preparación:

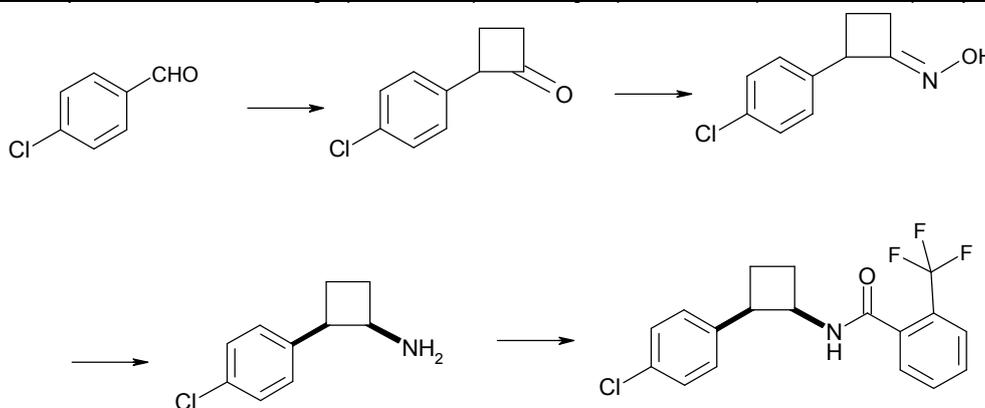
50 Ejemplo P1: Preparación de N-[cis-2-(4-clorofenil)oxetan-3-il]-2-(trifluorometil)benzamida (compuesto 57.010)



Se irradió una solución de 4-fluorobenzaldehído (288 mg, 2.32 mmol) y 2-trifluorometil-*N*-vinilbenzamida (ejemplo P8b) (1g, 4.65 mmol) en acetonitrilo (15 mL) con una lámpara de vapor de sodio a través de un filtro de cuarzo durante 7 días. La mezcla de reacción turbia se evaporó y el crudo medio sólido (1.6 g) se cromatografió en sílice con EtOAc/ciclohexano, a continuación otra vez más con MeOH/diclorometano y otra más con EtOAc/ciclohexano para obtener 43 mg (3%) de *N*-[cis-2-(4-clorofenil)oxetan-3-il]-2-(trifluorometil)benzamida.

$^1\text{H-RMN}$ (CDCl_3) 4.51 (1H, t); 5.17 (1H, t); 5.48 (1H, M); 5.71 (1H, d a); 6.08 (1H, d); 6.93 (1H, d); 7.12 (2H, t); 7.38 (2H, m); 7.47 (2H, m); 7.63 (1H, d).

Ejemplo P2: Preparación de cis *N*-[2-(4-clorofenil)ciclobutil]-2-(trifluorometil)benzamida (compuesto 57.006):



10

a. Preparación de 2-(4-clorofenil)ciclobutanona

A una solución agitada de 4-clorobenzaldehído (142 mg, 1 mmol) y tetrafluoroborato de ciclopropildifenilsulfonio (317 mg, 1 mmol) en 10 mL de THF anhidro, enfriada hasta 0 °C, se añadió gota a gota y con agitación una suspensión densa de *tert*-butóxido de potasio (1.4 mL, 1 M). Una vez finalizada la adición, la reacción se agitó 30 min y se añadió ácido tetrafluorobórico 1 M (10 mL, al 10% en THF). Se dejó que la muestra se calentara hasta temperatura ambiente y se añadió éter, y la solución etérea se lavó con NaHCO_3 saturado, salmuera y agua, y se secó. Tras filtrar y concentrar mediante evaporación rotatoria, se obtuvo un aceite. Se cromatografió en gel de sílice eluyendo con 5:1 de *i*-Hx:éter para obtener 2-(4-clorofenil)ciclobutanona como un aceite (180 mg, 83%).

15

$^1\text{H-RMN}$ (CDCl_3) 2.20 (1H, m); 2.57 (1H, m); 3.06 (1H, m); 3.23 (1H, m); 4.51 (1H, m); 7.20 (2H, m); 7.29 (3H, m);

20

b. Preparación de la oxima de 2-(4-clorofenil)ciclobutanona

Se calentó a reflujo una solución de 2-(4-clorofenil)ciclobutanona (1.122 g, 6.09 mmol), clorhidrato de hidroxilamina (3.541 g, 8.2 eq) y 36 mL de NaOH al 5% en 30 mL de EtOH durante 2 h. La solución se enfrió, el pH se ajustó a 6 y se extrajo con CHCl_3 . El extracto orgánico se lavó con salmuera y se secó. Tras filtrar y concentrar se obtuvo la oxima de 2-(4-clorofenil)ciclobutanona como un aceite (1 g, 84%).

25

$^1\text{H-RMN}$ (CDCl_3) 2.13 (1H, m); 2.53 (1H, m); 3.01 (2H, m); 4.40 (1H, m); 7.27 (5H, m);

c. Preparación de 2-(4-clorofenil)ciclobutanamina

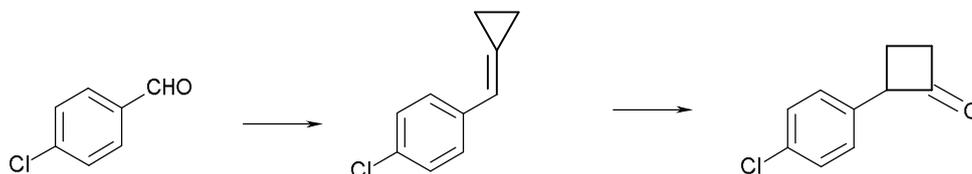
A una solución de la oxima de 2-(4-clorofenil)ciclobutanona (200 mg, 1 mmol) en metanol (5 mL) se añadieron MoO_3 (205 mg, 1.4 eq) y borohidruro sódico (394 mg, 10 eq) a 0 °C. Tras agitar a TA durante 2 h, se evaporó el disolvente. Se añadió una mezcla de H_2O y CH_2Cl_2 . Se separó la fase orgánica, se lavó con salmuera, se secó y se concentró al vacío. Se aislaron 120 mg del producto amínico como una mezcla 2:1 de los isómeros *cis* y *trans*. El producto crudo se empleó en la siguiente reacción sin purificar.

30

d. Preparación de *N*-[2-(4-clorofenil)ciclobutil]-2-(trifluorometil)benzamida: A una solución de 2-(4-clorofenil)ciclobutanamina (105 mg, 0.55 mmol) y trietilamina (140 mg, 2.5 eq) en THF se añadió cloruro de 2-trifluorometilbenzoilo (127.46 mg, 1.1 eq) a 0 °C. La mezcla de reacción se agitó a TA durante 2 h. El $\text{Et}_3\text{N}\cdot\text{HCl}$ se

eliminó por filtración y el THF se evaporó. El residuo (mezcla (2:1) de dos isómeros *cis* y *trans*) se purificó y se separó con cromatografía en gel de sílice eluyendo con 1:1 de i-Hx:éter dietílico (revelado con KMnO_4). Se aislaron *N*-[*cis*-2-(4-clorofenil)ciclobutil]-2-(trifluorometil)benzamida (*cis*) (33 mg, p.f. 147-9 °C) y su isómero *trans* (17 mg, p.f. 117-9 °C) como productos cristalinos.

