

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 630 373**

51 Int. Cl.:

A01N 43/40	(2006.01)	C07D 417/06	(2006.01)
A01N 43/54	(2006.01)	A01P 7/04	(2006.01)
A01N 43/56	(2006.01)		
A01N 43/78	(2006.01)		
A01N 43/80	(2006.01)		
C07D 213/75	(2006.01)		
C07D 401/06	(2006.01)		
C07D 405/06	(2006.01)		
C07D 413/04	(2006.01)		
C07D 413/06	(2006.01)		

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **15.04.2014 PCT/EP2014/057573**
- 87 Fecha y número de publicación internacional: **23.10.2014 WO14170300**
- 96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **15.04.2014 E 14718046 (7)**
- 97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **29.03.2017 EP 2986598**

54 Título: **Compuestos y derivados de acil-imino-piridina N-sustituidos para combatir plagas animales**

30 Prioridad:

19.04.2013 US 201361813690 P

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

21.08.2017

73 Titular/es:

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

72 Inventor/es:

**BANDUR, NINA, GERTRUD;
MCLAUGHLIN, MARTIN, JOHN y
POHLMAN, MATTHIAS**

74 Agente/Representante:

CARVAJAL Y URQUIJO, Isabel

Observaciones:

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

ES 2 630 373 T3

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

DESCRIPCIÓN

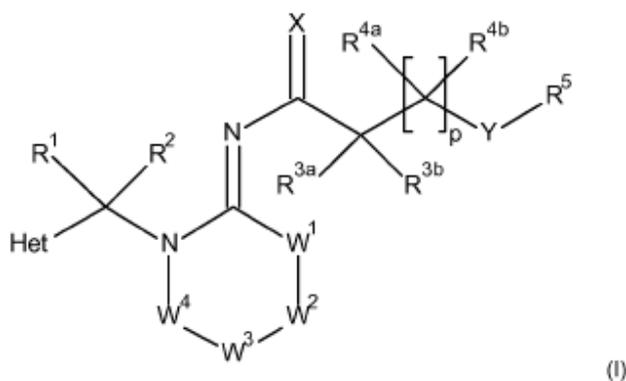
Compuestos y derivados de acil-imino-piridina N-sustituídos para combatir plagas animales

5 La presente invención se refiere a compuestos de acil-imino-piridina N-sustituídos, a los enantiómeros, diastereómeros, derivados y sales de los mismos y a composiciones que comprenden tales compuestos. La invención también se refiere al uso de los compuestos acil-imino-piridina N-sustituídos, de sus sales o de composiciones que los comprenden para combatir plagas animales. Adicionalmente, la invención se refiere también a métodos para aplicar tales compuestos.

10 Las plagas animales destruyen los cultivos en crecimiento y cosechados y atacan las viviendas de madera y las estructuras comerciales, causando grandes pérdidas económicas en el suministro de alimentos y en la propiedad. Aunque se conoce un gran número de agentes plaguicidas, debido a la capacidad de las plagas objetivo para desarrollar resistencia a dichos agentes, existe una necesidad continua de nuevos agentes para combatir plagas animales. En particular, las plagas animales tales como insectos y acaridos son difíciles de controlar efectivamente.

Por lo tanto, un objeto de la presente invención es proporcionar compuestos que tengan una buena actividad pesticida, especialmente contra insectos y acaridos difíciles de controlar.

15 Se ha encontrado que estos objetivos se resuelven mediante derivados de acil-imino-piridina N-sustituídos de la fórmula general I:



en donde

p es un entero seleccionado de 0, 1, 2, 3, 4, 5 o 6;

20 X es O o S;

Y es O o S(O)_m, en donde m es 0, 1, 2;

25 Het es un sistema de anillo heterocíclico o heteroaromático unido a carbono de 5 o 6 miembros u opcionalmente unido a nitrógeno, cada uno de los miembros del anillo seleccionados de átomos de carbono y al menos uno, hasta tres heteroátomos seleccionados independientemente de azufre, oxígeno o nitrógeno, en donde los miembros de anillo de carbono, azufre y nitrógeno pueden ser independientemente oxidados parcial o totalmente, y en el que cada anillo está opcionalmente sustituido con sustituyentes k seleccionados de R^{6a}, en donde k es un entero seleccionado de 1, 2, 3, 4, o 5, y dos o más sustituyentes R^{6a} se seleccionan independientemente unos de otros;

30 W¹, W², W³ y W⁴ representan un grupo de cadena de carbono conectado a N y C=N, y forman así un heterociclo que contiene nitrógeno de 5 o 6 miembros saturado, insaturado o parcialmente insaturado, en donde W¹, W², W³ y W⁴ cada uno representa independientemente CR^w, en donde cada R^w se selecciona independientemente uno de otro de hidrógeno, halógeno, ciano, azido, nitro, SCN, SF₅, C₁-C₁₀-alquilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₂-C₁₀-alqueno, C₂-C₁₀-alquino, y en donde los átomos de carbono de los radicales alifáticos y cicloalifáticos anteriormente mencionados pueden estar no sustituidos o parcialmente o completamente halogenados, o pueden opcionalmente estar además sustituidos independientemente uno de otro con uno o más R⁷;

35 OR⁸, NR^{9a}R^{9b}, S(O)_nR⁸, S(O)_nNR^{9a}R^{9b}, C(=O)R⁷, C(=O)NR^{9a}R^{9b}, C(=O)OR⁸, C(=S)R⁷, C(=S)NR^{9a}R^{9b}, C(=S)OR⁸, C(=S)SR⁸, C(=NR^{9a})R⁷, C(=NR^{9a})NR^{9a}R^{9b}, Si(R¹¹)₂R¹²;

fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R¹⁰;

un anillo heterocíclico aromático saturado, parcialmente saturado o insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituido con 1,

2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R¹⁰, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden estar opcionalmente oxidados;

o

dos de R^w presentes en un átomo de carbono del anillo pueden formar juntos =O, =CR¹³R¹⁴;

5 =S;, =NR^{17a}, =NOR¹⁶;=NNR^{17a};

o dos R^w de átomos de carbono adyacentes, pueden formar ambos juntos y junto con el enlace existente un doble enlace entre los átomos de carbono adyacentes;

y en donde uno de W² o W³ puede opcionalmente representar un enlace simple o doble entre los átomos de carbono adyacentes;

10 R¹, R² son independientemente uno de otro seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, CN, SCN, nitro, C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, en donde cada uno de los radicales de cadena de carbono alifáticos antes mencionados está sin sustituir, parcialmente o completamente halogenados o pueden llevar cualquier combinación de uno o más radicales R⁷;

15 Si(R¹¹)₂R¹², OR¹⁶, OSO₂R¹⁶, S(O)_nR¹⁶, S(O)_nNR^{17a}R^{17b}, NR^{17a}R^{17b}, C(=O)NR^{17a}R^{17b}, C(=S)NR^{17a}R^{17b}, C(=O)OR¹⁶, C(=O)R¹⁵, C(=S)R¹⁵, fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más, por ejemplo 1, 2, 3, 4 o sustituyentes R¹⁰, que se seleccionan independientemente unos de otros, un anillo heterocíclico aromático saturado, parcialmente saturado o insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3 o 4, sustituyentes R¹⁰, seleccionados independientemente uno de otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden estar opcionalmente oxidados,

20 o

R¹ y R² forman, junto con el átomo de carbono al que se unen, un anillo carbocíclico o heterocíclico saturado o parcialmente insaturado de 3 a 6 miembros, en donde cada uno de los átomos de carbono de dicho ciclo no está sustituido o puede llevar cualquier combinación de 1 o 2 radicales R⁷,

o

25 R¹ y R² pueden ser juntos =O, =CR¹³R¹⁴; =S;, =NR^{17a}, =NOR¹⁶;=NNR^{17a};

30 R^{3a}, R^{3b} se seleccionan cada uno independientemente uno del otro del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alquilsulfinilo, C₁-C₆-alquilsulfonilo y C₃-C₈-cicloalquilo, en donde cada uno de los seis últimos radicales mencionados están sin sustituir, parcial o totalmente halogenados, OR⁸, OSO₂R⁸, S(O)_nR⁸, S(O)_nNR^{9a}R^{9b}, NR^{9a}R^{9b}, C(=O)NR^{9a}R^{9b}, C(=S)NR^{9a}R^{9b}, C(=O)R⁷, C(=S)R⁷, fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más, por ejemplo 1, 2, 3, 4 o sustituyentes R¹⁰, que se seleccionan independientemente unos de otros, un anillo heterocíclico aromático saturado, parcialmente saturado o insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3 o 4, sustituyentes R¹⁰, seleccionados independientemente uno de otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden estar opcionalmente oxidados,

