

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 603 032**

51 Int. Cl.:

C07D 401/04 (2006.01)

C07D 405/04 (2006.01)

C07D 409/04 (2006.01)

A01N 43/40 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **13.07.2011 PCT/EP2011/061949**

87 Fecha y número de publicación internacional: **19.01.2012 WO12007500**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **13.07.2011 E 11736039 (6)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **17.08.2016 EP 2593447**

54 Título: **Compuestos de 3-piridil-heteroarilcarboxamida como pesticidas**

30 Prioridad:

15.07.2010 US 364514 P
15.07.2010 EP 10169682

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
23.02.2017

73 Titular/es:

BAYER INTELLECTUAL PROPERTY GMBH
(100.0%)
Alfred-Nobel-Strasse 10
40789 Monheim, DE

72 Inventor/es:

MÜHLTHAU, FRIEDRICH, AUGUST;
BRETSCHNEIDER, THOMAS;
FISCHER, REINER;
FÜSSLEIN, MARTIN;
HEIL, MARKUS;
HENSE, ACHIM;
KLUTH, JOACHIM;
KÖHLER, ADELINE;
FRANKEN, EVA-MARIA;
MALSAM, OLGA;
VOERSTE, ARND;
JESCHKE, PETER;
BECKER, ANGELA;
LÖSEL, PETER y
SATO, YOSHITAKA

74 Agente/Representante:

CARPINTERO LÓPEZ, Mario

ES 2 603 032 T3

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

DESCRIPCIÓN

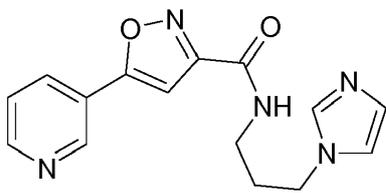
Compuestos de 3-piridil-heteroarilcarboxamida como pesticidas

La presente solicitud se refiere a nuevos compuestos heterocíclicos, a procedimientos para su preparación y a su uso para combatir parásitos animales, entre los que figuran artrópodos y en particular insectos.

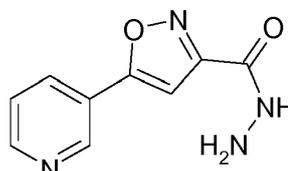
- 5 Determinados compuestos heterocíclicos se han conocido ya como compuestos de acción insecticida (véanse los documentos WO1999/006380 A1, EP 0 097 126 B1, US 2003/162812 A1, US 2002/013326 A1, WO 2009/149858 A1).

Determinados compuestos heterocíclicos se han conocido ya como compuestos de acción herbicida (véase el documento WO 2005/047281 A1).

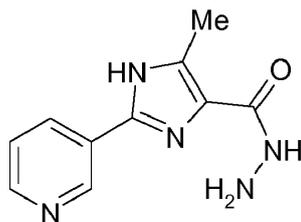
- 10 Así mismo se han conocido los siguientes compuestos, para los que, en cambio, no se describió ningún efecto insecticida:



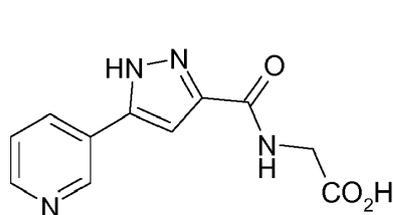
WO 2007/078113 A1



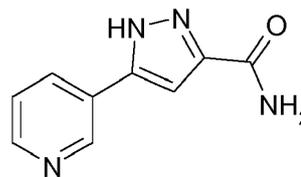
WO 1998/050385 A1



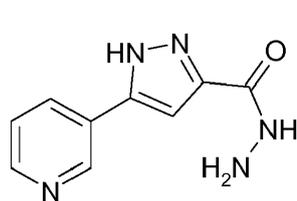
US 4,743,586
US 4,499,097



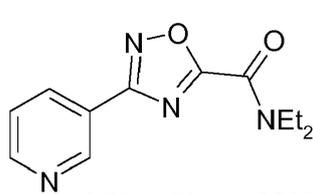
WO2009/117676 A1



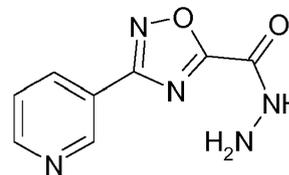
Bioorg. Med. Chem. Lett.
2000, 10, 1211-1214.



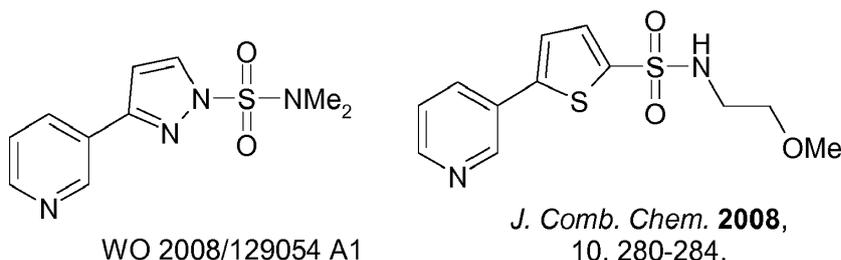
US 3,449,350



J. Het. Chem. **2009**,
46, 1271-1279.



J. Med. Chem. **2008**,
51, 4377-4380.

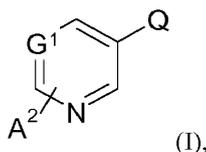


En los documentos WO 2000/027823 A1, US 6.288.061 B1, WO 1999/033827 A1, DE 28 38 892 A1, Chem. Heterocycl. Comp. 2000, 36, 1226-1231, WO 2000/021959 A1, EP 0647 635 A1, Pharmazie 1989, 44, 191-193, EP 0 097 126 B1, DE 24 53 082 A1, DE 24 53 083 A1 y US 4.110.456 se divulgan compuestos heterocíclicos para los que se indican usos farmacéuticos.

Los agentes fitosanitarios modernos deben satisfacer muchos requisitos, por ejemplo en relación al nivel, duración y amplitud de su efecto y uso posible. Esto juega un papel en la cuestión de la toxicidad, capacidad de combinación con otros principios activos o coadyuvantes de formulación así como en la cuestión del gasto que se debe dedicar para la síntesis de un principio activo. Además pueden desarrollarse resistencias. Por estos motivos no se puede considerar cerrada la búsqueda de nuevos agentes fitosanitarios y se mantiene la necesidad de nuevos compuestos con propiedades mejoradas con respecto a los compuestos conocidos en lo que respecta a algunos aspectos.

Era objetivo de la presente invención proporcionar compuestos mediante los cuales se amplíe el espectro de los pesticidas bajo distintos aspectos.

El objetivo se consigue, así como otros objetivos no mencionados explícitamente, que pueden derivarse o revelarse a partir de las relaciones discutidas en el presente documento, mediante el uso de compuestos de fórmula (I)

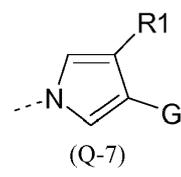
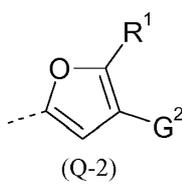
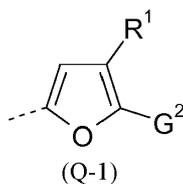


G¹ representa C-A¹,

A¹ representa hidrógeno,

A² representa hidrógeno,

Q representa uno de los siguientes restos



R¹ representa hidrógeno, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halógeno, ciano, haloalquilo C₁-C₃, hidroxilo o alcoxilo C₁-C₆,

G² representa C(=X)NR³R⁴,

X representa oxígeno o azufre,

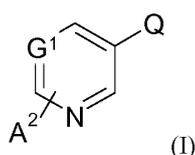
R³ representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, ciano-alquilo C₁-C₆, alcoxilo C₁-C₆, haloalcoxilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquil C₁-C₆-carbonilo opcionalmente sustituido con halógeno, opcionalmente alcoxi C₁-C₆-carbonilo opcionalmente sustituido con halógeno, cicloalquilcarbonilo C₃-C₆ opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ y ciano, o representa un catión, tal como por ejemplo un ion metálico mono- o divalente o un ion amonio opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆ o aril-alquilo C₁-C₆,

R⁴ representa un resto de la serie hidrógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆ y alquinilo C₂-C₆ en cada caso opcionalmente sustituido con halógeno, ciano, alcoxilo C₁-C₆, haloalcoxilo C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, haloalquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆ y haloalquilsulfonilo C₁-C₆, alcoxilo C₁-C₆, haloalcoxilo C₁-C₆, bis(C₁-C₆-alcoxi)-alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido con

- halógeno, bis(aquiltio C₁-C₆)-alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido con halógeno, alquilcarbonil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido con halógeno, alquilsulfinil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido con halógeno, alquilsulfonyl C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido con halógeno, alcoxycarbonil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido con halógeno, alquiniloxilo C₂-C₄, cicloalquilcarbonilo C₃-C₆ opcionalmente sustituido con halógeno, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido con halógeno, cicloalquilo C₃-C₆ y cicloalqueno C₃-C₆ sustituido en cada caso opcionalmente con halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxilo C₁-C₆ o haloalcoxilo C₁-C₆, en los que los anillos pueden contener de uno a tres heteroátomos de la serie azufre, oxígeno (no debiendo ser los átomos de oxígeno directamente adyacentes) y nitrógeno, arilo, heteroarilo, heterociclilo, heterocicli-
- alquilo C₁-C₆, aril-alquilo C₁-C₆, heteroaril-alquilo C₁-C₆ en cada caso opcionalmente sustituidos con halógeno, ciano (también en la parte de alquilo), nitro, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxilo C₁-C₆, haloalcoxilo C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, haloalquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonyl C₁-C₆, haloalquilsulfonyl C₁-C₆, amino, alquilamino C₁-C₆, di(C₁-C₆-alquil)amino, alquilcarbonilamino C₁-C₆, alcoxycarbonilamino C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆ o aminocarbonilo, o representa NR⁵R⁶, en el que R⁵ y R⁶ independientemente entre sí representan un resto de la serie hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxilo C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, alcoxilcarbonilo C₁-C₆, hetarilo y heterociclilo o R⁵ y R⁶ junto con el átomo de nitrógeno, al que están unidos, forman un heterociclo opcionalmente sustituido con halógeno,
- R³ y R⁴ también junto con el átomo de nitrógeno, al que están unidos, pueden formar un anillo de 3 a 7 miembros opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₆, alcoxilo C₁-C₆ o halógeno y que contiene opcionalmente uno o dos heteroátomos de la serie oxígeno, nitrógeno y azufre, no debiendo ser los átomos de oxígeno directamente adyacentes,

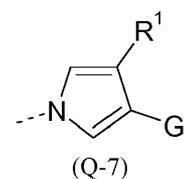
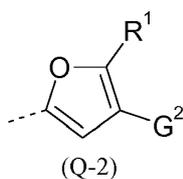
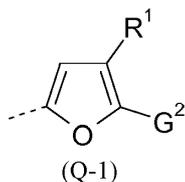
- así como sales, N-óxidos y formas tautoméricas de los compuestos de fórmula (I), en los que halógeno se selecciona de la serie flúor, cloro, bromo y yodo, arilo (también como parte de una unidad mayor, tal como por ejemplo arilalquilo) se selecciona de la serie fenilo, naftilo, antrilo, fenantrenilo y hetarilo (sinónimo de heteroarilo, también como parte de una unidad mayor, tal como por ejemplo hetarilalquilo) se selecciona de la serie furilo, tienilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, benzofurilo, benzisofurilo, benzotienilo, benzisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, benzisotiazolilo, benzoxazolilo, benzisoxazolilo, benzimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazoles, quinolinilo, isoquinolinilo, cinnolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo e indolizínilo, para combatir parásitos animales.

La invención se refiere así mismo a nuevos compuestos de fórmula (I)



en la que

- G¹ representa C-A¹,
 A¹ representa hidrógeno,
 A² representa hidrógeno,
 Q representa uno de los siguientes restos



- R¹ representa hidrógeno, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halógeno, ciano, haloalquilo C₁-C₃, hidroxilo o alcoxilo C₁-C₄,

- G² representa C(=X)NR³R⁴,
- X e Y representan independientemente entre sí oxígeno o azufre,
- R³ representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, ciano-alquilo C₁-C₄, alcoxilo C₁-C₄, haloalcoxilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido con halógeno, alcocarbonilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido con halógeno, cicloalquilcarbonilo C₃-C₆ opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C₁-C₄, alcoxilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y ciano, o representa un catión, tal como por ejemplo un ion metálico mono- o divalente o un ion amonio opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₄ o aril-alquilo C₁-C₄,
- R⁴ representa un resto de la serie hidrógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄ y alquino C₂-C₄ en cada caso opcionalmente sustituidos con halógeno, ciano, alcoxilo C₁-C₄, haloalcoxilo C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquilsulfinilo C₁-C₄, haloalquilsulfinilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄ y haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alcoxilo C₁-C₄, haloalcoxilo C₁-C₄, bis(alcoxi C₁-C₄)-alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido con halógeno, bis(alquiltio C₁-C₄)-alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido con halógeno, alquil C₁-C₄-carbonil-alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido con halógeno, alquilsulfinil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido con halógeno, alquilsulfinil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido con halógeno, alquilsulfonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido con halógeno, alcocarbonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido con halógeno, alquinoxilo C₂-C₄, cicloalquil C₃-C₆-carbonilo opcionalmente sustituido con halógeno, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido con halógeno, cicloalquilo C₃-C₆ y cicloalqueno C₃-C₆ en cada caso opcionalmente sustituidos con halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxilo C₁-C₄ o haloalcoxilo C₁-C₄, en los que los anillos pueden contener de uno a tres heteroátomos de la serie azufre, oxígeno (no debiendo ser los átomos de oxígeno directamente adyacentes) y nitrógeno, arilo, heteroarilo, aril-alquilo C₁-C₄, heteroaril-alquilo C₁-C₄ en cada caso opcionalmente sustituidos con halógeno, ciano (también en la parte de alquilo), nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxilo C₁-C₄, haloalcoxilo C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquilsulfinilo C₁-C₄, haloalquilsulfinilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, amino, alquilamino C₁-C₄, di(alquil C₁-C₄)amino, alquilcarbonilamino C₁-C₄, alcocarbonilamino C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄, alcocarbonilo C₁-C₄ o aminocarbonilo, o representa NR⁵R⁶, en el que R⁵ y R⁶ independientemente entre sí representan un resto de la serie hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄, alcocarbonilo C₁-C₄, hetarilo y heterociclilo o R⁵ y R⁶ junto con el átomo de nitrógeno, al que están unidos, forman un heterociclo opcionalmente sustituido con halógeno,
- R³ y R⁴ también junto con el átomo de nitrógeno, al que están unidos, pueden formar un anillo de 3 a 7 miembros opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₄, alcoxilo C₁-C₄ o halógeno y que contiene opcionalmente uno o dos heteroátomos de la serie oxígeno, nitrógeno y azufre, no debiendo ser los átomos de oxígeno directamente adyacentes,
- y en los que
 halógeno se selecciona de la serie flúor, cloro, bromo y yodo,
 arilo (también como parte de una unidad mayor, tal como por ejemplo arilalquilo) se selecciona de la serie fenilo, naftilo, antrilo, fenantrenilo y
 hetarilo (también como parte de una unidad mayor, tal como por ejemplo hetarilalquilo) se selecciona de la serie tienilo, pirimidilo, oxadiazolilo, oxazolilo, pirazinilo, imidazolilo, tiazolilo y furanilo.
 Se prefieren compuestos de fórmula (I), en la que
- G¹ representa C-A¹,
- A¹ representa hidrógeno,
- A² representa hidrógeno,
- Q representa Q-1, Q-2 o Q-7,
- R¹ representa hidrógeno o alquilo C₁-C₄,
- G² representa C(=X)NR³R⁴,
- X representa oxígeno,
- R³ representa un resto de la serie hidrógeno y alquilo C₁-C₄,
- R⁴ representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo C₁-C₄ y alqueno C₂-C₄ en cada caso opcionalmente sustituidos con halógeno, ciano y alquiltio C₁-C₄, representa alquino C₂-C₄, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido con halógeno y heteroaril-alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido con haloalquilo C₁-C₄ y

