

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 623 062**

51 Int. Cl.:

C07H 19/01 (2006.01)

A01N 43/90 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **26.02.2002 PCT/EP2002/02043**

87 Fecha y número de publicación internacional: **06.09.2002 WO02068441**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **26.02.2002 E 02727332 (5)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **22.02.2017 EP 1389216**

54 Título: **Avermectinas sustituidas en la posición 4ª que tienen propiedades plaguicidas**

30 Prioridad:

27.02.2001 CH 374012001

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

10.07.2017

73 Titular/es:

**MERIAL, INC. (100.0%)
3239 Satellite Boulevard Bldg. 500
Duluth, GA 30096, US**

72 Inventor/es:

**PITTERNA, THOMAS,SYNGENTA CROP
PROTECTION AG;
O'SULLIVAN, ANTHONY CORNELIUS y
LUTZ, WILLIAM,SYNGENTA CROP PROTECTION
AG**

74 Agente/Representante:

SALVA FERRER, Joan

Observaciones :

**Véase nota informativa (Remarks, Remarques
o Bemerkungen) en el folleto original publicado
por la Oficina Europea de Patentes**

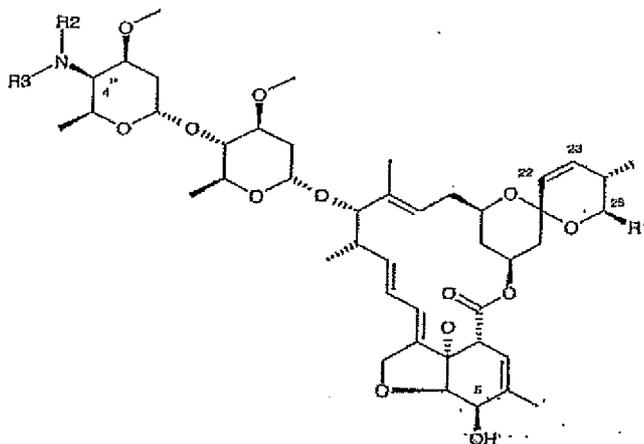
ES 2 623 062 T3

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

Avermectinas sustituidas en la posición 4'' que tienen propiedades plaguicidas

5 **[0001]** La invención proporciona (1) un compuesto de fórmula



en que

10 R₁ es isopropilo o sec-butilo;

R₂ es H o alquilo C₁₋₈;

R₃ es bencilo que porta, en el resto aromático, 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo consistente en OH, halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁₋₂, dimetilaminoalcoxi C₁₋₄, cicloalquilo C₃₋₆, halogenoalquilo C₁₋₂, alcoxi C₁₋₂, halogenoalcoxi C₁₋₂, fenoxi, fenilalquilo C₁₋₆, fenilalquenoil C₁₋₄, fenoxi no sustituido o sustituido con cloro o metoxi, benciloxi no sustituido o sustituido con cloro, metoxi o triclorometilo, metilendioxi, -C(=O)R₅, -O-C(=O)R₆ y NHC(=O)R₆; o

R₃ es -CH₂-C(=O)-alcoxi C₁₋₁₂; o

R₃ es -CH₂-heterociclilo, en el que el grupo heterociclilo se selecciona de piridilo, furanilo, tetrahydrofuranilo, piranilo, tetrahidropiranilo, pirazolilo, imidazolilo, tiazolilo, benzotienilo, quinolinilo, quinoxalinilo, benzofuranilo, benzimidazolilo, benzopirrolilo, benzotiazolilo, indolilo, cumarinilo e indazolilo, donde los radicales mencionados no están sustituidos o están mono- o disustituidos independientemente entre sí con halógeno, trifluorometilo, trifluorometoxi o nitro;

20 R₅ es H, OH, NH₂, NH-(alquilo C₁₋₂), N-(alquilo C₁₋₂)₂, -O-alquil C₁₋₂-C(=O)-R₇, -NH-alquil C₁₋₂-C(=O)-R₇, alquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₂, alcoxi C₁₋₂-alcoxi C₁₋₂, alquenoil C₂₋₄-oxi, alquinoil C₂₋₄-oxi; fenilo, fenoxi, benciloxi, NH-fenilo, NH-alquil C₁₋₆-C(=O)-R₇ o fenilo, fenoxi, benciloxi y NH-fenilo que están sustituidos con halógeno, nitro, metoxi, trifluorometilo o trifluorometoxi;

R₆ es H, alquilo C₁₋₃, fenilo o bencilo; y

R₇ es H, OH, NH₂, NH-(alquilo C₁₋₁₂), N-(alquilo C₁₋₁₂)₂, alquilo C₁₋₁₂, alcoxi C₁₋₁₂, alcoxi C₁₋₆-alcoxi C₁₋₆, alquenoil C₂₋₈-oxilo, fenilo, fenoxi, benciloxi o NH-fenilo;

30 o, si es apropiado, un isómero E/Z, mezcla de isómeros E/Z y/o tautómero del mismo,

un proceso para preparar estos compuestos, sus isómeros y tautómeros y el uso de estos compuestos, sus isómeros y tautómeros; plaguicidas cuyo compuesto activo se selecciona de estos compuestos y sus tautómeros y un procedimiento para controlar plagas usando estas composiciones.

35 **[0002]** La bibliografía propone ciertos compuestos macrólidos para controlar plagas. Sin embargo, las propiedades biológicas de estos compuestos conocidos no son enteramente satisfactorias y, como consecuencia, sigue habiendo necesidad de proporcionar compuestos adicionales que tengan propiedades plaguicidas, en particular para el control de insectos y representantes del orden *Acarina*. Según la invención, se consigue este objeto proporcionando los presentes compuestos de fórmula (I).

40

[0003] Los compuestos reivindicados según la invención son derivados de avermectina. Las avermectinas son conocidas por el especialista en la materia. Mroziak, H. *et al.*, *Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters* 5, (1995), 2435-2440 y el documento US 4427663 divulgan derivados de avermectina para uso como plaguicidas y parasiticidas. Son un grupo de compuestos activos plaguicidas estrechamente relacionados estructuralmente que se

obtienen fermentando una cepa del microorganismo *Streptomyces avermitilis*. Pueden obtenerse derivados de avermectinas mediante síntesis químicas convencionales.

5 **[0004]** Se hace referencia a las avermectinas que pueden obtenerse a partir de *Streptomyces avermitilis* como A1 a, A1 b, A2a, A2b, B1 a, B1 b, B2a y B2b. Los compuestos a los que se hace referencia como "A" y "B" tienen un radical metoxi y un grupo OH, respectivamente, en la posición 5. La serie "a" y la serie "b" son compuestos en que el sustituyente R₁ (en posición 25) es un radical sec-butilo y un radical isopropilo, respectivamente. El número 1 en el nombre de los compuestos significa que los átomos 22 y 23 están ligados por dobles enlaces; el número 2 significa que están ligados por un enlace sencillo y que el átomo de C 23 porta un grupo OH. Se remite a la nomenclatura anterior en la descripción de la presente invención para denotar el tipo de estructura específica en los derivados de avermectina de origen no natural según la invención que corresponde a la avermectina de origen natural. Se reivindican según la invención derivados de compuestos de la serie B1, en particular mezclas de derivados de avermectina B1 a y avermectina B1 b.

15 **[0005]** Algunos de los compuestos de fórmula (I) pueden estar presentes como tautómeros. Por consiguiente, anterior y posteriormente en la presente memoria, ha de considerarse también que los compuestos de fórmula (I), si es apropiado, incluyen los correspondientes tautómeros, incluso si estos últimos no se mencionan específicamente en cada caso.

20 **[0006]** A menos que se definan de otro modo, los términos generales usados anterior y posteriormente en la presente memoria tienen los significados dados a continuación.

[0007] A menos que se definan de otro modo, los grupos y compuestos que contienen carbono contienen en cada caso de 1 hasta e incluyendo 6, preferiblemente de 1 hasta e incluyendo 4, en particular 1 o 2, átomos de carbono.

[0008] El halógeno es, como grupo de por sí y también como elemento estructural de otros grupos y compuestos, tales como halogenoalquilo, halogenoalcoxi y halogenoalquiltio, flúor, cloro, bromo o yodo, en particular flúor, cloro o bromo, especialmente flúor o cloro.

30 **[0009]** El alquilo es, como grupo de por sí y también como elemento estructural de otros grupos y compuestos, tales como halogenoalquilo, alcoxi y alquiltio, teniendo en cuenta cada caso el número de átomos de carbono contenidos en cada caso en el grupo o compuesto en cuestión, de cadena lineal, concretamente metilo, etilo, propilo, butilo, pentilo, hexilo, heptilo u octilo, o ramificada, por ejemplo isopropilo, isobutilo, sec-butilo, terc-butilo, isopentilo, neopentilo o isohexilo.

[0010] El cicloalquilo es, como grupo de por sí y también como elemento estructural de otros grupos y compuestos, tales como, por ejemplo, halogenocicloalquilo, cicloalcoxi y cicloalquiltio, teniendo en cuenta en cada caso el número de átomos de carbono contenidos en cada caso en el grupo o compuesto en cuestión, ciclopropilo, 40 ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo o ciclooctilo.

[0011] El alqueno es, como grupo de por sí y también como elemento estructural de otros grupos y compuestos, teniendo en cuenta el número de átomos de carbono y dobles enlaces conjugados o aislados contenidos en el grupo, de cadena lineal, por ejemplo vinilo, alilo, 2-butenilo, 3-pentenilo, 1-hexenilo, 1-heptenilo, 45 1,3-hexadienilo o 1,3-octadienilo, o ramificada, por ejemplo isopropenilo, isobutenilo, isoprenilo, terc-pentenilo, isohexenilo, isoheptenilo o isoootenilo. Se da preferencia a grupos alqueno que tienen de 3 a 12, en particular de 3 a 6, especialmente 3 o 4 átomos de carbono.

[0012] El alquino es, como grupo de por sí y también como elemento estructural de otros grupos y compuestos, teniendo en cuenta en cada caso el número de átomos de carbono y dobles enlaces conjugados o aislados contenidos en el grupo o compuesto en cuestión, de cadena lineal, por ejemplo etinilo, propargilo, 2-butenilo, 3-pentinilo, 1-hexinilo, 1-heptinilo, 3-hexen-1-inilo o 1,5-heptadien-3-inilo, o ramificada, por ejemplo 3-metilbut-1-inilo, 4-etilpent-1-inilo, 4-metilhex-2-inilo o 2-metilhept-3-inilo. Se da preferencia a grupos alquino que tienen de 3 a 12, en particular de 3 a 6, especialmente 3 o 4 átomos de carbono.

55 **[0013]** Alquileo y alquilenilo son miembros de anillo de cadena lineal o ramificada; son en particular -CH₂-CH₂-CH₂-, -CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-, -CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-, -CH₂(CH₃)CH₂-CH₂-, -CH₂C(CH₃)₂-CH₂-, -CH₂-CH=CH-CH₂ o -CH₂-CH=CH-CH₂-CH₂-.

[0014] Los grupos y compuestos que contienen carbono sustituidos con halógeno tales como, por ejemplo, alquilo, alqueno, alquino, cicloalquilo, alcoxi o alquiltio sustituidos con halógeno, pueden estar parcialmente halogenados o perhalogenados, donde en el caso de polihalogenación, los sustituyentes halógenos pueden ser idénticos o diferentes. Son ejemplos de halogenoalquilo, como grupo de por sí y también como elemento estructural de otros grupos y compuestos, tales como halogenoalcoxi o halogenoalquiltio, metilo que está mono- a trisustituido con flúor, cloro y/o bromo, tal como CHF_2 o CF_3 ; etilo que está mono- a pentasustituido con flúor, cloro y/o bromo tal como CH_2CF_3 , CF_2CF_3 , CF_2CCl_3 , CF_2CHCl_2 , CF_2CHF_2 , CF_2CFCl_2 , CF_2CHBr_2 , CF_2CHClF , CF_2CHBrF o CClFCHClF ; propilo o isopropilo que está mono- a heptasustituido con flúor, cloro y/o bromo, tal como $\text{CH}_2\text{CHBrCH}_2\text{Br}$, $\text{CF}_2\text{CHFCF}_3$, $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ o $\text{CH}(\text{CF}_3)_2$; butilo o uno de sus isómeros mono- a nonasustituidos con flúor, cloro y/o bromo, tal como $\text{CF}(\text{CF}_3)\text{CHFCF}_3$ o $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_2\text{CF}_3$; pentilo o uno de sus isómeros mono- a undecasustituidos con flúor, cloro y/o bromo, tal como $\text{CF}(\text{CF}_3)(\text{CHF}_2)\text{CF}_3$ o $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$ y hexilo o uno de sus isómeros mono- a tridecasustituidos con flúor, cloro y/o bromo, tal como $(\text{CH}_2)_4\text{CHBrCH}_2\text{Br}$, $\text{CF}_2(\text{CHF})_4\text{CF}_3$, $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_4\text{CF}_3$ o $\text{C}(\text{CF}_3)_2(\text{CHF})_2\text{CF}_3$.

15 **[0015]** El arilo es en particular fenilo, naftilo, antraceno, fenantreno, perilenilo o fluorenilo, preferiblemente fenilo.

[0016] El heterociclilo se selecciona de piridilo, furanilo, tetrahydrofuranilo, piranilo, tetrahidropiranilo, pirazolilo, imidazolilo, tiazolilo, benzotienilo, quinolinilo, quinoxalinilo, benzofuranilo, bencimidazolilo, benzopirrolilo, benzotiazolilo, indolilo, cumarinilo e indazolilo, donde los radicales mencionados están no sustituidos o mono- o disustituidos independientemente entre sí con halógeno, trifluorometilo, trifluorometoxi o nitro.

[0017] En el contexto de la presente invención, se da preferencia a

25 (2) compuestos según el grupo (1) de fórmula (I) en que R_1 es isopropilo o sec-butilo, preferiblemente aquellos en que está presente una mezcla del derivado de isopropilo y sec-butilo;

(3) compuestos según el grupo (2) de fórmula (I), en que R_2 es H;

(4) compuestos según el grupo (2) de fórmula (I), en que R_2 es alquilo C_1-C_8 , en particular metilo;

(5) compuestos según el grupo (2) de fórmula (I), en que R_2 es etilo;

30 (6) compuestos según el grupo (2) de fórmula (I), en que R_2 es n-propilo;

(7) compuestos según cualquiera de los grupos (1) a (6) de fórmula (I), en que R_3 es bencilo que porta, en el resto aromático, de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo consistente en OH, halógeno, CN, NO_2 , alquilo C_1-C_2 , dimetilaminoalcoxi C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_2 , halogenoalcoxi C_1-C_2 , fenoxi, fenilalquilo C_1-C_6 , fenilalqueno C_1-C_4 , fenoxi no sustituido o sustituido con cloro o metoxi, benciloxi no sustituido o sustituido con cloro, metoxi o triclorometilo, metilendioxi, $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_5$, $-\text{O}-\text{C}(=\text{O})\text{R}_6$ y $\text{NHC}(=\text{O})\text{R}_6$;

35 R_5 es H, OH, NH_2 , $\text{NH}(\text{alquilo } C_1-C_2)$, $\text{N}(\text{alquilo } C_1-C_2)_2$, $-\text{O}-\text{alquil } C_1-C_2-\text{C}(=\text{O})-\text{R}_7$, $-\text{NH}-\text{alquil } C_1-C_2-\text{C}(=\text{O})-\text{R}_7$, alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_2 -alcoxi C_1-C_2 , alquenoil C_2-C_4 -oxi, alquinoil C_2-C_4 -oxi; fenilo, fenoxi, benciloxi, NH -fenilo, NH -alquil $C_1-C_6-\text{C}(=\text{O})-\text{R}_7$; o fenilo, fenoxi, benciloxi y NH -fenilo que están sustituidos con halógeno, nitro, metoxi, trifluorometilo o trifluorometoxi;

40 R_6 es H, alquilo C_1-C_3 , fenilo o bencilo; y

R_7 es H, OH, NH_2 , $\text{NH}(\text{alquilo } C_1-C_{12})$, $\text{N}(\text{alquilo } C_1-C_{12})_2$, alquilo C_1-C_{12} , alcoxi C_1-C_{12} , alcoxi C_1-C_6 -alcoxi C_1-C_6 , alquenoil C_2-C_8 -oxilo, fenilo, fenoxi, benciloxi o NH -fenilo;

(8) compuestos según cualquiera de los grupos (1) a (6) de fórmula (I) en que R_3 es $-\text{CH}_2-\text{C}(=\text{O})\text{R}_5$; y

R_5 es alcoxi C_1-C_{12} ;

45 (9) compuestos según cualquiera de los grupos (1) a (6) de fórmula (I) en que R_3 es $-\text{CH}_2$ -heterociclilo; en el que dicho heterociclilo se selecciona de piridilo, furanilo, tetrahydrofuranilo, piranilo, tetrahidropiranilo, pirazolilo, imidazolilo, tiazolilo, benzotienilo, quinolinilo, quinoxalinilo, benzofuranilo, bencimidazolilo, benzopirrolilo, benzotiazolilo, indolilo, cumarinilo e indazolilo, donde los radicales mencionados están no sustituidos o mono- o disustituidos independientemente entre sí con halógeno, trifluorometilo, trifluorometoxi o nitro;

50 (10) en el contexto de la invención, se da particular preferencia a los compuestos de fórmula (I) enumerados en las tablas y, si es apropiado, a sus isómeros E/Z y mezclas de isómeros E/Z; estos son en particular los compuestos

4"-desoxi-4"-epi-(N-metil-N-etoxicarbonilmetilamino)avermectina B1;

4"-desoxi-4"-epi-(N-metil-N-4-difluorometoxifenilmetilamino)avermectina B1;

4"-desoxi-4"-epi-(N-metil-N-2,5-difluorofenilmetilamino)avermectina B1;

55 4"-desoxi-4"-epi-(N-metil-N-2,3,4-trifluorofenilmetilamino)avermectina B1; y

4"-desoxi-4"-epi-N-[(6-cloropiridin-3-ilmetil)amino]javermectina B1.