35 o

en donde R^{3a} y R^{3b} pueden formar junto con el átomo de carbono al que están unidos, un anillo alifático de 3, 4 o 5 miembros, en donde cada uno de los átomos de carbono del anillo puede estar no sustituido o puede estar parcial o totalmente halogenado,

o

40 en donde R^{3a} y R^{3b} pueden formar juntos =O, =CR¹³R¹⁴; =S;, =NR^{17a}, =NOR¹⁶;=NNR^{17a},

y, si p es 1 o más, entonces uno de R^{3a} o R^{3b} pueden formar un doble enlace con el R^{4a} o R^{4b} del átomo de carbono adyacente

45 R^{4a}, R^{4b} se seleccionan cada uno independientemente uno de otro e independientemente del entero de p del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alquilsulfinilo, C₁-C₆-alquilsulfonilo y C₃-C₈-cicloalquilo, en donde cada uno de los seis últimos radicales mencionados están sin sustituir, parcial o totalmente halogenados,

o

50 en donde R^{4a} y R^{4b} pueden formar junto con el átomo de carbono al que están unidos, un anillo carbocíclico alifático de 3, 4 o 5 miembros, en donde cada uno de los átomos de carbono del anillo puede estar no sustituido o puede estar parcial o totalmente halogenado,

o en donde R^{4a} y R^{4b} pueden formar juntos =O, =CR¹³R¹⁴; =S; , =NR^{17a}, =NOR¹⁶;=NNR^{17a},

o, si p es 1 o más, uno de R^{4a} o R^{4b} puede formar un doble enlace con R^{3a} o R^{3b} o con otro R^{4a}, o R^{4b} de los átomos de carbono adyacentes.

5 R⁵ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, ciano, C₁-C₆-alquilo, C₇-C₁₂-alquilo, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alquilsulfinilo, C₁-C₆-alquilsulfonilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₃-C₈-cicloalquiltio, C₃-C₈-cicloalquilsulfinilo, C₃-C₈-cicloalquilsulfonilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquenoiltio, C₂-C₆-alquenoilsulfinilo, C₂-C₆-alquenoilsulfonilo, C₂-C₆-alquinilo, C₂-C₆-alquiniltio, C₂-C₆-alquinilsulfinilo y C₂-C₆-alquinilsulfonilo en donde los átomos de la cadena de carbono de los últimos radicales alifáticos y cicloalifáticos antes mencionados están sin sustituir, parcial o totalmente halogenados o pueden llevar cualquier combinación de uno o más radicales R⁷;

10 C(=O)NR^{9a}R^{9b}, C(=S)NR^{9a}R^{9b}, C(=O)R⁷, C(=S)R⁷; fenilo o CH₂-fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más, por ejemplo 1, 2, 3, 4 o sustituyentes R¹⁰, que se seleccionan independientemente unos de otros;

15 un anillo heterocíclico aromático saturado, parcialmente saturado o insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituido con q sustituyentes R^y, seleccionados independientemente de q e independientemente unos de otros, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden estar opcionalmente oxidados, en donde el anillo heterocíclico puede unirse directamente o enlazarse mediante un grupo CH₂ al resto de la molécula, y en donde q es un entero seleccionado de 1, 2, 3 o 4, y R^y se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, , C₁-C₁₀-alquilo, C₂-C₁₀-alqueno, en donde los átomos de carbono de los radicales alifáticos anteriormente mencionados pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o más R¹⁵, que se seleccionan independientemente unos de otros, OR¹⁶, -S(O)_nR¹⁶, S(O)_nNR^{17a}R^{17b}, NR^{17a}R^{17b}, C(=O)R¹⁵, C(=O)OR¹⁶, -C(=NR^{17a})R¹⁵, C(=O)NR^{17a}R^{17b}, C(=S)NR^{17a}R^{17b}, o dos R^y presentes juntos en un átomo de un heterocíclico parcialmente saturado pueden ser =O, =CR¹³R¹⁴; , =NR^{17a}, =NOR¹⁶ o =NNR^{17a};

25 o dos R^y en átomos de carbono adyacentes puede ser un puente seleccionado de CH₂CH₂CH₂CH₂, CH=CHCH=CH, N=CH-CH=CH, CH=N-CH=CH, N=CH-N=CH, CH₂CH₂CH₂, CH=CHCH₂, CH₂CH₂NR^{17a}, CH₂CH=N, CH=CH-NR^{17a}, y forman junto con los átomos de carbono a los que los dos R^y están unidos, un anillo carbocíclico o heterocíclico aromático fusionado parcialmente saturado o insaturado, de 5 miembros o de 6 miembros, en donde el anillo puede estar opcionalmente sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados de =O, OH, CH₃, OCH₃, halógeno, ciano, halometilo o halometoxi;

30 R^{6a} se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, azido, nitro, SCN, SF₅, C₁-C₁₀-alquilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₂-C₁₀-alqueno, C₂-C₁₀-alquino, y en donde los átomos de carbono de los radicales alifáticos y cicloalifáticos anteriormente mencionados pueden opcionalmente estar además sustituidos independientemente uno de otro con uno o más R⁷, OR⁸, NR^{9a}R^{9b}, S(O)_nR⁸, S(O)_nNR^{9a}R^{9b}, C(=O)R⁷, C(=O)NR^{9a}R^{9b}, C(=O)OR⁸, C(=S)R⁷, C(=S)NR^{9a}R^{9b}, C(=S)OR⁸, C(=S)SR⁸, C(=NR^{9a})R⁷, C(=NR^{9a})NR^{9a}R^{9b}, Si(R¹¹)₂R¹²;

fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R¹⁰;

35 un anillo heterocíclico aromático saturado, parcialmente saturado o insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R¹⁰, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden estar opcionalmente oxidados;

40 o dos de R^{6a} presentes en un átomo de carbono o de azufre del anillo pueden formar juntos =O, =CR¹³R¹⁴; =S; =NR^{17a}, =NOR¹⁶;=NNR^{17a};

45 o dos R^{6a} juntos forman una cadena de C-C₇ alqueno, formando así, junto con los átomos del anillo a los que están unidos, un anillo de 3, 4, 5, 6, 7 o 8 miembros, donde la cadena de alqueno puede estar interrumpida por 1 o 2 O, S y/o NR^{17a} y/o 1 o 2 de los grupos CH₂ de la cadena alqueno pueden ser reemplazados por un grupo C=O, C=S y/o C=NR^{17a}; y/o la cadena alqueno puede estar sustituida por uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-haloalquiltio, C₃-C₈-cicloalquilo, C₃-C₈-halocicloalquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-haloalqueno, C₂-C₆-alquino, C₂-C₆-haloalquino, penilo que puede estar sustituido por uno o más por ejemplo 1, 2, 3, 4 o 5 radicales R¹⁰, y un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o aromático de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados de N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros de anillo, donde el anillo heterocíclico puede estar sustituido por uno o más radicales R¹⁰;

55 R⁷ es cada uno independientemente uno de otro seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, azido, nitro, -SCN, SF₅, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alquilsulfinilo, C₁-C₆-alquilsulfonilo, C₁-C₆-haloalquiltio, C₃-C₈-cicloalquilo, C₃-C₈-halocicloalquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-haloalqueno, C₂-C₆-alquino, C₂-C₆-haloalquino, Si(R¹¹)₂R¹², OR¹⁶, OSO₂R¹⁶, S(O)_nR¹⁶, S(O)_nNR^{17a}R^{17b}, NR^{17a}R^{17b}, C(=O)NR^{17a}R^{17b}, C(=S)NR^{17a}R^{17b}, C(=O)OR¹⁶, C(=O)R¹⁵, C(=S)R¹⁵, C(=NR^{17a})R¹⁵,

- fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o sustituyentes R¹⁰, que se seleccionan independientemente unos de otros, un anillo heterocíclico aromático saturado, parcialmente saturado o insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3 o 4 sustituyentes R¹⁰, seleccionados independientemente uno de otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden estar opcionalmente oxidados;
- 5 o dos R⁷ presentes en un átomo de carbono pueden formar juntos =O, =CR¹³R¹⁴; =S; =NR^{17a}, =NOR¹⁶;=NNR^{17a};
- o dos R⁷ Pueden formar un anillo carbocíclico o heterocíclico saturado o parcialmente insaturado de 3, 4, 5, 6, 7 o 8 miembros junto con los átomos de carbono a los que están unidos los dos R⁷;
- 10 R⁸ es cada uno independientemente uno de otro seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno, ciano, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alquilsulfinilo, C₁-C₆-alquilsulfonilo, C₁-C₆-haloalquiltio, C₃-C₈-cicloalquilo, C₄-C₈-alquilcicloalquilo, C₃-C₈-halocicloalquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-haloalqueno, C₂-C₆-alquinilo, C₂-C₆ haloalquinilo, -Si(R¹¹)₂R¹², S(O)_nR¹⁶, S(O)_nNR^{17a}R^{17b}, NR^{17a}R^{17b}, -N=CR¹³R¹⁴, -C(=O)R¹⁵, C(=O)NR^{17a}R^{17b}, C(=S)NR^{17a}R^{17b}, C(=O)OR¹⁶, fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R¹⁰;
- 15 que se seleccionan independientemente unos de otros, un anillo heterocíclico aromático saturado, parcialmente saturado o insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3 o 4 sustituyentes R¹⁰, seleccionados independientemente uno de otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden estar opcionalmente oxidados;
- 20 R^{9a}, R^{9b} son cada uno independientemente uno de otro seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-haloalquiltio, C₃-C₈-cicloalquilo, C₃-C₈-halocicloalquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-haloalqueno, C₂-C₆-alquinilo, C₂-C₆ haloalquinilo, S(O)_nR¹⁶, -S(O)_nNR^{17a}R^{17b}, C(=O)R¹⁵, C(=O)OR¹⁶, C(=O)NR^{17a}R^{17b}, C(=S)R¹⁵, C(=S)SR¹⁶, C(=S)NR^{17a}R^{17b}, C(=NR^{17a})R¹⁵;
- 25 fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más, por ejemplo 1, 2, 3 o 4, sustituyentes R¹⁰, que se seleccionan independientemente unos de otros;
- un anillo heterocíclico aromático saturado, parcialmente saturado o insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3 o 4 sustituyentes R¹⁰, seleccionados independientemente uno de otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden estar opcionalmente oxidados;
- 30 o, R^{9a} y R^{9b} son juntos una cadena C₂-C₇ alqueno y forman un anillo aromático saturado, parcialmente saturado o insaturado de 3, 4, 5, 6, 7 u 8 miembros junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, en donde la cadena alqueno puede contener uno o dos heteroátomos seleccionados de oxígeno, azufre o nitrógeno, y puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-haloalquiltio, C₃-C₈-cicloalquilo, C₃-C₈-halocicloalquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-haloalqueno, C₂-C₆-alquinilo, C₂-C₆ haloalquinilo,
- 35 fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R¹⁰; que se seleccionan independientemente unos de otros, un anillo heterocíclico aromático saturado, parcialmente saturado o insaturado de 3, 4, 5, 6, o 7 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R¹⁰, seleccionados independientemente uno de otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden estar opcionalmente oxidados;
- 40 o R^{9a} y R^{9b} juntos pueden formar un =CR¹³R¹⁴, =NR¹⁷ o =NOR¹⁶ radical;
- R¹⁰ es cada uno independientemente uno de otro seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, azido, nitro, SCN, SF₅, C₁-C₁₀-alquilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₂-C₁₀-alqueno, C₂-C₁₀-alquinilo, en donde los átomos de carbono de los radicales alifáticos y cicloalifáticos anteriormente mencionados pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o más R¹⁵, que se seleccionan independientemente unos de otros, Si(R¹¹)₂R¹², OR¹⁶, OS(O)_nR¹⁶, -S(O)_nR¹⁶, S(O)_nNR^{17a}R^{17b}, NR^{17a}R^{17b}, C(=O)R¹⁵, C(=S)R¹⁵, C(=O)OR¹⁶, -C(=NR^{17a})R¹⁵, C(=O)NR^{17a}R^{17b}, C(=S)NR^{17a}R^{17b}, fenilo, opcionalmente sustituido con halógeno, ciano, nitro, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi o C₁-C₆-haloalcoxi, un anillo heterocíclico aromático saturado, parcialmente saturado o insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente uno de otro de halógeno, ciano, NO₂, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi o C₁-C₆-haloalcoxi, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden estar opcionalmente oxidados;
- 50 o dos R¹⁰ presentes juntos en un átomo de un heterocíclico parcialmente saturado pueden ser =O, =CR¹³R¹⁴, =NR^{17a}, =NOR¹⁶ o =NNR^{17a};