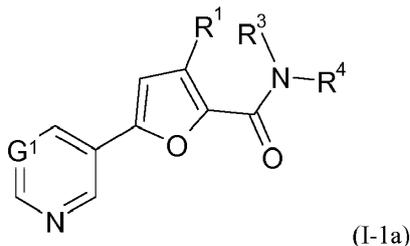
R³ y R⁴ también junto con el átomo de nitrógeno, al que están unidos, pueden formar un anillo de 3 a 7 miembros, que no contiene ningún heteroátomo adicional y en los que

halógeno se selecciona de la serie flúor, cloro, bromo y yodo y hetarilo (también como parte de una unidad mayor, tal como por ejemplo hetarilalquilo) se selecciona de la serie tienilo, pirimidilo y tiazolilo.

5

Los compuestos de fórmula (I) se pueden presentar dado el caso en función del tipo de sustituyentes como isómeros geométricos y/u ópticamente activos o mezclas isoméricas correspondientes en distinta composición. La invención se refiere tanto a los isómeros puros como a las mezclas isoméricas.

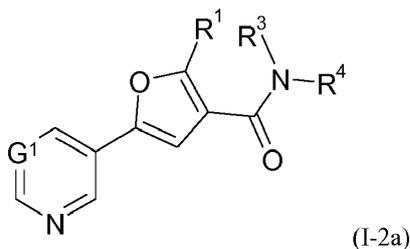
En una forma de realización preferida la invención se refiere a compuestos de fórmula (I-1a)



10

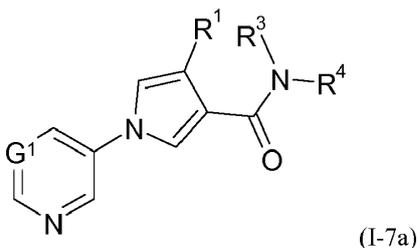
en la que G¹, R¹, R³ y R⁴ tienen los significados indicados anteriormente.

En una forma de realización preferida adicional la invención se refiere a compuestos de fórmula (I-2a)



en la que G¹, R¹, R³ y R⁴ tienen los significados indicados anteriormente.

15 En una forma de realización preferida adicional la invención se refiere a compuestos de fórmula (I-7a)



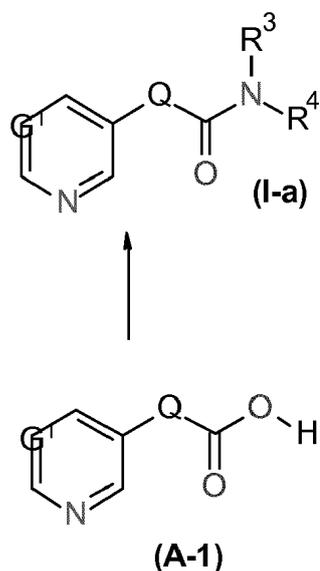
en la que G¹, R¹, R³ y R⁴ tienen los significados indicados anteriormente.

Los compuestos de acuerdo con la invención pueden prepararse de acuerdo con procedimientos habituales, conocidos por el experto.

20 La preparación de las estructuras principales heterocíclicas en los compuestos de fórmula (I) es posible de acuerdo con una o varias variantes de síntesis, que se muestran en los esquemas de reacción 1 a 4 y 6.

Compuestos de fórmula (I), en los que Q representa Q-1, Q-2 o Q-7, pueden prepararse por ejemplo de acuerdo con el esquema de reacción 1.

Esquema de reacción 1

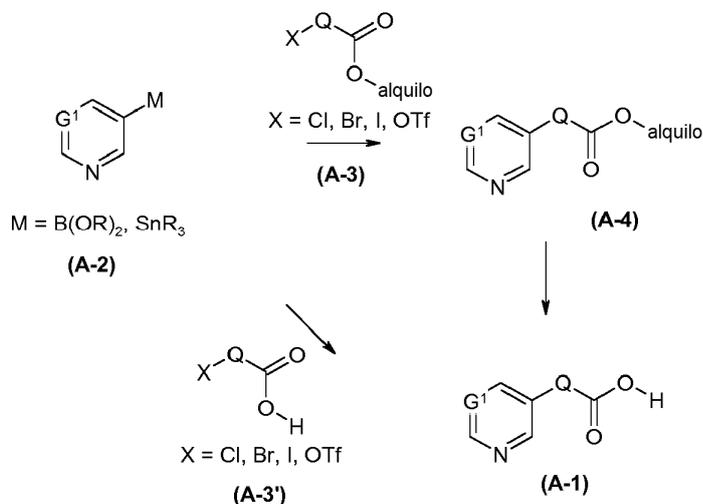


Los compuestos de fórmula (I-a) pueden prepararse activándose los ácidos carboxílicos de fórmula (A-1) mediante transformación en cloruros de ácido, fluoruros de ácido o anhídridos mixtos o mediante reacción con reactivos de acoplamiento tales como por ejemplo BOPCl (véase por ejemplo Houben-Weyl, Methoden der organischen Chemie, volumen 15/2; M. Bodanszky et al., The Practice of Peptide Synthesis, Springer, Nueva York, 1984; C. A. G. N. Montalbetti et al., Tetrahedron 2005, 61, 10827-10852) y haciéndose reaccionar a continuación con las aminas correspondientes opcionalmente en presencia de un reactivo de acoplamiento y de un agente auxiliar de reacción. Los reactivos de acoplamiento que son adecuados para la preparación de enlaces de amida, son conocidos (véase Bodansky et al., Peptide Synthesis 2ª ed, Wiley & Sons, Nueva York, 1976).

- 5 Puede obtenerse 2-bromo-2,2-difluoroetanamina según procedimientos conocidos en general (véase el documento WO 2004/916113 A2).

Los compuestos de fórmula (A-1), en los que Q representa Q-1, Q-2 o Q-7, pueden prepararse por ejemplo de acuerdo con el esquema de reacción 2.

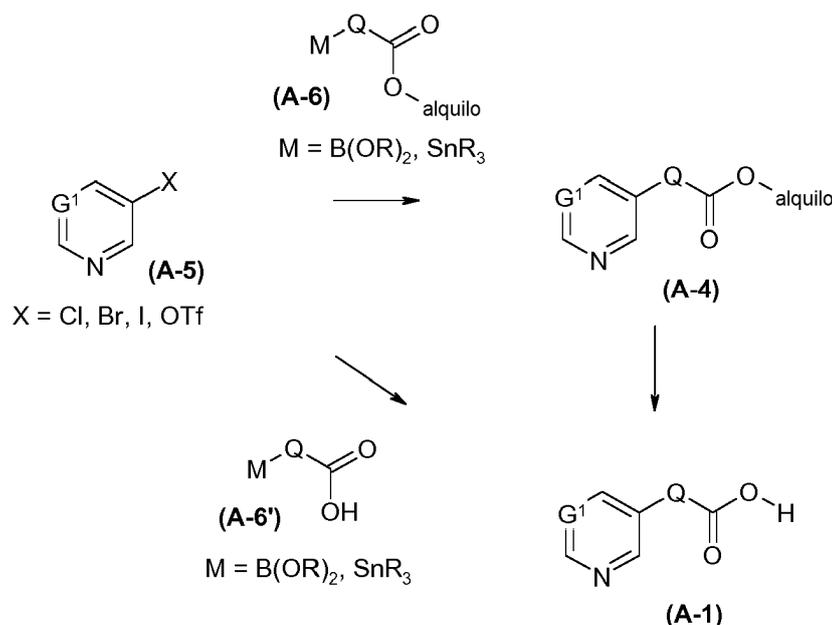
Esquema de reacción 2



- 15 Para la preparación de los compuestos de acuerdo con la invención se hacen reaccionar en primer lugar ácidos (hetero)arilbóricos o ésteres de ácido (hetero)arilbórico de fórmula (A-2) con los ésteres halogenados

- correspondientes de fórmula (A-3) de acuerdo con procedimientos conocidos (Chem. Rev. 1995, 95, 2457-2483; Tetrahedron 2002, 58, 9633-9695; Metal-Catalyzed Cross-Coupling Reactions (Eds.: A. de Meijere, F. Diederich), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, 2004) bajo catálisis con sal de metal de transición para dar compuestos de fórmula (A-4). Por ejemplo, se describe la reacción de ácido piridin-3-ilbórico con 5-bromo-2-furanato de metilo [Q-1] (véase L. A. McAllister et al., J. Am. Chem. Soc. 2006, 128, 4176-4177). Reacciones análogas con tiofenos sustituidos se describen en el documento WO 2005/61494 y Z.-K. Wan et al., Bioorg. Med. Chem. Lett. 2006, 16, 4941-4945. Reacciones de acoplamiento similares se describen para los siguientes ésteres de ácido carboxílico halogenados en parte sustituidos de fórmula (A-3) o los ácidos análogos de fórmula (A-3'): 5-cloro-3-furanato de metilo [documento US 6.302.047 B1, Q-2].
- Reacciones correspondientes se describen también con compuestos de trialquilestañoheteroarilo (véase J. Zhang et al., Bioorg. Med. Chem. Lett. 2000, 10, 2575-2578).
- Los ácidos bóricos y ésteres de ácido bórico de fórmula (A-2) son conocidos en general y pueden prepararse con procedimientos conocidos en general [ácido piridin-3-ilbórico (véase el documento WO 2005/66162), ácido pirimidin-5-ilbórico (véase el documento WO 2005/103019), 3-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)piridina (véase T. Ishiyama et al., Tetrahedron 2001, 57, 9813-9816)]. Compuestos de trialquilestañoheteroarilo de fórmula (A-2) son conocidos en general y pueden prepararse con procedimientos conocidos en general [3-(trimetilestannil)piridina (véase el documento US 6.544.985, WO 2003/72553). Los ésteres de ácido carboxílico halogenados de fórmula (A-3) o sus ácidos son conocidos en general y pueden prepararse con procedimientos conocidos en general [5-bromo-2-furanato de etilo (véase el documento WO 2004/33440), 5-bromo-3-furanato de metilo (véase G. Johansson et al., J. Med. Chem. 1997, 40, 3804-3819), 5-bromotiofen-2-carboxilato de metilo (véase el documento WO 2005/79791), 2-cloro-1,3-oxazol-5-carboxilato de metilo (véase el documento WO 2007/131953), 3-bromo-1,2-oxazol-5-carboxilato de etilo (véase el documento WO 2005/26149)].
- Compuestos de fórmula (A-4), en los que alquilo representa preferentemente metilo o etilo, pueden transformarse mediante escisión de éster del éster de ácido carboxílico en el compuesto de fórmula (A-1). La escisión de éster puede llevarse a cabo con los procedimientos conocidos (véase Greene's protective groups in organic synthesis, 4^a ed., P.G.M. Wuts, T.W. Greene, John Wiley & Sons, Inc., Hoboken, New Jersey, 2007); por ejemplo, el compuesto de fórmula (A-4) puede hacerse reaccionar con solución acuosa de hidróxido de litio en tetrahidrofurano y posterior acidificación o con solución acuosa de hidróxido de sodio en alcoholes y posterior acidificación para dar el ácido correspondiente de fórmula (A-1).
- Compuestos de fórmula (A-1), en los que Q representa Q-1 o Q-2, pueden prepararse por ejemplo de acuerdo con el esquema de reacción 3.

Esquema de reacción 3



- Para la preparación de los compuestos de acuerdo con la invención se hacen reaccionar en primer lugar halogenuros o triflatos (A-5) con los ácidos (hetero)arilbóricos o ésteres de ácido (hetero)arilbórico correspondientes de fórmula (A-6) o (A-6') de acuerdo con procedimientos conocidos (véase el esquema de reacción 2) bajo catálisis

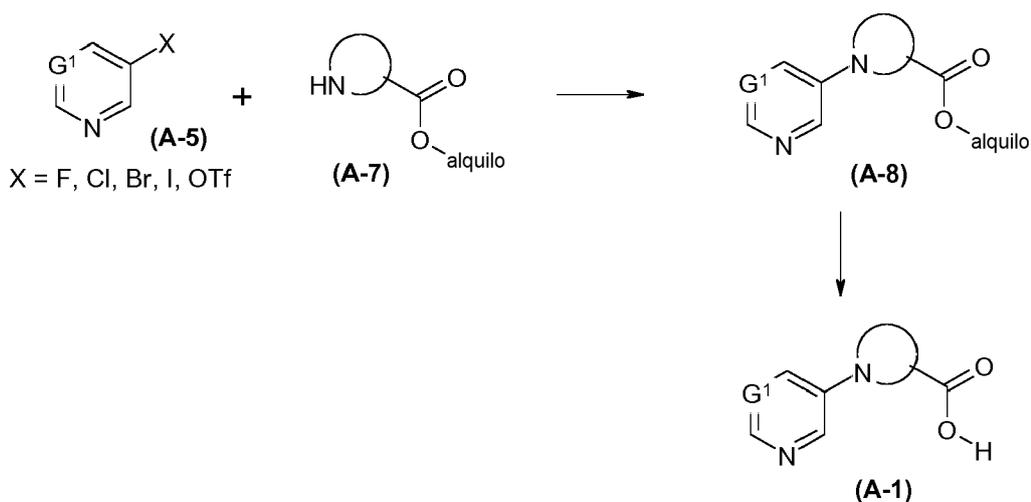
con sal de metal de transición para dar compuestos de fórmula (A-4) o (A-1).