[0018] La invención proporciona también un proceso para preparar los compuestos de fórmula (I) y, si es apropiado, tautómeros de los mismos, en el que

(A) para preparar un compuesto de fórmula (Ia) en que R_1 y R_2 tienen los mismos significados que se dan anteriormente en (1) para la fórmula (I) y R_3 tiene los mismos significados que se dan anteriormente en (1) para la fórmula (I),

5 se hace reaccionar un compuesto de fórmula (Ia) en que R_1 y R_2 tienen los mismos significados que se dan anteriormente en (1) para la fórmula (I) y R_3 es hidrógeno y que pueden prepararse mediante procedimientos conocidos de por sí;

con un compuesto de fórmula R_3 -Hal en que R_3 tiene los mismos significados que se dan anteriormente en (1) para la fórmula (I) y Hal es halógeno, en particular bromo o yodo; o

10 (B) para preparar un compuesto del compuesto (1) en que R_1 y R_3 tienen los mismos significados que se dan anteriormente en (1) para la fórmula (I) y R_2 es metilo,

se hace reaccionar un compuesto de fórmula (I) en que R_1 y R_3 tienen los mismos significados que se dan anteriormente en (1) para la fórmula (I) y R_2 es hidrógeno, con un compuesto de fórmula metil-Hal en que Hal es un halógeno, en particular bromo o yodo; o con formaldehído en presencia de un agente reductor.

15

[0019] Los comentarios realizados anteriormente en conexión con los tautómeros de compuestos de fórmula (I) se aplican análogamente a los materiales de partida mencionados anterior y posteriormente en la presente memoria con respecto a sus tautómeros.

20 **[0020]** Las reacciones descritas anterior y posteriormente en la presente memoria se llevan a cabo de manera conocida de por sí, por ejemplo en ausencia, o normalmente en presencia, de un disolvente o diluyente adecuado o una mezcla de los mismos, llevándose a cabo las reacciones, según se requiera, con enfriamiento, a temperatura ambiente o con calentamiento, por ejemplo en un intervalo de temperatura de aproximadamente $-80\text{ }^{\circ}\text{C}$ a la temperatura de ebullición del medio de reacción, preferiblemente de aproximadamente $0\text{ }^{\circ}\text{C}$ a aproximadamente
25 $+150\text{ }^{\circ}\text{C}$ y, si es necesario, en un recipiente cerrado a presión bajo atmósfera de gas inerte y/o en condiciones anhidras. Pueden encontrarse condiciones de reacción especialmente ventajosas en los Ejemplos.

[0021] El tiempo de reacción no es crítico; se prefiere un tiempo de reacción de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 24 horas; especialmente de aproximadamente 0,5 a aproximadamente 10 horas.

30

[0022] El producto se aísla mediante procedimientos normales, por ejemplo mediante filtración, cristalización, destilación o cromatografía, o cualquier combinación adecuada de dichos procedimientos.

35 **[0023]** Los materiales de partida mencionados anterior y posteriormente en la presente memoria que se usan en la preparación de los compuestos de fórmula (I) y, cuando sea aplicable, sus tautómeros, son conocidos o pueden prepararse mediante procedimientos conocidos de por sí, p.ej. como se indica a continuación.

Variante de proceso (A):

40 **[0024]** Los ejemplos de disolventes y diluyentes incluyen: hidrocarburos aromáticos, alifáticos y alicíclicos e hidrocarburos halogenados tales como benceno, tolueno, xileno, mesitileno, tetralina, clorobenceno, diclorobenceno, bromobenceno, éter de petróleo, hexano, ciclohexano, diclorometano, triclorometano, tetraclorometano, dicloroetano, tricloroetano o tetracloroetano; éteres tales como dietiléter, dipropiléter, diisopropiléter, dibutiléter, terc-butilmetiléter, etilenglicolmonometiléter, etilenglicolmonoetiléter, etilenglicoldimetiléter, dimetoxidietiléter,
45 tetrahidrofurano o dioxano; alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, isopropanol, butanol, etilenglicol o glicerol; ácidos carboxílicos tales como ácido acético o ácido fórmico; amidas tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dietilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilpirrolidona o triamida del ácido hexametilfosfórico; nitrilos tales como acetonitrilo o propionitrilo y sulfóxidos tales como dimetilsulfóxido y también agua; o mezclas de los disolventes mencionados; son especialmente adecuados éteres, alcoholes, agua y ácidos carboxílicos, más especialmente
50 tetrahidrofurano, ácido acético o agua.

[0025] Las reacciones se llevan a cabo ventajosamente en un intervalo de temperatura de aproximadamente temperatura ambiente al punto de ebullición del disolvente usado; se da preferencia a la reacción a 10 a $30\text{ }^{\circ}\text{C}$.

55 **[0026]** En una realización preferida de la variante (A), se lleva a cabo la reacción a temperatura ambiente en tetrahidrofurano en presencia de ácido acético. Se describen las condiciones especialmente preferidas para la reacción en el Ejemplo P1.1.

Variante de proceso (B):

[0027] Los ejemplos de disolventes y diluyentes incluyen: hidrocarburos aromáticos, alifáticos y alicíclicos e hidrocarburos halogenados y éteres como se enumeran anteriormente en la variante de proceso (A); cetonas tales como acetona, metiletilcetona o metilisobutilcetona; alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, isopropanol, 5 butanol, etilenglicol o glicerol; ésteres de ácido carboxílico tales como acetato de metilo, acetato de etilo o ésteres de ácido benzoico; amidas como se enumeran anteriormente en la variante de proceso (A); nitrilos tales como acetonitrilo o propionitrilo y sulfóxidos tales como dimetilsulfóxido; y también agua o mezclas de los disolventes mencionados; son especialmente adecuados agua, ésteres de ácidos orgánicos, hidrocarburos halogenados e hidrocarburos aromáticos; más especialmente mezclas bifásicas de dicho disolvente orgánico con agua.

10 **[0028]** Las reacciones se llevan a cabo ventajosamente en un intervalo de temperatura de aproximadamente temperatura ambiente al punto de ebullición del disolvente usado, preferiblemente de temperatura ambiente hasta 90 °C, especialmente hasta 60 °C, y en presencia de una base, preferiblemente una base inorgánica, por ejemplo hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio o hidrogenocarbonato de sodio.

15 **[0029]** Se describen las condiciones especialmente preferidas para la reacción, por ejemplo, en los Ejemplos P1.2, P1.3, P2.1 y P2.7.

Variante de proceso (C):

20 **[0030]** Los ejemplos de disolventes y diluyentes incluyen: hidrocarburos aromáticos, alifáticos y alicíclicos e hidrocarburos halogenados y éteres, amidas y nitrilos como se enumeran anteriormente en la variante de proceso (A); y sulfóxidos tales como dimetilsulfóxido o mezclas de los disolventes mencionados; siendo especialmente adecuados éteres e hidrocarburos.

25 **[0031]** Las reacciones se llevan a cabo ventajosamente en un intervalo de temperatura de 0 °C al punto de ebullición del disolvente usado, preferiblemente de 0 °C a temperatura ambiente. Se describen las condiciones especialmente preferidas para la reacción, por ejemplo, en el Ejemplo P2.2.

30 Variante de proceso (D):

[0032] Los disolventes adecuados incluyen aquellos mencionados en la variante (A); adicionalmente también cetonas tales como acetona, metiletilcetona y metilisobutilcetona y ácidos carboxílicos tales como ácido acético o ácido fórmico; ésteres de ácido carboxílico tales como acetato de metilo, acetato de etilo o ésteres de ácido 35 benzoico.

[0033] Las reacciones se llevan a cabo ventajosamente en un intervalo de temperatura de aproximadamente temperatura ambiente al punto de ebullición del disolvente usado, preferiblemente en presencia de una base inorgánica, por ejemplo hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio o 40 hidrogenocarbonato de sodio.

[0034] Se describen las condiciones especialmente preferidas para esta variante de proceso, por ejemplo, en el Ejemplo P2.6.

45 **[0035]** Como alternativa, es posible elegir una variante de proceso en la que se use un agente reductor, especialmente hidrógeno molecular, más especialmente en una mezcla de tetrahidrofurano y agua como disolvente y en presencia de un catalizador metal pesado, especialmente un catalizador de Pd.

50 **[0036]** Se describen las condiciones especialmente preferidas para esta variante de proceso, por ejemplo, en el Ejemplo P2.5.

Variante de proceso (E):

[0037] Los disolventes adecuados incluyen aquellos mencionados en la variante (B), siendo disolventes 55 especialmente adecuados ésteres de ácidos orgánicos, hidrocarburos halogenados e hidrocarburos aromáticos; especialmente mezclas bifásicas de un éster con agua.

[0038] Las reacciones se llevan a cabo ventajosamente en un intervalo de temperatura de 0 °C al punto de ebullición del disolvente usado, preferiblemente de temperatura ambiente a 60 °C, y en presencia de una base,

preferiblemente una base inorgánica, por ejemplo hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio o hidrogenocarbonato de sodio.

5 **[0039]** Se describen las condiciones especialmente preferidas para esta variante de proceso, por ejemplo, en el Ejemplo P2.3.

10 **[0040]** En una realización alternativa, los disolventes adecuados incluyen aquellos mencionados anteriormente, preferiblemente éteres, alcoholes, agua y ácidos carboxílicos, en combinación con un hidruro tal como borohidruro, especialmente NaCNBH_3 .

15 **[0041]** Se describen las condiciones especialmente preferidas para esta variante de proceso, por ejemplo, en el Ejemplo P2.4.

Variante de proceso (F):

15 **[0042]** Los ejemplos de disolventes y diluyentes incluyen: hidrocarburos aromáticos, alifáticos y alicíclicos e hidrocarburos halogenados; éteres, amidas y nitrilos como se enumeran anteriormente en la variante de proceso (A); cetonas tales como acetona, metiletilcetona o metilisobutilcetona; ésteres de ácido carboxílico tales como acetato de metilo, acetato de etilo o ésteres de ácido benzoico y sulfóxidos tales como dimetilsulfóxido; o mezclas de los
20 disolventes mencionados; son especialmente adecuados ésteres de ácidos orgánicos tales como acetato de etilo.

[0043] Se usan como agente de retirada de agua los reactivos de acoplamiento a péptido habituales, especialmente carbodiimidas e hidroxibenzotriazoles.

25 **[0044]** Las reacciones se llevan a cabo ventajosamente en un intervalo de temperatura de 0 °C al punto de ebullición del disolvente usado, preferiblemente a temperatura ambiente.

[0045] Se describen las condiciones especialmente preferidas para la reacción, por ejemplo, en el Ejemplo P2.8.

30

Variante de proceso (G):

35 **[0046]** Los ejemplos de disolventes y diluyentes incluyen: hidrocarburos aromáticos, alifáticos y alicíclicos y éteres como se enumeran anteriormente en la variante de proceso (A); y sulfóxidos tales como dimetilsulfóxido o mezclas de los disolventes mencionados; éteres, más especialmente tetrahidrofurano, siendo especialmente preferido tetrahidrofurano.

40 **[0047]** Las reacciones se llevan a cabo ventajosamente en un intervalo de temperatura de 0 °C al punto de ebullición del disolvente usado, preferiblemente de 0 °C a temperatura ambiente.

[0048] Se describen las condiciones especialmente preferidas para la reacción, por ejemplo, en el Ejemplo P2.10.

Variante de proceso (H):

45

[0049] Los disolventes adecuados incluyen aquellos mencionados en la variante (B), siendo disolventes especialmente adecuados agua, ésteres de ácidos orgánicos, hidrocarburos halogenados e hidrocarburos aromáticos; especialmente mezclas bifásicas de dicho disolvente orgánico con agua.

50 **[0050]** Las reacciones se llevan a cabo ventajosamente en un intervalo de temperatura de 0 °C al punto de ebullición del disolvente usado, preferiblemente de 90 °C al punto de ebullición del disolvente, y en presencia de una base, preferiblemente una base inorgánica, por ejemplo hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio o hidrogenocarbonato de sodio.

55 **[0051]** Se describen las condiciones especialmente preferidas para la reacción, por ejemplo, en el Ejemplo P3.2.

Variante de proceso (I):

[0052] Los disolventes adecuados incluyen aquellos mencionados en la variante (B), siendo disolventes especialmente adecuados agua, ésteres de ácidos orgánicos, hidrocarburos halogenados e hidrocarburos aromáticos; especialmente mezclas bifásicas de dicho disolvente orgánico con agua.

5 **[0053]** Las reacciones se llevan a cabo ventajosamente en un intervalo de temperatura de 0 °C al punto de ebullición del disolvente usado, preferiblemente de 90 °C al punto de ebullición, y en presencia de una base, preferiblemente una base inorgánica, por ejemplo hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio o hidrogenocarbonato de sodio.

10 **[0054]** Se describen condiciones especialmente preferidas para la reacción, por ejemplo, en el Ejemplo P3.1.

Variante de proceso (J):

15 **[0055]** Los disolventes adecuados incluyen aquellos mencionados en la variante (B), siendo disolventes especialmente adecuados agua, éteres de ácidos orgánicos, alcoholes y agua; especialmente mezclas bifásicas de un éter con agua.

20 **[0056]** Las reacciones se llevan a cabo ventajosamente en un intervalo de temperatura de 0 °C al punto de ebullición del disolvente usado, preferiblemente a temperatura ambiente.

[0057] Se describen las condiciones especialmente preferidas para la reacción, por ejemplo, en el Ejemplo P3.3.

25 **[0058]** Los compuestos de fórmula (I) pueden estar en forma de uno de los posibles isómeros o en forma de una mezcla de los mismos, en forma de isómeros puros o en forma de una mezcla isomérica, concretamente en forma de una mezcla racémica; la invención se refiere tanto a los isómeros puros como a las mezclas racémicas y ha de interpretarse en consecuencia anterior y posteriormente en la presente memoria, incluso si los detalles estereoquímicos no se mencionan específicamente en cada caso.

30 **[0059]** Los racematos pueden resolverse en las antípodas ópticas mediante procedimientos conocidos, por ejemplo mediante recristalización de un disolvente ópticamente activo, mediante cromatografía en adsorbentes quirales, por ejemplo cromatografía líquida a alta presión (HPLC) en acetilcelulosa, con la ayuda de microorganismos adecuados, mediante escisión con enzimas inmovilizadas específicas o mediante la formación de compuestos de inclusión, por ejemplo usando éteres corona quirales, complejándose solo un isómero.

35 **[0060]** Aparte de la separación de las correspondientes mezclas de isómeros, los isómeros ópticos puros pueden obtenerse según la invención también mediante procedimientos generalmente conocidos de síntesis enantioselectiva, por ejemplo llevando a cabo el proceso según la invención usando materiales de partida que tienen la estereoquímica correspondientemente adecuada.

40 **[0061]** En cada caso, es ventajoso aislar o sintetizar el isómero biológicamente más activo, cuando los componentes individuales tienen diferente actividad biológica.

45 **[0062]** Los compuestos de fórmula (I) pueden obtenerse también en forma de sus hidratos y/o pueden incluir otros disolventes, por ejemplo disolventes que pueden haberse usado para la cristalización de compuestos en forma sólida.

50 **[0063]** La invención se refiere a todas aquellas realizaciones del proceso según las cuales se usa un compuesto obtenible como material de partida o intermedio en cualquier etapa del proceso como material de partida y se llevan a cabo algunas o todas de las etapas restantes o se usa un material de partida en forma de un derivado o sal y/o sus racematos o antípodas o, especialmente, se forma en las condiciones de reacción.

[0064] En el proceso de la presente invención, es preferible usar aquellos materiales de partida e intermedios que den como resultado los compuestos de fórmula (I) que se prefieren especialmente.

55 **[0065]** La invención se refiere especialmente a los procesos de preparación descritos en los Ejemplos P1.1 a P4.3.

[0066] En el campo del control de plagas, los compuestos de fórmula (I) según la invención son ingredientes

activos que exhiben una actividad preventiva y/o curativa valiosa con un espectro biocida muy ventajoso y un espectro muy amplio, incluso a bajas tasas de concentración, aunque bien tolerada por animales de sangre caliente, peces y plantas. Sorprendentemente, son igualmente adecuados para controlar tanto plagas de plantas como ectoparásitos y endoparásitos en seres humanos y más especialmente en ganado productivo, animales domésticos y mascotas. Son eficaces contra todas o algunas etapas de desarrollo individuales de plagas animales normalmente sensibles, pero también de plagas animales resistentes tales como insectos y representantes del orden *Acarina*, nematodos, cestodos y trematodos, protegiendo al mismo tiempo los organismos útiles. La actividad insecticida o acaricida de los ingredientes activos según la invención puede manifestarse directamente por sí misma, concretamente en la mortalidad de las plagas que aparece inmediatamente o solo después de cierto tiempo, por ejemplo durante la muda, o indirectamente, por ejemplo en una tasa de oviposición o eclosión reducida, una buena actividad correspondiente a una mortalidad de al menos un 50 a 60 %.

[0067] Dichas plagas animales incluyen, por ejemplo, aquellas mencionadas en la solicitud de patente europea EP-A-736.252, página 5, línea 55 a página 6, línea 55. Las plagas mencionadas en la misma están por lo tanto incluidas como referencia en la materia en cuestión de la presente invención.