- o, dos R¹⁰ en átomos de carbono adyacentes puede ser un puente seleccionado de CH₂CH₂CH₂CH₂, CH=CHCH=CH, N=CH-CH=CH, CH=N-CH=CH, N=CH-N=CH, OCH₂CH₂CH₂, OCH=CHCH₂, CH₂OCH₂CH₂, OCH₂CH₂O, OCH₂OCH₂, CH₂CH₂CH₂, CH=CHCH₂, CH₂CH₂O, CH=CHO, CH₂OCH₂, CH₂C(=O)O, C(=O)OCH₂, O(CH₂)O, SCH₂CH₂CH₂, SCH=CHCH₂, CH₂SCH₂CH₂, SCH₂CH₂S, SCH₂SCH₂, CH₂CH₂S, CH=CHS, CH₂SCH₂, CH₂C(=S)S, C(=S)SCH₂, S(CH₂)S, CH₂CH₂NR^{17a}, CH₂CH=N, CH=CH-NR^{17a}, OCH=N, SCH=N y forman junto con los átomos de carbono a los que los dos R¹⁰ están unidos un anillo carbocíclico o heteocíclico aromático parcialmente saturado o insaturado de 5 miembros o 6 miembros, en donde el anillo puede estar opcionalmente sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados de =O, OH, CH₃, OCH₃, halógeno, ciano, halometilo o halometoxi;
- 5
- R¹¹, R¹² (son cada uno independientemente uno de otro seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ haloalquilo, C₁-C₆ alcoxi, C₁-C₆ alcoxi-alquilo, C₂-C₆ alqueno, C₂-C₆ haloalqueno, C₂-C₆ alquino, C₂-C₆ haloalquino, C₃-C₈ cicloalquilo, C₃-C₈ halocicloalquilo, C₁-C₆ alcoxi-alquilo, C₁-C₆ haloalcoxi-alquilo y fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R¹⁰; que se seleccionan independientemente unos de otros;
- 10
- R¹³, R¹⁴ son cada uno independientemente uno de otro seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno, C₁-C₄ alquilo, C₁-C₆ cicloalquilo, C₁-C₄ alcoxi-alquilo, fenilo y bencilo;
- 15
- R¹⁵ es cada uno independientemente uno de otro seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, OH, SH, SCN, SF₅, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alquilsulfino, C₁-C₆-alquilsulfonilo, C₁-C₆-haloalquiltio, trimetilsililo, trietilsililo, tertbutildimetilsililo, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₃-C₈-cicloalquilo, en donde los cuatro últimos radicales alifáticos y cicloalifáticos mencionados pueden estar no sustituidos, parcial o totalmente halogenados y/o oxigenados y/o pueden llevar 1 o 2 radicales seleccionados de C₁-C₄ alcoxi;
- 20
- fenilo, bencilo, piridilo, fenoxi, en el que los cuatro últimos radicales pueden estar no sustituidos, parcial o totalmente halogenados y/o llevar 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados de C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, (C₁-C₆-alcoxi)carbonilo, (C₁-C₆-alquil)amino
- o di-(C₁-C₆-alquil)amino, o dos R¹⁵ presentes en el mismo átomo de carbono pueden ser juntos =O, =CH(C₁-C₄), =C(C₁-C₄-alquil)C₁-C₄-alquilo, =N(C₁-C₆-alquil) o =NO(C₁-C₆-alquil);
- 25
- R¹⁶ es cada uno independientemente uno de otro seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno, ciano, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alquilsulfino, C₁-C₆-alquilsulfonilo, C₁-C₆-haloalquiltio, trimetilsililo, trietilsililo, tertbutildimetilsililo, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₃-C₈-cicloalquilo, en donde los cuatro últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos, parcial o totalmente halogenados y/o oxigenados y/o pueden llevar 1 o 2 radicales seleccionados de C₁-C₄ alcoxi, fenilo, bencilo, piridilo, fenoxi, en el que los cuatro últimos radicales pueden estar no sustituidos, parcial o totalmente halogenados y/o llevar 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados de C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆ haloalcoxi o (C₁-C₆-alcoxi)carbonilo;
- 30
- R^{17a}, R^{17b} son cada uno independientemente uno de otro seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno, ciano, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alquilsulfino, C₁-C₆-alquilsulfonilo, C₁-C₆-haloalquiltio, trimetilsililo, trietilsililo, tertbutildimetilsililo, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₃-C₈-cicloalquilo, en donde los cuatro últimos radicales alifáticos y cicloalifáticos mencionados pueden estar no sustituidos, parcial o totalmente halogenados y/o oxigenados y/o pueden llevar 1 o 2 radicales seleccionados de C₁-C₄-alcoxi, fenilo, bencilo, piridilo, fenoxi, en donde los cuatro últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos, parcial o totalmente halogenados y/o llevar 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados de C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆ haloalcoxi o (C₁-C₆-alcoxi)carbonilo,
- 35
- o, R^{17a} y R^{17b} pueden ser juntos una cadena a C₂-C₆ alqueno que forma un anillo saturado, parcialmente saturado o insaturado de 3 a 7 miembros, junto con el átomo de nitrógeno R^{17a} y R^{17b} están unidos, en donde la cadena de alqueno puede contener 1 o 2 heteroátomos seleccionados de oxígeno, azufre o nitrógeno, y puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi o C₁-C₄-haloalcoxi, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden estar opcionalmente oxidados;
- 40
- n es un entero seleccionado independientemente uno de otro de 0, 1 o 2;
- y/o un enantiómero, diastereómero, E/Z-isómero o sales aceptables desde el punto de vista agrícola o veterinario de los mismos para controlar y/o combatir las plagas animales.
- Los nitroimino- y cianoimino-piridilos sustituidos y su uso como pesticidas se han divulgado en el documento EP 259738. Las iminopiridinas sustituidas similares se han descrito como herbicidas en el documento EP 432600.
- 50
- Las heterocicliminas de trifluoroacetilo se divulgan como insecticidas en el documento EP 268915. Los acilimino piridilos sustituidos se han divulgado como insecticidas en el documento WO 2012/029672. La producción de los mismos se describe en el documento WO 2013/031671. El documento WO2013/129692 se refiere a un derivado heterocíclico que contiene nitrógeno que tiene un grupo 2-imino, y un novedoso agente de control de plagas que utiliza el mismo. Ciertas heterocicliminas y su uso como insecticidas se describen en el documento WO 9215564

Los compuestos de acilimino-piridina N-sustituídos de la fórmula I y sus sales aceptables en agricultura o veterinaria son altamente activos frente a plagas animales, es decir, artrópodos y nematodos dañinos, especialmente contra insectos y acaridos difíciles de controlar.

5 Por consiguiente, la presente invención se refiere a compuestos de acil-imino-piridina N-sustituídos de la fórmula general I, a sus sales útiles en agricultura o veterinariamente, a sus enantiómeros o diastereómeros.

Además, la presente invención se refiere a e incluye las siguientes realizaciones:

- composiciones agrícolas y veterinarias que comprenden una cantidad de al menos un compuesto de la fórmula I o un enantiómero, diastereómero o una sal del mismo;
- 10 - el uso de un compuesto de fórmula A o un enantiómero, diastereoisómero o una sal del mismo para combatir plagas animales;
- un método de lucha contra las plagas animales que comprende poner en contacto a las plagas animales, su hábito, terreno de reproducción, suministro de alimento, planta, semilla, suelo, área, material o entorno en el que las plagas animales crecen o pueden crecer o los materiales, semillas, suelos, superficies o espacios que se van a proteger contra ataque o infestación de animales con una cantidad efectiva de plaguicida de al menos un compuesto de fórmula I o un enantiómero, diastereómero o una sal del mismo;
- 15 - un método para proteger los cultivos contra el ataque o la infestación por plagas animales, que comprende poner en contacto un cultivo con una cantidad efectiva como plaguicida de al menos un compuesto de la fórmula I o un enantiómero, diastereómero o una sal del mismo;
- un método para la protección de la propagación de las plantas, especialmente de las semillas, de los insectos del suelo y de las raíces y brotes de las plántulas de insectos foliares y del suelo, que comprende poner en contacto las semillas antes de la siembra y/o después de la pregerminación con al menos un compuesto de fórmula I, o los enantiómeros, diastereómeros o sales de los mismos;
- 20 - semillas que comprenden un compuesto de fórmula I o un enantiómero, diastereómero o una sal del mismo;
- el uso de compuestos de fórmula I o los enantiómeros, diastereoisómeros o sales veterinarias aceptables de los mismos para combatir parásitos en y sobre animales.
- 25 - un método para tratar, controlar, prevenir o proteger animales contra infestación o infección por parásitos que comprende administrar oralmente, tópicamente o parenteralmente o aplicar a los animales una cantidad efectiva como parasiticida de un compuesto de fórmula I o los enantiómeros, diastereómeros y/o sales aceptables desde el punto de vista veterinario de los mismos;
- 30 - un proceso para la preparación de una composición veterinaria para el tratamiento, control, prevención o protección de animales contra la infestación o infección por parásitos que comprende añadir una cantidad efectiva como parasiticida de un compuesto de fórmula I o los enantiómeros, diastereómeros y/o sales aceptables desde el punto de vista veterinario de los mismos a una composición portadora adecuada para uso veterinario;
- 35 - el uso de un compuesto de fórmula I o sus enantiómeros, diastereómeros y/o sales sales aceptables desde el punto de vista veterinario de los mismos para la preparación de un medicamento para el tratamiento, control, prevención o protección de animales contra la infestación o infección por parásitos;

La presente invención se refiere especialmente a materiales de propagación de plantas, en particular como se ha mencionado anteriormente a semillas, que comprenden al menos un compuesto de fórmula I y/o una sal aceptable desde el punto de vista agrícola de los mismos.

40 La presente invención se refiere a todos los posibles estereoisómeros de los compuestos de fórmula I, es decir, a enantiómeros o diastereómeros individuales, así como a mezclas de los mismos.

La presente invención se refiere a cada isómero solo, o mezclas o combinaciones de los isómeros en cualquier proporción entre sí.

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

50 Las sales de los compuestos de la fórmula I son preferiblemente sales aceptables desde el punto de vista agrícola y/o veterinaria. Pueden formarse en un método habitual, por ejemplo haciendo reaccionar el compuesto con un ácido del anión en cuestión si el compuesto de fórmula I tiene una funcionalidad básica o haciendo reaccionar un compuesto ácido de fórmula I con una base adecuada.