Reacciones correspondientes se describen también con compuestos de trialkylestafioheteroarilo Bioorg. Med. Chem. 2003, 11, 281-292 [Q-1]).

- 5 La reacción de ésteres de fórmula (A-4) para dar ácidos carboxílicos de fórmula (A-1) puede llevarse a cabo tal como se describe en el esquema de reacción 3.

Compuestos de fórmula (A-1), en los que Q representa Q-7, pueden prepararse por ejemplo de acuerdo con el esquema de reacción 4.

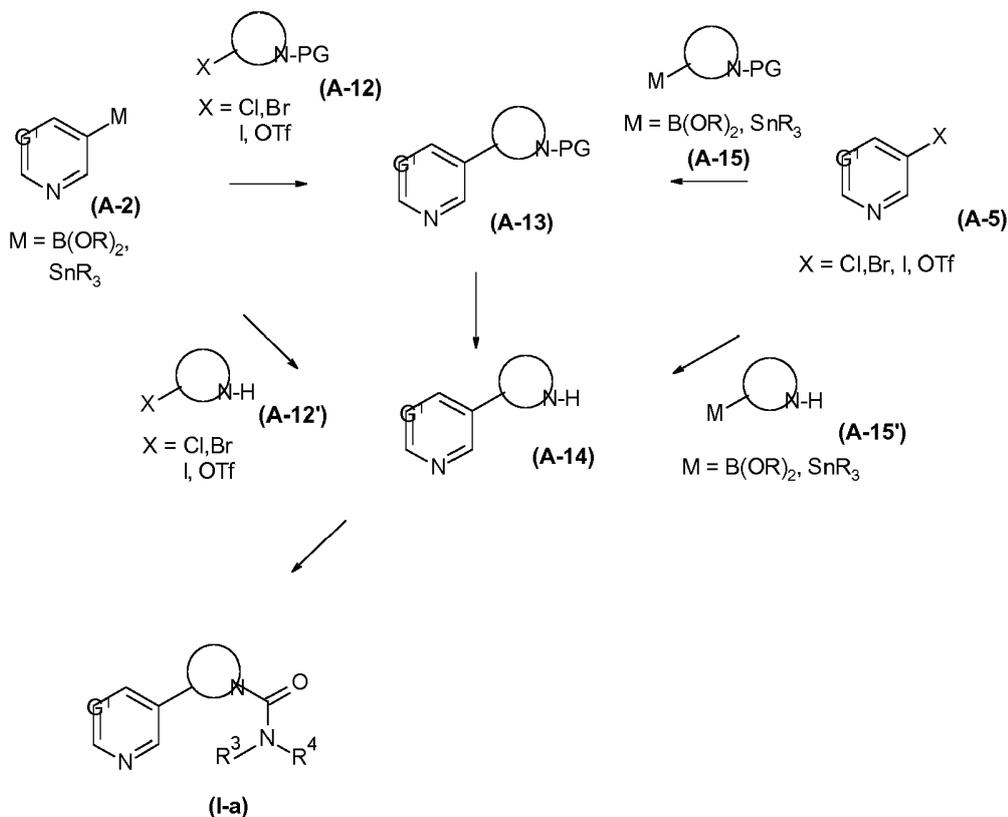
Esquema de reacción 4



- 10 Para la preparación de los compuestos de acuerdo con la invención se hacen reaccionar en primer lugar halogenuros o triflatos de fórmula (A-5) con los ésteres de fórmula (A-7) de acuerdo con procedimientos conocidos (Mini-Reviews in Organic Chemistry 2008, 5, 323-330; Molecules 2009, 14, 5169-5178; Pyrazol: Eur. J. Org. Chem. 2004, 4, 695-709) bajo catálisis con sal de metal de transición para dar compuestos de fórmula (A-8). Por ejemplo, se describe la reacción de 1H-pirrol-3-carboxilato de metilo [Q-7] con 4-bromoisquinolina (véase el documento WO 2004/7478).

- 15 La reacción de ésteres de fórmula (A-8) para dar ácidos carboxílicos de fórmula (A-1) puede llevarse a cabo tal como se describe en el esquema de reacción 3.

Esquema de reacción 6



Para la preparación de los compuestos de acuerdo con la invención del tipo (I-a) se hacen reaccionar en primer lugar, de manera análoga a las reacciones mostradas en el esquema de reacción 2, ácidos (hetero)arilbóricos o ésteres de ácido (hetero)arilbórico de fórmula (A-2) con los compuestos halogenados correspondientes (A-12, PG corresponde por ejemplo a tritilo) o de fórmula (A-12') de acuerdo con procedimientos conocidos (véase anteriormente) bajo catálisis con sal de metal de transición para dar compuestos de fórmula (A-13) o (A-14). Se describe la reacción del siguiente compuesto con ácidos piridinilbóricos sustituidos: 3-bromo-1-(triisopropilsilil)-1H-pirrol (J. Am. Chem. Soc. 2007, 129, 3358-3366, Q-7).

Como alternativa, pueden prepararse compuestos de fórmula (A-13) o (A-14), de manera análoga a las reacciones mostradas en el esquema de reacción 3, mediante reacción catalizada con sal de metal de transición de halogenuros o triflatos de fórmula (A-5) con los ácidos (hetero)arilbóricos o ésteres de ácido (hetero)aril-bórico correspondientes de fórmulas (A-15) o (A-15').

La reacción de los compuesto de fórmula (A-13) para dar el compuesto no protegido de fórmula (A-14) puede llevarse a cabo de acuerdo con procedimientos conocidos en general (véase Greene's protective groups in organic synthesis, 4th ed., P.G.M. Wuts, T.W. Greene, John Wiley & Sons, Inc., Hoboken, New Jersey, 2007); por ejemplo puede hacerse reaccionar (A-X, PG = tritilo) con ácido clorhídrico en etanol para dar el compuesto no protegido correspondiente de fórmula (A-14) (véase M. T. Burger et al., J. Med. Chem. 2006, 49, 1730-1743).

Para la preparación de los compuestos de acuerdo con la invención del tipo (I-a,) se hacen reaccionar los compuestos correspondientes de fórmula (A-14) con los reactivos de acilación correspondientes opcionalmente en presencia de un activador y un agente auxiliar de reacción básico.

Los principios activos de acuerdo con la invención son adecuados por su buena tolerancia por las plantas, toxicidad favorable en animales de sangre caliente y buena tolerancia ambiental para la protección de plantas y órganos de plantas, para aumentar los rendimientos de cosecha, mejorar la calidad de los productos de cosecha y para combatir parásitos animales, especialmente insectos, arácnidos, helmintos, nematodos y moluscos, que aparecen en agricultura, en horticultura, en cría de animales, en bosques, en jardines e instalaciones de tiempo libre, en la protección de existencias y materiales, así como en el sector de la higiene. Se pueden usar preferentemente como agentes fitosanitarios. Son eficaces contra las especies de sensibilidad normal y resistentes, así como contra todos o algunos de los estados de desarrollo. Pertenecen a los parásitos mencionados anteriormente:

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

Además pueden combatirse protozoos, como *Eimeria*.

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

Del orden de los homópteros, por ejemplo, *Acyrtosipon* spp., *Aeneolamia* spp., *Agonoscena* spp., *Aleurodes* spp., *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus* spp., *Amrasca* spp., *Anuraphis cardui*, *Aonidiella* spp., *Aphanostigma piri*, *Aphis* spp., *Arboridia apicalis*, *Aspidiella* spp., *Aspidiotus* spp., *Atanus* spp., *Aulacorthum solani*, *Bemisia* spp., *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycolus* spp., *Brevicoryne brassicae*, *Calligypona marginata*, *Carneiocephala fulgida*, *Ceratovacuna lanigera*, *Cercopidae*, *Ceroplastes* spp., *Chaetosiphon fragaefolii*, *Chionaspis tegalensis*, *Chlorita onukii*, *Chromaphis juglandicola*, *Chrysomphalus ficus*, *Cicadulina mbila*, *Coccoxystus halli*, *Coccus* spp., *Cryptomyzus ribis*, *Dalbulus* spp., *Dialeurodes* spp., *Diaphorina* spp., *Diaspis* spp., *Doralis* spp., *Drosicha* spp.,

55 Del orden de los homópteros, por ejemplo, *Acyrtosipon* spp., *Aeneolamia* spp., *Agonoscena* spp., *Aleurodes* spp., *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus* spp., *Amrasca* spp., *Anuraphis cardui*, *Aonidiella* spp., *Aphanostigma piri*, *Aphis* spp., *Arboridia apicalis*, *Aspidiella* spp., *Aspidiotus* spp., *Atanus* spp., *Aulacorthum solani*, *Bemisia* spp., *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycolus* spp., *Brevicoryne brassicae*, *Calligypona marginata*, *Carneiocephala fulgida*, *Ceratovacuna lanigera*, *Cercopidae*, *Ceroplastes* spp., *Chaetosiphon fragaefolii*, *Chionaspis tegalensis*, *Chlorita onukii*, *Chromaphis juglandicola*, *Chrysomphalus ficus*, *Cicadulina mbila*, *Coccoxystus halli*, *Coccus* spp., *Cryptomyzus ribis*, *Dalbulus* spp., *Dialeurodes* spp., *Diaphorina* spp., *Diaspis* spp., *Doralis* spp., *Drosicha* spp.,

5 Dysaphis spp., Dysmicoccus spp., Empoasca spp., Eriosoma spp., Erythroneura spp., Euscelis bilobatus, Geococcus coffeae, Homalodisca coagulata, Hyalopterus arundinis, Icerya spp., Idiocerus spp., Idioscopus spp., Laodelphax striatellus, Lecanium spp., Lepidosaphes spp., Lipaphis erysimi, Macrosiphum spp., Mahanarva fimbriolata, Melanaphis sacchari, Metcalfiella spp., Metopolophium dirhodum, Monellia costalis, Monelliopsis pecanis, Myzus spp., Nasonovia ribisnigri, Nephrotettix spp., Nilaparvata lugens, Oncometopia spp., Orthezia praelonga, Parabemisia myricae, Paratrioza spp., Parlatoria spp., Pemphigus spp., Peregrinus maidis, Phenacoccus spp., Phloeomyzus passerinii, Phorodon humuli, Philloxera spp., Pinnaspis aspidistrae, Planococcus spp., Protospulvinaria pyriformis, Pseudaulacaspis pentagona, Pseudococcus spp., Psilla spp., Pteromalus spp., Pyrilla spp., Quadraspidiotus spp., Quesada gigas, Rastrococcus spp., Rhopalosiphum spp., Saissetia spp., Scaphoides titanus, Schizaphis graminum, 10 Selenaspis articulatus, Sogata spp., Sogatella furcifera, Sogatodes spp., Stictocephala festina, Tenalaphara malayensis, Tinocallis caryaefoliae, Tomaspis spp., Toxoptera spp., Trialeurodes vaporariorum, Trioza spp., Typhlocyba spp., Unaspis spp., Viteus vitifolii.

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

15 Del orden de los isópodos, por ejemplo, Armadillidium vulgare, Oniscus asellus, Porcellio scaber.

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

20 Del orden de los lepidópteros, por ejemplo, Acronicta major, Aedia leucomelas, Agrotis spp., Alabama argillacea, Anticarsia spp., Barathra brassicae, Bucculatrix thurberiella, Bupalus piniarius, Cacoecia podana, Capua reticulana, Carpocapsa pomonella, Cheimantobia brumata, Chilo spp., Choristoneura fumiferana, Clysia ambiguella, Cnaphalocerus spp., Earias insulana, Ephestia kuehniella, Euproctis chryorrhoea, Euxoa spp., Feltia spp., Galleria mellonella, Helicoverpa spp., Heliothis spp., Hofmannophila pseudospretella, Homona magnanima, Hyponomeuta padella, Laphygma spp., Lithocolletis blancardella, Lithophane antennata, Loxagrotis albicosta, Lymantria spp., Malacosoma neustria, Mamestra brassicae, Mocis repanda, Mythimna separata, Oria spp., Oulema oryzae, Panolis flammea, Pectinophora gossypiella, Phillocnistis citrella, Pieris spp., Plutella xilostella, Prodenia spp., Pseudaletia 25 spp., Pseudoplusia includens, Pyrausta nubilalis, Spodoptera spp., Thermesia gemmatalis, Tinea pellionella, Tineola bisselliella, Tortrix viridana, Trichoplusia spp..

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

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

30 Del orden de los sínfilos, por ejemplo, Scutigera immaculata.

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

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

35 Pertencen a los nematodos parásitos de plantas, por ejemplo, Anguina spp., Aphelenchoides spp., Belonoaimus spp., Bursaphelenchus spp., Ditylenchus dipsaci, Globodera spp., Heliocotilenchus spp., Heterodera spp., Longidorus spp., Meloidogyne spp., Pratylenchus spp., Radopholus similis, Rotilenchus spp., Trichodorus spp., Tilenchorhynchus spp., Tilenchulus spp., Tilenchulus semipenetrans, Xiphinema spp..

40 Los compuestos de acuerdo con la invención se pueden usar en concentraciones o cantidades de aplicación determinadas también como herbicidas, protectores, reguladores del crecimiento o agentes para mejorar las propiedades de las plantas, o como microbicidas, por ejemplo, como fungicidas, antimicóticos, bactericidas, viricidas (incluyendo agentes contra viroides) o como agentes contra MLO (organismo similar a micoplasma) y RLO (organismo similar a Rickettsia). Se pueden usar también como productos intermedios o de partida para la síntesis de otros principios activos.