[0068] También es posible controlar plagas de la clase *Nematoda* usando los compuestos según la invención. Dichas plagas incluyen, por ejemplo, nematodos de nudo de raíz, nematodos formadores de quistes y también nematodos de tallo y hoja; especialmente de *Heterodera spp.*, p.ej., *Heterodera schachtii*, *Heterodera avenae* y *Heterodera trifolii*; *Globodera spp.*, p.ej. *Globodera rostochiensis*; *Meloidogyne spp.*, p.ej., *Meloidogyne incognita* y *Meloidogyne javanica*; *Radopholus spp.*, p.ej., *Radopholus simiis*; *Pratylenchus*, p.ej., *Pratylenchus neglectans* y *Pratylenchus penetrans*; *Tylenchulus*, p.ej., *Tylenchulus semipenetrans*; *Longidorus*, *Trichodorus*, *Xiphinema*, *Ditylenchus*, *Apheenchooides* y *Anguina*; particularmente *Meloidogyne*, p.ej., *Meloidogyne incognita* y *Heterodera*, p.ej., *Heterodera glycines*.

[0069] Es un aspecto especialmente importante de la presente invención el uso de los compuestos de fórmula (I) según la invención en la protección de plantas contra plagas de alimentación parasitaria.

[0070] Los compuestos según la invención pueden usarse para controlar, concretamente para inhibir o destruir, plagas del tipo mencionado que aparecen en plantas, especialmente en plantas útiles y ornamentales en agricultura, en horticultura y en silvicultura, o en partes de dichas plantas tales como los frutos, flores, hojas, tallos, tubérculos o raíces, mientras que en algunos casos las partes de planta que crecen después siguen protegidas contra esas plagas.

[0071] Las cosechas diana incluyen especialmente cereales tales como trigo, cebada, centeno, avena, arroz, maíz y sorgo; remolacha tal como remolacha azucarera y remolacha forrajera; frutos, p.ej., pomos, frutas con hueso y frutas blandas tales como manzanas, peras, ciruelas, melocotones, almendras, cerezas y bayas, p.ej., fresas, frambuesas y moras; plantas leguminosas tales como judías, lentejas, guisantes y judías de soja; plantas oleaginosas tales como colza, mostaza, amapola, olivas, girasoles, coco, aceite de ricino, cacao y cacahuetes; cucurbitáceas tales como calabacines, pepinos y melones; plantas fibrosas tales como algodón, lino, cáñamo y yuta; frutos cítricos tales como naranjas, limones, pomelo y mandarinas; verduras tales como espinaca, lechuga, espárrago, repollos, zanahorias, cebollas, tomates, patatas y pimentón; lauráceas tales como aguacate, canela y alcanfor y tabaco, nueces, café, berenjenas, azúcar de caña, té, pimienta, vides, lúpulos, plátanos, plantas de caucho natural y ornamentales.

[0072] Son campos de uso adicionales de los compuestos según la invención la protección de bienes almacenados y almacenes y la protección de materiales brutos, y también en el sector de la higiene, especialmente la protección de animales domésticos y ganado productivo contra plagas del tipo mencionado, más especialmente la protección de animales domésticos, especialmente gatos y perros, del ataque de pulgas, garrapatas y nematodos.

[0073] La invención se refiere por lo tanto también a composiciones plaguicidas, tales como concentrados emulsionables, concentrados en suspensión, disoluciones directamente pulverizables o diluibles, pastas extensibles, emulsiones diluidas, polvos humectables, polvos solubles, polvos dispersables, polvos humectables, polvos finos, gránulos y encapsulaciones de sustancias poliméricas, que comprenden al menos uno de los compuestos según la invención, haciéndose la elección de la formulación de acuerdo con los objetivos pretendidos y las circunstancias reinantes.

[0074] El ingrediente activo se usa en esas composiciones en forma pura, un ingrediente activo sólido, por ejemplo, con un tamaño de partícula específico, o preferiblemente junto con al menos uno de los coadyuvantes

normales en la tecnología de formulación, tal como extensores, p.ej., disolventes o portadores sólidos o compuestos activos en superficie (tensioactivos). En el campo del control de parásitos en seres humanos, animales domésticos, ganado productivo y mascotas, será evidente que se usan solo los aditivos fisiológicamente tolerables.

5 **[0075]** Se usan como coadyuvantes de formulación, por ejemplo, portadores sólidos, disolventes, estabilizadores, coadyuvantes de "liberación lenta", colorantes y opcionalmente sustancias activas en superficie (tensioactivos). Los portadores y coadyuvantes adecuados incluyen todas las sustancias usadas normalmente. Como coadyuvantes, tales como disolventes, portadores sólidos, compuestos activos en superficie, tensioactivos no iónicos, tensioactivos catiónicos, tensioactivos aniónicos y coadyuvantes adicionales en las composiciones usadas
10 según la invención, entran en consideración, por ejemplo, aquellos descritos en el documento EP-A-736.252, página 7, línea 51 a página 8, línea 39.

[0076] Las composiciones para uso en la protección de cosechas y en seres humanos, animales domésticos y ganado productivo comprenden generalmente de 0,1 a 99 %, especialmente de 0,1 a 95 %, de ingrediente activo y
15 de 1 a 99,9 %, especialmente de 5 a 99,9 %, de al menos un coadyuvante sólido o líquido, incluyendo generalmente la composición de 0 a 25 %, especialmente de 0,1 a 20 %, de tensioactivos (%= % en peso en cada caso). Mientras que los productos comerciales se formularán preferiblemente como concentrados, el usuario final empleará normalmente formulaciones diluidas que tienen concentraciones considerablemente menores de ingrediente activo.

20 **[0077]** La acción de los compuestos según la invención y las composiciones que los comprenden contra plagas animales puede ampliarse significativamente y adaptarse a las circunstancias dadas mediante la adición de otros insecticidas, acaricidas o nematicidas. Los aditivos adecuados incluyen, por ejemplo, representantes de las siguientes clases de ingrediente activo: compuestos organofosforados, nitrofenoles y derivados, formamidas, ureas, carbamatos, piretroides, hidrocarburos clorados y preparaciones de *Bacillus thuringiensis*.

25 **[0078]** Los ejemplos de copartícipes de mezcla especialmente adecuados incluyen: azametifós; clorfenvinfós; bupirimato; cipermetrina, cipermetrina rica en cis; ciromazina; diafentiuorón; diazinón; diclorvós; dicrotofós; diciclanilo; fenoxicarb; fluazurón; furatiocarb; isazofós; yodfenfós; kinopreno; lufenurón; metacrifós; metidación; monocrotofós; fosfamidón; profenofós; diofenolano; una sustancia obtenible a partir de *Bacillus thuringiensis* cepa
30 GC91 o de NCTC11821; pimetozina; bromopropilato; metopreno; disulfotón; quinalfós; taufluvalinato; tiociclam; tiometón; aldicarb; azinfós-metilo; benfuracarb; bifentrina; buprofezina; carbofurano; dibutilaminotio; cartap; clorfluazurón; clorpirifós; ciflutrina; alfa-cipermetrina; zeta-cipermetrina; deltametrina; diflubenzurón; endosulfán; etiofencarb; fenitrotión; fenazaquina; fenobucarb; fenvalerato; formotión; metiocarb; heptenofós; imidacloprid; isoprocarb; metamidofós; metomilo; mevinfós; paratión; paratión-metilo; fosalona; pirimicarb; propoxur;
35 teflubenzurón; terbufós; triazamato; abamectina; fenobucarb; tebufenozida; fipronilo; beta-ciflutrina; silafluofeno; fenpiroximato; piridabeno; primicarb; piriproxifeno; pirimidifeno; nematorina; nitenpiram; NI-25, acetamiprida; avermectina B₁ (abamectina); un extracto activo con insectos de una planta; una preparación que comprende nematodos activa con insectos; una preparación obtenible a partir de *Bacillus subtilis*; una preparación que comprende hongos activa con insectos; una preparación que comprende virus activa con insectos; AC 303.630;
40 acefato; acrinatrina; alanicarb; alfametrina; amitraz; AZ 60541; azinfós A; azinfós M; azociclotina; bendiocarb; bensultap; betaciflutrina; BPMC; brofenprox; bromofós A; bufencarb; butocarboxim; butilpiridabeno; cadusafós; carbarilo; carbofenotión; cloetocarb; cloretoxifós; clormefós; cis-resmetrina; clocitrina; clofentezina; cianofós; cicloprotrina; cihexatina; demetón M; demetón S; demetón-S-metilo; diclofentión; diclifós; dietión; dimetoato; dimetilvinfós; dioxatión; edifenfós; emamectina; esfenvalerato; etión; etofenprox; etoprofós; etrimfós; fenamifós; óxido
45 de fenbutatina; fenotiocarb; fenpropatrina; fenpirad; fentión; fluazinam; flucicloxurón; flucitrinato; flufenoxurón; flufenprox; fonofós; fostiazato; fubfenprox; HCH; hexaflumurón; hexitiazox; IKI-220; iprobenfós; isofenfós; isoxatión; ivermectina; lambda-cihalotrina; malatión; mecarbam; mesulfenfós; metaldehído; metolcarb; milbemectina; moxidectina; naled; NC 184; ometoato; oxamilo; oxidemetón M; oxideprofós; permetrina; fentoato; forato; fosmet;
50 foxima; pirimifós M; pirimifós A; promecarb; propafós; protiofós; protoato; piraclofós; piridafentión; pirresmetrina; piretro; RH 5992; salitión; sebufós; sulfotep; sulprofós; tebufenpirad; tebupirimfós; teflutrina; temefós; terbam; tetraclorvinfós; tiacloprida; tiametoxam; tiafenox; tiodicarb; tiofanox; tionazina; turingiensina; tralometrina; triarateno; triazofós; triazuron; triclorfón; triflumurón; trimetacarb; vamidotión; xililcarb; YI 5301/5302; zetametrina; DPX-MP062; RH-2485; D 2341 o XMC (metilcarbamato de 3,5-xililo).

55 **[0079]** Los productos de protección de cosechas preferidos tienen especialmente las siguientes composiciones (%= porcentaje en peso):

Concentrados emulsionables:

[0080]

Ingrediente activo: 1 a 90 %, preferiblemente 5 a 20 %
 Tensioactivo: 1 a 30 %, preferiblemente 10 a 20 %
 Disolvente: 5 a 98 %, preferiblemente 70 a 85 %

5

Polvos finos:

[0081]

Ingrediente activo: 0,1 a 10 %, preferiblemente 0,1 a 1 %
 Portador sólido: 99,9 a 90 %, preferiblemente 99,9 a 99 %

10

Concentrados en suspensión:

[0082]

Ingrediente activo: 5 a 75 %, preferiblemente 10 a 50 %
 Agua: 94 a 24 %, preferiblemente 88 a 30 %
 Tensioactivo: 1 a 40 %, preferiblemente 2 a 30 %

15

Polvos humectables:

20

[0083]

Ingrediente activo: 0,5 a 90 %, preferiblemente 1 a 80 %
 Tensioactivo: 0,5 a 20 %, preferiblemente 1 a 15 %

25 Gránulos:

[0084]

Ingrediente activo: 0,5 a 30 %, preferiblemente 3 a 15 %
 Portador sólido: 99,5 a 70 %, preferiblemente 97 a 85 %

30

[0085] Las composiciones según la invención pueden comprender también coadyuvantes sólidos o líquidos adicionales, tales como estabilizadores, p.ej. aceites vegetales o aceites vegetales epoxidados (p.ej., aceite de coco, aceite de colza o aceite de soja epoxidado), antiespumantes, p.ej. aceite de silicona, conservantes, reguladores de la viscosidad, aglutinantes y/o taquificantes así como fertilizantes u otros ingredientes activos para obtener efectos especiales, p.ej. acaricidas, bactericidas, fungicidas, nematocidas, molusquicidas o herbicidas selectivos.

35

[0086] Los productos de protección de cosechas según la invención se preparan de manera conocida en ausencia de coadyuvantes, p.ej., por molido, tamizado y/o compresión de un ingrediente activo sólido o mezcla de ingredientes activos, por ejemplo a un cierto tamaño de partícula, y en presencia de al menos un coadyuvante, por ejemplo, mezclando íntimamente y/o moliendo el ingrediente activo o mezcla de ingredientes activos con el coadyuvante o coadyuvantes. La invención se refiere igualmente a aquellos procesos para la preparación de las composiciones según la invención y al uso de los compuestos de fórmula (I) en la preparación de esas composiciones.

40

[0087] La invención se refiere también a los procedimientos de aplicación de los productos de protección de cosechas, concretamente a los procedimientos de control de plagas del tipo mencionado, tales como pulverización, atomización, espolvoreado, recubrimiento, cobertura, dispersión o vertido, que se seleccionan de acuerdo con los objetivos pretendidos y las circunstancias reinantes, y al uso de las composiciones para controlar plagas del tipo mencionado. Las tasas de concentración típicas son de 0,1 a 1000 ppm, preferiblemente de 0,1 a 500 ppm, de ingrediente activo. Las tasas de aplicación por hectárea son generalmente de 1 a 2000 g de ingrediente activo por hectárea, especialmente de 10 a 1000 g/ha, preferiblemente de 20 a 600 g/ha.

50

[0088] Es un procedimiento preferido de aplicación en el campo de la protección de cosechas la aplicación al follaje de las plantas (aplicación foliar), dependiendo la frecuencia y tasa de aplicación del riesgo de infestación por la plaga en cuestión. Sin embargo, el ingrediente activo puede penetrar también en las plantas a través de las raíces (acción sistémica) cuando se impregna la ubicación de las plantas con una formulación líquida o cuando se incorpora el ingrediente activo en forma sólida a la ubicación de las plantas, por ejemplo al suelo, p.ej. en forma granular (aplicación a suelo). En el caso de cosechas de arroz con cáscara, dichos gránulos pueden aplicarse en cantidades medidas al campo de arroz inundado.

55

[0089] Los productos de protección de cosechas según la invención son también adecuados para proteger material de propagación de plantas, p.ej. semilla, tal como frutos, tubérculos o granos, o esquejes de plantas, frente a plagas animales. El material de propagación puede tratarse con la composición antes de plantar; por ejemplo, la semilla puede cubrirse antes de sembrarse. Los ingredientes activos según la invención pueden aplicarse también a granos (recubrimiento) mediante impregnación de las semillas con una formulación líquida o mediante recubrimiento de las mismas con una formulación sólida. La composición puede aplicarse también al sitio de plantación cuando se está plantando el material de propagación, por ejemplo al surco de semilla durante la siembra. La invención se refiere también a dichos procedimientos de tratamiento de material de propagación de plantas y al material de propagación de plantas así tratado.

Ejemplos de preparación:

[0090] * denota ejemplos de referencia

Ejemplo P1.1: 4"-Desoxi-4"-epi-(N-3-fluorofenilmetilamino)avermectina B1

[0091] Se disuelve 1,0 g de 4"-desoxi-4"-epi-aminoavermectina B1 en 12 ml de tetrahidrofurano, se añaden 1,8 ml de ácido acético, 0,2 ml de agua y 0,18 ml de 3-fluorobenzaldehído. Se añaden entonces 90 mg de cianoborohidruro de sodio. Se agita la mezcla a temperatura ambiente durante 12 horas. Se lleva a cabo entonces la extracción con acetato de etilo y solución saturada de cloruro de sodio; se seca la fase orgánica sobre sulfato de sodio y se separan los disolventes por destilación. Se purifica el residuo por cromatografía en gel de sílice (hexano/acetato de etilo) procurando 4"-desoxi-4"-epi-(N-3-fluorofenilmetilamino)avermectina B1.

***Ejemplo P1.2: 4"-Desoxi-4"-epi-N-etilaminoavermectina B1**

[0092] Se disuelven 4,0 g de 4"-desoxi-4"-epi-aminoavermectina B1 en 24 ml de acetato de etilo. Se añaden 7,4 ml de yoduro de etilo y 24 ml de bicarbonato de sodio (1 N en agua). Se agita vigorosamente la mezcla a temperatura ambiente durante 14 horas. Se separan entonces las fases, se seca la fase orgánica sobre sulfato de sodio y se separan los disolventes por destilación. Se purifica el residuo por cromatografía en gel de sílice (hexano/acetato de etilo), procurando 4"-desoxi-4"-epi-N-etilaminoavermectina B1.

Ejemplo P1.3: 4"-Desoxi-4"-epi-N-(isopropoxicarbonilmetil)aminoavermectina B1

[0093] Se disuelven 300 mg de 4"-desoxi-4"-epi-aminoavermectina B1 en 3 ml de acetato de etilo. Se añaden 620 mg de bromoacetato de isopropilo y 3 ml de bicarbonato de sodio (1 N en agua). Se agita vigorosamente la mezcla a temperatura ambiente durante 18 horas. Se separan entonces las fases, se seca la fase orgánica sobre sulfato de sodio y se separa el disolvente por destilación. Se purifica el residuo por cromatografía en gel de sílice (hexano/acetato de etilo), procurando 4"-desoxi-4"-epi-N-(isopropoxicarbonilmetil)aminoavermectina B1.

***Ejemplo P2.1: 4"-Desoxi-4"-epi-(N-metil-N-1-propen-3-ilamino)avermectina B1**

[0094] Se disuelven 600 mg de 4"-desoxi-4"-epi-metilaminoavermectina B1 en 6 ml de acetato de etilo. Se añaden 0,56 ml de bromuro de alilo y 6 ml de carbonato de sodio (1 N en agua). Se agita vigorosamente la mezcla a 60 °C durante 18 horas y entonces se enfría. Se separan entonces las fases, se seca la fase orgánica sobre sulfato de sodio y se separa el disolvente por destilación. Se purifica el residuo por cromatografía en gel de sílice (hexano/acetato de etilo), procurando 4"-desoxi-4"-epi-(N-metil-N-1-propen-3-ilamino)avermectina B1.