Las sales adecuadas para uso agrícola o veterinario son especialmente las sales de aquellos cationes o las sales de adición de ácidos de aquellos ácidos cuyos cationes y aniones, respectivamente, no tienen ningún efecto adverso sobre la acción de los compuestos de acuerdo con la presente invención. Los cationes adecuados son en particular los iones de los metales alcalinos, preferiblemente litio, sodio y potasio, de los metales alcalinotérreos, preferiblemente calcio, magnesio y bario, y de los metales de transición, preferiblemente manganeso, cobre, zinc y hierro, amonio (NH_4^+) y amonio sustituido en el que uno a cuatro de los átomos de hidrógeno están reemplazados por C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -hidroxialquilo, C_1 - C_4 -alcoxi, C_1 - C_4 -alcoxi- C_1 - C_4 -alquilo, hidroxí- C_1 - C_4 -alcoxi- C_1 - C_4 -alquilo, fenilo o bencilo. Ejemplos de iones amonio sustituidos comprenden metilamonio, isopropilamonio, dimetilamonio, diisopropilamonio, trimetilamonio, tetrametilamonio, tetraetilamonio, tetrabutilamonio, 2-hidroxietilamonio, 2-(2-hidroxietoxi)etilamonio, bis(2-hidroxietil)amonio, benciltrimetilamonio y benciltrietilamonio, además iones fosfonio, iones sulfonio, preferiblemente tri(C_1 - C_4 alquil) sulfonio y iones sulfoxonio, preferiblemente tri(C_1 - C_4 alquil) sulfoxonio.

Los aniones de sales de adición de ácido útiles son principalmente cloruro, bromuro, fluoruro, sulfato de hidrógeno, sulfato, dihidrogenofosfato, fosfato de hidrógeno, fosfato, nitrato, hidrogenocarbonato, carbonato, hexafluorosilicato, hexafluorofosfato, benzoato y los aniones de ácidos C_1 - C_4 alcanóicos, preferiblemente formiato, acetato, propionato y butirato. Pueden formarse haciendo reaccionar los compuestos de las fórmulas I con un ácido del anión correspondiente, preferiblemente ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico o ácido nítrico.

Las uniones estructurales orgánicas mencionados en las definiciones anteriores de las variables son - al igual que el término halógeno - términos colectivos para listas individuales de los miembros individuales del grupo. El prefijo C_n - C_m indica en cada caso el número posible de átomos de carbono en el grupo.

Se entenderá por "halógeno" el término flúor, cloro, bromo y yodo.

El término "parcial o totalmente halogenado" se entenderá que significa 1 o más, por ejemplo 1, 2, 3, 4 o 5 o todos los átomos de hidrógeno de un radical dado han sido reemplazados por un átomo de halógeno, en particular por flúor o cloro.

El término " C_n - C_m -alquilo" como se usa aquí (y también en C_n - C_m -alquilamino, di- C_n - C_m -alquilamino, C_n - C_m -alquilaminocarbonilo, di-(C_n - C_m -alquilamino)carbonilo, C_n - C_m -alquiltio, C_n - C_m -alquilsulfino y C_n - C_m -alquilsulfonio) se refiere a un grupo hidrocarburo saturado ramificado o no ramificado que tiene n a m, por ejemplo 1 a 10 átomos de carbono, preferiblemente 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metilpropilo, 2-metilpropilo, 1,1-dimetiletilo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, hexilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo, 1-etil-2-metilpropilo, heptilo, octilo, 2-etilhexilo, nonilo y decilo y sus isómeros. C_1 - C_4 -alquilo significa por ejemplo metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metilpropilo, 2-metilpropilo o 1,1-dimetiletilo.

El término " C_n - C_m -haloalquilo" como se usa aquí (y también en C_n - C_m -haloalquilsulfino y C_n - C_m -haloalquilsulfonio) se refiere a un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene n a m átomos de carbono, por ejemplo 1 a 10 en particular 1 a 6 átomos de carbono (como se ha mencionado más arriba), donde algunos o todos los átomos de hidrógeno en estos grupos pueden ser reemplazados por átomos de halógeno como se ha mencionado más arriba, por ejemplo C_1 - C_4 -haloalquilo, tales como clorometilo, bromometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorodifluorometilo, 1-cloroetilo, 1-bromoetilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-cloro-2-fluoroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, pentafluoroetilo y similares. El término C_1 - C_{10} -haloalquilo en particular comprende C_1 - C_2 -fluoroalquilo, que es sinónimo de metilo o etilo, en donde 1, 2, 3, 4 o 5 átomos de hidrógeno son sustituidos por átomos de flúor, tales como fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo y pentafluorometilo.

De la misma manera, " C_n - C_m -alcoxi" y " C_n - C_m -alquiltio" (o C_n - C_m -alquilsulfeno, respectivamente) se refieren a grupos alquilo de cadena lineal o ramificada que tienen n a m átomos de carbono, por ejemplo 1 a 10, en particular 1 a 6 o 1 a 4 átomos de carbono (como se ha mencionado más arriba) unidos mediante enlaces de oxígeno o azufre, respectivamente, a cualquier enlace en el grupo alquilo. Ejemplos incluyen C_1 - C_4 -alcoxi tales como metoxi, etoxi, propoxi, isopropoxi, butoxi, sec-butoxi, isobutoxi y tert-butoxi, además C_1 - C_4 -alquiltio tales como metiltio, etiltio, propiltio, isopropiltio, y n-butiltio.

De acuerdo con lo anterior, los términos " C_n - C_m -haloalcoxi" y " C_n - C_m -haloalquiltio" (o C_n - C_m -haloalquilsulfeno, respectivamente) se refieren a grupos alquilo de cadena lineal o ramificada que tienen n a m átomos de carbono, por ejemplo 1 a 10, en particular 1 a 6 o 1 a 4 átomos de carbono (como se ha mencionado más arriba) unidos mediante enlaces de oxígeno o azufre, respectivamente, a cualquier enlace en el grupo alquilo, donde algunos o todos los átomos de hidrógeno en estos grupos pueden ser reemplazados por átomos de halógeno como se ha mencionado más arriba, por ejemplo C_1 - C_2 -haloalcoxi, tales como clorometoxi, bromometoxi, diclorometoxi, triclorometoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, clorofluorometoxi, diclorofluorometoxi, clorodifluorometoxi, 1-cloroetoxi, 1-bromoetoxi, 1-fluoroetoxi, 2-fluoroetoxi, 2,2-difluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2-fluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, 2,2-dicloro-2-fluoroetoxi, 2,2,2-tricloroetoxi y pentafluoroetoxi, además C_1 - C_2 -haloalquiltio, tales como

5 clorometilitio, bromometilitio, diclorometilitio, triclorometilitio, fluorometilitio, difluorometilitio, trifluorometilitio, clorofluorometilitio, diclorofluorometilitio, clorodifluorometilitio, 1- cloroetilitio, 1-bromoetilitio, 1-fluoroetilitio, 2-fluoroetilitio, 2,2-difluoroetilitio, 2,2,2-trifluoroetilitio, 2-cloro- 2-fluoroetilitio, 2-cloro-2,2-difluoroetilitio, 2,2-dicloro-2-fluoroetilitio, 2,2,2-tricloroetilitio y pentafluoroetilitio y similares. De la misma manera los términos C₁-C₂-fluoroalcoxi y C₁-C₂-fluoroalquilitio se refieren a C₁-C₂-fluoroalquilo que está unido al resto de la molécula a través de un átomo de oxígeno o un átomo de azufre, respectivamente.

10 El término "C₂-C_m-alqueno" como se usa aquí pretende un grupo hidrocarburo insaturado ramificado o no ramificado que tiene 2 a m, por ejemplo 2 a 10 o 2 a 6 átomos de carbono y un doble enlace en cualquier posición, tales como etenilo, 1-propenilo, 2- propenilo, 1-metil-etenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-2-propenilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-metil-1-butenilo, 2-metil-1-butenilo, 3- metil-1-butenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1,2-dimetil-1-propenilo, 1,2-dimetil-2-propenilo, 1-etil-1-propenilo, 1- etil-2-propenilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1-metil-1-pentenilo, 2- metil-1-pentenilo, 3- metil-1-pentenilo, 4-metil-1-pentenilo, 1-metil-2-pentenilo, 2-metil-2-pentenilo, 3-metil-2-pentenilo, 4-metil-2- pentenilo, 1-metil-3-pentenilo, 2-metil-3-pentenilo, 3-metil-3-pentenilo, 4-metil-3-pentenilo, 1-metil-4-pentenilo, 2- metil-4-pentenilo, 3-metil-4-pentenilo, 4-metil-4-pentenilo, 1,1-dimetil-2-butenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, 1,2-dimetil- 1-butenilo, 1,2-dimetil-2-butenilo, 1,2-dimetil-3-butenilo, 1,3-dimetil-1-butenilo, 1,3-dimetil-2-butenilo, 1,3-dimetil- 3-butenilo, 2,2-dimetil-3-butenilo, 2,3-dimetil-1-butenilo, 2,3-dimetil-2-butenilo, 2,3-dimetil-3-butenilo, 3,3-dimetil- 1-butenilo, 3,3-dimetil-2-butenilo, 1-etil-1-butenilo, 1-etil-2-butenilo, 1-etil-3-butenilo, 2-etil-1-butenilo, 2-etil- 2-butenilo, 2-etil-3-butenilo, 1,1,2-trimetil-2-propenilo, 1-etil-1-metil-2-propenilo, 1-etil-2-metil-1-propenilo y 1-etil-2-metil-2-propenilo.