45 Los principios activos se pueden transformar en las formulaciones habituales como soluciones, emulsiones, polvos de pulverización, suspensiones basadas en agua y aceite, polvos, productos en polvo, pastas, polvos solubles, gránulos solubles, gránulos de dispersión, concentrados de suspensión-emulsión, sustancias naturales impregnadas con principio activo, sustancias sintéticas impregnadas con principio activo, fertilizantes, así como microencapsulaciones en sustancias poliméricas.

50 Estas formulaciones se preparan de modo conocido, por ejemplo, mediante mezclado de los principios activos con extensores, es decir disolventes líquidos y/o vehículos sólidos, dado el caso usando agentes tensioactivos, como agentes emulsionantes y/o agentes dispersantes y/o agentes espumantes. La preparación de formulaciones se realiza o bien en equipos adecuados o también antes o durante el uso.

Como coadyuvantes pueden ser de uso aquellas sustancias que son adecuadas para conferir al propio agente y a preparaciones derivadas de este (por ejemplo, líquidos de pulverización, desinfectantes de semillas) propiedades especiales, como determinadas propiedades técnicas y/o también propiedades biológicas especiales. Como coadyuvantes típicos se tienen en cuenta: extensores, disolventes y vehículos.

- 5 Como extensores son adecuados, por ejemplo, agua, líquidos químicos orgánicos polares y no polares, por ejemplo, de la clase de los hidrocarburos aromáticos y no aromáticos (como parafinas, alquilbencenos, alquilnaftalenos, clorobencenos), los alcoholes y polioles (que dado el caso pueden estar sustituidos, eterificados y/o esterificados), las cetonas (como acetona, ciclohexanona), ésteres (también grasas y aceites) y (poli)éteres, las aminas simples y sustituidas, amidas, lactamas (como N-alquilpirrolidona) y lactonas, las sulfonas y sulfóxidos (como dimetilsulfóxido).
- 10 En el caso del uso de agua como extensor se pueden usar por ejemplo también disolventes orgánicos como disolventes auxiliares. Como disolventes líquidos se tienen en cuenta esencialmente: compuestos aromáticos como xileno, tolueno o alquilnaftaleno, compuestos aromáticos clorados e hidrocarburos alifáticos clorados como clorobenceno, cloroetileno o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos como ciclohexano o parafina, por ejemplo, fracciones de petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoholes como butanol o glicol, así como sus éteres y
- 15 ésteres, cetonas como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, disolventes polares fuertes como dimetilsulfóxido, así como agua.

Como vehículos sólidos se tienen en cuenta:

- por ejemplo, sales de amonio y polvos de rocas naturales como caolín, arcilla, talco, creta, cuarzo, atapulgita, montmorillonita o tierra de diatomeas y polvos de rocas sintéticos como sílice de alta dispersión, óxido y silicatos
- 20 de aluminio; como vehículos sólidos para gránulos se tienen en cuenta: por ejemplo, rocas naturales rotas y fraccionadas como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita, así como gránulos sintéticos de polvos inorgánicos y orgánicos, así como gránulos de material orgánico como papel, serrín, cáscaras de coco, mazorcas de maíz y tallos de tabaco; como agentes emulsionantes y/o espumantes se tienen en cuenta: por ejemplo,
- 25 agentes emulsionantes no ionogénicos y aniónicos como éster de ácido graso y polioxietileno, éteres de alcohol graso y polioxietileno, por ejemplo, alquilaril-poliglicoléteres, alquilsulfonatos, alquilsulfatos, arilsulfonatos, así como hidrolizados de albúmina; como agentes de dispersión se tienen en cuenta sustancias no iónicas y/o
- 30 iónicas, por ejemplo, de las clases de alcohol-POE- y/o POP-éteres, ésteres de ácido y/o de POP- POE, alquilaril- y/o POP- POE-éteres, aductos grasos y/o de POP- POE, derivados de POE- y/o POP-poliol, aductos de POE- y/o POP-sorbitán o azúcar, sulfatos, sulfonatos y fosfatos de alquilo o arilo o los aductos de PO-éter correspondientes. Además de oligo- o polímeros adecuados, por ejemplo partiendo de monómeros vinílicos, de ácido acrílico, de EO y/o PO solo o en combinación con, por ejemplo, (poli)-alcoholes o (poli)-aminas. Además pueden ser de uso lignina y sus derivados de ácido sulfónico, celulosas simples y modificadas, ácidos sulfónicos aromáticos y/o alifáticos así como sus aductos con formaldehído.

- 35 Se pueden usar en las formulaciones adhesivos como carboximetilcelulosa, polímeros naturales y sintéticos en forma de polvo, grano o látex, como goma arábiga, poli(alcohol vinílico), poli(acetato de vinilo), así como fosfolípidos naturales como cefalina y lecitina y fosfolípidos sintéticos.

Se pueden usar colorantes como pigmentos inorgánicos, por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, azul de ferrocianuro y colorantes orgánicos como colorantes de alizarina, azoicos y de metalfalocianina y oligonutrientes como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

- 40 Otros aditivos pueden ser sustancias aromáticas, aceites minerales o vegetales dado el caso modificados, ceras y sustancias nutritivas (también oligonutrientes), como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

Además pueden estar contenidos estabilizadores como estabilizadores de frío, conservantes, agentes anti-oxidación, agentes fotoprotectores u otros agentes que mejoran la estabilidad química y/o física.

- 45 Las formulaciones contienen en general entre el 0,01 y el 98 % en peso de principio activo, preferentemente entre el 0,5 y el 90 %.

- Los principios activos de acuerdo con la invención pueden usarse como tal o en sus formulaciones también en mezcla con uno o varios fungicidas, bactericidas, acaricidas, nematocidas, insecticidas, microbicidas, fertilizantes, atrayentes, esterilizantes, sinergistas, protectores, semioquímicos y/o reguladores del crecimiento de las plantas,
- 50 para ampliar de este modo, por ejemplo el espectro de acción, la duración de la acción, aumentar la velocidad de acción, impedir repelencia o evitar desarrollo de resistencia. Además, tales combinaciones de principios activos pueden mejorar el crecimiento de las plantas, aumentar la tolerancia frente a altas o bajas temperaturas, contra sequía o contra el contenido en agua o sal del suelo, aumentar el rendimiento de floración, facilitar la recogida y aumentar los rendimientos de la cosecha, acelerar la maduración, aumentar la calidad y/o el valor nutricional de los
- 55 productos de la cosecha, prolongar la capacidad de almacenamiento y/o mejorar la procesabilidad de los productos de la cosecha. Mediante combinación de los principios activos de acuerdo con la invención con componentes de mezcla se obtienen efectos sinérgicos, es decir, la eficacia de la mezcla respectiva es mayor de lo que cabía esperar debido a las eficacias de los componentes individuales. En general, las combinaciones pueden usarse tanto como

aplicaciones de semillas como también en premezclas, mezclas de tanque o mezclas acabadas.

Cada principio activo adicional puede mezclarse en un amplio intervalo, preferentemente en una relación de 100:1 a 1.100, de manera especialmente preferente de 5:1 a 1:5 con los principios activos de acuerdo con la invención.

Componentes de mezcla especialmente favorables son por ejemplo los siguientes

5 Insecticidas / Acaricidas / Nematicidas:

Los principios activos mencionados en el presente documento con su "common name" son conocidos y se describen por ejemplo en Pestizidhandbuch ("The Pesticide Manual" 14ª Ed., British Crop Protection Council 2006) o pueden buscarse en Internet (por ejemplo <http://www.alanwood.net/pesticides>).

(1) Inhibidores de acetilcolinesterasa (AChE), tales como por ejemplo

10 carbamatos, por ejemplo alanicarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbarilo, carbofurano, carbosulfano, etiofencarb, fenobucarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, triazamato, trimetacarb, XMC y xililcarb; o organofosfatos, por ejemplo acefato, azametifós; azinfós (-metilo, -etilo), cadusafós, cloretoxifós, clorofenvinfós, cloromefós, cloropirifós (-metilo), coumafós, cianofós, demetón-S-metilo, diazinona, diclorovós/DDVP, dicrotofós, dimetoato, dimetilvinfós, disulfotona, EPN, etiona, etoprofós, etrimfós, famfur, fenamifós, fenitrotriona, fentiona, fostiazato, heptenofós, isofenfós, O-(metoxiaminotio-fosforil)salicilato de isopropilo, isoxationa, malationa, mecarbam, metamidofós, metidationa, mevinfós, monocrotofós, naled, ometoato, oxidemeton-metilo, parationa, (-metilo), fentoato, forato, fosalona, fosmet, fosfamidona, foxim, pirimifós (-metilo), fosfenofós, propetamfós, protiofós, piraclófós, piridafentiona, quinalfós, sebufos, sulfotep, tebupirimfós, temefós, terbufós, tetraclorvinfós, tiometona, triazofós, triclorofona y vamidotona

(2) Antagonistas de los canales de cloruro controlados por GABA, tales como por ejemplo

Organocloros, por ejemplo clordano y endosulfano (alfa-); o fiprol (fenilpirazol), por ejemplo etiprol, fipronilo, pirafluprol y piriprol.

25 (3) Moduladores de los canales de sodio / bloqueantes de los canales de sodio dependientes de la tensión, tales como por ejemplo

piretroides, por ejemplo acrinatrina, aletrina (d-cis-trans, d-trans), bifentrina, bioalletrina, bioaletrina-S-ciclopentenilo, bioresmetrina, cicloprotrina, ciflutrina (beta-), cihalotrina (gamma-, lambda), cipermetrina (alfa-, beta-, theta-, zeta-), cifenotrina [isómeros (1R)-trans], deltametrina, dimeflutrina, empentrina [isómeros (EZ)-(1R)], esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucrinato, flumetrina, flualinato (tau-), halfenprox, imiprotrina, metoflutrina, permetrina, fenotrina [isómero (1R)-trans], praletrina, proflutrina, piretrina (piretro), resmetrina, RU 15525, silafluofeno, teflutrina, tetrametrina [isómeros (1R)], tralometrina, transflutrina y ZXI 8901; o DDT; o metoxiclor.

(4) Agonistas nicotínicos de receptores de acetilcolina, como por ejemplo

35 neonicotinoides, por ejemplo, acetamiprid, clotianidina, dinotefurano, imidacloprida, nitenpiram, tiacloprid y tiametoxam; o nicotina.

(5) Moduladores (agonistas) alostéricos de receptores acetilcolina, como por ejemplo

espinosinas, por ejemplo, espinetoram y espinosad.

(6) Activadores de canales de cloruro, como por ejemplo

40 avermectinas/milbemicinas, por ejemplo, abamectina, emamectina-benzoato, lepimectina y milbemectina (II-6-4).

(7) Análogos de hormona juvenil, por ejemplo hidropreno, quinopreno, metopreno; o fenoxicarb; piriproxifeno.

(8) Principios activos con mecanismos de acción desconocidos o inespecífico, como por ejemplo agentes gasificantes, por ejemplo, bromuro de metilo y otros haluros de alquilo; o cloropirrina; fluoruro de sulfurilo; bórax; ácido tánico.

45 (9) Antinutrientes selectivos, por ejemplo, pimetrocina; o flonicamida.

(10) Inhibidores de crecimiento de ácaros, por ejemplo, clofentezina, hexitiazox, etoxazoles.

(11) Disruptores microbianos de la membrana intestinal de insectos, tal como por ejemplo, *Bacillus thuringiensis* subespecie israelensis, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* subespecie aizawai, *Bacillus thuringiensis* subespecie kurstaki, *Bacillus thuringiensis* subespecie tenebrionis y proteínas de plantas BT, por ejemplo: Cry1Ab,

Cry1Ac, Cry1Fa, Cry2Ab, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34/35Ab1.

(12) Inhibidores de la fosforilación oxidativa, disruptores de ATP, tal como por ejemplo diafentiurona; o compuestos organoestánicos, por ejemplo, azociclotin, cihexatina y fenbutatina-óxido; o propargita; tetradifon.

5 (13) Desacopladores de la fosforilación oxidativa por interrupción del gradiente de protones H, tales como por ejemplo clorfenapir y DNOC.

(14) Antagonistas nicotínicos de receptor de acetilcolina, tales como por ejemplo, bensultap, cartap (-clorhidrato), tiociclam y tiosultap (sódico).

10 (15) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 0, tales como por ejemplo benzoilureas, por ejemplo, bistrifluron, clorofluazuron, diflubenzuron, flucicloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron y triflumuron.

(16) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, Tipo 1, tales como por ejemplo buprofezina.

(17) Principios activos nocivos para la piel, tales como por ejemplo ciromazina.

15 (18) Agonistas/disruptores de ecdisona, tales como por ejemplo diacilhidrazinas, por ejemplo cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida y tebufenozida.

(19) Agonistas octopaminérgicos, tales como por ejemplo amitraz.

(20) Inhibidores de transporte de electrones de complejo III, tales como por ejemplo hidrametilnona; acequinocilo; fluacipirim.

20 (21) Inhibidores de transporte de electrones de complejo I, por ejemplo del grupo de los METI-acaricidas, por ejemplo, fenazaquina, fenpiroximato, pirimidifeno, piridabeno, tebufenpirad, tolfenpirad; o rotenona (Derris).

(22) Bloqueadores de canal de sodio dependientes de tensión, por ejemplo, Indoxacarb; metaflumizona.

(23) Inhibidores de la acetil-CoA-carboxilasa, tales como por ejemplo derivados de ácidos tetrónicos, por ejemplo, espirodiclofeno y espiromesifeno; o derivados de ácido tetrámico, por ejemplo espirotetramato.

25 (24) Inhibidores de transporte de electrones de complejo IV, tales como por ejemplo fosfinas, por ejemplo, fosfuro de aluminio, fosfuro de calcio, fosfina, fosfuro de cinc; o cianuro.

(25) Inhibidores de transporte de electrones de complejo II, tales como por ejemplo cienopirafeno.

30 (28) Efectores de receptores de rianodina, tales como por ejemplo diamidas, por ejemplo flubendiamida, clorantraniliprol (rinaxipir), ciantraniliprol (ciazipir) así como 3-bromo-N-{2-bromo-4-cloro-6-[(1-ciclopropiletil)carbamoil]fenil}-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocida por el documento WO2005/077934) o 2-[3,5-dibromo-2-[[[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil]amino]benzoil]-1,2-dimetilhidrazincarboxilato de metilo (conocido por el documento WO2007/043677).