***Ejemplo P2.2: 4"-Desoxi-4"-epi-(N-2-hidroxietil-N-metilamino)avermectina B1**

[0095] Etapa 1: Se disuelven 4,55 g de 4"-desoxi-4"-epi-metilaminoavermectina B1 en 45 ml de acetato de etilo. Se añaden 8,6 g de bromoacetato de etilo y 45 ml de bicarbonato de sodio (1 N en agua). Se agita vigorosamente la mezcla a 60 °C durante 18 horas y entonces se enfría. Se separan entonces las fases, se seca la fase orgánica sobre sulfato de sodio y se separa el disolvente por destilación. Se purifica el residuo por cromatografía en gel de sílice (hexano/acetato de etilo), procurando 4"-desoxi-4"-epi-(N-metil-N-etoxicarbonilmetilamino)avermectina B1.

[0096] Etapa 2: Se disuelven 300 mg de 4"-desoxi-4"-epi-(N-metil-N-etoxicarbonilmetilamino)avermectina B1 en 6 ml de tolueno. Se añaden con agitación a temperatura ambiente 1,3 ml de hidruro de diisobutilaluminio (1,2

los disolventes por destilación. Se purifica el residuo por cromatografía en gel de sílice (acetato de etilo/metanol), procurando 4"-desoxi-4"-epi-(N-etil-N-metilamino)avermectina B1.

*Ejemplo P2.8: 4"-Desoxi-4"-epi-[N-[(1-benciloxicarboniletílcarbamoil)metil]-N-metilamino]avermectina B1

5

[0104] Se disuelven 500 mg de 4"-desoxi-4"-epi-(N-carboximetil-N-metilamino)avermectina B en 5 ml de acetato de etilo y se añaden entonces 170 mg de éster bencílico de L-alanina, 72 mg de 1-hidroxi-7-azabenzotriazol y 110 mg de N,N-diciclohexilcarbodiimida. Se lleva a cabo la agitación a temperatura ambiente durante 7 días. Se extrae entonces la mezcla con acetato de etilo y bicarbonato de sodio (1 N en agua), se seca la fase orgánica sobre sulfato de sodio y se separa el disolvente por destilación. Se purifica el residuo por cromatografía en gel de sílice (hexano/acetato de etilo), procurando 4"-desoxi-4"-epi-[N-[(1-benciloxicarboniletílcarbamoil)metil]-N-metilamino]avermectina B1.

10

*Ejemplo P2.9: 4"-Desoxi-4"-epi-[N-[(1-carboxietilcarbamoil)metil]-N-metilamino]avermectina B1

15

[0105] Se disuelven 160 mg de 4"-desoxi-4"-epi-[N-[(1-benciloxicarboniletílcarbamoil)metil]-N-metilamino]avermectina B1 en 10 ml de tetrahidrofurano. Se añaden 50 mg de paladio (al 5 % en carbono) y se lleva a cabo la hidrogenación a presión normal y temperatura ambiente. Después de 3 horas, cesó la absorción de hidrógeno. Se filtra la mezcla por Celite y se separa el disolvente por evaporación, procurando 4"-desoxi-4"-epi-[N-[(1-carboxietilcarbamoil)metil]-N-metilamino]avermectina B1.

20

*Ejemplo P2.10: 4"-Desoxi-4"-epi-[N-(2-hidroxi-2-metilpropil)-N-metilamino]avermectina B1

[0106] Se disuelven 300 mg de 4"-desoxi-4"-epi-(N-metil-N-etoxicarbonilmetilamino)avermectina B1 (etapa 1 de P2.2) en 6 ml de tetrahidrofurano. Con agitación a temperatura ambiente, se añaden 0,64 ml de bromuro de metilmagnesio (3 mol/l en dietiléter). Después de 1 hora, se lleva a cabo la extracción con acetato de etilo y solución saturada de cloruro de amonio. Se separan entonces las fases, se seca la fase orgánica sobre sulfato de sodio y se separan los disolventes por destilación. Se purifica el residuo por cromatografía en gel de sílice (acetato de etilo/metanol), procurando 4"-desoxi-4"-epi-[N-(2-hidroxi-2-metilpropil)-N-metilamino]avermectina B1.

30

*Ejemplo P3.1: 4"-Desoxi-4"-epi-[N,N-bis-(1-fenil-1-propen-3-il)amino]avermectina B1

[0107] Se disuelven 3,48 g de 4"-desoxi-4"-epi-aminoavermectina B1 en 40 ml de acetato de etilo. Se añaden 4,62 g de 3-bromo-1-fenil-1-propeno y 40 ml de bicarbonato de sodio (1 N en agua). Se agita vigorosamente la mezcla a 60 °C y entonces se enfría. Se separan entonces las fases, se seca la fase orgánica sobre sulfato de sodio y se separa el disolvente por destilación. Se purifica el residuo por cromatografía en gel de sílice (hexano/acetato de etilo), procurando 4"-desoxi-4"-epi-[N,N-bis-(1-fenil-1-propen-3-il)amino]avermectina B1.

35

*Ejemplo P3.2: 4"-Desoxi-4"-epi-(azetidín-1-il)avermectina B1

40

[0108] Se disuelven 300 mg de 4"-desoxi-4"-epi-aminoavermectina B1 en 1 ml de tolueno. Se añaden 0,106 ml de 1,3-dibromopropano y 1 ml de bicarbonato de sodio (1 N en agua). Se agita vigorosamente la mezcla a 90 °C durante 24 horas y entonces se enfría. Se separan entonces las fases, se seca la fase orgánica sobre sulfato de sodio y se separa el disolvente por destilación. Se purifica el residuo por cromatografía en gel de sílice (acetato de etilo/metanol), procurando 4"-desoxi-4"-epi-(azetidín-1-il)avermectina B1.

45

*Ejemplo P3.3: 4"-Desoxi-4"-epi-[N,N-bis-(3,3-dimetilbutil)amino]avermectina B1

[0109] Se disuelven 0,87 g de 4"-desoxi-4"-epi-aminoavermectina B1 en 10 ml de tetrahidrofurano. Se añaden 1 ml de ácido píválico, 0,1 ml de agua y 0,60 g de 3,3-dimetilbutiraldehído. Se añaden entonces 0,38 g de cianoborohidruro de sodio. Se agita la mezcla a temperatura ambiente durante 14 horas. Se lleva a cabo la extracción entonces con acetato de etilo y bicarbonato de sodio (1 N en agua), se seca la fase orgánica sobre sulfato de sodio y se separan los disolventes por destilación. Se purifica el residuo por cromatografía en gel de sílice (hexano/acetato de etilo), procurando 4"-desoxi-4"-epi-[N,N-bis-(3,3-dimetilbutil)amino]avermectina B1.

55

*P4.1: 4"-Desoxi-4"-epi-[N-(3-acetoxipropil)-N-metilamino]avermectina B1

[0110] Se disuelven 100 mg de 4"-desoxi-4"-epi-[N-(3-yodopropil)-N-metilamino]avermectina B1 y 100 mg de acetato de sodio en 2 ml de N,N-dimetilformamida. Se calienta la mezcla a 60 °C y se agita a esta temperatura

durante 90 minutos. Se enfría entonces la mezcla a temperatura ambiente y se extrae con dietiléter. Se separa la fase orgánica, se lava con bicarbonato de sodio (1 N en agua) y se seca sobre sulfato de sodio. Se separa el disolvente por destilación y se purifica el residuo sobre gel de sílice usando hexano/acetato de etilo como eluyente, procurando 4"-desoxi-4"-epi-[N-(3-acetoxipropil)-N-metilamino]avermectina B1.

5

*P4.2:4"-Desoxi-4"-epi-[N-(3-yodopropil)-N-metilamino]avermectina B1

[0111] Se disuelven 3 g de 4"-desoxi-4"-epi-N-metilaminoavermectina B1 y 9 ml de 1,3-diyodopropano en 9 ml de acetato de etilo. Se añaden 18 ml de solución de bicarbonato de sodio (1 N en agua) y se agita la mezcla durante 3 días a 60 °C. Se enfría entonces la mezcla a temperatura ambiente, se separa la fase orgánica y se seca sobre sulfato de sodio. Se separa el disolvente por destilación y se purifica el residuo sobre gel de sílice usando hexano/acetato de etilo como eluyente, procurando 4"-desoxi-4"-epi-[N-(3-yodopropil)-N-metilamino]avermectina B1.

10

*P4-3: 4"-Desoxi-4"-epi-N-(2-cianoetilamino)avermectina B1

15

[0112] Se disuelven 872 mg de 4"-desoxi-4"-epi-N-aminoavermectina B1 en 5 ml de metanol. Se añaden 212 mg de acrilonitrilo y se agita la mezcla durante 3 días a temperatura ambiente. Se separa entonces el disolvente por destilación y se purifica el residuo sobre gel de sílice usando hexano/acetato de etilo como eluyente, procurando 4"-desoxi-4"-epi-N-(2-cianoetilamino)avermectina B1.

20

[0113] De forma similar a los ejemplos de preparación anteriores, es posible preparar los compuestos enumerados en las Tablas 1 a 3. En las tablas, el símbolo  denota el enlace a través del cual se enlaza el radical en cuestión con el átomo de nitrógeno del esqueleto.

25

[0114] Puesto que en la mayoría de casos los compuestos están presentes como mezclas de los derivados de avermectina B1a y B1b, la caracterización por datos físicos normales tales como punto de fusión o índice de refracción tiene poco sentido. Por esta razón, los compuestos se caracterizan por los tiempos de retención que se determinan en un análisis por HPLC (cromatografía líquida de alta resolución). Aquí, el término B1 hace referencia al componente principal en que R₁ es sec-butilo, con un contenido habitualmente de más del 80 %. B1b denota el componente minoritario en que R₁ es isopropilo. Los compuestos en que se dan dos tiempos de retención tanto para el derivado B1a como para el derivado B1b, son mezclas de diastereómeros que pueden separarse cromatográficamente. En el caso de compuestos en que se da solo un tiempo de retención en la columna B1a o solo en la columna B1b, puede obtenerse el componente B1a o B1b puro, respectivamente, durante el procesamiento. Las estructuras correctas de los componentes B1a y B1b se asignan por espectrometría de masas. Se usa el

35

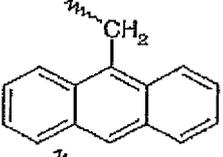
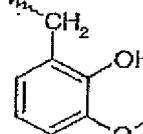
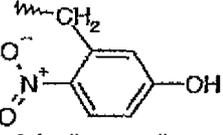
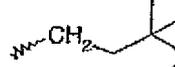
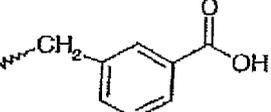
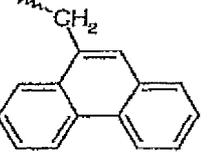
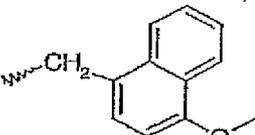
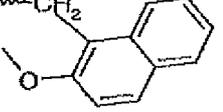
siguiente procedimiento para análisis de HPLC:

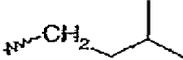
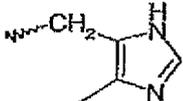
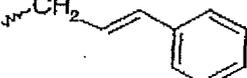
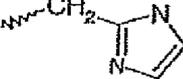
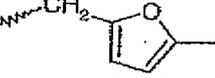
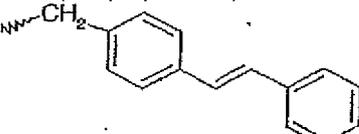
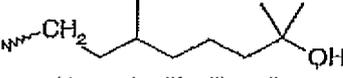
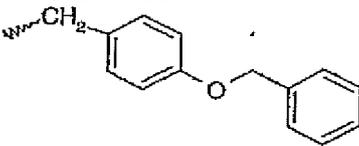
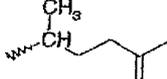
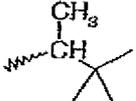
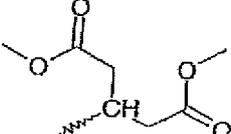
Condiciones de gradiente de HPLC			
Disolvente A:	Ácido trifluoroacético al 0,01 % en H ₂ O		
Disolvente B:	Ácido trifluoroacético al 0,01 % en CH ₃ CN		
Tiempo (min):	A [%]	B [%]	Caudal (µl/min)
0	80	20	500
0,1	50	50	500
10	5	95	500
15	0	100	500
17	0	100	500
17,1	80	20	500
22	80	20	500
Tipo de columna	YMC-Pack ODS-AQ		
Longitud de columna	125 mm		
Diámetro interno de columna	2 mm		
Temperatura	40 °C		

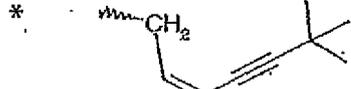
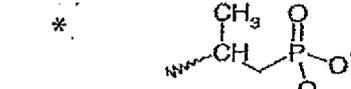
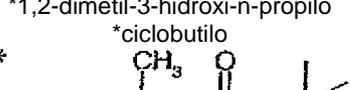
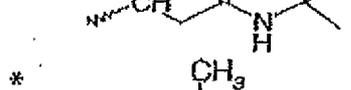
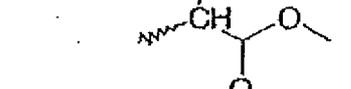
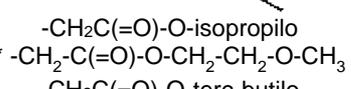
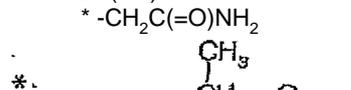
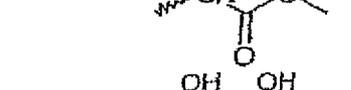
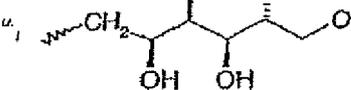
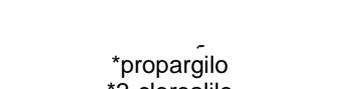
[0115] La columna YMC-Pack ODS-AQ usada para la cromatografía de los compuestos se fabrica por YMC, Alte Raesfelderstrasse 6, 46514 Schermbeck, Alemania.

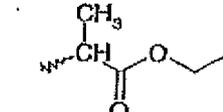
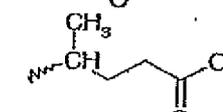
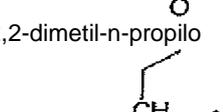
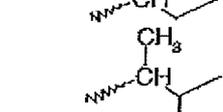
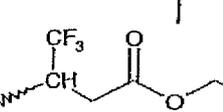
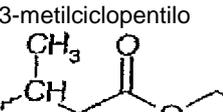
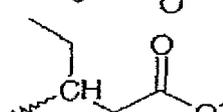
40

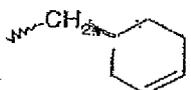
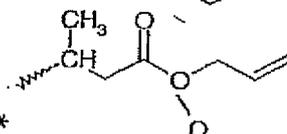
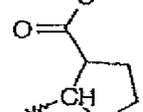
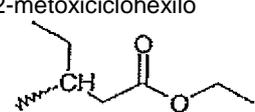
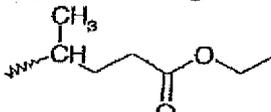
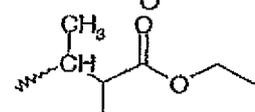
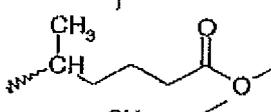
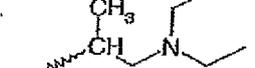
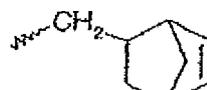
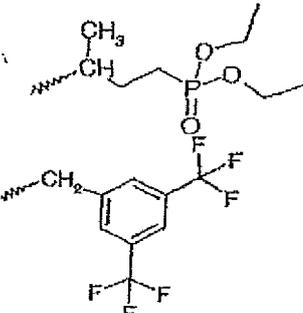
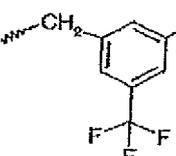
Tabla 1: Compuestos de fórmula (I) en que R₁ es sec-butilo (B1a) o isopropilo (B1b) y R₂ es hidrógeno. * Denota ejemplo de referencia.