5 Ejemplo P3: Preparación de 2-(4-clorofenil)ciclobutanona (alternativa)



10 a. Preparación de 1-cloro-4-(ciclopropilidenometil)benzeno A una suspensión de bromuro de (4-bromopropil)trifenilfosfonio (29.3 g) en THF anhidro (200 mL) se añadió *tert*-butóxido de potasio (14.19 g, 2.2 eq) en 5 porciones separadas en intervalos de 15 min para obtener una suspensión amarilla. La mezcla se calentó a reflujo durante 10 min y se añadió 4-diclorobenzaldehído (8.08 g, 56.9 mmol) para obtener una suspensión naranja. La mezcla de reacción se agitó y después se calentó a reflujo durante 4 h. Posteriormente, la mezcla de reacción se enfrió hasta temperatura ambiente y se filtró a través de un lecho de Celite. El disolvente se eliminó al vacío y el material crudo resultante (9 g) se sometió a cromatografía flash con isohexano como eluyente para obtener 1-cloro-4-(ciclopropilidenometil)benzeno (5 g, 53%).

15 $^1\text{H-RMN}$ (CDCl_3) 1.19 (2H, m); 1.41 (2H, m); 6.70 (1H, m); 7.27 (2H, m); 7.46 (2H, m).

b. Preparación de 2-(4-clorofenil)ciclobutanona

20 A una solución de 1-cloro-4-(ciclopropilidenometil)benzeno (5 g, 30 mmol) en CH_2Cl_2 (80 mL) se añadió el ácido *m*-cloroperbenzoico (5.3 g, 30 mmol) en 5 porciones separadas a 0 °C. Tras agitar a 0 °C durante 3 h, la mezcla de reacción se lavó con solución acuosa saturada de NaHCO_3 y salmuera, se secó con Na_2SO_4 y se concentró. Al producto crudo en CH_2Cl_2 (40 mL) se añadió HBF_4 al 10% (11.6 mL de HBF_4 al 48% y 46 mL de H_2O). Tras agitar a TA durante 17 h, la mezcla se extrajo con CH_2Cl_2 , se lavó con solución acuosa saturada de NaHCO_3 y salmuera. El disolvente se eliminó al vacío y el residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (con isohexano como eluyente y relevado con KMnO_4) para obtener 2-(4-clorofenil)ciclobutanona (3.470 g, 64%).

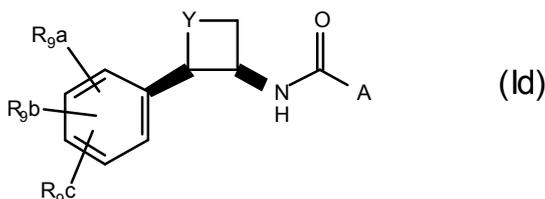
Tablas 57: Datos de caracterización

25 La Tabla 57 muestra los datos referentes a los puntos de fusión seleccionados, HPLC-MS seleccionado y RMN seleccionado para los compuestos de la presente invención. Se empleó CDCl_3 como disolvente para las mediciones de RMN, a menos que se indique lo contrario. No se intenta enumerar todos los datos de caracterización en todos los casos.

30 En la Tabla 57 y en toda la descripción que se indica a continuación, las temperaturas se presentan en grados Celsius; "RMN" significa espectro de resonancia magnética nuclear; HPLC es cromatografía líquida de alta resolución; MS significa espectro de masas; "%" es porcentaje en peso, a menos que las correspondientes concentraciones se indiquen en otras unidades. En toda esta descripción se han empleado las siguientes abreviaturas:

p.f. =	punto de fusión (°C)	p.eb. =	punto de ebullición
S =	singlete	a =	ancho
d =	doblete	dd =	doble doblete
t =	triplete	c =	cuadruplete
m =	multiplete	ppm =	partes por millón

La Tabla 57 siguiente es una lista de los compuestos característicos de fórmula Id. Esta representa la fórmula I, donde



Y es O o CH_2 , y R1, R2, R3, R4 y R5 son H.

ES 2 590 504 T3

Comp. n.º	Y	R9a,R9b, R9c*	A	p.f. [°C]	Tiempo de retención [min]	M+H ⁺
57.001	CH ₂	4-OCF ₃	A1	110 - 112		
57.002	CH ₂	4-OCF ₃	A9	120 - 123		
57.003	CH ₂	4-OCF ₃	A6	128 - 131		
57.004	O	4-Cl	A6			RMN
57.005	CH ₂	4-Cl	A1	138 - 140		
57.006	CH ₂	4-Cl	A6	147 - 149		
57.007	CH ₂	4-Cl	A5	149-150		
57.008	CH ₂	2,4-Cl ₂	A1	124-126		
57.009	CH ₂	2,4-Cl ₂	A6	126-128		
57.010	O	4-F	A6		1.7	340
57.011	CH ₂	2,4-Cl ₂	A5	157-159		RMN
57.012	CH ₂	2,4-Cl ₂	A10			RMN
57.013	CH ₂	4-Cl	A10			RMN
57.014	CH ₂	2-F,4-Cl	A1	126 - 129		
57.015	CH ₂	2-F,4-Cl	A6			RMN
57.016	CH ₂	4-OCHF ₂	A1		1.71	354
57.017	CH ₂	4-OCHF ₂	A6		1.78	386
57.018	CH ₂	4-Cl	A7	98 - 101		
57.019	CH ₂	4-Cl	A31	86 - 89		
57.020	CH ₂	4-Cl	A3	115 - 116		
57.021	CH ₂	4-Cl	A23	80 - 82		
57.022	CH ₂	4-Cl	A2	138 - 141		
57.023	CH ₂	4-Cl	A26	156 - 158		
57.024	CH ₂	4-Cl	A7	122 - 124		
57.025	CH ₂	2,4-Cl ₂	A3	109 - 111		
57.026	CH ₂	2,4-Cl ₂	A31	96 - 102		
57.027	CH ₂	2,4-Cl ₂	A7	124 - 128		
57.028	CH ₂	2,4-Cl ₂	A23	119 - 121		
57.029	CH ₂	2,4-Cl ₂	A2	92 - 94		
57.030	CH ₂	2,4-Cl ₂	A26	141 - 143		
57.031	CH ₂	2,4-Cl ₂	A4	82 - 84		
57.032	CH ₂	4-F	A1	134 - 135		

ES 2 590 504 T3

Comp. n.º	Y	R9a,R9b, R9c*	A	p.f. [°C]	Tiempo de retención [min]	M+H ⁺
57.033	CH ₂	4-F	A6	143 - 144		
57.034	CH ₂	4-Br	A1	137 - 138		
57.035	CH ₂	4-Br	A6	144 - 145		
57.036	no ensayado	4-F	A5	156 - 157		
57.037	CH ₂	4-Br	A5	139 - 140		
57.038	CH ₂	4-cPr	A5	157 - 158		
57.039	CH ₂	4-CN	A5	170 - 174		
57.040	CH ₂	4-F	A3	111 - 114		
57.041	CH ₂	4-F	A4	95 - 98		
57.042	CH ₂	4-F	A23	75 - 80		
57.043	CH ₂	4-F	A2	131 - 132		
57.044	CH ₂	4-F	A26	122 - 124		
57.045	CH ₂	4-Br	A2	167 - 169		
57.046	CH ₂	4-Br	A26	166 - 170		
57.047	O	2,4,6-F ₃	A6		0.89	376
57.048	O	4-OCHF ₂	A6	115 - 120		
57.049	O	4-CF ₃	A6	123 - 125		
57.050	O	2-F, 4-CF ₃	A6	99 - 108		
57.051	O	2,4-F ₂	A1	125 - 130		
57.052	O	2,4,6-F ₃	A1	130 - 136		
57.053	O	4-F	A1	95 - 101		
57.054	O	4-F	A5	107 - 127		
57.055	O	2,4-F ₂	A6	129 - 132		
57.056	O	2,4-F ₂	A5	131 - 134		
57.057	O	2,4,6-F ₃	A5	143 - 146		
57.058	CH ₂	2,4-F ₂	A6	106-108		
57.059	CH ₂	2,4-F ₂	A3	124-126		
57.060	CH ₂	2,4-F ₂	A5	146-147		
57.061	CH ₂	2,4-F ₂	A26	108-110		
57.062	CH ₂	2-Cl, 4-CF ₃	A6	131-133		
57.063	CH ₂	2-Cl, 4-CF ₃	A3	95-97		
57.064	CH ₂	2-Cl, 4-CF ₃	A5	137-139		