35 Otros principios activos con mecanismo de acción desconocido, tal como por ejemplo azadiractina, amidoflumet, benzoximato, bifenazato, quinometionat, criolita, ciflumetofeno, dicofol, fluensulfona (5-cloro-2-[(3,4,4-trifluorobut-3-en-1-il)sulfonil]-1,3-tiazol), flufenerim, piridalilo y pirifluquinazona; además preparaciones a base de Bacillus firmus (I-1582, BioNeem, Votivo) así como los siguientes compuestos:

40 4-[[[(6-bromopirid-3-il)metil](2-fluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento WO 2007/115644), 4-[[[(6-fluoropirid-3-il)metil](2,2-difluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento WO 2007/115644), 4-[[[(2-cloro-1,3-tiazol-5-il)metil](2-fluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento WO 2007/115644), 4-[[[(6-cloropirid-3-il)metil](2-fluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento WO 2007/115644), 4-[[[(6-cloropirid-3-il)metil](2,2-difluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento WO 2007/115644), 4-[[[(6-cloro-5-fluoropirid-3-il)metil](metil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento WO 2007/115643), 4-[[[(5,6-dicloropirid-3-il)metil](2-fluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento WO 2007/115646), 4-[[[(6-cloro-5-fluoropirid-3-il)metil](ciclopropil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento WO 2007/115643), 4-[[[(6-cloropirid-3-il)metil](ciclopropil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento EP-A-0 539 588), 4-[[[(6-cloropirid-3-il)metil](metil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento EP-A-0 539 588), 4-[[[(1R)-1-(6-cloropiridin-3-il)etil](metil)oxido-λ⁴-sulfaniliden]cianamida (conocida por el documento WO2007/149134) y sus diastereómeros 4-[[[(1R)-1-(6-cloropiridin-3-il)etil](metil)oxido-λ⁴-sulfaniliden]cianamida (A) y 4-[[[(1S)-1-(6-cloropiridin-3-il)etil](metil)oxido-λ⁴-sulfaniliden]cianamida (B) (así mismo conocidas por el documento WO2007/149134) así como sulfoxaflor (así mismo conocido por el documento WO2007/149134) y sus diastereómeros 4-[[[(R)-metil(oxido){(1R)-1-[6-(trifluorometil)piridin-3-il]etil]-λ⁴-sulfaniliden]cianamida (A1) y 4-[[[(S)-metil(oxido){(1S)-1-[6-(trifluorometil)piridin-3-il]etil]-λ⁴-sulfaniliden]cianamida (A2), designado como grupo A de

diastereómeros (conocido por los documentos WO 2010/074747, WO 2010/074751), [(R)-metil(oxido){(1S)-1-[6-(trifluorometil)piridin-3-il]etil}-λ⁴-sulfaniliden]cianamida (B1) y [(S)-metil(oxido){(1R)-1-[6-(trifluorometil)piridin-3-il]etil}-λ⁴-sulfaniliden]cianamida (B2), designado como grupo B de diastereómeros (así mismo conocido por los documentos WO 2010/074747, WO 2010/074751) y 11-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-12-hidroxi-1,4-dioxa-9-azadiespiro[4.2.4.2]tetradec-11-en-10-ona (conocida por el documento WO 2006/089633), 3-(4'-fluoro-2,4-dimetilbifenil-3-il)-4-hidroxi-8-oxa-1-azaespiro[4.5]dec-3-en-2-ona (conocida por el documento WO 2008/067911),

1-[2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil]-3-(trifluorometil)-1H-1,2,4-triazol-5-amina (conocida por el documento WO 2006/043635),

[[3S,4aR,12R,12aS,12bS)-3-[(ciclopropilcarbonil)oxi]-6,12-dihidroxi-4,12b-dimetil-11-oxo-9-(piridin-3-il)-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-decahidro-2H,11H-benzof[*f*]pirano[4,3-b]cromen-4-il]metilciclopropanocarboxilato (conocido por el documento WO 2006/129714),

2-ciano-3-(difluorometoxi)-N,N-dimetilbencenosulfonamida (conocida por el documento WO2006/056433),

2-ciano-3-(difluorometoxi)-N-metilbencenosulfonamida (conocida por el documento WO2006/100288), 2-ciano-3-(difluorometoxi)-N-etilbencenosulfonamida (conocida por el documento WO2005/035486), 4-(difluorometoxi)-N-etil-N-metil-1,2-benzotiazol-3-amin-1,1-dióxido (conocido por el documento WO2007/057407) y N-[1-(2,3-dimetilfenil)-2-(3,5-dimetilfenil)etil]-4,5-dihidro-1,3-tiazol-2-amina (conocida por el documento WO2008/104503).

En una forma de realización preferida de la invención se añaden a los agentes fitosanitarios para aumentar el efecto adicionalmente un promotor de la penetración. Como promotores de la penetración se tienen en cuenta por ejemplo también sustancias que promueven la compatibilidad de los compuestos de fórmula (I) en la capa de pulverización.

A estos pertenecen por ejemplo aceites minerales o vegetales. Como aceites se tienen en cuenta todos los aceites, opcionalmente modificados, que pueden emplearse habitualmente en agentes agroquímicos. A modo de ejemplo se mencionan aceite de girasol, aceite de nabina, aceite de oliva, aceite de ricino, aceite de colza, aceite de grano de maíz, aceite de semilla de algodón y aceite de soja o los ésteres de los aceites mencionados. Se prefieren aceite de colza, aceite de girasol y sus ésteres metílico o etílico, en particular éster metílico de aceite de colza.

La concentración de promotores de la penetración puede variarse en los agentes de acuerdo con la invención en un amplio intervalo. En el caso de los agentes fitosanitarios formulados, esta se encuentra en general en del 1 al 95 % en peso, preferentemente del 1 al 55 % en peso, de manera especialmente preferente el 15 - 40 % en peso. En los agentes listos para su uso (caldos de pulverización) la concentración se encuentra en general entre 0,1 y 10 g/l, preferentemente entre 0,5 y 5 g/l.

Los principios activos de acuerdo con la invención se pueden presentar además en el uso como insecticidas en sus formulaciones comerciales, así como en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones, mezclados con sinergistas. Los sinergistas son compuestos mediante los que se controla el efecto de los principios activos, sin que el sinergizador añadido deba ser activo eficaz por sí mismo.

Los principios activos de acuerdo con la invención se pueden presentar además en el uso como insecticidas en sus formulaciones comerciales, así como en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones, en mezclas con sustancias inhibitoras que reducen la degradación del principio activo después de la aplicación en el entorno de las plantas, sobre la superficie de las partes de la planta o en los tejidos de la planta.

El contenido en principio activo de las formas de aplicación preparadas a partir de las formulaciones comerciales puede variar en amplios intervalos. La concentración de principio activo de las formas de aplicación puede encontrarse del 0,0000001 hasta el 95 % en peso de principio activo, preferentemente entre el 0,00001 y el 1 % en peso.

La aplicación tiene lugar en uno de los modos habituales adaptados a las formas de aplicación.

De acuerdo con la invención se pueden tratar todas las plantas y partes de las plantas. Por plantas se entienden, a este respecto, todas las plantas y poblaciones de plantas tales como plantas silvestres deseadas y no deseadas o plantas de cultivo (incluyendo plantas de cultivo de aparición natural). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que pueden obtenerse mediante procedimientos de cultivo y optimización convencionales o mediante procedimientos biotecnológicos y de ingeniería genética o combinaciones de estos procedimientos, incluyendo las plantas transgénicas e incluyendo las variedades de plantas no protegibles o protegibles por el derecho de protección de variedades. A modo de ejemplo se mencionan las plantas de cultivo importantes, tales como cereales (trigo, arroz), maíz, soja, patata, remolacha azucarera, tomates, guisantes y otras variedades de verdura, algodón, tabaco, colza, así como plantas frutales (con las frutas manzanas, peras, frutas cítricas y uvas). Por partes de las plantas deben entenderse todas las partes y órganos de la planta aéreos y subterráneos, como brote, hoja, flor y raíz, citándose a modo de ejemplo hojas, agujas, tallos, troncos, flores, cuerpos fructíferos, frutos y semillas, así como raíces, tubérculos y rizomas. Pertenecen a las partes de las plantas también productos de cosecha así como material de reproducción vegetativa y generativa, por ejemplo esquejes, tubérculos, rizomas, ramas y semillas.

El tratamiento de acuerdo con la invención de plantas y partes de las plantas con los principios activos se realiza directamente o mediante exposición a su entorno, espacio vital o espacio de almacenamiento según los procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo, mediante inmersión, pulverización, vaporización, nebulización, dispersión, deposición, inyección y en material reproductivo, especialmente en semillas, además mediante envolturas de una o varias capas.

Como ya se ha mencionado anteriormente, pueden tratarse según la invención todas las plantas y sus partes. En una forma de realización preferida, se tratan tipos de plantas y especies de plantas de origen silvestre u obtenidos mediante procedimientos de cultivo biológico convencional, como cruzamiento o fusión de protoplastos, así como sus partes. En una forma de realización preferida adicional, se tratan plantas transgénicas y tipos de plantas que se han obtenido mediante procedimientos de ingeniería genética dado el caso en combinación con procedimientos convencionales (organismos modificados genéticamente) y sus partes. Los términos "partes" o "partes de las plantas" o "partes de planta" se han ilustrado anteriormente.

De manera especialmente preferente, se tratan plantas según la invención de las especies de plantas respectivamente comerciales o que se encuentran en uso. Por especies de plantas, se entienden plantas con nuevas propiedades ("rasgos"), que se crían tanto mediante cultivo convencional, mediante mutagénesis o mediante técnicas de ADN recombinante. Éstas pueden ser especies, biotipos y genotipos.

Según el tipo de planta o especie de planta, su hábitat y condiciones de crecimiento (suelo, clima, periodo vegetativo, alimentación), pueden aparecer también efectos superaditivos ("sinérgicos") mediante el tratamiento de acuerdo con la invención. Así, son posibles, por ejemplo, cantidades de aplicación reducidas y/o ampliaciones del espectro de acción y/o un reforzamiento del efecto de las sustancias y agentes utilizables de acuerdo con la invención, mejor crecimiento de plantas, mayor tolerancia frente a altas o bajas temperaturas, mayor tolerancia a sequía o frente al contenido de agua o sales del suelo, mayor rendimiento de floración, recolección facilitada, aceleramiento de la maduración, mayores rendimientos de cosecha, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos de cosecha, mayor capacidad de almacenamiento y/o procesabilidad de los productos de cosecha, que superan los efectos que realmente se esperan.

Pertencen a las plantas o variedades de plantas transgénicas preferidas según la invención para tratar (obtenidas por ingeniería genética) todas las plantas que mediante la modificación por ingeniería genética han obtenido material genético que confiere a estas plantas propiedades valiosas especialmente ventajosas ("rasgos"). Son ejemplos de dichas propiedades mejor crecimiento de planta, tolerancia elevada frente a temperaturas altas o bajas, tolerancia aumentada frente a sequedad o frente al contenido de sal de agua o suelo, rendimiento de floración elevado, recolección facilitada, aceleramiento de la maduración, mayores rendimientos de cosecha, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos de cosecha, mayor capacidad de almacenamiento y/o procesabilidad de los productos de cosecha. Son ejemplos adicionales y especialmente destacados de dichas propiedades una defensa elevada de las plantas frente a plagas animales y microbianas, como frente a insectos, ácaros, hongos fitopatógenicos, bacterias y/o virus, así como una tolerancia elevada de las plantas frente a determinados principios activos herbicidas. Como ejemplos de plantas transgénicas, se citan las plantas de cultivo importantes como cereales (trigo, arroz), maíz, soja, patata, remolacha, tomate, guisante y otras especies de verduras, algodón, tabaco, colza, así como plantas frutales (con los frutos manzana, pera, frutos cítricos y uvas de vino), siendo especialmente destacadas maíz, soja, patata, algodón, tabaco y colza. Como propiedades ("rasgos"), se destacan especialmente la defensa elevada de las plantas frente a insectos, arácnidos, nematodos y caracoles, especialmente por aquellas toxinas generadas en las plantas mediante el material genético de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo, mediante los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF, así como sus combinaciones) (en adelante, "plantas Bt"). Como propiedades ("rasgos"), se destacan también especialmente la defensa elevada de las plantas frente a hongos, bacterias y virus mediante resistencia sistémica adquirida (SAR), sistemina, fitoalexinas, desencadenantes, así como genes de resistencia y las correspondientes proteínas y toxinas expresadas. Como propiedades ("rasgos"), se destacan especialmente también la tolerancia elevada de las plantas frente a determinados principios activos herbicidas, por ejemplo, imidazolinonas, sulfonilureas, glifosato o fosfinotricina (por ejemplo, gen "PAT"). Los genes que confieren las propiedades respectivamente deseadas ("rasgos") pueden aparecer también en combinaciones entre sí en las plantas transgénicas. Como ejemplos de "plantas Bt", se citan variedades de maíz, variedades de algodón, variedades de soja y variedades de patata, que se comercializan con las referencias comerciales YIELD GARD® (por ejemplo, maíz, algodón, soja), KnockOut® (por ejemplo, maíz), StarLink® (por ejemplo, maíz), Bollgard® (algodón), Nucotn® (algodón) y NewLeaf® (patata). Como ejemplos de plantas tolerantes a herbicida, se citan variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja que se comercializan con las referencias comerciales Roundup Ready® (tolerancia frente a glifosato, por ejemplo, maíz, algodón, soja), Liberty Link® (tolerancia frente a fosfinotricina, por ejemplo, colza), IMI® (tolerancia frente a imidazolinonas) y STS® (tolerancia frente a sulfonilureas, por ejemplo, maíz). Como plantas resistentes a herbicida (criadas convencionalmente con tolerancia a herbicida), se citan también las especies comercializadas con la referencia Clearfield® (por ejemplo, maíz). Por supuesto, estas indicaciones son válidas también para las variedades de plantas desarrolladas en el futuro o presentes en el mercado futuro con estas u otras propiedades genéticas desarrolladas en el futuro ("rasgos").