15 El término "C₂-C_m-alquino" tal como se utiliza en la presente memoria se refiere a un grupo hidrocarburo insaturado ramificado o no ramificado que tiene de 2 a m, por ejemplo 2 a 10 o 2 a 6 átomos de carbono y que contiene al menos un enlace triple, tal como etinilo, propinilo, 1-butinilo, 2-butinilo y similares.

25 El término " C₁-C₄- alcoxi-C₁-C₄alquilo" tal como se utiliza en la presente memoria se refiere a alquilo que tiene de 1 a 4 átomos de carbono, por ejemplo como ejemplos específicos mencionados anteriormente, en el que un átomo de hidrógeno del radical alquilo se reemplaza por un grupo C₁-C₄- alcoxi.

30 El término "C₃-C_m- cicloalquilo" tal como se utiliza en la presente memoria se refiere a radicales cicloalifáticos saturados monocíclicos de 3 a m miembros, por ejemplo ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, ciclooctilo y ciclodecilo.

El término "arilo" tal como se utiliza en la presente memoria se refiere a un radical hidrocarburo aromático tal como naftilo o en particular fenilo.

El término "anillo carbocíclico de 3 a 6 miembros" como se usa en la presente memoria se refiere a anillos de ciclopropano, ciclobutano, ciclopentano y ciclohexano.

35 El término "anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o aromático de 3, 4, 5, 6, 7 o 7 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos" o "que contiene grupos heteroátomos", en el que estos heteroátomos se seleccionan de N, O, S, NO, SO y SO₂ y son miembros de anillo, como se usa en la presente memoria se refiere a radicales monocíclicos, estando los radicales monocíclicos saturados, parcialmente insaturados o aromáticos. El radical heterocíclico puede estar unido al resto de la molécula a través de un miembro de anillo de carbono o a través de un miembro de anillo de nitrógeno.

40 Ejemplos de anillos heterocíclicos o heterocíclicos saturados de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros incluyen: Oxiranilo, aziridinilo, azetidino, 2 tetrahidrofuranilo, 3-tetrahidrofuranilo, 2 tetrahidrotienilo, 3 tetrahidrotienilo, 2-pirrolidinilo, 3-pirrolidinilo, 3 pirazolidinilo, 4 pirazolidinilo, 5-pirazolidinilo, 2 imidazolidinilo, 4 imidazolidinilo, 2-oxazolidinilo, 4-oxazolidinilo, 5 oxazolidinilo, 3-isoxazolidinilo, 4 isoxazolidinilo, 5 isoxazolidinilo, 2 tiazolidinilo, 4-tiazolidinilo, 5-tiazolidinilo, 3 isotiazolidinilo, 4-isotiazolidinilo, 5 isotiazolidinilo, 1,2,4-oxadiazolidin-3-ilo, 1,2,4 oxadiazolidin 5 ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-3-ilo, 1,2,4 tiadiazolidin- 5-ilo, 1,2,4 triazolidin-3-ilo, 1,3,4-oxadiazolidin-2-ilo, 1,3,4 tiadiazolidin-2-ilo, 1,3,4 triazolidin-2-ilo, 2-tetrahidropirranilo, 4 tetrahidropirranilo, 1,3-dioxan-5-ilo, 1,4-dioxan-2-ilo, 2-piperidinilo, 3-piperidinilo, 4-piperidinilo, 3-hexahidropiridazinilo, 4 hexahidropiridazinilo, 2-hexahidropirimidinilo, 4-hexahidropirimidinilo, 5 hexahidropirimidinilo, 2-piperazinilo, 1,3,5-hexahidrotiazin-2-ilo y 1,2,4 hexahidrotiazin-3-ilo, 2-morfolinilo, 3-morfolinilo, 2-tiomorfolinilo, 3- tiomorfolinilo, 1-oxotiomorfolin-2-ilo, 1-oxotiomorfolin-3-ilo, 1,1-dioxotiomorfolin-2-ilo, 1,1-dioxotiomorfolin- 3-ilo, hexahidroazepin-1-, -2-, -3- o -4-ilo, hexahidrooxepinilo, hexahidro-1,3-diazepinilo, hexahidro-1,4-diazepinilo, hexahidro- 1,3-oxazepinilo, hexahidro-1,4-oxazepinilo, hexahidro-1,3-dioxepinilo, hexahidro-1,4-dioxepinilo y similares.

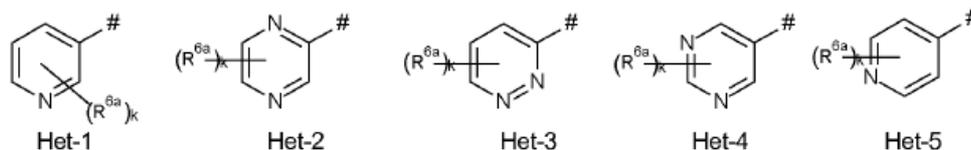
55 Ejemplos de anillos heterocíclicos o heterocíclicos parcialmente insaturados de 3, 4, 5, 6 o 7- incluyen: 2,3- dihidrofur-2-ilo, 2,3-dihidrofur-3-ilo, 2,4-dihidrofur-2-ilo, 2,4-dihidrofur-3-ilo, 2,3-dihidrotien-2-ilo, 2,3 dihidrotien-3-ilo, 2,4 dihidrotien-2-ilo, 2,4-dihidrotien-3-ilo, 2-pirrolin-2-ilo, 2-pirrolin-3-ilo, 3 pirrolin-2-ilo, 3-pirrolin-3-ilo, 2-isoxazolin-3- ilo, 3-isoxazolin-3-ilo, 4 isoxazolin 3 ilo, 2-isoxazolin-4-ilo, 3-isoxazolin-4-ilo, 4-isoxazolin-4-ilo, 2 isoxazolin-5-ilo, 3-isoxazolin- 5-ilo, 4-isoxazolin-5-ilo, 2-isotiazolin-3-ilo, 3 isotiazolin-3-ilo, 4-isotiazolin-3-ilo, 2-isotiazolin-4-ilo, 3-