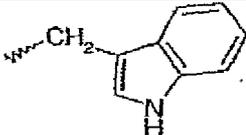
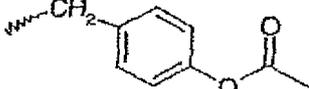
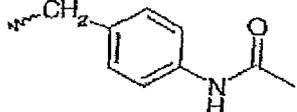
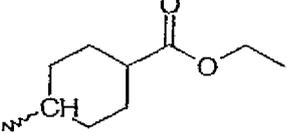
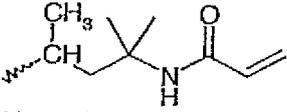
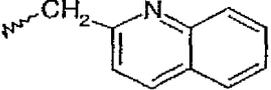
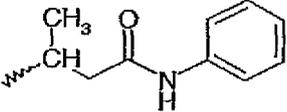
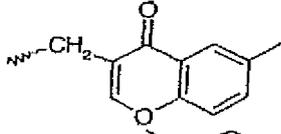
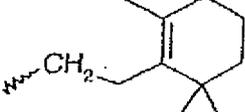
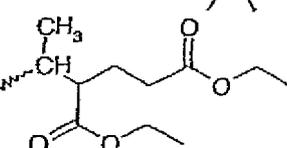
No.	R ₃	Tiempo de retención (min)	
		B1a	B1b
1.1		7.64	7.06
1.2		5.92	5.62
1.3	(3-nitrofenil)metilo	5.80	5.59
1.4*	(4-dimetilaminofenil)metilo	6.12	5.87
1.5	(3-bromofenil)metilo	6.32	6.00
1.6		5.84	5.48
1.7*	2-fenil-n-propilo	6.62/6.41	6.20/6.00
1.8	3-piridilmetilo	5.96	5.61
1.9	(2,4-dimetilfenil)metilo	6.59	6.22
1.10	(3-fluorofenil)metilo	5.80	5.46
1.11 *		6.18	5.87
1.12		5.39	5.14
1.13 *		7.11	6.72
1.14	(3,4-metilendioxi-6-nitrofenil)metilo	6.01	5.66
1.15 *		8.37	7.75
1.16	(2-hidroxi-5-metoxifenil)metilo	5.64	5.26
1.17	(2-hidroxi-4-metoxifenil)metilo	5.81	5.55
1.18	(2,3-dihidroxifenil)metilo	5.45	5.10
1.19	(2-hidroxi-5-nitrofenil)metilo	6.28	5.92
1.20 *		6.73	6.34
1.21 *	dec-4-en-1-ilo	7.96	7.54

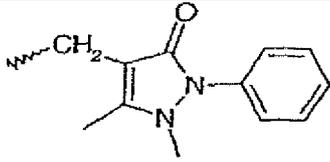
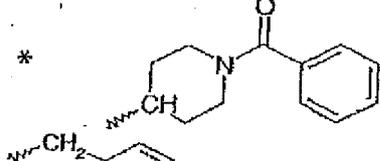
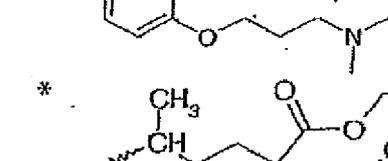
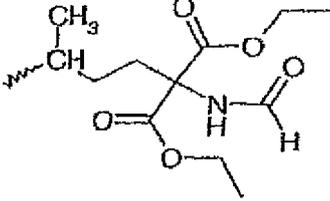
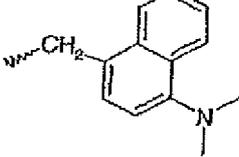
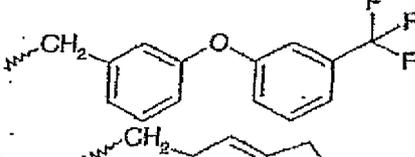
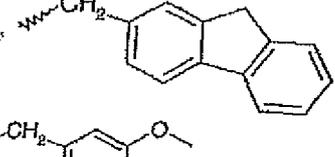
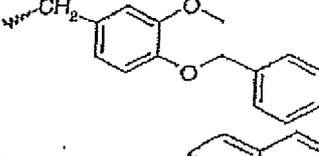
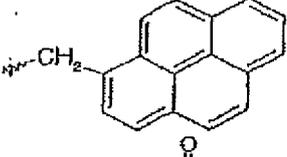
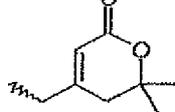
1.22	(3-[4-metoxifenoxi]fenil)metilo	7.00	6.62
1.23 *		6.63	6.25
1.24 *	3-fenil-n-propilo	7.03	6.65
1.25	4-piridilmetilo	5.40	5.07
1.26 *		4.57	4.32
1.27 *	etilo	5.30	4.96
1.28 *	n-butilo	5.56	5.10
1.29 *		5.95	5.60
1.30	(2-bromofenil)metilo	6.85	6.47
1.31		5.24	4.86
1.32 *		5.74	5.36
1.33 *	(4-n-propoxifenil)metilo	6.49	6.10
1.34		7.18	-
1.35	(2-cloro-4-hidroxifenil)metilo	6.30	5.87
1.36	ciclododecilo	9.2	8.80
1.37 *	1-metil-n-butilo	6.76/6.98	6.33/6.50
1.38 *	4-hidroxi-1-metil-n-butilo	6.25	5.70
1.39 *	1-metil-n-propilo	7.50	6.81
1.40 *		6.50	6.10
1.41 *	(4-terc-butilfenil)metilo	7.31	6.98
1.42 *	3-fenil-n-butilo	7.22	6.90
1.43		6.84	6.56
1.44	*-CH ₂ -C(=O)-O-CH ₂ -fenilo	7.15	6.76
1.45	-CH ₂ -C(=O)-O-metilo	5.75	5.39
1.46	-CH ₂ -C(=O)-O-etilo	6.12	5.72
1.47	* 	6.95	6.41
1.48	* 	6.40	5.96
1.49	* 	6.27	5.81

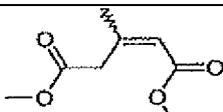
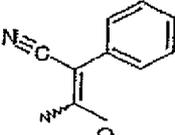
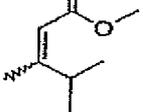
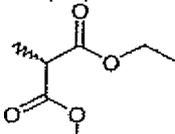
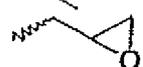
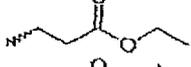
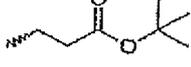
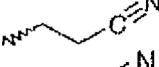
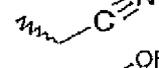
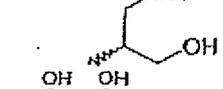
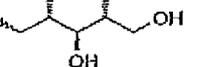
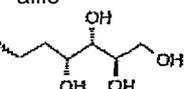
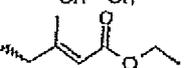
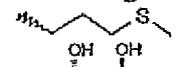
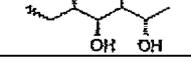
1.50	* 	5.86	5.50
1.51	* 	5.24	5.86
1.52	* 	5.35	5.00
1.53	* 	5.20	4.86
1.54	*1,2-dimetil-3-hidroxi-n-propilo	5.71	5.30
1.55	*ciclobutilo	5.61	5.24
1.56	* 	7.42	6.90
1.57	* 	6.47	6.02
1.58	-CH ₂ C(=O)-O-isopropilo	5.93	5.72
1.59	* -CH ₂ -C(=O)-O-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₃	5.44	5.21
1.60	-CH ₂ C(=O)-O-terc-butilo	6.15	5.97
1.61	* -CH ₂ C(=O)NH ₂	4.83	4.58
1.62	* 	6.13	5.67
1.63	* 	3.46	3.26
1.64	*propargilo	5.36	4.97
1.65	*2-cloroalilo	5.93	5.51
1.66	*3,3-dicloroalilo	6.12	5.72
1.67	* 	5.97	5.59
1.68	* 	5.57	5.24
1.69	* 	5.20	4.86
1.70	* 	5.71	5.30

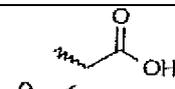
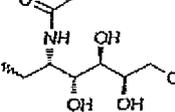
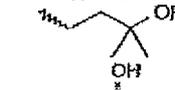
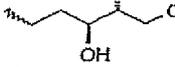
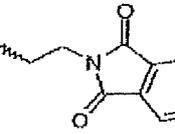
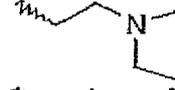
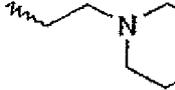
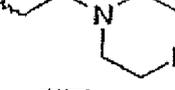
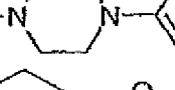
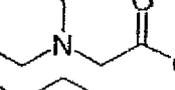
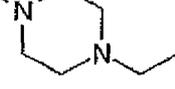
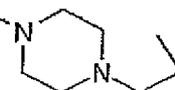
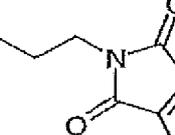
1.71			
1.72			
1.73	*		
1.74	*		
1.75			
1.76			
1.77	*		
1.78	*		
1.79	*		
1.80	*		
1.81	*		
1.82	*		
1.83			
1.84			
1.85			
1.86			
1.87			
1.88			
1.89			
1.90			
1.91			
1.92			
1.93			
1.94			
1.95			
1.96			
1.97			
1.98			
1.99			
1.100			
1.101			
1.102			
1.103			

1.104	*		
1.105	*		
1.106	*		
1.107		*2-metoxiciclohexilo	
1.108	*		
1.109	*		
1.110	*		
1.111	*		
1.112	*		
1.113		(2-trifluorometilfenil)metilo	
1.114		(3-trifluorometoxifenil)metilo	
1.115		(3-cianofenil)metilo	
1.116		(2,3-metilendioxfenil)metilo	
1.117		(2-metoxi-5-bromofenil)metilo	
1.118		(3-bromo-4-hidroxi-5-metoxifenil)metilo	
1.119		(2-nitro-3-metoxifenil)metilo	
1.120		(4-metoxifenil)metilo	
1.121		(3-hidroxi-4-metoxifenil)metilo	
1.122	*		
1.123		*2-etilhexilo	
1.124	*		
1.125			
1.126		[4-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil]metilo	

1.127			
1.128			
1.129		(3-bromo-4,6-dimetoxifenil)metilo	
1.130		(2-bromo-4,5-dimetoxifenil)metilo	
1.131			
1.132		(2-nitro-4,5-dimetoxifenil)metilo	
1.133		*2-benciloietilo	
1.134		(3,5-dimetil-4-hidroxifenil)metilo	
1.135		(2-hidroxi-4,6-dimetoxifenil)metilo	
1.136	*		
1.137	*		
1.138			
1.139	*		
1.140		(2,4,6-trimetilfenil)metilo	
1.141		*3,7-dimetiloct-6-en-1-ilo	
1.142		*naft-1-ilo	
1.143		*naft-2-ilo	
1.144	*		
1.145	*		
1.146	*		

1.147	<p>*</p> 		
1.148	<p>*</p> 		
1.149			
1.150	<p>*</p> 		
1.151	<p>*n-dodecilo</p>		
1.152	<p>(3-[3,4-diclorofenoxi]fenil)metilo</p>		
1.153	<p>(3-[4-clorofenoxi]fenil)metilo</p>		
1.154	<p>*</p> 		
1.155	<p>*</p> 		
1.156	<p>*</p> 		
1.157			
1.158	<p>*</p> 		
1.159	<p>*</p> 		

1.160	*		11.03	10.39
1.161	*		12.27	11.70
1.162	*		12.28	
1.163		*n-propilo	5.42	5.08
1.164		*isobutilo	5.49	5.26
1.165		*3,3,3-trifluorometilo	5.55	5.23
1.166		*3-hidroxiopropilo	4.83	4.54
1.167	*		10.79	10.24
1.168	*		4.91	4.54
1.169		*n-pentilo	5.42	5.17
1.170		*n-hexilo	5.82	5.55
1.171		*n-heptilo	6.18	5.87
1.172		*n-nonilo	7.10	6.83
1.173		*n-decilo	7.53	7.21
1.174			5.12	4.79
1.175			5.72	5.45
1.176	*		4.57	4.18
1.177	*		9.01	8.37
1.178	*		4.64	4.43
1.179	*		4.12	
1.180		*alilo	4.91	4.59
1.181	*		3.99	3.75
1.182	*		5.49	5.12
1.183	*		5.28	4.91
1.184	*		4.27	4.00

1.185	*		5.43	
1.186	*		4.09	
1.187	*		4.98	4.67
1.188	*		4.16	3.89
1.189		*2-feniletilo	5.49	5.12
1.190	*		5.23	4.96
1.191		* $-(CH_2)_2NH_2$		
1.192		* $(CH_2)_2N(CH_3)_2$		
1.193	*			
1.194	*			
1.195	*			
1.196	*			
1.197	*			
1.198	*			
1.199	*			
1.200	*			
1.201	*			
1.202	*			

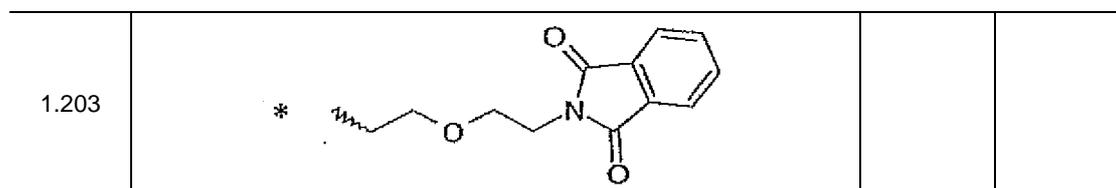
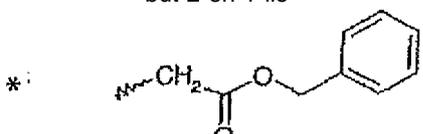
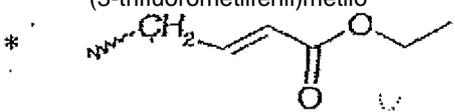
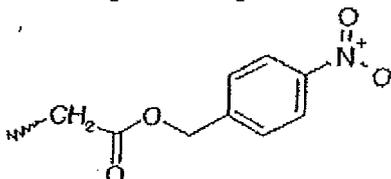
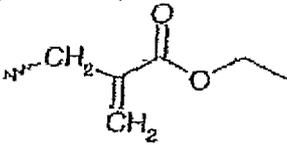
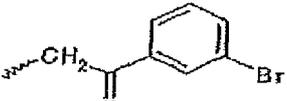
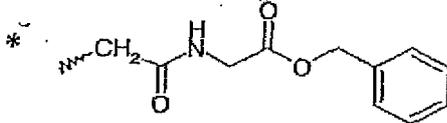
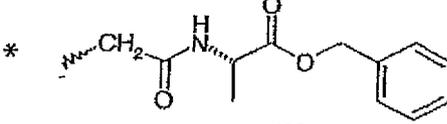
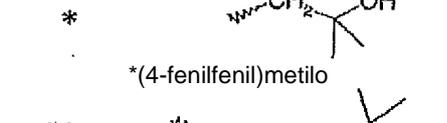
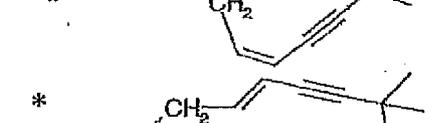
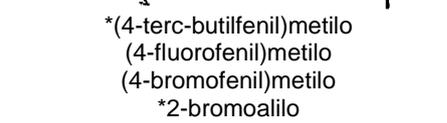
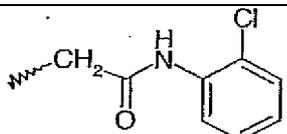
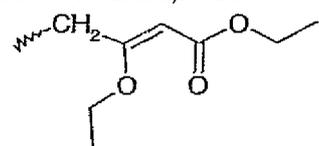
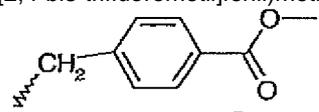
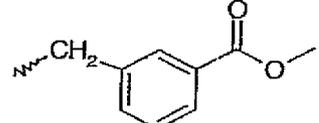
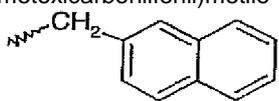
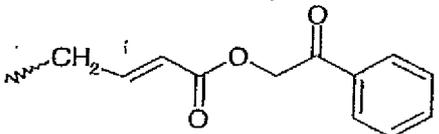
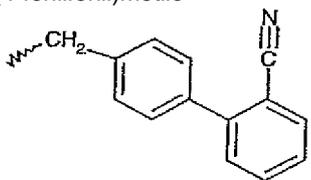


Tabla 2: Compuestos de fórmula (I) en que R₁ es sec-butilo (B1a) o isopropilo (B1b) y R₂ es metilo:

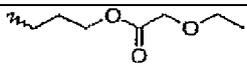
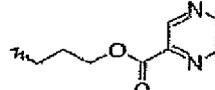
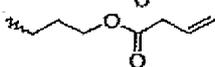
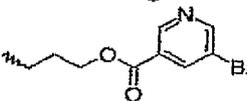
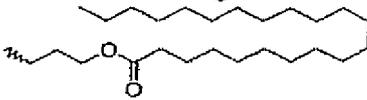
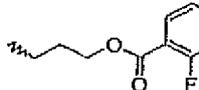
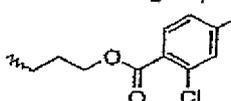
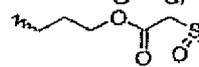
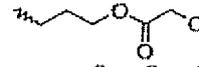
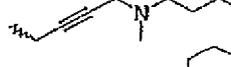
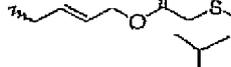
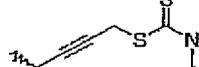
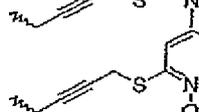
No.	R ₃	Tiempo de retención (min)	
		B1a	B1b
2.1	bencilo	6.20	5.75
2.2	*alilo	5.53	5.25
2.3	-CH ₂ -C(=O)-O-etilo	6.57	6.05
2.4	*2-hidroxi-etilo	4.27	3.97
2.5	-CH ₂ -C(=O)-O-metilo	6.09	5.66
2.6	*but-2-en-1-ilo	6.11	5.66
2.7	* 	7.53	7.08
2.8	-CH ₂ -C(=O)-O-terc-butilo	7.05	6.59
2.9	(4-fluoro-2-trifluorometilfenil)metilo	9.49	8.97
2.10	(4-fluoro-3-trifluorometilfenil)metilo	7.25	6.61
2.11	(3,4-difluorofenil)metilo	6.55	6.11
2.12	*isopropilo	4.48	4.13
2.13	(3-trifluorometilfenil)metilo	7.38	6.96
2.14	* 	6.40	5.99
2.15	*2-metilalilo	6.19	5.88
2.16	*-CH ₂ -C(=O)-OH	6.42	5.91
2.17	*-CH ₂ -C(=O)-NH ₂	5.27	4.97
2.18	* 	8.18	7.69
2.19	(2-metilfenil)metilo	7.02	6.59
2.20	* 	6.55	6.15
2.21	* 	5.20	5.00
2.22	*etilo	5.11	4.67