Las plantas citadas se pueden tratar de forma especialmente ventajosa de acuerdo con la invención con los compuestos de fórmula general (I) o las mezclas de principios activos de acuerdo con la invención. Los intervalos

preferidos dados anteriormente en los principios activos o mezclas son también válidos para el tratamiento de estas plantas. Se destaca especialmente el tratamiento de plantas con los compuestos o mezclas citados especialmente en el presente texto.

5 Los principios activos de acuerdo con la invención actúan no solo contra plagas de plantas, higiene y existencias, sino también contra parásitos animales del sector médico veterinario (ecto- y endoparásitos) como garrapatas duras, garrapatas blandas, ácaros de la sarna, ácaros chupadores, moscas (picadoras y chupadoras), larvas de moscas parásitas, piojos, malófagos de piel, malófagos de pluma y pulgas. Pertenecen a estos parásitos:

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

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

15 Del orden de los dípteros y los subórdenes nematóceros, así como *Brachycerina*, por ejemplo, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp., *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides* spp., *Chrysops* spp., *Hybomitra* spp., *Atilotus* spp., *Tabanus* spp., *Haematopota* spp., *Philipomyia* spp., *Braula* spp., *Musca* spp., *Hidrotaea* spp., *Stomoxis* spp., *Haematobia* spp., *Morellia* spp., *Fannia* spp., *Glossina* spp., *Calliphora* spp., *Lucilia* spp., *Chrysomyia* spp., *Wohlfahrtia* spp., *Sarcophaga* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Gasterophilus* spp., *Hippobosca* spp., *Lipoptena* spp., *Melophagus* spp..

20 Del orden de los sifonápteros, por ejemplo, *Pulex* spp., *Ctenocephalides* spp. (*Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*), *Xenopsilla* spp., *Ceratophyllus* spp..

Del orden de los heterópteros, por ejemplo, *Cimex* spp., *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongilus* spp..

Del orden de los blatarios, por ejemplo, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blattella germanica*, *Supella* spp..

25 De la subclase de los ácaros (*Acarina*) y los órdenes de los *Meta-* así como *Mesostigmata*, por ejemplo, *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., *Ixodes* spp., *Amblyomma* spp., *Boophilus* spp., *Dermacentor* spp., *Haemophysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Rhipicephalus* spp., *Dermanyssus* spp., *Raillietia* spp., *Pneumonyssus* spp., *Sternostoma* spp., *Varroa* spp..

30 Del orden de los actinédidos (*Prostigmata*) y acarídidos (*Astigmata*), por ejemplo, *Acarapis* spp., *Cheiletiella* spp., *Ornithocheiletiella* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Listrophorus* spp., *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp., *Laminosioptes* spp..

35 Los principios activos de acuerdo con la invención de fórmula (I) son adecuados también para combatir artrópodos que atacan a animales útiles agrícolas como, por ejemplo, vacas, ovejas, cabras, caballos, cerdos, asnos, camellos, búfalos, conejos, gallinas, pavos, patos, gansos, abejas, mascotas tales como, por ejemplo, perros, gatos, aves domésticas, peces de acuario, así como los denominados animales de ensayo como, por ejemplo, hámsteres, conejillos de indias, ratas y ratones. Mediante el combate de estos artrópodos, deben reducirse los fallecimientos y reducciones de rendimiento (de carne, leche, lana, pieles, huevos, miel, etc.), de modo que mediante el uso de los principios activos de acuerdo con la invención es posible una cría de animales más económica y sencilla.

40 La aplicación de los principios activos de acuerdo con la invención se realiza de modo conocido en el sector veterinario y en la cría de animales mediante administración por vía entérica en forma de, por ejemplo, comprimidos, cápsulas, pociones, brebajes, gránulos, pastas, bolos, procedimiento de alimentación continua, supositorios, mediante administración por vía parenteral como, por ejemplo, mediante inyecciones (intramuscular, subcutánea, intravenosa, intraperitoneal, entre otras), implantes, mediante administración por vía nasal, mediante aplicación dérmica en forma, por ejemplo, de inmersión o baño (remojo), pulverización (pulverizador), vertido (vertido dorsal y en la cruz), lavado, empolvado, así como con ayuda de cuerpos de moldeo que contienen principios activos como collares, marcas en la oreja, marcas en el rabo, brazaletes, ronzales, dispositivos de marcaje, etc.

45 En la aplicación para ganado, aves de corral, mascotas, etc., se puede usar los principios activos de fórmula (I) como formulaciones (por ejemplo, polvos, emulsiones, agentes fluidos) que contienen el principio activo en una cantidad del 1 al 80 % en peso, directamente o después de dilución a 100 a 10.000 veces, o se usan como baño químico.

50 Además se ha encontrado que los compuestos de acuerdo con la invención muestran un elevado efecto insecticida frente a insectos que degradan materiales industriales.

A modo de ejemplo y preferentemente, sin embargo sin limitación, se citan los siguientes insectos:

escarabajos como *Hylotrupes bajulus*, *Chlorophorus pilosis*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinus pecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Ernobius mollis*, *Priobium carpini*, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*, *Lyctus*

planicollis, *Lyctus linearis*, *Lyctus pubescens*, *Trogoxylon aequale*, *Minthes rugicollis*, *Xyleborus spec.*, *Tryptodendron spec.*, *Apate monachus*, *Bostrychus capucinus*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxylon spec.*, *Dinoderus minutus*;

himenópteros como *Sirex juvencus*, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus*, *Urocerus augur*;

- 5 termitas como *Kaloterme flavicollis*, *Cryptoterme brevis*, *Heteroterme indicola*, *Reticuliterme flavipes*, *Reticuliterme santonensis*, *Reticuliterme lucifugus*, *Mastoterme darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis*, *Coptoterme formosanus*;

lepismas como *Lepisma saccharina*.

- 10 Por materiales industriales se entiende en el presente contexto materiales no vivos como, por ejemplo, plásticos, adhesivos, colas, papeles y cartones, cuero, madera, productos del procesamiento de la madera y agentes de recubrimiento.

Los agentes listos para uso pueden contener dado el caso otros insecticidas y dado el caso uno o varios fungicidas.

En lo que respecta a asociados de mezcla adicionales posibles se hace referencia a los insecticidas y fungicidas citados anteriormente.

- 15 Al mismo tiempo se pueden usar los compuestos de acuerdo con la invención para la protección de objetos contra la incrustación, especialmente cascos de embarcaciones, tamices, redes, edificios, atracaderos y balizas que se encuentren en contacto con agua de mar o salobre.

Además se pueden usar los compuestos de acuerdo con la invención solos o en combinaciones con otros principios activos como agentes anti-incrustación.

- 20 Los principios activos son adecuados también para combatir parásitos animales en protección del hogar, higiene y provisiones, especialmente insectos, arácnidos y ácaros que se originan en espacios cerrados como, por ejemplo, viviendas, naves de fábricas, oficinas, cabinas de vehículos, entre otros. Estos se pueden usar para combatir estos parásitos solos o en combinación con otros principios activos y coadyuvantes en productos insecticidas para el hogar. Estos son efectivos contra especies sensibles y resistentes así como contra todos los estados de desarrollo.
- 25 A estos parásitos pertenecen:

Del orden de los escorpionideos, por ejemplo, *Buthus occitanus*.

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

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

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

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

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

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

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

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

- 40 Del orden de los *Saltatoria*, por ejemplo, *Acheta domesticus*.

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

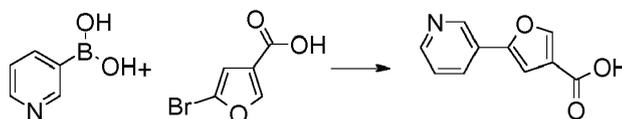
- 15 La aplicación en el campo de los insecticidas domésticos se realiza solo o en combinación con otros principios activos adecuados como ésteres de ácido fosfórico, carbamatos, piretroides, neonicotinoides, reguladores del crecimiento o principios activos de otras clases de insecticidas conocidas.

- 20 La aplicación se realiza en aerosoles, pulverizadores sin presión, por ejemplo, pulverizadores de bombeo y atomización, nebulizadores automáticos, nebulizadores, espumas, geles, productos de vaporización con placas vaporizadoras de celulosa o plástico, vaporizadores de líquido, vaporizadores de gel y membrana, vaporizadores propulsores, sistemas de vaporización sin energía o pasivos, papeles antipolillas, saquitos antipolillas y geles antipolillas, en forma de gránulos o polvos, en cebos dispersados o trampas con cebo.

Ejemplos de preparación

Ejemplo E: 5-(Piridin-3-il)-N-(2,2,2-trifluoroetil)-furan-3-carboxamida

- 25 *etapa 1: Ácido 5-(piridin-3-il)-furan-3-carboxílico*

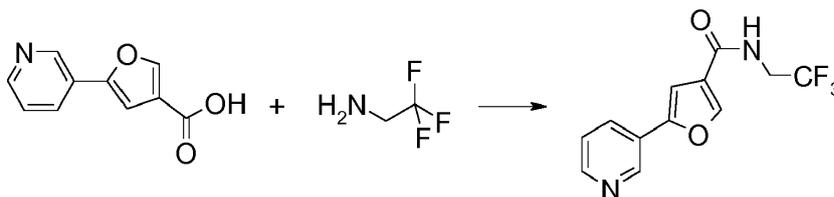


- 30 Se agitaron 31 mg (0,17 mmoles) de cloruro de paladio (II) y 250 mg (0,95 mmoles) de trifenilfosfano con 0,5 g de cloruro de tetrabutilamonio en 50 ml de DMF bajo argón 5 min a 95 °C, entonces se mezcla con una solución en DMF de 6,20 g (50,4 mmoles) de ácido piridin-3-bórico (obtenido según Tetrahedron Lett. 2002, 4285 o J. Org. Chem. 2002, 5394) y 8,20 g (42,9 mmoles) de ácido 5-bromo-furano-3-carboxílico (impurificado, obtenido según Bull. Chem. Soc. France 1971, 990) así como 16,0 g (114 mmoles) de carbonato de potasio como solución en 30 ml de agua y se agita durante 16 horas a 95 °C bajo argón. Se mezcló con ácido cítrico acuoso, se concentró, se disolvió en hidróxido de sodio diluido, cloruro de sodio acuoso, *n*-butanol, se mezcló con cloruro de sodio hasta saturación, se extrajo tres veces con *n*-butanol y se evaporaron las fases orgánicas reunidas. Se mezcló con 400 ml de metanol, se agitó a 40 °C, se filtró, se concentró hasta turbidez, se succionó el precipitado y se repitió el procedimiento con el filtrado. Las tortas del filtro reunidas se secaron en el evaporado rotatorio y se purificaron mediante cromatografía sobre gel de sílice (eluyente: acetona / MTBE 30 % → acetona / metanol 20 %).

Rendimiento 1,68 g (15 % d. t.); HPLC-EM: logP (HCOOH) = 0,07; Masa (m/z): 190,1 (M+H)⁺;

¹H-RMN (d₆-DMSO): 7,30 (s, 1H), 7,45 (m, 1H), 8,10 (d, 1H), 8,30 (s, 1H), 8,50 (m, 1H), 8,95 ppm (s, 1H).

- 40 *Etapa 2 : 5-(Piridin-3-il)-N-(2,2,2-trifluoroetil)-furan-3-carboxamida*



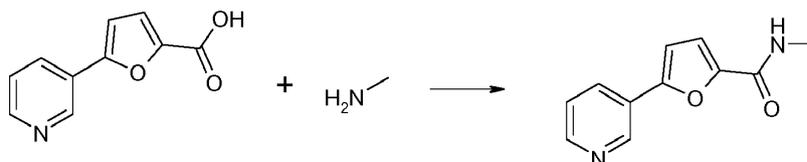
Se disolvieron 245 mg (1,30 mmoles) de ácido 5-(piridin-3-il)-furan-3-carboxílico en acetonitrilo con 3,00 ml (17 mmoles) de *N,N*-diisopropiletilamina y se mezclaron con 0,52 g (2 mmoles) de BOP-Cl. Después de 20 minutos se

mezcló con 0,30 ml (3,90 mmoles) de 2,2,2-trifluoroetilamina, se agitó la mezcla durante 16 horas, entonces se concentró, se mezcló con acetato de etilo, cloruro de sodio acuoso y tampón fosfato pH 7 y se extrajo dos veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas reunidas se secaron con Na₂SO₄ y se concentraron. El residuo se purificó mediante cromatografía sobre gel de sílice (eluyente: ciclohexano / acetona).

5 Rendimiento: 30,0 mg (7 % d. t.); HPLC-EM: logP (HCOOH) = 1,13; Masa (m/z): 271,0 (M+H)⁺;

¹H-RMN (CD₃CN): 4,05 (m, 2H), 7,20 (s, 1H), 7,25 (a, 1H), 7,40 (m, 1H), 8,00 (m, 1H), 8,15 (s, 1H), 8,55 (m, 1H), 8,95 ppm (s, 1H).

Ejemplo G: *N*-Metil-5-(piridin-3-il)-furano-2-carboxamida



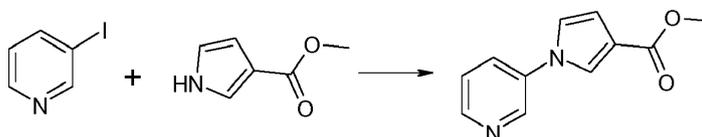
10 Se dispuso previamente ácido 5-(piridin-3-il)-furano-2-carboxílico (200 mg, 1,06 mmoles) (preparación véase el documento US 3.927.008) en 30 ml de dioxano y se mezcló con clorhidrato de *N*-(3-dimetilaminopropil)-*N'*-etil-carbodiimida (253 mg, 1,32 mmoles). Con agitación se añadió gota a gota una solución 2 M de metilamina en tetrahidrofurano (41,0 mg, 1,32 mmoles). Se agitó durante 3 horas y se añadió entonces 1 ml de agua. La mezcla de reacción se agitó durante la noche a temperatura ambiente y se eliminó el disolvente a continuación a presión reducida. El residuo se recogió en agua y se extrajo con acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato de magnesio, el disolvente se eliminó en el evaporador rotatorio y el residuo se sometió a cromatografía sobre gel de sílice (eluyente: ciclohexano, acetato de etilo, mezcla 1:1).