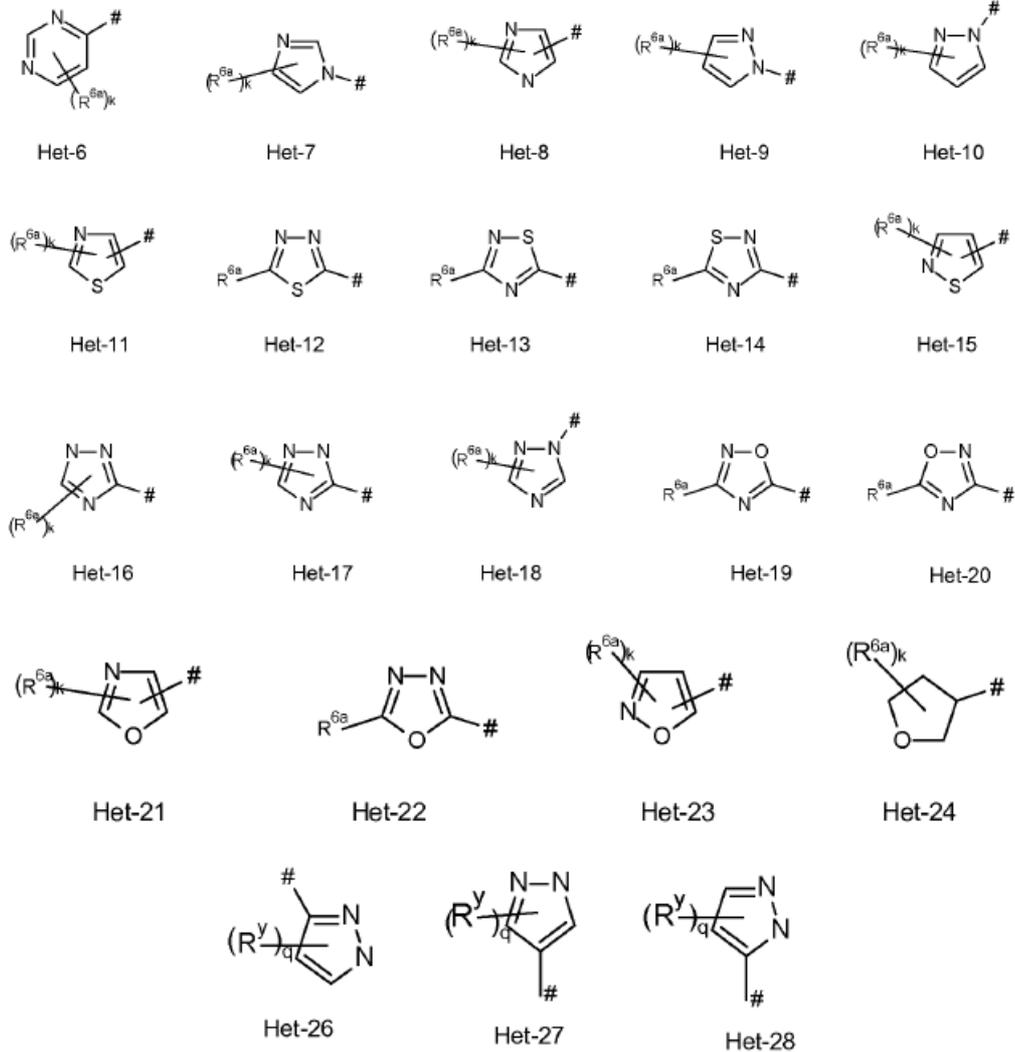
- isotiazolin-4-ilo, 4 isotiazolin-4-ilo, 2-isotiazolin-5-ilo, 3-isotiazolin-5-ilo, 4-isotiazolin-5-ilo, 2,3 dihidropirazol-1-ilo, 2,3-dihidropirazol- 2-ilo, 2,3-dihidropirazol-3-ilo, 2,3 dihidropirazol-4-ilo, 2,3-dihidropirazol-5-ilo, 3,4-dihidropirazol-1-ilo, 3,4 dihidropirazol- 3-ilo, 3,4-dihidropirazol-4-ilo, 3,4-dihidropirazol-5-ilo, 4,5 dihidropirazol-1-ilo, 4,5-dihidropirazol-3-ilo, 4,5-dihidropirazol- 4-ilo, 4,5 dihidropirazol-5-ilo, 2,3-dihidrooxazol-2-ilo, 2,3-dihidrooxazol-3-ilo, 2,3 dihidrooxazol-4-ilo, 2,3-dihidrooxazol- 5-ilo, 3,4-dihidrooxazol-2-ilo, 3,4 dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-4-ilo, 3,4-dihidrooxazol-5-ilo, 3,4 dihidrooxazol- 2-ilo, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-4-ilo, 2-, 3-, 4-, 5- o 6-di- o tetrahidropiridinilo, 3-di- o tetrahidropiridazinilo, 4 di- o tetrahidro-piridazinilo, 2-di- o tetrahidropirimidinilo, 4-di- o tetrahidropirimidinilo, 5 di- o tetrahidropirimidinilo, di- o tetrahidropirazinilo, 1,3,5-di- o tetrahidrotiazin-2-ilo, 1,2,4-di- o tetrahidrotiazin-3-ilo, 2,3,4,5-tetrahidro[1H]azepin-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, 3,4,5,6-tetrahidro[2H]azepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, 2,3,4,7 tetrahidro[1H]azepin-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, 2,3,6,7 tetrahidro[1H]azepin-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, tetrahidrooxepinilo, tales como 2,3,4,5-tetrahidro[1H]oxepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, 2,3,4,7 tetrahidro[1H]oxepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, 2,3,6,7 tetrahidro[1H]oxepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, tetrahidro-1,3-diazepinilo, tetrahidro-1,4-diazepinilo, tetrahidro-1,3-oxazepinilo, tetrahidro-1,4-oxazepinilo, tetrahidro-1,3-dioxepinilo y tetrahidro-1,4-dioxepinilo.
- 15 Ejemplos de anillos heterocíclicos (heterociclo) aromáticos o heteroaromáticos de 5 o 6 miembros son: 2-furilo, 3-furilo, 2-tienilo, 3-tienilo, 2-pirrolilo, 3-pirrolilo, 3-pirazolilo, 4-pirazolilo, 5-pirazolilo, 2-oxazolilo, 4-oxazolilo, 5-oxazolilo, 2-tiazolilo, 4 tiazolilo, 5-tiazolilo, 2-imidazolilo, 4-imidazolilo, 1,3,4-triazol-2-ilo, 2-piridinilo, 3-piridinilo, 4-piridinilo, 3-piridazinilo, 4-piridazinilo, 2-pirimidinilo, 4-pirimidinilo, 5-pirimidinilo y 2-pirazinilo.
- 20 Un "C₂-C_m-alquileo" es una cadena alifática saturada ramificada o preferiblemente no ramificada que tiene 2 a m, por ejemplo 2 a 7 átomos de carbono, por ejemplo CH₂CH₂, -CH(CH₃)-, CH₂CH₂CH₂, CH(CH₃)CH₂, CH₂CH(CH₃), CH₂CH₂CH₂CH₂, CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂, CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂, y CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂.

Preferencias

Las realizaciones y compuestos preferidos de la presente invención se describen en los siguientes párrafos.

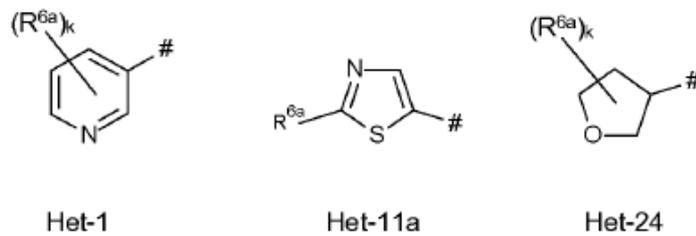
- 25 Las observaciones hechas a continuación relacionadas con las realizaciones preferidas de las variables de los compuestos de fórmula I, especialmente con respecto a sus sustituyentes X, Y, W¹, W², W³, W⁴, Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b}, R^{4a}, R^{4b} y R⁵ y sus variables p son válidos tanto por sí mismos, y en particular, en todas las combinaciones posibles entre sí.
- Cuando # aparece en una fórmula que muestra una subestructura preferida de un compuesto de la presente invención, denota el enlace de unión en la molécula restante.
- 30 Se prefieren los compuestos de fórmula (I), en donde Het se selecciona del grupo que consiste en radicales de fórmulas Het-1 a Het-28:





en donde # indica el enlace en la fórmula (I), k es 0, 1 o 2 y R^{6a} tiene el significado preferido como se define más adelante.

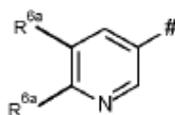
5 Son especialmente preferidos los compuestos de fórmula (I), en donde Het se selecciona del grupo que consiste en radicales de fórmulas Het-1, Het-11a y Het-24: y



en donde # indica el enlace en la fórmula (I), k es 0, 1 o 2 y R^{6a} tiene el significado preferido como se define más adelante.

Especialmente más preferidos son los compuestos de fórmula (I), en donde Het es Het-1a:

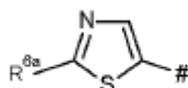
10 y



Het-1

En la que # indica el enlace en la fórmula (I), y R^{6a} tiene el significado preferido como se define más adelante.

Especialmente más preferidos son los compuestos de fórmula (I), en donde Het es Het-11a:

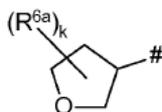


Het-11a

5

y en donde # indica el enlace en la fórmula (I), y R^{6a} tiene el significado preferido como se define más adelante.