ES 2 590 504 T3

Comp. n.º	Y	R9a,R9b, R9c*	A	p.f. [°C]	Tiempo de retención [min]	M+H ⁺
57.065	CH2	2-Cl, 4-CF3	A26	112-114		
57.066	CH2	2-F, 4-CF3	A6	110-112		
57.067	CH2	2-F, 4-CF3	A3	109-111		
57.068	CH2	2-F, 4-CF3	A5	151-153		
57.069	CH2	2-F, 4-CF3	A26	152-154		
57.070	CH2	2,4-Cl2	A10		1.41	322.27
57.071	CH2	2,4-Cl2	A13		1.75	354.04
57.072	CH2	2,4-Cl2	A9		1.74	334.21
57.073	CH2	2,4-Cl2	A18		1.73	374.17
57.074	CH2	2,4-Cl2	A27		1.66	324.17
57.075	CH2	2,4-Cl2	A4		1.66	355.14
57.076	CH2	2,4-Cl2	A12		1.76	338.47
57.077	CH2	2,4-Cl2	A17		1.74	372.14
57.078	CH2	2,4-Cl2	A11		1.8	335.19
57.079	CH2	2,4-Cl2	A29		1.63	345.2
57.080	CH2	2,4-Cl2	A21		1.72	368.2
57.081	CH2	2,4-Cl2	A20		1.74	352.24
57.082	CH2	2,4-Cl2	A24		1.63	336.17
57.083	CH2	2,4-Cl2	A16		1.8	388.09
57.084	CH2	2,4-Cl2	A12		1.8	446.14
57.085	CH2	2,4-Cl2	A19		1.89	404.18
57.086	CH2	2,4-Cl2	A8		1.8	406.18
57.087	CH2	2,4-Cl2	A14		1.76	397.97
57.088	CH2	2,4-Cl2	A22		1.17	335.22
57.089	CH2	2,4-Cl2	A30		1.92	420.19
57.090	CH2	2,4-Cl2	A28		1.59	356.14
57.091	CH2	4-Cl	A10		1.29	288.32
57.092	CH2	4-Cl	A13		1.62	320.28
57.093	CH2	4-Cl	A9		1.63	300.16
57.094	CH2	4-Cl	A18		1.62	340.09
57.095	CH2	4-Cl	A27		1.55	290.23
57.096	CH2	4-Cl	A4		1.54	321.13

ES 2 590 504 T3

Comp. n.º	Y	R9a,R9b, R9c*	A	p.f. [°C]	Tiempo de retención [min]	M+H ⁺
57.097	CH2	4-Cl	A12		1.64	304.22
57.098	CH2	4-Cl	A17		1.63	338.45
57.099	CH2	4-Cl	A11		1.65	301.17
57.100	CH2	4-Cl	A29		1.45	310.98
57.101	CH2	4-Cl	A21		1.56	334.22
57.102	CH2	4-Cl	A20		1.63	318.18
57.103	CH2	4-Cl	A24		1.49	301.73
57.104	CH2	4-Cl	A16		1.69	354.18
57.105	CH2	4-Cl	A12		1.69	411.53
57.106	CH2	4-Cl	A19		1.78	370.22
57.107	CH2	4-Cl	A8		1.71	372.19
57.108	CH2	4-Cl	A14		1.64	364.26
57.109	CH2	4-Cl	A22		1.02	301.29
57.110	CH2	4-Cl	A30		1.83	386.28
57.111	CH2	4-Cl	A28		1.45	322.05

*cualquiera de los grupos R_{9a}, R_{9b} y R_{9c} es hidrógeno dependiendo de los sustituyentes definidos en cada fila

datos de +RMN:

57.011:

5 2.08 (1H, m); 2.37 (2H, m); 2.62 (1H, m); 4.26 (1H, m); 5.05 (1H, m); 5.42 (1H, m); 7.32 (2H, m); 7.41 (1H, s); 7.49 (1H, m); 7.65 (1H, m); 8.69 (1H, d).

57.012:

2.13 (1H, m); 2.39 (2H, m); 2.62 (1H, m); 4.28 (1H, m); 5.17 (1H, m); 7.33 (3H, m); 7.42 (1H, d); 7.75 (1H, d a); 8.76 (1H, d).

57.013:

10 2.18 (1H, m); 2.35 (2H, m); 2.62 (1H, m); 3.39 (1H, m); 5.07 (1H, m); 7.20 (2H, d); 7.27 (2H, d); 7.38 (1H, t); 7.75 (1H, d a); 8.75 (2H, d).

57.015:

2.11 (1H, m); 2.30 (2H, m); 2.61 (1H, m); 4.15 (1H, m); 5.02 (1H, m); 5.53 (1H, d a); 4.10 (1H, d); 7.10 (1H, m); 7.17 (2H, m); 7.27 (1H, m); 7.47 (2H, m); 7.61 (1H, d).

15 57.004:

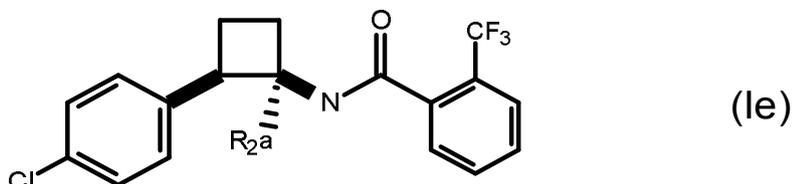
4.51 (1H, dd); 5.18 (1H, dd); 5.50 (1H, ddd); 5.69 (1H, d a); 6.08 (1H, d); 6.90 (1H, d); 7.35 – 7.77 (7H, m).

Método de HPLC-MS para 57.047 y 57.070-57.111

20 Los espectros se registraron en un espectrómetro de masas de Waters (espectrómetro de masas de cuadrupolo único SQD o ZQ) dotado de una fuente de electronebulización (polaridad: iones positivos o negativos, capilaridad: 3.00 kV, rango del cono: 30-60 V, extractor: 2.00 V, temperatura de la fuente: 150°C, temperatura de desolvatación: 350°C, flujo del gas del cono: 0 L/h, flujo de gas de desolvatación: 650 L/h, rango de masas: 100-900 Da) y un UPLC Acquity de Waters: Bomba binaria, compartimento térmico para la columna y detector de haz de diodos. Desgasificador de disolventes, bomba binaria, compartimento térmico para la columna y detector de haz de diodos. Columna: UPLC

HSS T3 de Waters, 1.8 mm, 30 x 2.1 mm, temp.: 60 °C, rango de longitudes de onda del DAD (nm): de 210 a 500, gradiente de disolventes: A = agua + 5% de MeOH + 0.05% de HCOOH; B= acetonitrilo + 05 % de HCOOH; gradiente: 0 min, 0% de B, 100% de A; 1.2-1.5 min, 100% de B; flujo (mL/min): 0.85.

5 La Tabla 58 siguiente es una lista de los compuestos característicos de fórmula Ie. Esta representa la fórmula I, donde B es 4-clorofenilo, A es A6, Y es CH₂, y R1, R3, R4 y R5 son H.