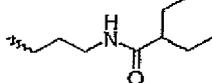
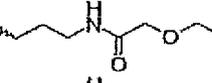
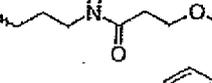
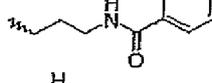
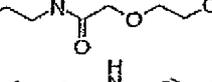
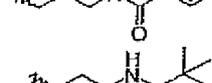
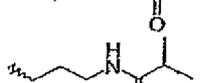
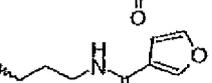
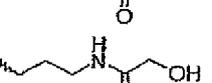
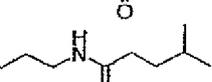
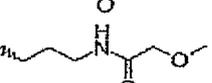
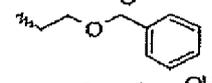
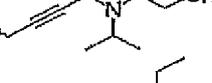
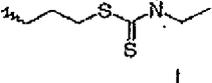
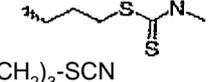
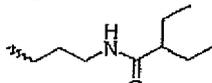
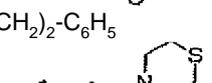
2.23	* 	7.08	6.62
2.24	* 	6.95	6.55
2.25	* 	4.98	4.55
2.26	* (4-fenilfenil)metilo	7.84	7.43
2.27	* 	7.86	7.59
2.28	* 	6.56	6.12
2.29	* (4-terc-butilfenil)metilo	8.32	7.94
2.30	(4-fluorofenil)metilo	6.88	6.49
2.31	(4-bromofenil)metilo	7.50	7.07
2.32	* 2-bromoalilo		
2.33	-CH ₂ -C(=O)-O-isopropilo		
2.34	* -CH ₂ -C(=O)-O-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₃		
2.35	(2,3,4-trifluorofenil)metilo		
2.36	(2,4,5-trifluorofenil)metilo		
2.37	(2,3,6-trifluorofenil)metilo		
2.38	(3,5-dibromofenil)metilo		
2.39	(3-fluoro-6-bromofenil)metilo		
2.40	(2,3-diclorofenil)metilo		
2.41	(2,6-diclorofenil)metilo		
2.42	(2,5-diclorofenil)metilo		
2.43	(3,4-diclorofenil)metilo		
2.44	(2-fluoro-3-clorofenil)metilo		
2.45	(2-cloro-4-fluorofenil)metilo		
2.46	(2,5-difluorofenil)metilo		
2.47	(2,6-difluorofenil)metilo		
2.48	(2,3-difluorofenil)metilo		
2.49	(3,5-difluorofenil)metilo		
2.50	(3-bromofenil)metilo		
2.51	(2-clorofenil)metilo		
2.52	(2-fluorofenil)metilo		
2.53	(3-fluorofenil)metilo		
2.54	(4-yodofenil)metilo		
2.55	(2-yodofenil)metilo		
2.56	(4-nitrofenil)metilo		
2.57	(3-nitrofenil)metilo		
2.58	(2-cloro-5-[trifluorometil]fenil)metilo		
2.59	(3-fluoro-5-[trifluorometil]fenil)metilo		
2.60	(3,5-diclorofenil)metilo		
2.61	(2-trifluorometilfenil)metilo		
2.62	(3-trifluorometoxifenil)metilo		
2.63	(4-cianofenil)metilo		
2.64	(2-cianofenil)metilo		
2.65	(3-cianofenil)metilo		
2.66	* (2,3-dicloro-4-metoxifenil)metilo		

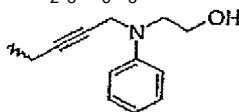
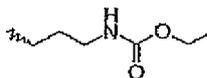
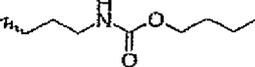
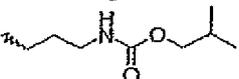
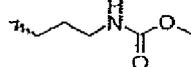
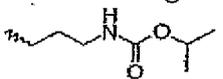
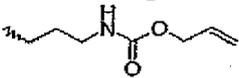
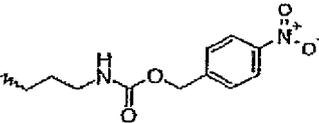
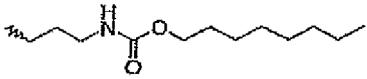
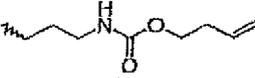
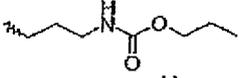
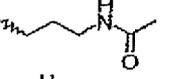
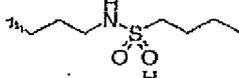
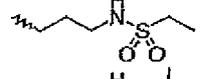
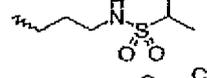
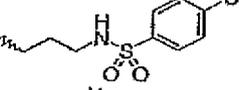
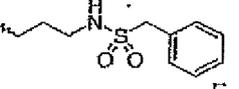
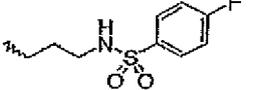
2.67	*			
2.68		(4-difluorometoxifenil)metilo	7.88	7.56
2.69		(2-fluoro-3-metilfenil)metilo		
2.70	*			
2.71		([3,5-bis-trifluorometil]fenil)metilo		
2.72		([2,4-bis-trifluorometil]fenil)metilo		
2.73				
2.74				
2.75		(3,5-dimetilfenil)metilo		
2.76		(2-metoksi-4-metoxicarbonilfenil)metilo		
2.77	*			
2.78	*		6.94	6.67
2.79		*(2-fenilfenil)metilo		
2.80		*(4-fenilfenil)metilo		
2.81	*		5.18	4.81
2.82		*n-propilo		
2.83		*isopropilo	5.77	5.34
2.84		*n-butilo	5.93	5.55
2.85		*n-pentilo	6.52	6.09
2.86		*n-hexilo	7.10	6.62
2.87		*n-heptilo	7.32	7.00
2.88		*n-octilo	5.66	5.23
2.89		*isobutilo	5.77	5.34
2.90		*sec-butilo		
2.91		*terc-butilo		
2.92		*isopentilo	5.98	5.61
2.93		*neopentilo	5.99	5.49
2.94		*isohexilo	5.61	5.18

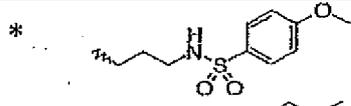
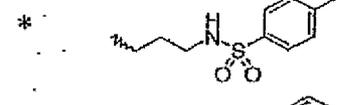
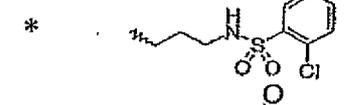
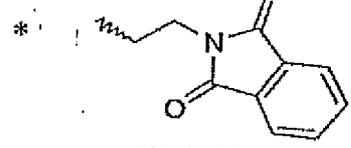
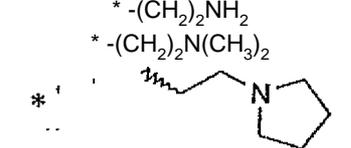
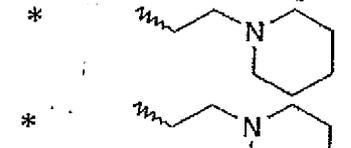
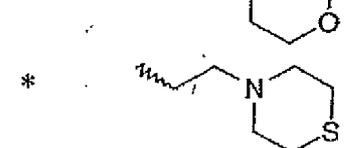
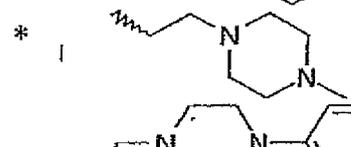
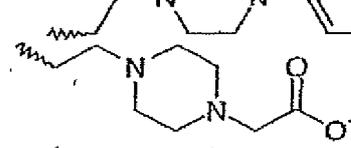
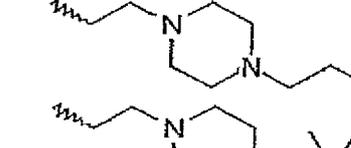
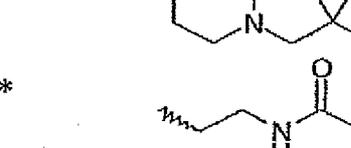
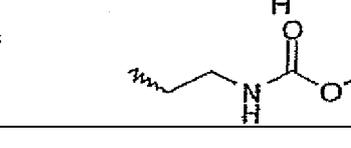
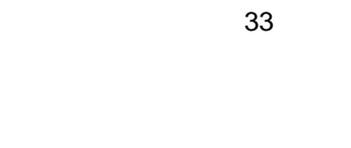
2.95	*			
2.96				
2.97		*trifluorometilo	10.60	
2.98		*propargilo	6.63	6.25
2.99	*		8.54	
2.100		*3,3-dicloroalilo	5.99	5.61
2.101		*2-cloroalilo	7.63	7.04
2.102		*3,3,3-trifluoropropilo	6.14	5.66
2.103	*		9.34	
2.104	*		8.41	
2.105		*3-hidroxiopropilo	4.70	4.38
2.106		*n-nonilo	7.74	7.42
2.107		*n-decilo	8.38	8.06
2.108		*3-yodopropilo	5.12	4.75
2.109		*ciclobutilo	5.50	5.13
2.110		*-(CH ₂) ₃ N(CH ₃) ₂	3.41	3.04
2.111		*-(CH ₂) ₃ NH ₂	3.29	
2.112		*-(CH ₂) ₃ NHCH ₃	3.37	
2.113	*		4.77	4.38
2.114	*		5.58	5.09
2.115		*-CH ₂ -CH=CH-CH ₂ -Cl	5.71	5.29
2.116		*-CH ₂ -CH=CH-CH ₂ -N(CH ₃) ₂	3.26	3.07
2.117			5.60	5.28
2.118		*-CH ₂ -CH ₂ -CN	5.66	5.28
2.119				
2.120			6.29	5.92
2.121	*		5.74	5.39

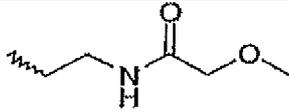
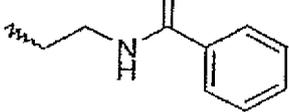
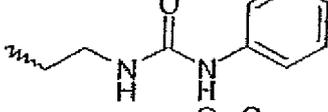
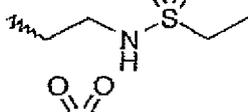
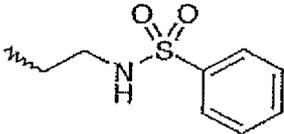
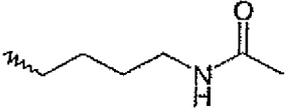
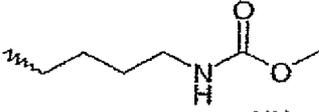
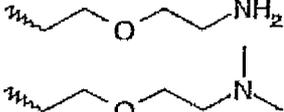
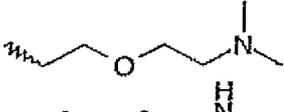
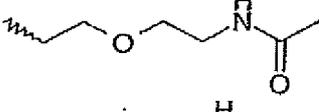
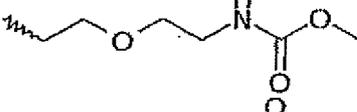
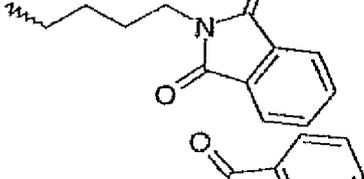
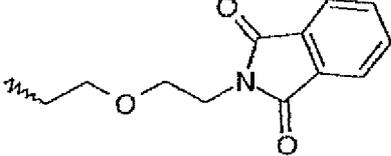
2.122		* -CH ₂ -CN	10.23	
2.123	*		5.33	5.02
2.124	*		5.07	4.76
2.125	*		5.24	5.01
2.126	*		7.74	7.47
2.127	*		4.70	4.43
2.128	*		5.17	4.87
2.129	*		6.17	5.88
2.130	*		6.88	6.51
2.131	*		5.60	5.28
2.132	*		4.75	4.46
2.133	*		5.59	
2.134	*		5.39	5.01
2.135	*		5.33	4.91
2.136	*		3.83	3.63
2.137	*		4.08	3.78
2.138	*		4.77	4.45
2.139	*		3.80	3.60
2.140	*		7.86	7.37
2.141	*		5.81	5.39
2.142	*		4.91	4.54
2.143	*		6.36	5.94
2.144	*		7.80	7.35

2.145	*		7.27	6.76
2.146	*		6.83	6.29
2.147	*		8.22	7.78
2.148	*		8.11	7.63
2.149	*		13.55	13.30
2.150	*		5.37	5.13
2.151	*		6.43	6.03
2.152	*		4.86	4.59
2.153	*		5.01	4.75
2.154	*		3.81	3.64
2.155	*		3.91	3.70
2.156	*		3.48	3.31
2.157	*		3.63	3.41
2.158	*		4.11	3.79
2.159	*		5.04	
2.160	*		3.72	
2.161	*		4.05	3.84
2.162	*		3.79	3.52
2.163	*		4.67	4.37
2.164	*		5.50	5.11

2.165	*		5.49	5.17
2.166	*		4.80	4.48
2.167	*		4.75	4.53
2.168	*		5.33	4.96
2.169	*		4.64	4.37
2.170	*		4.85	4.48
2.171	*		5.49	5.07
2.172	*		4.96	4.64
2.173	*		4.85	4.59
2.174	*		4.37	4.11
2.175	*		5.60	5.28
2.176	*		4.59	4.27
2.177	*		6.29	5.87
2.178	*		3.52	3.36
2.179	*		6.56	6.08
2.180	*		5.81	5.44
2.181		* $-(\text{CH}_2)_3\text{-SCN}$	5.16	
2.182	*		4.69	
2.183		* $-(\text{CH}_2)_2\text{-C}_6\text{H}_5$	6.13	5.71
2.184	*		3.52	3.36
2.185	*		3.58	3.36

2.186	* $-(\text{CH}_2)_3-\text{C}_6\text{H}_5$	6.40	5.92
2.187	* 	5.55	5.17
2.188	* 	5.23	4.96
2.189	* 	5.87	5.55
2.190	* 	6.03	5.65
2.191	* 	4.91	4.64
2.192	* 	5.44	5.12
2.193	* 	5.55	5.23
2.194	* 	5.71	5.44
2.195	* 	7.69	7.36
2.196	* 	5.60	5.28
2.197	* 	5.71	5.33
2.198	* 	4.48	4.21
2.199	* 	5.28	4.96
2.200	* 	4.80	4.53
2.201	* 	5.07	4.80
2.202	* 	5.81	5.49
2.203	* 	5.63	5.31
2.204	* 	5.82	5.44

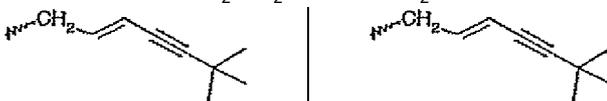
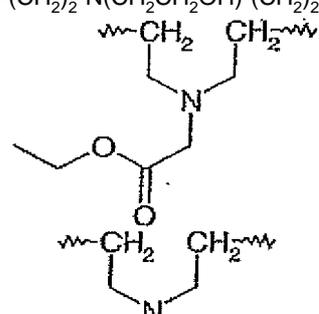
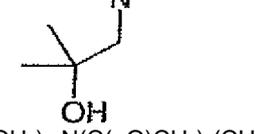
2.205	* 	5.71	5.44
2.206	* 	5.92	5.60
2.207	* 	5.98	5.60
2.208	* 		
2.209	* $-(CH_2)_2NH_2$		
2.210	* $-(CH_2)_2N(CH_3)_2$		
2.211	* 		
2.212	* 		
2.213	* 		
2.214	* 		
2.215	* 		
2.216	* 		
2.217	* 		
2.218	* 		
2.219	* 		
2.220	* 		
2.221	*		

2.222	* 		
2.223	* 		
2.224	* 		
2.225	* 		
2.226 *			
2.227 *	-(CH ₂) ₄ NH ₂		
2.228 *	-(CH ₂) ₄ N(CH ₃) ₂		
2.229 *			
2.230 *			
2.231 *			
2.232 *			
2.233 *			
2.234 *			
2.235 *			
2.236 *			

2.237 *			
2.238 *			
2.239			
2.240 *			
2.241 *			
2.242 *			
2.243 *			
2.244 *			
2.245 *			
2.246 *			
2.247 *			
2.248 *			

Tabla 3: Compuesto de fórmula (I) en que R₁ es sec-butilo (B1a) o isopropilo (B1b):

No.	R ₂	R ₃	Tiempo de retención (min)	
			B1a	B1b
3.1 *	3-fenilalilo	3-fenilalilo	8.54	
3.2 *		-(CH ₂) ₄ -	5.69	
3.3 *		-(CH ₂) ₃ -	5.50	
3.4 *	3-fenil-n-propilo	3-fenil-n-propilo	8.46	
	3,7-dimetil-oct-6-en-1-ilo	3,7-dimetil-oct-6-en-1-ilo	10.74	
3.6	etilo		8.28	
3.7 *	etilo	etilo	5.73	5.31
3.8 *	-CH ₂ CH ₂ C(CH ₃)	-CH ₂ CH ₂ C(CH ₃)	9.11	8.64
3.9 *			8.34	7.85
3.10 *		-CH ₂ -CH(OH)-CH ₂ -		5.12