15 Rendimiento: 171 mg (75 % d. t.); HPLC-EM: logP (HCOOH) = 0,42; Masa (m/z): 203,1 (M+H)⁺;

20 ¹H-RMN (d₆-DMSO): 2,56 (d, 3H), 7,50-7,55 (m, 2H), 7,66 (m, 1H), 8,30 (m, 1H), 8,80 (m, 1H), 9,23 (m, 1H), 9,32 ppm (m, 1H).

Ejemplo J: 1-(Piridin-3-il)-*N*-(2,2,2-trifluoroetil)-pirrol-3-carboxamida

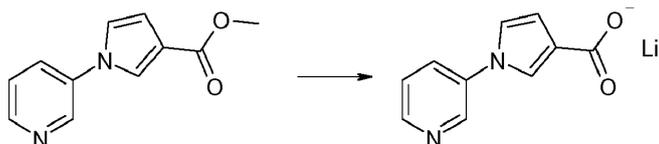
Etapla 1: Éster metílico de ácido 1-(piridin-3-il)-pirrol-3-carboxílico



25 Bajo argón se mezclaron 250 mg (1,18 mmoles) de 3-yodopiridina con 123 mg (0,98 mmoles) de éster metílico de ácido 1*H*-pirrol-3-carboxílico, 28,1 mg (0,14 mmoles) de yoduro de Cu (I), 21,5 mg (0,14 mmoles) de 8-hidroxiquinolina y 150 mg (1,08 mmoles) de carbonato de potasio en 1 ml de dimetilformamida y se hicieron reaccionar en el reactor de microondas. Después de 40 minutos (200 vatios, 150 °C) se enfrió la mezcla de reacción y se filtró a través de un cartucho de gel de sílice de 1 g, el cartucho se lavó una vez más con dimetilformamida, se reunieron las soluciones y se concentró a vacío. El residuo se mezcló con éster acético/agua y se sacudió. La fase orgánica se separó y se secó sobre sulfato de sodio. Tras concentrarse la solución a vacío se obtuvo el producto.

30 Rendimiento: 146 mg (85 % de pureza, 52 % d. t.); HPLC-EM: logP (HCOOH) = 1,26; Masa (m/z): 203,0 (M+H)⁺.

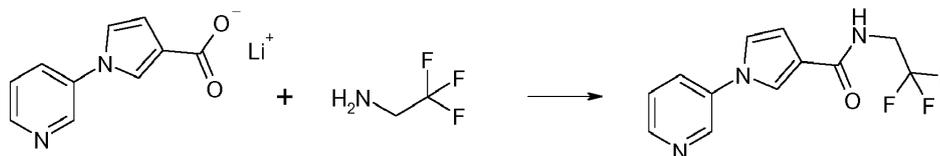
Etapla 2: Sal de litio del ácido 1-(piridin-3-il)-pirrol-3-carboxílico



35 Se dispusieron previamente 147 mg (720 μmoles) de éster metílico de ácido 1-(piridin-3-il)-pirrol-3-carboxílico en 1 ml de tetrahidrofurano y se mezcló con una solución de 88,8 mg (3,62 mmoles) de hidróxido de litio en un poco de metanol/agua (1:1). La solución formada en primer lugar después de la adición de la solución de hidróxido de litio estaba claramente en disolución. Después de 48 horas a temperatura ambiente se agitó durante 15 horas a 50 °C. Después de concentrar a vacío se obtuvo la sal de litio bruta, que se empleó sin purificación adicional en la siguiente etapa de reacción.

40 Rendimiento: 149 mg (100 % d. t.)

Etapa 3: 1-(Piridin-3-il)-N-(2,2,2-trifluoroetil)-pirrol-3-carboxamida



5 Se disolvieron 149 mg (760 μ moles) de sal de litio del ácido 1-(piridin-3-il)-pirrol-3-carboxílico en 3 ml de *N,N*-dimetilformamida y se agitó durante 10 minutos a temperatura ambiente. Después de la adición de 82,0 mg (8,30 mmoles) de trifluoroetilamina y una solución de *N,N*-diisopropiletilamina en dimetilformamida se agitó durante 15 horas a temperatura ambiente. Tras concentrarse la solución de reacción, se purificó el residuo restante por medio de cromatografía de presión media.

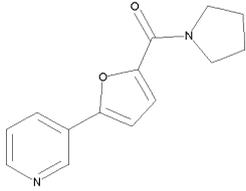
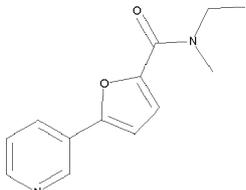
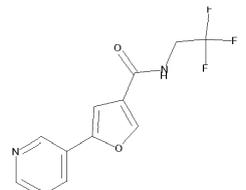
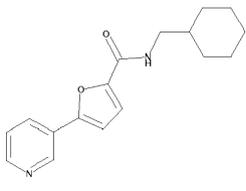
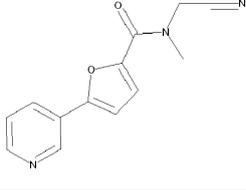
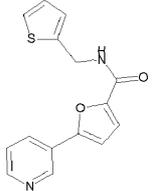
Rendimiento: 101 mg (10 % d. t.); HPLC-EM: logP (HCOOH) = 1,24; Masa (m/z): 270,0 (M+H)⁺;

¹H-RMN (d₆-DMSO): 4,05 (m, 2H), 6,81 (m, 1H), 7,50-7,55 (m, 2H), 8,07 (m, 2H), 8,50 (m, 2H), 8,90 ppm (m, 1H).

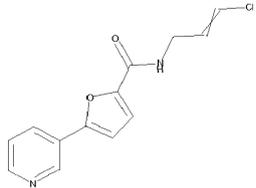
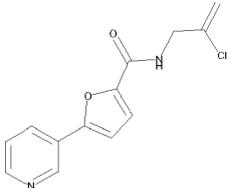
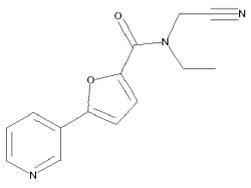
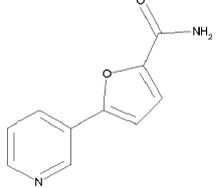
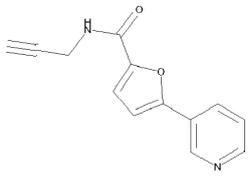
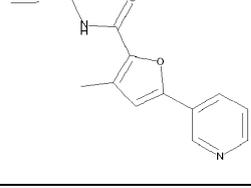
10 De manera análoga o de acuerdo con los datos generales para la preparación se prepararon los compuestos expuestos en las siguiente Tabla:

Número de compuesto	Estructura	logP ¹ (HCO ₂ H)	(M+H) ⁺	Datos de RMN ²
6		1,23	245,1	¹ H-RMN (CD ₃ CN): 1,30 (a, 6H), 3,60 (a, 4H), 6,95 (d, 1H), 7,05 (d, 1H), 7,40 (m, 1H), 8,05 (m, 1H), 8,55 (m, 1H), 8,95 ppm (s, 1H).
7		0,51	217,1	¹ H-RMN (CD ₃ CN): 3,00-3,40 (a, 6H), 6,95 (d, 1H), 7,05 (d, 1H), 7,40 (m, 1H), 8,05 (m, 1H), 8,55 (m, 1H), 8,95 ppm (m, 1H).
8		1,36	257,0	¹ H-RMN (CD ₃ CN): 0,25 (m, 1H), 0,35 (m, 1H), 0,45 (m, 1H), 0,55 (m, 1H), 1,05 (m, 1H), 1,30 (m, 3H), 3,45 (m, 1H), 6,95 (m, 1H), 7,10 (m, 2H), 7,40 (m, 1H), 8,15 (m, 1H), 8,55 (m, 1H), 9,05 ppm (m, 1H).
9		0,43	228,1	¹ H-RMN (CD ₃ CN): 4,25 (m, 2H), 7,00 (d, 1H), 7,20 (d, 1H), 7,45 (m, 1H), 7,70 (a, 1H), 8,15 (d, 1H), 8,55 (m, 1H), 9,05 ppm (s, 1H).

(continuación)

Número de compuesto	Estructura	logP ¹ (HCO ₂ H)	(M+H) ⁺	Datos de RMN ²
10		1,06	243,2	¹ H-RMN (CD ₃ CN): 1,90 (m, 4H), 3,55 (m, 2H), 3,90 (m, 2H), 7,00 (d, 1H), 7,01 (d, 1H), 7,40 (m, 1H), 8,05 (m, 1H), 8,55 (m, 1H), 9,00 ppm (s, 1H).
11		1,00	231,1	¹ H-RMN (CD ₃ CN): 1,20 (a, 3H), 3,10 (a, 3H), 3,60 (a, 2H), 6,95 (d, 1H), 7,05 (d, 1H), 7,40 (m, 1H), 8,05 (m, 1H), 8,55 (m, 1H), 8,95 ppm (s, 1H).
12 (Ejemplo E)		1,13	271,0	¹ H-RMN (CD ₃ CN): 4,05 (m, 2H), 7,20 (s, 1H), 7,25 (a, 1H), 7,40 (m, 1H), 8,00 (m, 1H), 8,15 (s, 1H), 8,55 (m, 1H), 8,95 ppm (s, 1H).
15		2,02	285,2	¹ H-RMN (CD ₃ CN): 1,00-1,90 (m, 11H), 3,20 (m, 2H), 6,90 (d, 1H), 7,10 (d, 1H), 7,40 (m, 1H), 8,10 (m, 1H), 8,50 (m, 1H), 9,00 ppm (s, 1H).
16		0,72	242,1	¹ H-RMN (CD ₃ CN): 3,35 (s, 3H), 4,50 (s, 2H), 7,00 (d, 1H), 7,20 (d, 1H), 7,40 (m, 1H), 8,05 (m, 1H), 8,55 (m, 1H), 9,00 ppm (s, 1H).
17		1,46	285,1	¹ H-RMN (CD ₃ CN): 4,70 (m, 2H), 7,00 (m, 2H), 7,05 (m, 1H), 7,20 (m, 1H), 7,30 (m, 1H), 7,40 (m, 1H), 7,80 (a, 1H), 8,10 (m, 1H), 8,50 (m, 1H), 9,00 ppm (s, 1H).

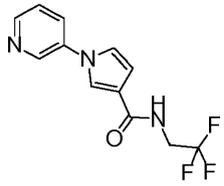
(continuación)

Número de compuesto	Estructura	logP ¹ (HCO ₂ H)	(M+H) ⁺	Datos de RMN ²
18		1,27; 1,33 (mezcla isomérica)	263,1	¹ H-RMN (CD ₃ CN): 3,95 (m, 1H), 4,15 (m, 1H), 5,90-6,10 (m, 1H), 6,20-6,30 (m, 1H), 7,00 (d, 1H), 7,10 (d, 1H), 7,40 (m, 2H), 8,10 (m, 1H), 8,50 (m, 1H), 9,00 ppm (s, 1H)
19		1,28	263,1	¹ H-RMN (CD ₃ CN): 4,10 (m, 2H), 5,35 (s, 1H), 5,50 (m, 1H), 7,00 (d, 1H), 7,10 (d, 1H), 7,45 (m, 1H), 7,60 (a, 1H), 8,15 (m, 1H), 8,55 (m, 1H), 9,05 ppm (s, 1H).
20		1,11	256,0	¹ H-RMN (CD ₃ CN): 1,35 (t, 3H), 3,80 (a, 2H), 4,40 (a, 2H), 7,00 (d, 1H), 7,20 (d, 1H), 7,45 (m, 1H), 8,10 (d, 1H), 8,6 (m, 1H), 9,00 ppm (s, 1H).
21		-	189,1	¹ H-RMN (CD ₃ CN): 6,00 (a, 1H), 6,90 (a, 1H), 7,00 (d, 1H), 7,10 (d, 1H), 7,40 (m, 1H), 8,10 (m, 1H), 8,55 (m, 1H), 9,00 ppm (s, 1H).
22		0,72	227,1	¹ H-RMN (CD ₃ CN): 2,40 (s, 1H), 4,10 (m, 2H), 7,00 (d, 1H), 7,15 (d, 1H), 7,40 (m, 2H), 8,10 (m, 1H), 8,55 (m, 1H), 9,00 ppm (s, 1H).
23		1,07	242,1	¹ H-RMN (CD ₃ CN): 2,40 (s, 3H), 4,20 (m, 2H), 6,85 (s, 1H), 7,40 (m, 1H), 7,50 (a, 1H), 8,10 (d, 1H), 8,55 (m, 1H), 9,00 ppm (s, 1H).

(continuación)

Número de compuesto	Estructura	logP ¹ (HCO ₂ H)	(M+H) ⁺	Datos de RMN ²
24		1,58	259,2	¹ H-RMN (CD ₃ CN): 1,25 (t, 6H), 2,25 (s, 3H), 3,50 (q, 4H), 6,80 (s, 1H), 7,35 (m, 1H), 8,00 (d, 1H), 8,50 (m, 1H), 8,90 ppm (s, 1H).
26		1,49	332,9	¹ H-RMN (CD ₃ CN): 4,25 (m, 2H), 7,00 (d, 1H), 7,20 (d, 1H), 7,40 (m, 1H), 7,60 (a, 1H), 8,10 (d, 1H), 8,55 (m, 1H), 9,05 ppm (s, 1H).
27		1,69	368,0	¹ H-RMN (CD ₃ CN): 3,35 (m, 2H), 3,80 (m, 2H), 7,00 (d, 1H), 7,10 (d, 1H), 7,40 (m, 2H), 7,90 (m, 1H), 8,15 (m, 1H), 8,50 (m, 1H), 9,00 ppm (s, 1H).
30		1,39	243,2	¹ H-RMN (d ₆ -DMSO): 0,50 (m, 2H), 0,80 (m, 2H), 1,00 (m, 1H), 3,13 (m, 2H), 7,50-7,55 (m, 2H), 7,65 (m, 1H), 8,32 (m, 1H), 8,75 (m, 1H), 9,20 (m, 1H), 9,33 ppm (m, 1H)
31 (Ejemplo G)		0,42	203,1	¹ H-RMN (d ₆ -DMSO): 2,56 (d, 3H), 7,50-7,55 (m, 2H), 7,66 (m, 1H), 8,30 (m, 1H), 8,80 (m, 1H), 9,23 (m, 1H), 9,32 ppm (m, 1H).
32		0,83	231,1	-

(continuación)

Número de compuesto	Estructura	logP ¹ (HCO ₂ H)	(M+H) ⁺	Datos de RMN ²
36 (Ejemplo J)		1,24	270,0	¹ H-RMN (d ₆ -DMSO): 4,05 (m, 2H), 6,81 (m, 1H), 7,50-7,55 (m, 2H), 8,07 (m, 2H), 8,50 (m, 2H), 8,90 ppm (m, 1H).