Comp. n.º	R2a	p.f. [°C]	Tiempo de retención [min]	M+H ⁺
58.001	-OMe	85 - 93		
58.002	-CN	130 - 136		

Método de LC-MS:

Espectrómetro de masas ACQUITY SQD de Waters (espectrómetro de masas de cuadrupolo único)

Método de ionización: electronebulización

10 Polaridad: iones positivos

Capilaridad (kV): 3.00, cono (V): 20.00, extractor (V): 3.00, temperatura de la fuente (°C): 150, temperatura de desolvatación (°C): 400, flujo de gas del cono (L/h): 60, flujo de gas de desolvatación (L/h): 700

Rango de masas: 100-800 Da

Rango de longitudes de onda del DAD (nm): 210-400

15 Método ACQUITY UPLC de Waters con las siguientes condiciones de gradiente para HPLC

(disolvente A: 9:1 de agua/metanol, 0.1% de ácido fórmico, y disolvente B: acetonitrilo, 0.1% de ácido fórmico)

Tiempo (minutos) A (%) B (%) Velocidad de flujo (mL/min)

0	100	0	0.75
2.5	0	100	0.75
20 2.8	0	100	0.75
3.0	100	0	0.75

Tipo de columna: ACQUITY UPLC HSS T3 de Waters; longitud de la columna: 30 mm; diámetro interno de la columna: 2.1 mm; tamaño de partícula: 1.8 micras; temperatura: 60 °C.

Ejemplos biológicos:

25 *Meloidogyne* spp. (nematodo nodulador de las raíces), actividad de contacto, prevención. Ensayo en bolsas.

Se colocaron papeles de filtro (9 cm x 4.5 cm) con una cavidad pequeña en bolsas de plástico (12 cm x 6 cm). Se colocó una semilla de pepino cv. *Toshka* en el centro de la cavidad del papel de filtro de todas las bolsas necesarias para un ensayo. Las semillas de pepino en las bolsas se trataron con soluciones de prueba con una concentración de 200 ppm pipeteando la solución directamente sobre las semillas de pepino en la cavidad del papel de filtro en la bolsa. Antes de la aplicación, se preparó la solución del compuesto con una concentración dos veces mayor que la requerida y la suspensión de huevos se prepara con solución de nutrientes FORL con 3000 huevos/ 0.5 mL. Después de aplicar todos los tratamientos, se pipetearon en las bolsas 3000 huevos (en 0.5 mL de solución de nutrientes FORL). Las bolsas se incubaron en una cámara humidificada durante doce días y se regaron regularmente para mantener una buena humedad en el papel de filtro que es esencial para el sistema radicular del pepino en crecimiento. Después de este período, el papel de filtro que contenía las plántulas de pepino germinadas se sacó de la bolsa de plástico para contar el número de agallas provocadas por *Meloidogyne* spp. en cada sistema radicular.

Los siguientes compuestos presentaron una reducción del agallamiento superior al 80% en comparación con el control sin tratar: 57.009, 57.010, 57.011, 57.017, 57.012, 57.015, 57.014, 57.006, 57.016, 57.018, 57.020, 57.021, 57.022, 57.023, 57.024, 57.025, 57.028, 57.029, 57.030, 57.031, 57.033, 57.035, 57.036, 57.037, 57.039, 57.047, 57.048, 57.051, 57.052, 57.054, 57.055, 57.056, 57.057.

5 *Meloidogyne* spp. (nematodo nodulador de las raíces), actividad de contacto, prevención, ensayo de empapado.

Se sembraron semillas de pepino cv. *Toshka* directamente en macetas llenas de un sustrato arenoso. Seis días después, cada una de las macetas se trató con 5 mL de una suspensión WP10 del compuesto de ensayo con una concentración de 20 ppm. A continuación, se inocularon 3000 huevos de *M. incognita* en las macetas. Se realizó una recolección del estudio catorce días después de la aplicación e inoculación del estudio. Se evaluó el agallamiento de las raíces de acuerdo con el índice de agallas de Zeck (Zeck, 1971).

Los siguientes compuestos presentaron una reducción del agallamiento superior al 80% en comparación con el control sin tratar: 57.001, 57.002, 57.003, 57.004, 57.005, 57.006, 57.007, 57.008, 57.010, 57.011, 57.014, 57.015, 57.016, 57.017, 57.018, 57.020, 57.021, 57.022, 57.023, 57.024, 57.025, 57.026, 57.028, 57.029, 57.031, 57.032, 57.033, 57.034, 57.035, 57.036, 57.037, 57.039, 57.040, 57.041, 57.042, 57.047, 57.048, 57.051, 57.052, 57.054, 57.055, 57.056, 57.057

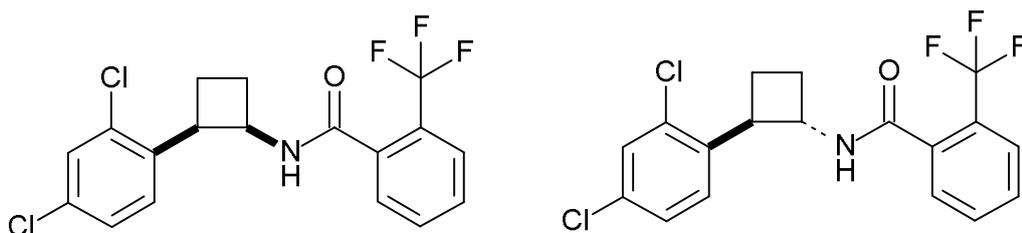
Heterodera schachtii

Se pipetea 0.5 mL de una solución acuosa del compuesto de ensayo (200 ppm o 20 ppm) en cada uno de los tres pocillos. Se añaden 0.5 mL de una suspensión de nematodos que contiene aproximadamente 200-500 larvas J2 de *Heterodera schachtii* a cada pocillo. Tras conservar los pocillos en la oscuridad a 25 °C durante 48 horas, se evalúa la movilidad de las larvas y se calcula el promedio de los tres pocillos.

Los nematodos presentaron una actividad comprendida entre un 0 y un 40% en los pocillos tratados con 20 ppm de los compuestos 57.033, 57.035, 57.036, 57.037, 57.040, 57.041, 57.043, 57.044, 57.055, 57.056, 57.057.

Los nematodos presentaron una actividad comprendida entre un 0 y un 40% en los pocillos tratados con 200 ppm de los compuestos 57.007, 57.008, 57.009, 57.010, 57.011, 57.017, 57.018, 57.020, 57.022, 57.023, 57.024, 57.025, 57.028, 57.029, 57.030, 57.031, 57.039, 57.047, 57.048.

A continuación, la Tabla 59 muestra la comparación de la actividad nematocida de los isómeros *cis*, que son los objetos de esta presente invención, con la de sus isómeros *trans* correspondientes. Los isómeros *trans* se obtuvieron utilizando el método P2 anterior y se separaron de sus isómeros *cis* tal como se describe en el método P2d. En la tabla se enumeran de acuerdo con sus isómeros *cis* con el sufijo "*trans*", tal como se muestra en este ejemplo de 57-009 y 57-009*trans*.