3.11 *	-CH ₂ -CH ₂ -CH(OH)-CH ₂ -		5.53	5.15
3.12 *			10.75	10.36
3.13	etilo	bencilo		
3.14 *	etilo	alilo	4.38	4.11
3.15	etilo	-CH ₂ C(=O)OC ₂ H ₅	6.21	5.74
3.16 *	3-metil-n-butilo	3-metil-n-butilo		
3.17 *	3-fenil-n-butilo	3-fenil-n-butilo		
3.18 *	etilo	n-propilo		
3.19 *	etilo	isopropilo		
3.20 *	etilo	n-butilo		
3.21 *	etilo	pentilo		
3.22 *	etilo	hexilo		
3.23 *	etilo	heptilo		
3.24 *	etilo	n-octilo		
3.25 *	etilo	sec-butilo		
3.26 *	etilo	tert-butilo		
3.27 *	etilo	isopentilo		
3.28 *	etilo	neopentilo		
* 3.29	etilo	isohexilo		
* 3.30	(CH ₂) ₅ -			
* 3.31	-(CH ₂)-ciclopropilo	-(CH ₂)-ciclopropilo	6.13	5.71
* 3.32	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -			
* 3.33	-(CH ₂) ₂ -S-(CH ₂) ₂ -			
* 3.34	-(CH ₂) ₂ -NH-(CH ₂) ₂ -			
* 3.35	-(CH ₂) ₂ -NCH ₃ -(CH ₂) ₂ -			
* 3.36	-(CH ₂) ₂ -N(i-Propilo)-(CH ₂) ₂ -			
* 3.37	-(CH ₂) ₂ -N(CH ₂ CH ₂ OH)-(CH ₂) ₂ -			
* 3.38				
* 3.39				
* 3.40	-(CH ₂) ₂ -N(C(=O)CH ₃)-(CH ₂) ₂ -			
* 3.41	-(CH ₂) ₂ -N(C ₆ H ₅)-(CH ₂) ₂ -			
* 3.42	-(CH ₂) ₂ -N(CH ₂ C ₆ H ₅)-(CH ₂) ₂ -			

Ejemplos de formulación para uso en la protección de cosechas (%= porcentaje en peso)

<u>Ejemplo F1: Concentrados de emulsión</u>		a)	b)	c)
5	Compuesto activo	25 %	40 %	50 %
	Dodecibencenosulfonato de calcio	5 %	8 %	6 %
	Poli(etilenglicol)éter de aceite de ricino (36 mol de EO)	5 %	-	-
	Tributilfenolpoli(etilenglicol)éter (30 mol de EO)	-	12 %	4 %

Ciclohexanona	-	15 %	20 %
Mezcla de xilenos	65 %	25 %	20 %

El mezclado de compuesto activo finalmente molido y aditivos da un concentrado de emulsión que, por dilución con agua, procura emulsiones de la concentración deseada.

	<u>Ejemplo F2: Soluciones</u>	a)	b)	c)	d)
	Compuesto activo	80 %	10 %	5 %	95 %
	Etilenglicolmonometiléter	-	20 %	-	-
10	Polietilenglicol (PM 400)	-	-	70 %	-
	N-metilpirrolid-2-ona	20 %	-	-	-
	Aceite de coco epoxidado	-	-	-	1 %
	Éter de petróleo (intervalo de ebullición: 160-190 °C)	-	-	94 %	-

15 El mezclado de compuesto activo finamente molido y aditivos da una solución adecuada para uso en forma de microgotas.

	<u>Ejemplo F3: Soluciones</u>	a)	b)	c)	d)
	Compuesto activo	5 %	10 %	8 %	21 %
20	Caolín	94 %	-	79 %	54 %
	Ácido silícico finalmente dividido	1 %	-	13 %	7 %
	Atapulgita	-	90 %	-	18 %

25 Se disuelve el compuesto activo en diclorometano, se pulveriza la solución sobre la mezcla de portadores y se evapora el disolvente a presión reducida.

	<u>Ejemplo F4: Polvo humectable</u>	a)	b)	c)
	Compuesto activo	25 %	50 %	75 %
	Lignosulfonato de sodio	5 %	5 %	-
30	Laurilsulfato de sodio	3 %	-	5 %
	Diisobutilnaftalenosulfonato de sodio	-	6 %	10 %
	Octilfenolpolietilenglicoléter (7-8 mol de EO)	-	2 %	-
	Ácido silícico finalmente dividido	5 %	10 %	10 %
	Caolín	62 %	27 %	-

35 Se mezclan compuesto activo y aditivos y se muele la mezcla en un molino adecuado. Esto da polvos humectables que pueden diluirse con agua dando suspensiones de la concentración deseada.

	<u>Ejemplo F5: Concentrado en emulsión</u>	
40	Compuesto activo	10 %
	Octilfenolpolietilenglicoléter (4-5 mol de EO)	3 %
	Dodecibencenosulfonato de calcio	3 %
	Polietilenglicoléter de aceite de ricino (36 mol de EO)	4 %
	Ciclohexanona	30 %
45	Mezcla de xilenos	50 %

El mezclado de compuesto activo finamente molido y aditivos da un concentrado de emulsión que, por dilución con agua, procura emulsiones de la concentración deseada.

50	<u>Ejemplo F6: Gránulos extruidos</u>	
	Compuesto activo	10 %
	Lignosulfonato de sodio	2 %
	Carboximetilcelulosa	1 %
	Caolín	87 %

55 Se mezclan compuesto activo y aditivos, se muele la mezcla, se humedece con agua, se extruye y se granula, y se secan los gránulos con corriente de aire.

Ejemplo 7: Gránulos recubiertos

Compuesto activo	3 %
Polietilenglicol (PM 200)	3 %
Caolín	94 %

5 En un mezclador, se aplica el compuesto activo finamente molido uniformemente al caolín, que se ha humedecido con polietilenglicol. Esto da gránulos recubiertos libres de polvo.

Ejemplo F8: Concentrado de suspensión

Compuesto activo	40 %
10 Etilenglicol	10 %
Nonilfenolpolietilenglicoléter (15 mol de EO)	6 %
Lignosulfonato de sodio	10 %
Carboximetilcelulosa	1 %
Solución acuosa de formaldehído (al 37 %)	0,2 %
15 Emulsión acuosa de aceite de silicona (al 75 %)	0,8 %
Agua	32 %

El mezclado de compuesto activo finamente molido y aditivos da un concentrado de suspensión que, por dilución con agua, procura suspensiones de la concentración deseada.

20

Ejemplo biológicos:

Ejemplo B1: Actividad contra *Spodoptera littoralis*

25 **[0116]** Se pulverizan plantas de judía de soja jóvenes con una solución de pulverización en emulsión acuosa que comprende 12,5 ppm de compuesto activo y, después de secar el recubrimiento de pulverización, se pueblan con 10 orugas de la primera etapa de *Spodoptera littoralis* y se introducen en un envase de plástico. 3 días después, se determina la reducción de la población en porcentaje y la reducción del daño por alimentación en porcentaje (% de actividad) comparando el número de orugas muertas y el daño por alimentación entre las plantas tratadas y no tratadas.

30

[0117] En esta prueba, los compuestos de las tablas muestran buena actividad. Por tanto, en particular los compuestos 1.001, 1.002, 1.003, 1.004, 1.005, 1.006, 1.007, 1.008, 1.009, 1.010, 1.011, 1.012, 1.013, 1.014, 1.015, 1.016, 1.017, 1.018, 1.019, 1.020, 1.021, 1.022, 1.023, 1.024, 1.025, 1.026, 1.027, 1.028, 1.029, 1.030, 1.031, 1.032, 35 1.033, 1.034, 1.035, 1.036, 1.037, 1.038, 1.039, 1.040, 1.041, 1.042, 1.043, 1.044, 1.045, 1.046, 1.047, 1.048, 1.050, 1.051, 1.052, 1.053, 1.054, 1.055, 1.056, 1.057, 1.058, 1.059, 1.060, 1.061, 1.062, 1.063, 1.064, 1.065, 1.066, 1.067, 1.068, 1.069, 1.070, 1.071, 1.072, 1.073, 1.074, 1.075, 1.076, 1.077, 1.078, 1.079, 1.080, 1.081, 1.082, 1.083, 1.084, 1.085, 1.086, 1.087, 1.088, 1.089, 1.090, 1.091, 1.092, 1.093, 1.094, 1.095, 1.096, 1.097, 1.098, 1.099, 1.100, 1.101, 1.102, 1.103, 1.104, 1.106, 1.107, 1.109, 1.110, 1.111, 1.112, 1.113, 1.114, 1.115, 1.116, 1.117, 1.118, 1.119, 1.120, 40 1.121, 1.122, 1.123, 1.124, 1.125, 1.126, 1.127, 1.128, 1.129, 1.130, 1.131, 1.132, 1.133, 1.134, 1.135, 1.136, 1.137, 1.138, 1.139, 1.140, 1.141, 1.142, 1.143, 1.144, 1.145, 1.146, 1.147, 1.148, 1.149, 1.150, 1.151, 1.152, 1.153, 1.154, 1.155, 1.156, 1.157, 1.158, 2.001, 2.002, 2.003, 2.004, 2.005, 2.006, 2.007, 2.008, 2.009, 2.010, 2.011, 2.012, 2.013, 2.014, 2.015, 2.016, 2.017, 2.018, 2.019, 2.020, 2.021, 2.022, 2.023, 2.023, 2.024, 2.025, 2.026, 2.027, 2.028, 2.029, 2.030, 2.031, 2.032, 2.033, 2.034, 2.035, 2.036, 2.037, 2.038, 2.039, 2.040, 2.041, 2.042, 2.043, 2.044, 2.045, 45 2.046, 2.047, 2.048, 2.049, 2.050, 2.051, 2.052, 2.053, 2.054, 2.055, 2.056, 2.057, 2.058, 2.059, 2.060, 2.061, 2.062, 2.063, 2.064, 2.065, 2.066, 2.067, 2.068, 2.069, 2.070, 2.071, 2.072, 2.073, 2.074, 2.075, 2.076, 2.077, 2.078, 2.079, 2.080, 2.081, 3.001, 3.002, 3.003, 3.004, 3.005, 3.006, 3.007, 3.008, 3.009, 3.010, 3.011 y 3.012 efectúan una reducción de la población de plagas en más de un 80 %.

50 Ejemplo B2: Actividad contra *Spodoptera littoralis*, sistémico:

[0118] Se colocan plantones de maíz en la solución de prueba. Después de 6 días, se cortan las hojas, se colocan sobre papel de filtro húmedo en una placa Petri y se pueblan con 12 a 15 larvas de *Spodoptera littoralis* de la etapa L1. 4 días después, se determina la reducción de la población en porcentaje (% de actividad) comparando 55 el número de orugas muertas entre las plantas tratadas y no tratadas.

[0119] En esta prueba, los compuestos de las tablas muestran buena actividad. Por tanto, en particular, los compuestos 1.001, 1.002, 1.003, 1.004, 1.005, 1.006, 1.007, 1.008, 1.009, 1.010, 1.012, 1.013, 1.014, 1.015, 1.016, 1.017, 1.018, 1.019, 1.020, 1.021, 1.022, 1.023, 1.024, 1.025, 1.026, 1.027, 1.028, 1.029, 1.030, 1.031, 1.032, 1.033,

1.034, 1.035, 1.036, 1.037, 1.038, 1.039, 1.040, 1.041, 1.042, 1.043, 1.044, 1.045, 1.046, 1.047, 1.048, 1.049, 1.050, 1.051, 1.052, 1.053, 1.054, 1.055, 1.056, 1.057, 1.058, 1.059, 1.060, 1.061, 1.062, 1.064, 1.065, 1.066, 1.067, 1.068, 1.069, 1.070, 1.071, 1.072, 1.073, 1.074, 1.075, 1.076, 1.077, 1.078, 1.079, 1.080, 1.081, 1.082, 1.083, 1.084, 1.085, 1.086, 1.087, 1.088, 1.089, 1.090, 1.091, 1.092, 1.093, 1.094, 1.095, 1.096, 1.097, 1.098, 1.099, 1.100, 1.101, 1.102, 5 1.103, 1.104, 1.105, 1.106, 1.107, 1.108, 1.109, 1.110, 1.111, 1.112, 1.113, 1.114, 1.115, 1.116, 1.117, 1.118, 1.119, 1.120, 1.121, 1.122, 1.123, 1.124, 1.125, 1.126, 1.127, 1.128, 1.129, 1.130, 1.131, 1.132, 1.133, 1.134, 1.135, 1.136, 1.137, 1.138, 1.138, 1.139, 1.140, 1.141, 1.142, 1.143, 1.144, 1.145, 1.146, 1.147, 1.148, 1.149, 1.150, 1.151, 1.152, 1.153, 1.154, 1.155, 1.156, 1.157, 1.158, 2.001, 2.002, 2.003, 2.004, 2.005, 2.006, 2.007, 2.008, 2.009, 2.010, 2.011, 2.012, 2.013, 2.014, 2.015, 2.016, 2.017, 2.018, 2.019, 2.020, 2.021, 2.022, 2.023, 2.024, 2.025, 2.026, 2.027, 2.028, 10 2.029, 2.030, 2.031, 2.032, 2.033, 2.034, 2.035, 2.036, 2.037, 2.038, 2.039, 2.040, 2.041, 2.042, 2.043, 2.044, 2.045, 2.046, 2.047, 2.048, 2.049, 2.050, 2.051, 2.052, 2.053, 2.054, 2.055, 2.056, 2.057, 2.058, 2.059, 2.060, 2.061, 2.062, 2.063, 2.064, 2.065, 2.066, 2.067, 2.068, 2.069, 2.070, 2.071, 2.072, 2.073, 2.074, 2.075, 2.076, 2.077, 2.078, 2.079, 2.080, 2.081, 3.001, 3.002, 3.003, 3.004, 3.005, 3.006, 3.007, 3.008, 3.009, 3.010, 3.011 y 3.012 efectúan una reducción de la población de plagas de más de un 80 %.

15

Ejemplo B3: Actividad contra *Heliothis virescens*

[0120] Se colocan 30-35 huevos de 0 a 24 horas de *Heliothis virescens* sobre papel de filtro en una placa Petri sobre una capa de alimentación sintética. Se pipetea entonces 0,8 ml de la solución de prueba sobre los papeles de filtro. Se lleva a cabo la evaluación después de 6 días. Se determina la reducción de la población en porcentaje (% de actividad) comparando el número de huevos y larvas muertos en los papeles de filtro tratados y no tratados.

[0121] En esta prueba, los compuestos de las tablas muestran buena actividad. Por tanto, en particular los compuestos 1.001, 1.002, 1.003, 1.004, 1.005, 1.006, 1.007, 1.008, 1.009, 1.010, 1.011, 1.012, 1.013, 1.014, 1.015, 1.016, 1.017, 1.018, 1.019, 1.020, 1.021, 1.022, 1.023, 1.024, 1.025, 1.026, 1.027, 1.028, 1.029, 1.030, 1.031, 1.032, 1.033, 1.034, 1.035, 1.036, 1.037, 1.038, 1.039, 1.040, 1.041, 1.042, 1.043, 1.044, 1.045, 1.046, 1.047, 1.048, 1.052, 1.053, 1.054, 1.055, 1.056, 1.057, 1.069, 1.070, 1.071, 1.072, 1.073, 1.074, 1.075, 1.076, 1.078, 1.079, 1.080, 1.081, 1.082, 1.083, 1.084, 1.085, 1.086, 1.087, 1.088, 1.089, 1.090, 1.091, 1.092, 1.093, 1.094, 1.095, 1.096, 1.097, 1.098, 30 1.099, 1.100, 1.101, 1.102, 1.103, 1.104, 1.107, 1.109, 1.110, 1.111, 1.112, 1.113, 1.114, 1.115, 1.116, 1.117, 1.118, 1.119, 1.120, 1.121, 1.122, 1.123, 1.124, 1.125, 1.126, 1.127, 1.128, 1.129, 1.130, 1.131, 1.132, 1.133, 1.134, 1.135, 1.136, 1.137, 1.138, 1.138, 1.139, 1.140, 1.141, 1.142, 1.143, 1.144, 1.145, 1.147, 1.148, 1.149, 1.150, 1.151, 1.152, 1.153, 1.154, 1.155, 1.156, 1.157, 1.158, 2.001, 2.002, 2.003, 2.005, 2.006, 2.007, 2.008, 2.009, 2.010, 2.011, 2.012, 2.013, 2.014, 2.015, 2.016, 2.017, 2.018, 2.019, 2.020, 2.021, 2.026, 2.027, 2.028, 2.029, 2.030, 2.031, 2.032, 2.033, 35 2.034, 2.035, 2.036, 2.037, 2.038, 2.039, 2.040, 2.042, 2.043, 2.044, 2.045, 2.046, 2.047, 2.048, 2.049, 2.050, 2.051, 2.052, 2.053, 2.054, 2.055, 2.056, 2.057, 2.058, 2.059, 2.062, 2.063, 2.064, 2.066, 2.067, 2.068, 2.069, 2.070, 2.071, 2.073, 2.074, 2.075, 2.076, 2.077, 2.078, 2.079, 2.080, 2.081, 3.001, 3.002, 3.003, 3.004, 3.005, 3.006, 3.007, 3.008, 3.009 y 3.010 efectúan la reducción de la población de plagas de más de un 80 %.