1 Descripción de procedimientos para la determinación de los valores de logP y detección de masas

La determinación de los valores de logP indicados en la Tabla tuvo lugar de acuerdo la directiva CEE 79/831 anexo V.A8 mediante HPLC (*High Performance Liquid Chromatography*) en una columna de fase inversa (C 18).
5 Temperatura: 55 °C.

Eluyentes para la determinación en el intervalo ácido (pH 3,4):

Eluyente A: acetonitrilo + 1 ml de ácido fórmico/L. Eluyente B: agua + 0,9 ml de ácido fórmico/l.

Gradiente: de 10 % de eluyente A / 90 % de eluyente B a 95 % de eluyente A / 5 % de eluyente B en 4,25 min.

10 La calibración tuvo lugar con alcan-2-onas no ramificadas (con 3 a 16 átomos de carbono), cuyos valores de logP son conocidos (determinación de los valores de logP por medio de los tiempos de retención mediante interpolación lineal entre dos alcanonas sucesivas). Los valores de λ_{max} se determinaron por medio de los espectros UV de 200 nm a 400 nm en los máximos de las señales cromatográficas. La detección de masas (M⁺, m/z) tuvo lugar a través de un espectrómetro de masas Agilent MSD.

2 Medición de los espectros de RMN

15 Los espectros de RMN se determinaron con un aparato Bruker Avance 400, equipado con un cabezal de muestras de flujo (60 μ l de volumen). Como disolvente se usaron CD₃CN, CDCl₃ o d₆-DMSO, empleándose como referencia tetrametilsilano (0,00 ppm). En casos individuales se determinaron los espectros de RMN con un aparato Bruker Avance II 600 o un aparato Varian Unity Inova 400.

20 Las escisión de las señales se describió tal como sigue: s (singlete), d (doblete), t (triplete), q (cuadruplete), quin (quintete), m (multiplete), br (ancho).

Ejemplos biológicos

Prueba de *Myzus persicae* (tratamiento por pulverización)

Disolventes: 78 partes en peso de acetona
1,5 partes en peso dimetilformamida

Emulsionante: 0,5 partes en peso alquilarilpoliglicoléter

25 Para la preparación de una preparación de principio activo conveniente se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua que contiene emulsionante hasta la concentración deseada. Discos de hoja de col china (*Brassica pekinensis*), que estaban infestadas por todos los estadios del pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*), se pulverizan con una preparación principio activo de la concentración deseada.

30 Después de 6 días se determina el efecto en %. A este respecto, el 100 % significa que todos los pulgones habían muerto; el 0 % significa que ningún pulgón había muerto.

En esta prueba mostraron, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación un efecto del 100 % con una cantidad de aplicación de 500 g/ha: 6, 7, 9, 11, 17, 19, 20, 22, 23, 30, 31, 32.

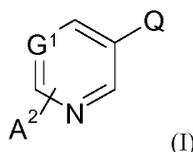
En esta prueba mostraron por ejemplo los siguientes compuestos de los Ejemplos de preparación un efecto del 90 % con una cantidad de aplicación de 500 g/ha: 12, 16, 18, 24, 36.

ES 2 603 032 T3

En esta prueba mostraron por ejemplo los siguientes compuestos de los Ejemplos de preparación un efecto del 80 % con una cantidad de aplicación de 500 g/ha: 8, 27.

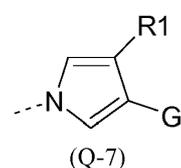
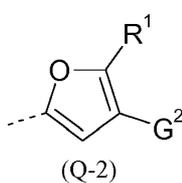
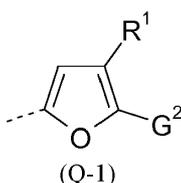
REIVINDICACIONES

1. Uso de compuestos de fórmula (I)



en la que

- 5 G¹ representa C-A¹,
 A¹ representa hidrógeno,
 A² representa hidrógeno,
 Q representa uno de los siguientes restos



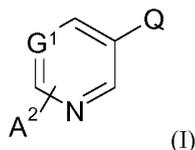
- 10 R¹ representa hidrógeno, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halógeno, ciano, haloalquilo C₁-C₃, hidroxilo o alcoxilo C₁-C₆,
 G² representa C(=X)NR³R⁴,
 X representa oxígeno o azufre,
 R³ representa un resto de la serie de hidrógeno, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, ciano-alquilo
 15 C₁-C₆, alcoxilo C₁-C₆, haloalcoxilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquil-C₁-C₆-carbonilo dado el caso sustituido con halógeno, alcoxi-C₁-C₆-carbonilo dado el caso sustituido con halógeno, cicloalquilcarbonilo C₃-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ y ciano, o representa un catión, tal como por ejemplo un ion metálico mono- o divalente o un ion amonio dado el caso sustituido con alquilo C₁-C₆ o aril-alquilo C₁-C₆,
 20 R⁴ representa un resto de la serie de hidrógeno, ciano, en cada caso alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆ y alquinilo C₂-C₆, dado el caso sustituidos con halógeno, ciano, alcoxilo C₁-C₆, haloalcoxilo C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, haloalquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonylo C₁-C₆ y haloalquilsulfonylo C₁-C₆, alcoxilo C₁-C₆, haloalcoxilo C₁-C₆, bis(alcoxi C₁-C₆)-alquilo C₁-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, bis(alquiltio C₁-C₆)-alquilo C₁-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, alquilcarbonil-C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, alquilsulfinil-C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, alquilsulfonyl-C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, alcoxycarbonil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, alquiniloxilo C₂-C₄, cicloalquilcarbonilo C₃-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, cicloalquil-C₃-C₆-alquilo C₁-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, cicloalquilo C₃-C₆ y cicloalquilenilo C₃-C₆ sustituidos en cada caso dado el caso con halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxilo C₁-C₆ o haloalcoxilo C₁-C₆, en los que los anillos pueden contener de uno a tres heteroátomos de la serie de azufre, oxígeno (no debiendo ser los átomos de oxígeno directamente adyacentes) y nitrógeno, arilo, heteroarilo, heterociclilo, heterocicliil-alquilo C₁-C₆, aril-alquilo C₁-C₆, heteroaril-alquilo C₁-C₆ en cada caso dado el caso sustituidos con halógeno, ciano (también en la parte de alquilo), nitro, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxilo C₁-C₆, haloalcoxilo C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, haloalquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonylo C₁-C₆, haloalquilsulfonylo C₁-C₆, amino, alquilamino C₁-C₆, di(alquil-C₁-C₆)amino, alquilcarbonilamino C₁-C₆, alcoxycarbonilamino C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, haloalcoxil-C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquil-C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆ o aminocarbonilo, o representa NR⁵R⁶, en donde R⁵ y R⁶ representan independientemente entre sí un resto de la serie de hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxilo C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, alcoxilcarbonilo C₁-C₆, hetarilo y heterociclilo o R⁵ y R⁶ junto con el átomo de nitrógeno, al que están unidos, forman un heterociclo dado el caso sustituido con halógeno,
 40 R³ y R⁴ también junto con el átomo de nitrógeno, al que están unidos, pueden formar un anillo de 3 a 7 miembros dado el caso sustituido con alquilo C₁-C₆, alcoxilo C₁-C₆ o halógeno y que contiene dado el caso uno o dos heteroátomos de la serie de oxígeno, nitrógeno y azufre, no debiendo ser los átomos de oxígeno directamente adyacentes,
 45

así como sales, N-óxidos y formas tautoméricas de los compuestos de fórmula (I), seleccionándose halógeno de la serie de flúor, cloro, bromo y yodo, arilo (también como parte de una unidad mayor, tal como por ejemplo arilalquilo) se selecciona de la serie de fenilo, naftilo, antrilo, fenantrenilo y

- 50 hetarilo (sinónimo de heteroarilo, también como parte de una unidad mayor, tal como por ejemplo hetarilalquilo) se

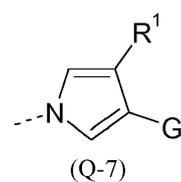
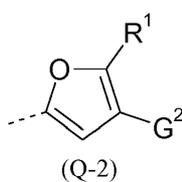
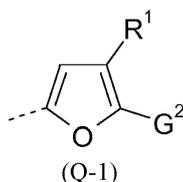
5 selecciona de la serie de furilo, tienilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, benzofurilo, benzisofurilo, benzotienilo, benzisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, benzisotiazolilo, benzoxazolilo, benzisoxazolilo, benzimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazoles, quinolinilo, isoquinolinilo, cinnolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo e indolizino, para combatir parásitos animales.

2. Compuestos de fórmula (I)



en la que

G¹ representa C-A¹,
 A¹ representa hidrógeno,
 A² representa hidrógeno,
 15 Q representa uno de los siguientes restos



R¹ representa hidrógeno, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halógeno, ciano, haloalquilo C₁-C₃, hidroxilo o alcoxilo C₁-C₄,

G² representa C(=X)NR³R⁴,

20 X e Y representan independientemente entre sí oxígeno o azufre,

R³ representa un resto de la serie de hidrógeno, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, ciano-alquilo C₁-C₄, alcoxilo C₁-C₄, haloalcoxilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alcoxi-C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, alcoxicarbonilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, cicloalquilcarbonilo C₃-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, alquilo C₁-C₄, alcoxilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y ciano, o representa un catión, tal como por ejemplo un ion metálico mono- o divalente o un ion amonio dado el caso sustituido con alquilo C₁-C₄ o aril-alquilo C₁-C₄,

25 R⁴ representa un resto de la serie de hidrógeno, ciano, de alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄ y alquinilo C₂-C₄ en cada caso dado el caso sustituidos con halógeno, ciano, alcoxilo C₁-C₄, haloalcoxilo C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquilsulfinito C₁-C₄, haloalquilsulfinito C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄ y haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alcoxilo C₁-C₄, haloalcoxilo C₁-C₄, bis(alcoxi-C₁-C₄)-alquilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, bis(alquiltio-C₁-C₄)-alquilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, alquil-C₁-C₄-carbonil-alquilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, alquilsulfinito-C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, alquilsulfonil-C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, alcoxicarbonil-C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, alquiniloxilo C₂-C₄, cicloalquil-C₃-C₆-carbonilo dado el caso sustituido con halógeno, cicloalquil-C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, cicloalquilo C₃-C₆ y cicloalquenilo C₃-C₆ en cada caso dado el caso sustituidos con halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxilo C₁-C₄ o haloalcoxilo C₁-C₄, en los que los anillos pueden contener de uno a tres heteroátomos de la serie de azufre, oxígeno (no debiendo ser los átomos de oxígeno directamente adyacentes) y nitrógeno, arilo, heteroarilo, aril-alquilo C₁-C₄, heteroaril-alquilo C₁-C₄ en cada caso dado el caso sustituidos con halógeno, ciano (también en la parte de alquilo), nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxilo C₁-C₄, haloalcoxilo C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquilsulfinito C₁-C₄, haloalquilsulfinito C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, amino, alquilamino C₁-C₄, di(alquil-C₁-C₄)amino, alquilcarbonilamino C₁-C₄, alcoxicarbonilamino C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalcoxi-C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquil-C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄, alcoxicarbonilo C₁-C₄ o aminocarbonilo, o representa NR⁵R⁶, en donde R⁵ y R⁶ representan independientemente entre sí un resto de la serie de hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄, alcoxicarbonilo C₁-C₄, hetarilo y heterociclilo o R⁵ y R⁶ junto con el átomo de nitrógeno, al que están unidos, forman un heterociclo dado el caso sustituido con halógeno, R³ y R⁴ también junto con el átomo de nitrógeno, al que están unidos, pueden formar un anillo de 3 a 7 miembros dado el caso sustituido con alquilo C₁-C₄, alcoxilo C₁-C₄ o halógeno y que contiene dado el caso uno o dos heteroátomos de la serie de oxígeno, nitrógeno y azufre, no debiendo ser los átomos de oxígeno directamente adyacentes,

30

35

40

45

50

y en donde

halógeno se selecciona de la serie de flúor, cloro, bromo y yodo,

arilo (también como parte de una unidad mayor, tal como por ejemplo arilalquilo) se selecciona de la serie de fenilo, naftilo, antrilo, fenantrenilo y

5 hetarilo (también como parte de una unidad mayor, tal como por ejemplo hetarilalquilo) se selecciona de la serie de tienilo, pirimidilo, oxadiazolilo, oxazolilo, pirazinilo, imidazolilo, tiazolilo y furanilo.

3. Compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 2, en los que

G¹ representa C-A¹,

A¹ representa hidrógeno,

10 A² representa hidrógeno,

Q representa Q-1, Q-2 o Q-7,

R¹ representa hidrógeno o alquilo C₁-C₄,

G² representa C(=X)NR³R⁴,

X representa oxígeno,

15 R³ representa un resto de la serie de hidrógeno y alquilo C₁-C₄,

R⁴ representa un resto de la serie de hidrógeno, alquilo C₁-C₄ y alqueno C₂-C₄ en cada caso dado el caso sustituidos con halógeno, ciano y alquilio C₁-C₄, representa alquinilo C₂-C₄, cicloalquil-C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con halógeno y heteroaril-alquilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con haloalquilo C₁-C₄ y

20 R³ y R⁴ también junto con el átomo de nitrógeno, al que están unidos, pueden formar un anillo de 3 a 7 miembros, que no contiene ningún heteroátomo adicional y en donde

halógeno se selecciona de la serie de flúor, cloro, bromo y yodo y

hetarilo (también como parte de una unidad mayor, tal como por ejemplo hetarilalquilo) se selecciona de la serie de tienilo, pirimidilo y tiazolilo.

25 4. Procedimiento para combatir parásitos animales, **caracterizado porque** se deja actuar un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 2 o 3 sobre los parásitos y/o su hábitat, exceptuándose procedimientos en el cuerpo animal o humano.