Compuesto 57-009

compuesto 57-009*trans*

isómero *cis*

isómero *trans*

Tabla 59

Comp. n.º	estereoquímica	Nem 1	Nem 2	p.f. [°C]	Tiempo de retención	M+H+
57.009	<i>cis</i>	100	ne			
57.009 <i>trans</i>	<i>trans</i>	68	48	147 - 148		
57.011	<i>cis</i>	100	100			
57.011 <i>trans</i>	<i>trans</i>	84	64		1.88	389
57.012	<i>cis</i>	98	83			

ES 2 590 504 T3

57.012 <i>trans</i>	<i>trans</i>	1	ne		1.71	322
57.014	<i>cis</i>	93	100			
57.014 <i>trans</i>	<i>trans</i>	69	13	117 - 119		

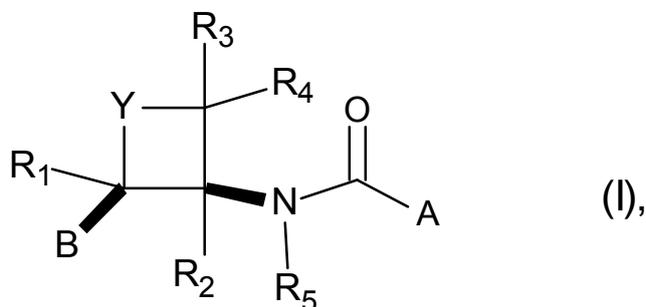
- Cribado biológico del Nem 1. *Meloidogyne* spp. (nematodo nodulador de las raíces), actividad de contacto, prevención. Ensayo en bolsas. Los valores se proporcionan en % de agallamiento.

- Cribado biológico del Nem 2. *Meloidogyne* spp. (nematodo nodulador de las raíces), actividad de contacto, prevención, ensayo de empapado. Los valores se proporcionan en % de agallamiento.

5 - ne significa "no evaluado".

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula (I)



donde

5 Y es O, C=O o CR₁₂R₁₃;

A es un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros que contiene de 1 a 3 heteroátomos, cada uno seleccionado independientemente entre oxígeno, nitrógeno y azufre, o un anillo fenílico; estando el anillo heteroaromático o el anillo fenílico opcionalmente sustituido con uno o más R₆;

10 R₆ es, independientemente de los demás, halógeno, ciano, alquilo C1-C4, haloalquilo C1-C4, alcoxi C1-C4, haloalcoxi C1-C4, haloalquiltio C1-C4, (alcoxi C1-C4)-(alquilo C1-C4) o (haloalcoxi C1-C4)-(alquilo C1-C4);

R₁, R₂, R₃, R₄, R₁₂ y R₁₃ son, independientemente unos de otros, hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C1-C4, alcoxi C1-C4 o haloalquilo C1-C4;

R₅ es hidrógeno, metoxi o hidroxilo,

B es fenilo sustituido con uno o más R₈,

15 R₈ es, independientemente de los demás, halógeno, ciano o un grupo -L-R₉, donde cada L es, independientemente de los demás, un enlace, -O-, -OC(O)-, -NR₇-, -NR₇CO-, -NR₇S(O)_n-, -S(O)_n-, -S(O)_nNR₇-, -COO- o CONR₇-,

n es 0, 1 o 2,

R₇ es hidrógeno, alquilo C1-C4, haloalquilo C1-C4, bencilo o fenilo, donde el bencilo y el fenilo no están sustituidos o están sustituidos con halógeno, ciano, alquilo C1-C4 o haloalquilo C1-C4,

20 R₉ es, independientemente de los demás, alquilo C1-C6, que no está sustituido o está sustituido con uno o más R₁₀, cicloalquilo C3-C6, que no está sustituido o está sustituido con uno o más R₁₀, bicicloalquilo C6-C14, que no está sustituido o está sustituido con uno o más R₁₀, alqueno C2-C6, que no está sustituido o está sustituido con uno o más R₁₀, alquino C2-C6, que no está sustituido o está sustituido con uno o más R₁₀, fenilo, que no está sustituido o está sustituido con uno o más R₁₀, o heteroarilo, que no está sustituido o está sustituido con uno o más R₁₀,

25 R₁₀ es, independientemente de los demás, halógeno, ciano, alquilo C1-C4, haloalquilo C1-C4, alcoxi C1-C4, haloalcoxi C1-C4, alquiltio C1-C4, haloalquiltio C1-C4, alquenoiloxi C3-C6 o alquinoiloxi C3-C6;

o una de sus sales o N-óxidos;

donde B y A-CO-NR₅ están en *cis* uno respecto del otro en el anillo de cuatro miembros, o un tautómero o isómero de estos compuestos.

30 2. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, donde Y es O o CH₂;

A es un anillo heteroaromático de 6 miembros que contiene de 1 a 2 átomos de nitrógeno, o un anillo fenílico; estando el anillo heteroaromático o el anillo fenílico opcionalmente sustituido con uno o más R₆;

R₆ es, independientemente de los demás, halógeno, ciano, alquilo C1-C4, haloalquilo C1-C4 o haloalcoxi C1-C4;

R₁, R₂, R₃, R₄ y R₅ son cada uno hidrógeno;

35 B es fenilo sustituido con uno o más R₈;

R8, independientemente de los demás, se selecciona entre halógeno, ciano, alquilo C1-C4, haloalquilo C1-C4, haloalcoxi C1-C4 o cicloalquilo C3-C6.

3. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o la reivindicación 2, donde A es un anillo heteroaromático de 6 miembros que contiene de 1 a 2 átomos de nitrógeno y que tiene de 1 a 3 sustituyentes seleccionados entre R6, o un anillo fenílico que tiene de 1 a 3 sustituyentes seleccionados entre R6.

4. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-3, donde B es un fenilo sustituido con de 1 a 3 sustituyentes R8.

5. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-4, donde B es un fenilo sustituido con de 1 a 3 sustituyentes, seleccionados independientemente entre fluoro, cloro, trifluorometilo, ciclopropilo, difluorometoxi y trifluorometoxi, A es un fenilo, piridilo o pirazinilo, dichos anillos, independientemente unos de otros, no están sustituidos o están sustituidos con de 1 a 3 sustituyentes, seleccionados independientemente entre cloro, bromo, fluoro, metilo, ciano y trifluorometilo, Y es O o CH₂, y R1, R2, R3, R4 y R5 son cada uno hidrógeno.

6. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-5, donde

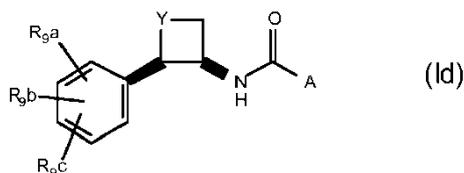
Y es CH₂;

B es un fenilo mono- o disustituido con halógeno;

A se selecciona entre fenilo, pirazinilo y piridilo, cada uno de los cuales está mono- o disustituido con sustituyentes seleccionados independientemente entre halógeno y haloalquilo C1-C4;

R1, R2, R3, R4 y R5 son cada uno hidrógeno.