40 Ejemplo B4: Actividad contra orugas de *Plutella xylostella*

[0122] Se pulverizan plantas de repollo jóvenes con una solución de pulverización en emulsión acuosa que comprende 12,5 ppm de compuesto activo. Después de secar el recubrimiento de pulverización, se pueblan las planas de repollo con 10 orugas de la primera etapa de *Plutella xylostella* y se introducen en un envase de plástico. Se lleva a cabo la evaluación después de 3 días. Se determinan la reducción de la población en porcentaje y la reducción del daño por alimentación en porcentaje (% de actividad) comparando el número de orugas muertas y el daño por alimentación sobre las plantas tratadas y no tratadas.

[0123] En esta prueba, los compuestos de las tablas muestran buena actividad contra *Plutella xylostella*. Por tanto, en particular los compuestos 1.001, 1.002, 1.003, 1.004, 1.005, 1.006, 1.007, 1.008, 1.009, 1.010, 1.011, 1.012, 1.013, 1.014, 1.015, 1.016, 1.017, 1.018, 1.019, 1.020, 1.021, 1.022, 1.023, 1.024, 1.025, 1.026, 1.027, 1.028, 1.029, 1.030, 1.031, 1.032, 1.033, 1.034, 1.035, 1.037, 1.038, 1.039, 1.040, 1.041, 1.042, 1.043, 1.046, 1.050, 1.051, 1.052, 1.053, 1.054, 1.055, 1.056, 1.057, 1.058, 1.060, 1.061, 1.070, 1.075, 1.082, 1.083, 1.084, 1.085, 1.086, 1.087, 1.088, 1.089, 1.090, 1.091, 1.092, 1.093, 1.094, 1.095, 1.096, 1.097, 1.098, 1.099, 1.100, 1.101, 1.102, 1.104, 1.113, 55 1.114, 1.115, 1.116, 1.117, 1.118, 1.119, 1.120, 1.121, 1.122, 1.123, 1.125, 1.126, 1.127, 1.128, 1.129, 1.130, 1.131, 1.132, 1.133, 1.134, 1.135, 1.138, 1.140, 1.141, 1.142, 1.143, 1.144, 1.145, 1.147, 1.149, 1.151, 1.152, 1.153, 1.154, 1.155, 1.156, 1.157, 1.158, 2.001, 2.002, 2.003, 2.005, 2.006, 2.007, 2.008, 2.009, 2.010, 2.011, 2.012, 2.013, 2.014, 2.015, 2.017, 2.018, 2.019, 2.020, 2.021, 2.022, 2.026, 2.027, 2.028, 2.029, 2.030, 2.031, 2.032, 2.033, 2.034, 2.035, 2.042, 2.046, 2.057, 2.068, 2.070, 2.073, 2.077, 2.078, 3.001, 3.002, 3.003, 3.004, 3.005, 3.006, 3.007, 3.008 y 3.009

efectúan una reducción de la población de plagas de más de un 80 %.

Ejemplo B5: Actividad contra *Frankliniella occidentalis*

5 [0124] Se colocan en placas Petri discos de las hojas de judías sobre agar y se pulverizan con solución de prueba en una cámara de pulverización. Se pueblan entonces las hojas con una población mixta de *Frankliniella occidentalis*. Se lleva a cabo la evaluación después de 10 días. Se determina la reducción en porcentaje (% de actividad) comparando la población sobre las hojas tratadas con la de las hojas no tratadas.

10 [0125] En particular, los compuestos 1.027, 1.037, 1.038, 1.039, 1.040, 1.050, 1.061, 1.065, 1.068, 1.082, 2.005, 2.006, 2.007, 2.008, 2.009, 2.010, 2.011, 2.012, 2.013, 2.014, 2.015, 2.016, 2.017, 2.018, 2.020, 2.021, 2.026, 2.027, 2.028, 2.029, 2.030, 2.032, 2.033, 2.034, 2.036, 2.038, 2.040, 2.042, 2.046, 2.047, 2.049, 2.050, 2.051, 2.055, 2.057, 2.062, 2.070, 2.071, 2.072, 3.003, 3.006 y 3.012 efectúan una reducción de la población de plagas de más de un 80 %.

15

Ejemplo B6: Actividad contra *Diabrotica balteata*

[0126] Se pulverizan plantones de maíz con una solución de pulverización en emulsión acuosa que comprende 12,5 ppm de compuesto activo y, después de secar el recubrimiento de pulverización, se puebla con 10
20 larvas de la segunda etapa de *Diabrotica balteata* y se introducen entonces en un envase de plástico. Después de 6 días, se determina la reducción de la población en porcentaje (% de actividad) comparando las larvas muertas entre las plantas tratadas y no tratadas.

[0127] En esta prueba, los compuestos de las tablas muestran buena actividad. Por tanto, en particular los
25 compuestos 1.002, 1.003, 1.004, 1.005, 1.006, 1.007, 1.008, 1.009, 1.010, 1.011, 1.012, 1.013, 1.014, 1.015, 1.016, 1.017, 1.018, 1.019, 1.020, 1.021, 1.022, 1.023, 1.024, 1.025, 1.027, 1.028, 1.029, 1.030, 1.031, 1.032, 1.033, 1.034, 1.035, 1.037, 1.038, 1.039, 1.040, 1.041, 1.042, 1.043, 1.045, 1.046, 1.047, 1.048, 1.052, 1.053, 1.054, 1.055, 1.056, 1.057, 1.058, 1.059, 1.063, 1.064, 1.065, 1.066, 1.067, 1.068, 1.069, 1.070, 1.071, 1.072, 1.074, 1.075, 1.076, 1.077, 1.078, 1.079, 1.080, 1.081, 1.082, 1.083, 1.084, 1.085, 1.086, 1.087, 1.088, 1.090, 1.091, 1.092, 1.093, 1.094, 1.095,
30 1.096, 1.097, 1.098, 1.099, 1.100, 1.101, 1.102, 1.104, 1.105, 1.107, 1.108, 1.109, 1.111, 1.113, 1.114, 1.115, 1.116, 1.117, 1.118, 1.119, 1.120, 1.121, 1.122, 1.123, 1.125, 1.126, 1.127, 1.128, 1.129, 1.130, 1.131, 1.132, 1.133, 1.134, 1.135, 1.136, 1.137, 1.138, 1.139, 1.140, 1.141, 1.142, 1.143, 1.144, 1.145, 1.147, 1.148, 1.149, 1.150, 1.151, 1.152, 1.153, 1.154, 1.155, 1.156, 1.157, 1.158, 2.001, 2.002, 2.003, 2.004, 2.005, 2.006, 2.007, 2.008, 2.009, 2.010, 2.011, 2.012, 2.013, 2.014, 2.015, 2.016, 2.017, 2.018, 2.019, 2.020, 2.021, 2.022, 2.025, 2.026, 2.027, 2.028, 2.030, 2.031,
35 2.032, 2.033, 2.034, 2.046, 2.050, 2.051, 2.052, 2.056, 2.073, 2.074, 2.076, 2.077, 3.001, 3.002, 3.004, 3.005, 3.006, 3.007, 3.008 y 3.009 efectúan una reducción de la población de plaga de más de un 80 %.

Ejemplo B7: Actividad contra *Tetranychus urticae*

40 [0128] Se pueblan plantas de judía jóvenes con una población mixta de *Tetranychus urticae* y, después de 1 día, se pulverizan con una solución de pulverización en emulsión acuosa que comprende 12,5 ppm de compuesto activo, se incuban a 25 °C durante 6 días y se evalúan entonces. Se determina la reducción de la población en porcentaje (% de actividad) comparando el número de huevos, larvas y adultos muertos sobre las plantas tratadas y no tratadas.

45

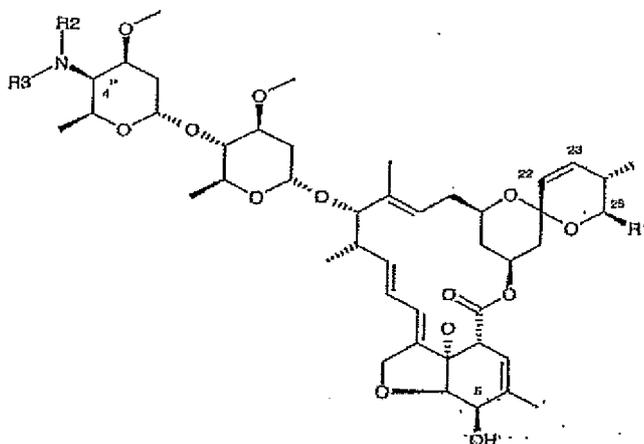
[0129] En esta prueba, los compuestos de las tablas muestran buena actividad. Por tanto, en particular los compuestos 1.001, 1.002, 1.003, 1.004, 1.005, 1.006, 1.007, 1.008, 1.009, 1.010, 1.011, 1.012, 1.013, 1.014, 1.015, 1.016, 1.017, 1.018, 1.019, 1.020, 1.021, 1.022, 1.023, 1.024, 1.025, 1.026, 1.027, 1.028, 1.029, 1.030, 1.031, 1.032, 1.033, 1.034, 1.035, 1.036, 1.037, 1.038, 1.039, 1.040, 1.041, 1.042, 1.043, 1.044, 1.045, 1.046, 1.047, 1.048, 1.049,
50 1.050, 1.051, 1.052, 1.053, 1.054, 1.055, 1.056, 1.057, 1.058, 1.059, 1.060, 1.061, 1.062, 1.063, 1.064, 1.065, 1.066, 1.067, 1.068, 1.069, 1.070, 1.071, 1.072, 1.073, 1.074, 1.075, 1.076, 1.077, 1.078, 1.079, 1.080, 1.081, 1.082, 1.083, 1.084, 1.085, 1.086, 1.087, 1.088, 1.089, 1.090, 1.091, 1.092, 1.093, 1.094, 1.095, 1.096, 1.097, 1.098, 1.099, 1.100, 1.101, 1.102, 1.103, 1.104, 1.105, 1.106, 1.107, 1.108, 1.109, 1.110, 1.111, 1.112, 1.113, 1.114, 1.115, 1.116, 1.117, 1.118, 1.119, 1.120, 1.121, 1.122, 1.123, 1.124, 1.126, 1.127, 1.128, 1.129, 1.130, 1.131, 1.132, 1.133, 1.134, 1.135,
55 1.136, 1.137, 1.138, 1.139, 1.140, 1.141, 1.142, 1.143, 1.144, 1.145, 1.146, 1.147, 1.148, 1.149, 1.150, 1.151, 1.152, 1.153, 1.154, 1.155, 1.156, 1.157, 1.158, 2.001, 2.002, 2.003, 2.004, 2.005, 2.006, 2.007, 2.008, 2.009, 2.010, 2.011, 2.012, 2.013, 2.014, 2.015, 2.016, 2.017, 2.018, 2.019, 2.020, 2.021, 2.022, 2.023, 2.024, 2.025, 2.026, 2.027, 2.028, 2.029, 2.030, 2.031, 2.032, 2.033, 2.034, 2.035, 2.036, 2.037, 2.038, 2.039, 2.040, 2.041, 2.042, 2.043, 2.044, 2.045, 2.046, 2.047, 2.048, 2.049, 2.051, 2.052, 2.053, 2.054, 2.055, 2.056, 2.057, 2.058, 2.059, 2.060, 2.061, 2.062, 2.063,

ES 2 623 062 T3

2.064, 2.065, 2.066, 2.067, 2.068, 2.069, 2.070, 2.071, 2.072, 2.073, 2.074, 2.075, 2.076, 2.077, 2.078, 2.079, 2.081, 3.001, 3.002, 3.003, 3.004, 3.005, 3.006, 3.007, 3.008, 3.009, 3.010, 3.011 y 3.012 efectúan una reducción de la población de plaga de más de un 80 %.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula



5

en que

R₁ es isopropilo o sec-butilo;

R₂ es H o alquilo C₁₋₈;

- 10 R₃ es bencilo que porta, en el resto aromático, 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo consistente en OH, halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁₋₂, dimetilaminoalcoxi C₁₋₄, cicloalquilo C₃₋₆, halogenoalquilo C₁₋₂, alcoxi C₁₋₂, halogenoalcoxi C₁₋₂, fenoxi, fenilalquilo C₁₋₆, fenilalqueno C₁₋₄, fenoxi no sustituido o sustituido con cloro o metoxi, benciloxi no sustituido o sustituido con cloro, metoxi o triclorometilo, metilendioxi, -C(=O)R₅, -O-C(=O)R₆ y NHC(=O)R₆; o
- 15 R₃ es -CH₂-C(=O)-alcoxi C₁₋₁₂; o
R₃ es -CH₂-heterociclilo, en el que el grupo heterociclilo se selecciona de piridilo, furanilo, tetrahidrofuranilo, piranilo, tetrahidropiranilo, pirazolilo, imidazolilo, tiazolilo, benzotienilo, quinolinilo, quinoxalinilo, benzofuranilo, bencimidazolilo, benzopirrolilo, benzotiazolilo, indolilo, cumarinilo e indazolilo, donde los radicales mencionados no están sustituidos o están mono- o disustituidos independientemente entre sí con halógeno, trifluorometilo, trifluorometoxi o nitro;
- 20 R₅ es H, OH, NH₂, NH-(alquilo C₁₋₂), N-(alquilo C₁₋₂)₂, -O-alquil C₁₋₂-C(=O)-R₇, -NH-alquil C₁₋₂-C(=O)-R₇, alquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₂, alcoxi C₁₋₂-alcoxi C₁₋₂, alquenoil C₂₋₄-oxi, alquinoil C₂₋₄-oxi; fenilo, fenoxi, benciloxi, NH-fenilo, NH-alquil C₁₋₆-C(=O)-R₇ o fenilo, fenoxi, benciloxi y NH-fenilo que están sustituidos con halógeno, nitro, metoxi, trifluorometilo o trifluorometoxi;
- 25 R₆ es H, alquilo C₁₋₃, fenilo o bencilo; y
R₇ es H, OH, NH₂, NH-(alquilo C₁₋₁₂), N-(alquilo C₁₋₁₂)₂, alquilo C₁₋₁₂, alcoxi C₁₋₁₂, alcoxi C₁₋₆-alcoxi C₁₋₆, alquenoil C₂₋₈-oxilo, fenilo, fenoxi, benciloxi o NH-fenilo;
o, si es apropiado, un isómero E/Z, mezcla de isómeros E/Z y/o tautómero del mismo.
- 30 2. Un compuesto de fórmula según la reivindicación 1, en el que R₃ es bencilo que porta, en el resto aromático, de 1 a 3 sustituyentes seleccionados del grupo consistente en OH, halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁₋₂, dimetilaminoalcoxi C₁₋₄, cicloalquilo C₃₋₆, halogenoalquilo C₁₋₂, alcoxi C₁₋₂, halogenoalcoxi C₁₋₂, fenoxi, fenilalquilo C₁₋₆, fenilalqueno C₁₋₄, fenoxi no sustituido o sustituido con cloro o metoxi, benciloxi no sustituido o sustituido con cloro, metoxi o triclorometilo, metilendioxi, -C(=O)R₅, -O-C(=O)R₆ y NHC(=O)R₆;
- 35 R₅ es H, OH, NH₂, NH-(alquilo C₁₋₂), N-(alquilo C₁₋₂)₂, -O-alquil C₁₋₂-C(=O)-R₇, -NH-alquil C₁₋₂-C(=O)-R₇, alquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₂, alcoxi C₁₋₂-alcoxi C₁₋₂, alquenoil C₂₋₄-oxi, alquinoil C₂₋₄-oxi; fenilo, fenoxi, benciloxi, NH-fenilo, NH-alquil C₁₋₆-C(=O)-R₇; o fenilo, fenoxi, benciloxi, NH-fenilo que están sustituidos con halógeno, nitro, metoxi, trifluorometilo o trifluorometoxi;
- R₆ es H, alquilo C₁₋₃, fenilo o bencilo y
- 40 R₇ es H, OH, NH₂, NH-(alquilo C₁₋₁₂), N-(alquilo C₁₋₁₂)₂, alquilo C₁₋₁₂, alcoxi C₁₋₁₂, alcoxi C₁₋₆-alcoxi C₁₋₆, alquenoil C₂₋₈-oxilo, fenilo, fenoxi, benciloxi o NH-fenilo.
3. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que R₃ es -CH₂-C(=O)-alcoxi C₁₋₁₂.

4. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que R₃ es -CH₂-heterociclilo, en el que el grupo heterociclilo se selecciona de piridilo, furanilo, tetrahidrofuranilo, piranilo, tetrahidropiranilo, pirazolilo, imidazolilo, tiazolilo, benzotienilo, quinolinilo, quinoxalinilo, benzofuranilo, bencimidazolilo, benzopirrolilo, benzotiazolilo, indolilo, cumarinilo e indazolilo, en que los radicales mencionados están no sustituidos o mono- o disustituidos independientemente entre sí con halógeno, trifluorometilo, trifluorometoxi o nitro.
5. Una composición plaguicida que contiene al menos un compuesto de fórmula (I) como se describe en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4 como compuesto activo y al menos un auxiliar.
- 10 6. Un procedimiento para controlar plagas en el que se aplica una composición como se describe en la reivindicación 5 a las plagas o su hábitat.
7. Un proceso para preparar una composición como se describe en la reivindicación 5 que contiene al menos un auxiliar, en el que el compuesto activo se mezcla íntimamente y/o se muele con el auxiliar o auxiliares.
- 15 8. El uso de un compuesto de fórmula (I) como se describe en la reivindicación 1 para preparar una composición como se describe en la reivindicación 5.
9. Una composición como se describe en la reivindicación 5 para uso en el control de plagas.
- 20 10. Un procedimiento según la reivindicación 6 para proteger material de propagación de plantas, en el que se trata el material de propagación o la ubicación donde se planta el material de propagación.
11. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4 para uso en el control de plagas.