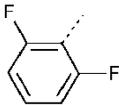
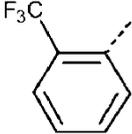
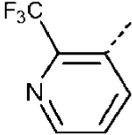
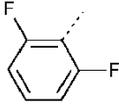
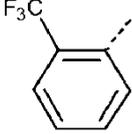
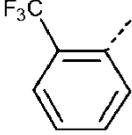
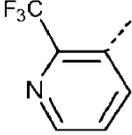
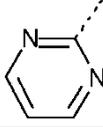
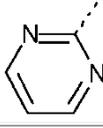
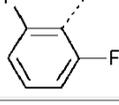
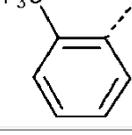
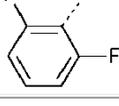
7. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, donde el compuesto se selecciona entre cualquiera de los compuestos 1-118 de fórmula (Id)

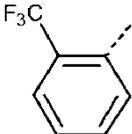
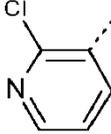
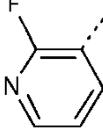
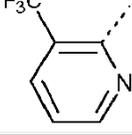
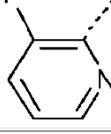
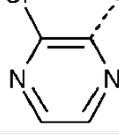
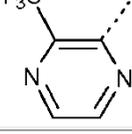
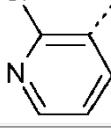
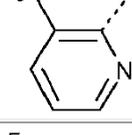
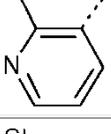
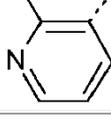


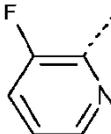
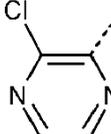
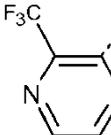
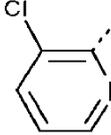
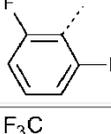
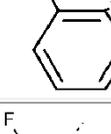
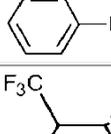
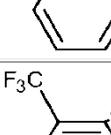
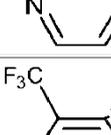
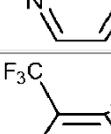
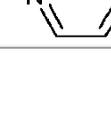
o una de sus sales o N-óxidos;

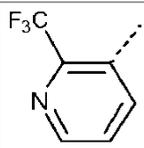
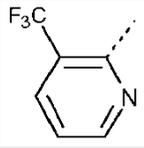
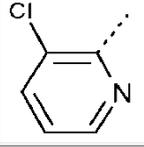
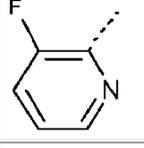
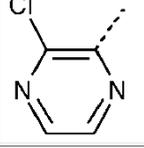
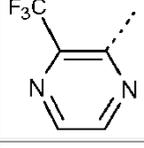
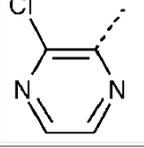
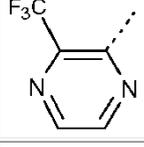
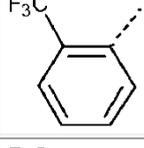
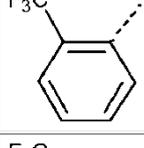
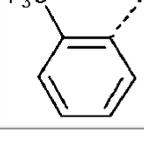
donde Y, R9a, R9b, R9c y A son como se definen en la siguiente tabla:

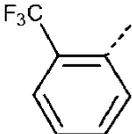
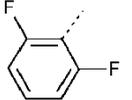
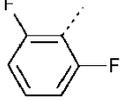
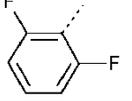
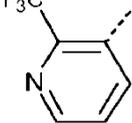
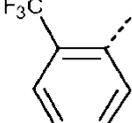
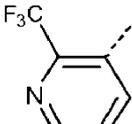
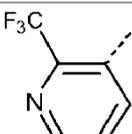
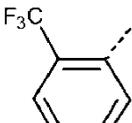
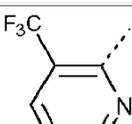
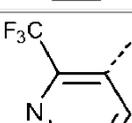
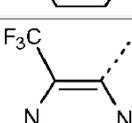
Compuesto N.º	Y	R9a,R9b, R9c*	A
1	CH ₂	4-OCF ₃	
2	CH ₂	4-OCF ₃	
3	CH ₂	4-OCF ₃	
4	O	4-Cl	

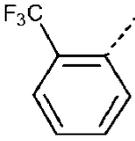
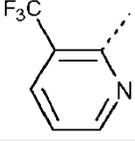
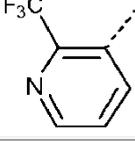
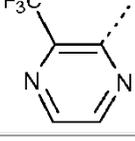
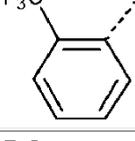
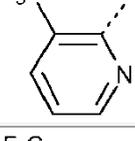
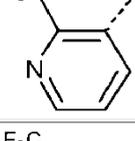
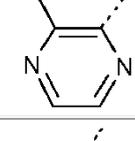
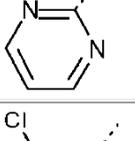
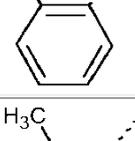
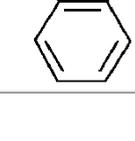
Compuesto N.º	Y	R9a,R9b, R9c*	A
5	CH ₂	4-Cl	
6	CH ₂	4-Cl	
7	CH ₂	4-Cl	
8	CH ₂	2,4-Cl2	
9	CH ₂	2,4-Cl2	
10	O	4-F	
11	CH ₂	2,4-Cl2	
12	CH ₂	2,4-Cl2	
13	CH ₂	4-Cl	
14	CH ₂	2-F,4-Cl	
15	CH ₂	2-F,4-Cl	
16	CH ₂	4-OCHF2	

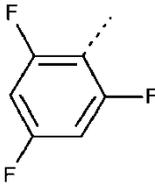
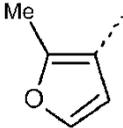
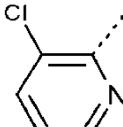
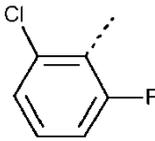
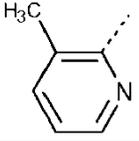
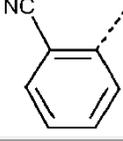
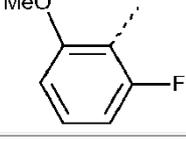
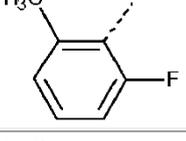
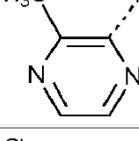
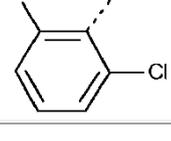
Compuesto N.º	Y	R9a,R9b, R9c*	A
17	CH ₂	4-OCHF ₂	
18	CH ₂	4-Cl	
19	CH ₂	4-Cl	
20	CH ₂	4-Cl	
21	CH ₂	4-Cl	
22	CH ₂	4-Cl	
23	CH ₂	4-Cl	
24	CH ₂	4-Cl	
25	CH ₂	2,4-Cl ₂	
26	CH ₂	2,4-Cl ₂	
27	CH ₂	2,4-Cl ₂	

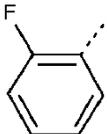
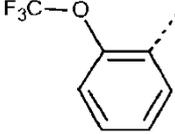
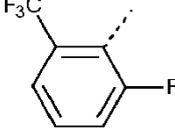
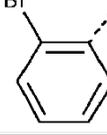
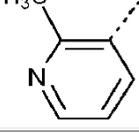
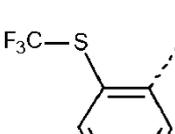
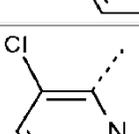
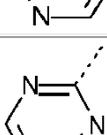
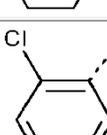
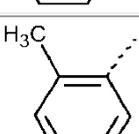
Compuesto N.º	Y	R9a,R9b, R9c*	A
28	CH ₂	2,4-Cl ₂	
29	CH ₂	2,4-Cl ₂	
30	CH ₂	2,4-Cl ₂	
31	CH ₂	2,4-Cl ₂	
32	CH ₂	4-F	
33	CH ₂	4-F	
34	CH ₂	4-Br	
35	CH ₂	4-Br	
36	no evaluado	4-F	
37	CH ₂	4-Br	
38	CH ₂	4-cPr	

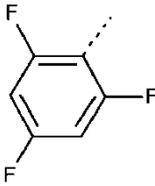
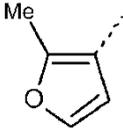
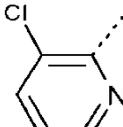
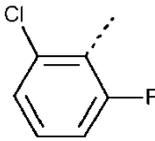
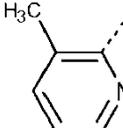
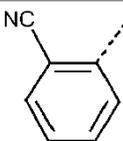
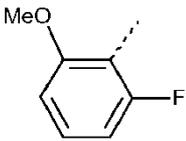
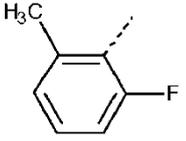
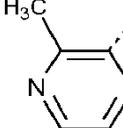
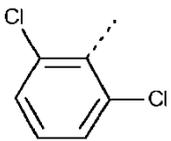
Compuesto N.º	Y	R9a,R9b, R9c*	A
39	CH ₂	4-CN	
40	CH ₂	4-F	
41	CH ₂	4-F	
42	CH ₂	4-F	
43	CH ₂	4-F	
44	CH ₂	4-F	
45	CH ₂	4-Br	
46	CH ₂	4-Br	
47	O	2,4,6-F ₃	
48	O	4-OCHF ₂	
49	O	4-CF ₃	

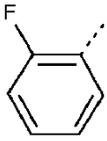
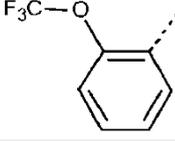
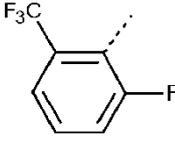
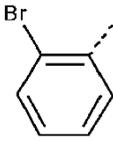
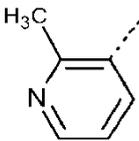
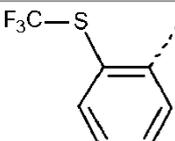
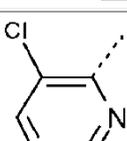
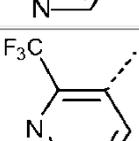
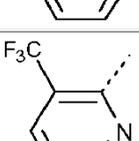
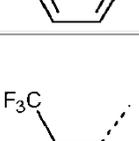
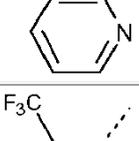
Compuesto N.º	Y	R9a,R9b, R9c*	A
50	O	2-F, 4-CF ₃	
51	O	2,4-F ₂	
52	O	2,4,6-F ₃	
53	O	4-F	
54	O	4-F	
55	O	2,4-F ₂	
56	O	2,4-F ₂	
57	O	2,4,6-F ₃	
58	CH ₂	2,4-F ₂	
59	CH ₂	2,4-F ₂	
60	CH ₂	2,4-F ₂	
61	CH ₂	2,4-F ₂	

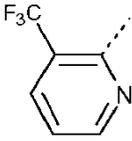
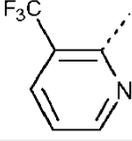
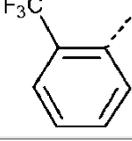
Compuesto N.º	Y	R9a,R9b, R9c*	A
62	CH2	2-Cl, 4-CF3	
63	CH2	2-Cl, 4-CF3	
64	CH2	2-Cl, 4-CF3	
65	CH2	2-Cl, 4-CF3	
66	CH2	2-F, 4-CF3	
67	CH2	2-F, 4-CF3	
68	CH2	2-F, 4-CF3	
69	CH2	2-F, 4-CF3	
70	CH2	2,4-Cl2	
71	CH2	2,4-Cl2	
72	CH2	2,4-Cl2	

Compuesto N.º	Y	R9a,R9b, R9c*	A
73	CH2	2,4-Cl2	
74	CH2	2,4-Cl2	
75	CH2	2,4-Cl2	
76	CH2	2,4-Cl2	
77	CH2	2,4-Cl2	
78	CH2	2,4-Cl2	
79	CH2	2,4-Cl2	
80	CH2	2,4-Cl2	
81	CH2	2,4-Cl2	
82	CH2	2,4-Cl2	
83	CH2	2,4-Cl2	

Compuesto N.º	Y	R9a,R9b, R9c*	A
84	CH2	2,4-Cl2	
85	CH2	2,4-Cl2	
86	CH2	2,4-Cl2	
87	CH2	2,4-Cl2	
88	CH2	2,4-Cl2	
89	CH2	2,4-Cl2	
90	CH2	2,4-Cl2	
91	CH2	4-Cl	
92	CH2	4-Cl	
93	CH2	4-Cl	

Compuesto N.º	Y	R9a,R9b, R9c*	A
94	CH2	4-Cl	
95	CH2	4-Cl	
96	CH2	4-Cl	
97	CH2	4-Cl	
98	CH2	4-Cl	
99	CH2	4-Cl	
100	CH2	4-Cl	
101	CH2	4-Cl	
102	CH2	4-Cl	
103	CH2	4-Cl	
104	CH2	4-Cl	

Compuesto N.º	Y	R9a,R9b, R9c*	A
105	CH2	4-Cl	
106	CH2	4-Cl	
107	CH2	4-Cl	
108	CH2	4-Cl	
109	CH2	4-Cl	
110	CH2	4-Cl	
111	CH2	4-Cl	
112	CH2	2-Cl, 4-F	
113	CH2	2-Cl, 4-F	
114	CH2	2-Cl, 4-Br	
115	CH2	2,4-F2	

Compuesto N.º	Y	R9a,R9b, R9c*	A
116	CH2	4-OCF3	
117	CH2	2-F, 4-Cl	
118	CH2	2-Cl, 4-F	

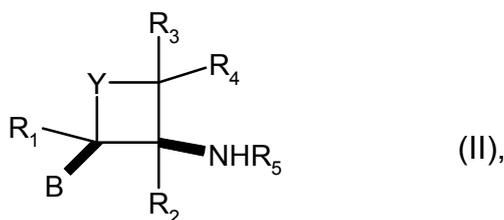
y donde cualquiera de los grupos R9a, R9b y R9c es hidrógeno a menos que se defina de otro modo; o un tautómero o estereoisómero de estos compuestos.

8. El compuesto, o una de sus sales o *N*- óxidos, de acuerdo con la reivindicación 1 seleccionado entre

N-[(1,2-*cis*)-2-(4-clorofenil)ciclobutil]-2-(trifluorometil)piridin-3-carboxamida;

- 5 *N*-[(1,2-*cis*)-2-(2,4-diclorofenil)ciclobutil]-2,6-difluorobenzamida;
N-[(1,2-*cis*)-2-(2,4-diclorofenil)ciclobutil]-2-(trifluorometil)benzamida;
N-[(1,2-*cis*)-2-(2,4-diclorofenil)ciclobutil]-2-(trifluorometil)piridin-3-carboxamida;
N-[(1,2-*cis*)-2-(2,4-difluorofenil)ciclobutil]-2-(trifluorometil)benzamida;
N-[(1,2-*cis*)-2-(2,4-difluorofenil)ciclobutil]-2-(trifluorometil)piridin-3-carboxamida;
- 10 *N*-[(1,2-*cis*)-2-(2,4-difluorofenil)ciclobutil]-3-(trifluorometil)pirazin-2-carboxamida;
N-[(1,2-*cis*)-2-[2-cloro-4-(trifluorometil)fenil]ciclobutil]-3-(trifluorometil)piridin-2-carboxamida;
N-[(1,2-*cis*)-2-[2-cloro-4-(trifluorometil)fenil]ciclobutil]-2-(trifluorometil)piridin-3-carboxamida;
N-[(1,2-*cis*)-2-[2-cloro-4-(trifluorometil)fenil]ciclobutil]-3-(trifluorometil)pirazin-2-carboxamida;
N-[(1,2-*cis*)-2-[2-fluoro-4-(trifluorometil)fenil]ciclobutil]-2-(trifluorometil)benzamida;
- 15 *N*-[(1,2-*cis*)-2-[2-fluoro-4-(trifluorometil)fenil]ciclobutil]-3-(trifluorometil)piridin-2-carboxamida;
N-[(1,2-*cis*)-2-[2-fluoro-4-(trifluorometil)fenil]ciclobutil]-2-(trifluorometil)piridin-3-carboxamida;
N-[(1,2-*cis*)-2-[2-fluoro-4-(trifluorometil)fenil]ciclobutil]-3-(trifluorometil)pirazin-2-carboxamida;
2-(trifluorometil)-*N*-[(2,3-*cis*)-2-(2,4,6-trifluorofenil)oxetan-3-il]benzamida;
2,6-difluoro-*N*-[(2,3-*cis*)-2-(2,4,6-trifluorofenil)oxetan-3-il]benzamida;
- 20 *N*-[(2,3-*cis*)-2-(2,4-difluorofenil)oxetan-3-il]-2-(trifluorometil)benzamida;
N-[(2,3-*cis*)-2-(2,4-difluorofenil)oxetan-3-il]-2-(trifluorometil)piridin-3-carboxamida;
3-cloro-*N*-[(1,2-*cis*)-2-(2,4-diclorofenil)ciclobutil]pirazin-2-carboxamida;
N-[(1,2-*cis*)-2-(2,4-diclorofenil)ciclobutil]-3-(trifluorometil)piridin-2-carboxamida;
3-cloro-*N*-[(1,2-*cis*)-2-(2,4-diclorofenil)ciclobutil]piridin-2-carboxamida;
- 25 *N*-[(1,2-*cis*)-2-(2,4-diclorofenil)ciclobutil]-2-metilpiridin-3-carboxamida;
N-[(1,2-*cis*)-2-(2,4-diclorofenil)ciclobutil]-3-metilpiridin-2-carboxamida;

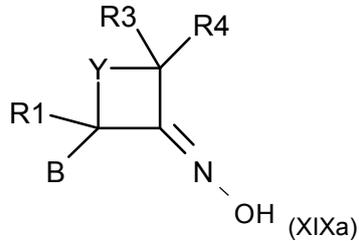
- N*-[(1,2-*cis*)-2-(2,4-difluorofenil)ciclobutil]-2-(trifluorometil)piridin-3-carboxamida;
 2-cloro-*N*-[(1,2-*cis*)-2-(2,4-dicloro-fenil)ciclobutil]nicotinamida;
N-[(1,2-*cis*)-2-(2-cloro-4-fluorofenil)ciclobutil]-2-(trifluorometil)piridin-3-carboxamida;
N-[(1,2-*cis*)-2-(2-cloro-4-fluorofenil)ciclobutil]-3-(trifluorometil)piridin-2-carboxamida;
 5 *N*-[(1,2-*cis*)-2-(4-bromo-2-clorofenil)ciclobutil]-3-(trifluorometil)piridin-2-carboxamida;
N-[(1,2-*cis*)-2-(2,4-difluorofenil)ciclobutil]-3-(trifluorometil)piridin-2-carboxamida;
N-[(1,2-*cis*)-2-(4-metoxifenil)ciclobutil]-3-(trifluorometil)piridin-2-carboxamida;
N-[(1,2-*cis*)-2-(4-cloro-2-fluorofenil)ciclobutil]-3-(trifluorometil)piridin-2-carboxamida; y
 10 *N*-[(1,2-*cis*)-2-(2-cloro-4-fluorofenil)ciclobutil]-2-(trifluorometil)benzamida; o un tautómero o estereoisómero de estos compuestos.
9. Una composición pesticida, que, además de comprender adyuvantes de formulación, comprende una cantidad eficaz como pesticida de un compuesto de fórmula I de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-8.
10. La composición de acuerdo con la reivindicación 9, que comprende además uno o más agentes insecticidas, acaricidas y/o fungicidas.
- 15 11. Un método para controlar el daño y/o las pérdidas de producción debidos a una plaga y/u hongos que comprende aplicar a la plaga o a una planta susceptible de ser atacada por la plaga y/u hongos, o al emplazamiento de esta, o a un material de propagación vegetal una cantidad eficaz de un compuesto tal como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1-8, o una composición definida en la reivindicación 9 o 10.
- 20 12. Un método para proteger material de propagación vegetal del daño y/o las pérdidas de producción debidos a una plaga y/u hongos que comprende aplicar al material de propagación vegetal o al lugar en el que está plantado el material de propagación una cantidad eficaz de un compuesto tal como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1-8, o una composición definida en la reivindicación 9 o 10.
13. El método de acuerdo con la reivindicación 11 o la reivindicación 12, donde el daño o las pérdidas se deben a una plaga de nematodos.
- 25 14. Un material de propagación vegetal cubierto, donde la capa del material de propagación vegetal comprende un compuesto tal como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1-8.
15. Una composición farmacéutica para el control de helmintos, arácnidos y artrópodos endo- y ectoparasitarios que comprende un compuesto tal como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1-8, un portador fisiológicamente tolerable y opcionalmente uno o más auxiliares de formulación habituales.
- 30 16. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto definido en cualquiera de las reivindicaciones 1-8, un portador fisiológicamente tolerable y opcionalmente uno o más auxiliares de formulación habituales para prevenir la infección con enfermedades transmitidas por helmintos, arácnidos y artrópodos endo- y ectoparasitarios.
17. La composición de acuerdo con la reivindicación 15 o 16 que comprende además uno o más compuestos biológicamente activos diferentes.
- 35 18. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de la reivindicaciones 1 a 8 para controlar y prevenir las infestaciones e infecciones por nematodos endo- y ectoparasitarios en animales de sangre caliente, que comprende inyectar, aplicar por vía tópica o administrar por vía oral una composición de acuerdo con la reivindicación 15 o 16.
19. Un proceso para preparar un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, que comprende hacer reaccionar un compuesto de fórmula II



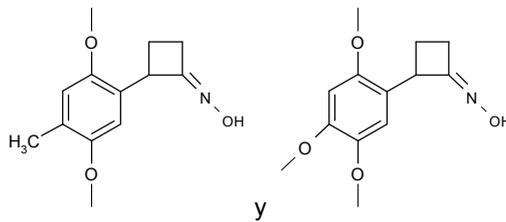
en donde B, Y, R₁, R₂, R₃, R₄ y R₅ son como se definen en la reivindicación 1; con un agente acilante de fórmula III A-C(=O)-R* (III),

en donde A es como se define en la reivindicación 1, y R* es halógeno, hidroxilo o alcoxi C₁₋₆, en presencia de una base.

5 20. Compuestos de fórmula (XIXa)

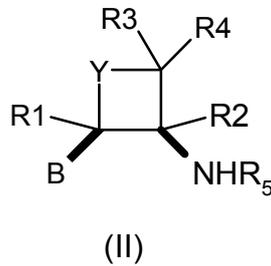


donde B, Y, R₁, R₃ y R₄ son como se definen en la reivindicación 1, donde los compuestos de fórmulas

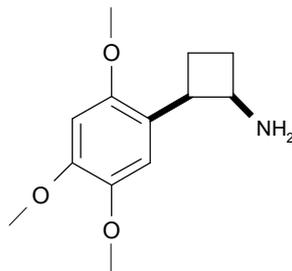


se excluyen.

10 21. Compuestos de fórmula



donde B, Y, R₁, R₂, R₃, R₄ y R₅ son como se definen en la reivindicación 1, donde el compuesto de fórmula



se excluye.