Son especialmente preferidos los compuestos de fórmula (I), en donde Het es Het-24:

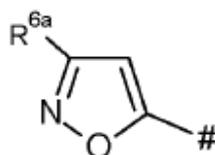


Het-24

10 y donde # representa el enlace en la fórmula (I) y en donde k es 0.

Son especialmente preferidos los compuestos de fórmula (I), en donde Het es Het-24 y en donde # indica el enlace en la fórmula (I) y en donde k se selecciona de 1 o 2, y R^{6a} tiene el significado preferido como se define más adelante.

Especialmente más preferidos son los compuestos de fórmula (I), en donde Het es Het-23a:



Het-23a

15 y en donde # indica el enlace en la fórmula (I), y R^{6a} tiene el significado preferido como se define más adelante.

Se prefieren los compuestos de fórmula (I), en donde en Het, k se selecciona de 0, 1 o 2.

Especialmente preferidos son los compuestos de fórmula (I), en donde en Het, k es 0, 1 o 2 y R^{6a} tiene el significado preferido como se define aquí más adelante.

20 Se prefieren los compuestos de fórmula (I), en donde Het está sustituido con R^{6a} seleccionados cada uno independientemente uno del otro del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, C₁-C₆-alquilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, en donde los átomos de carbono de los radicales alifáticos y cicloalifáticos anteriormente mencionados pueden estar opcionalmente sustituidos independientemente entre sí con uno o más R⁷, OR⁸, NR^{9a}R^{9b}, S(O)_nR⁸, S(O)_nNR^{9a}R^{9b}, C(=O)R⁷, C(=O)NR^{9a}R^{9b}, C(=O)OR⁸, C(=S)R⁷, C(=S)NR^{9a}R^{9b}, C(=NR^{9a})R⁷, C(=NR^{9a})NR^{9a}R^{9b}.

- Son especialmente preferidos los compuestos de fórmula (I), en donde Het está sustituido con R^{6a} seleccionados cada uno independientemente uno del otro del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, C₁-C₄-alcoxi o C₁-C₄-alquilo, en donde los átomos de carbono de estos últimos dos radicales pueden estar parcialmente o totalmente halogenados.
- 5 Se prefieren los compuestos de fórmula (I), en donde R¹ y R² son independientemente uno de otro seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₂-C₆-halocicloalquilo; o R¹ y R² pueden ser juntos =O, =CR¹³R¹⁴ o =S; o R¹ y R² forman, junto con el átomo de carbono, al que se unen, un anillo carbocíclico saturado de 3 a 5 miembros;
- Son especialmente preferidos los compuestos de fórmula (I), en donde R¹ y R² son independientemente uno de otro seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, C₁-C₃-alquilo o C₁-C₃-haloalquilo.
- 10 Son especialmente preferidos los compuestos de fórmula (I), en donde R¹ y R² son ambos hidrógeno. Son especialmente preferidos los compuestos de fórmula (I), en donde R¹ es hidrógeno, y R² es CH₃.
- 15 Se prefieren los compuestos de fórmula (I), en donde R^{3a} y R^{3b} se seleccionan cada uno independientemente entre sí del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-haloalquiltio y OR⁸, en donde R⁸ es C(=O)R¹⁵, y R¹⁵ es C₁-C₆-alquilo, en donde el radical alifático puede estar no sustituido, parcial o totalmente halogenado.
- Se prefieren los compuestos de fórmula (I), en donde R^{3a}, R^{3b} se seleccionan cada uno independientemente uno de otro del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₆-alquilo y C₁-C₆-haloalquilo.
- Son especialmente preferidos los compuestos de fórmula (I), en donde R^{3a}, R^{3b} se seleccionan cada uno independientemente uno de otro de hidrógeno o fluoro.
- 20 Se prefieren los compuestos de fórmula (I), en donde R^{3a}, R^{3b} forman junto con el átomo de carbono al que están unidos, un anillo de ciclopropano, en donde cada uno de los átomos de carbono del anillo puede estar no sustituido o puede estar parcial o totalmente halogenado.
- Se prefieren los compuestos de fórmula (I), en donde p es 0.
- 25 Se prefieren los compuestos de fórmula (I), en donde p es 1 y R^{4a}, R^{4b} se seleccionan independientemente entre sí a partir de hidrógeno o halógeno.
- Son especialmente preferidos los compuestos de fórmula (I), en donde p es 1 y R^{4a}, R^{4b} se seleccionan independientemente entre sí a partir de hidrógeno o fluoro.
- Son especialmente preferidos los compuestos de fórmula (I), en donde p es 1, y en donde uno de R^{4a} y R^{4b} pueden formar un doble enlace con R^{3a} o R^{3b} de los átomos de carbono adyacentes.
- 30 Se prefieren los compuestos de fórmula (I), en donde X es S.
- Se prefieren los compuestos de fórmula (I), en donde X es O.
- Se prefieren los compuestos de fórmula (I), en donde Y se selecciona de O.
- Se prefieren los compuestos de fórmula (I), en donde Y se selecciona de S, S=O o S(O)₂.
- Son especialmente preferidos los compuestos de fórmula (I), en donde Y se selecciona de S.
- 35 Son especialmente preferidos los compuestos de fórmula (I), en donde Y se selecciona de S=O.
- Son especialmente preferidos los compuestos de fórmula (I), en donde Y se selecciona de S(O)₂.
- 40 Se prefieren los compuestos de fórmula (I), en donde R⁵ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, ciano, C₁-C₆-alquilo, C₇-C₁₀-alquilo, C₃-C₁₀-cicloalquilo, C₂-C₆-alqueno y C₂-C₆-alquino, en donde los átomos de la cadena de carbono de los cuatro radicales alifáticos y cicloalifáticos antes mencionados están no sustituidos, parcial o totalmente halogenados o pueden llevar cualquier combinación de uno o más radicales R⁷, en donde R⁷ se selecciona independientemente entre sí de halógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi o C(=O)O-R¹⁶, y en donde R¹⁶ es independientemente uno del otro C₁-C₆-alquilo, en donde los radicales alquilo pueden estar no sustituidos, parcialmente o totalmente halogenados y/o puede llevar 1 o 2 radicales seleccionados de C₁-C₄ alcoxi.
- 45 Se prefieren los compuestos de fórmula (I), en donde R⁵ se selecciona del grupo que consiste en fenilo o CH₂-fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes, que se seleccionan independientemente uno de otro de hidrógeno, halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi o fenoxi.
- Se prefieren los compuestos de fórmula (I), en donde R⁵ se selecciona del grupo que consiste en un anillo heterocíclico aromático saturado, parcialmente saturado o insaturado de 5 o 6 miembros seleccionado de piridina, furano, oxazol, oxadiazol, isoxazol, tiazol, tiadiazol o isotiazol, en el que el anillo heterocíclico puede unirse directamente o elazado

mediante un grupo CH₂ al resto de la molécula, en donde el anillo heterocíclico no está sustituido o está opcionalmente sustituido con uno, dos o tres sustituyentes R^y seleccionados independientemente uno de otro y en donde R^y es seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano y C₁-C₄ alquilo, donde los átomos de carbono del radical alquilo pueden estar no sustituidos o parcial o totalmente halogenados y/o pueden llevar 1,2 o 3 radicales seleccionados de C₁-C₄ alcoxi.

5 Se prefieren los compuestos de fórmula (I), en donde R⁵ se selecciona del grupo que consiste en un anillo heterocíclico aromático saturado, parcialmente saturado o insaturado de 5 o 6 miembros seleccionado de piridina, furano, oxazol, oxadiazol, isoxazol, tiazol, tiadiazol o isotiazol, en el que el anillo heterocíclico no está sustituido o está opcionalmente sustituido con uno, dos o tres sustituyentes R^y seleccionados independientemente entre sí y en el que el R^y se selecciona del grupo que consiste en halógeno, ciano y C₁-C₄ alquilo, en donde los átomos de carbono del radical alquilo puede estar no sustituidos o parcial o totalmente halogenados y/o puede llevar 1,2 o 3 radicales seleccionados de C₁-C₄ alcoxi.

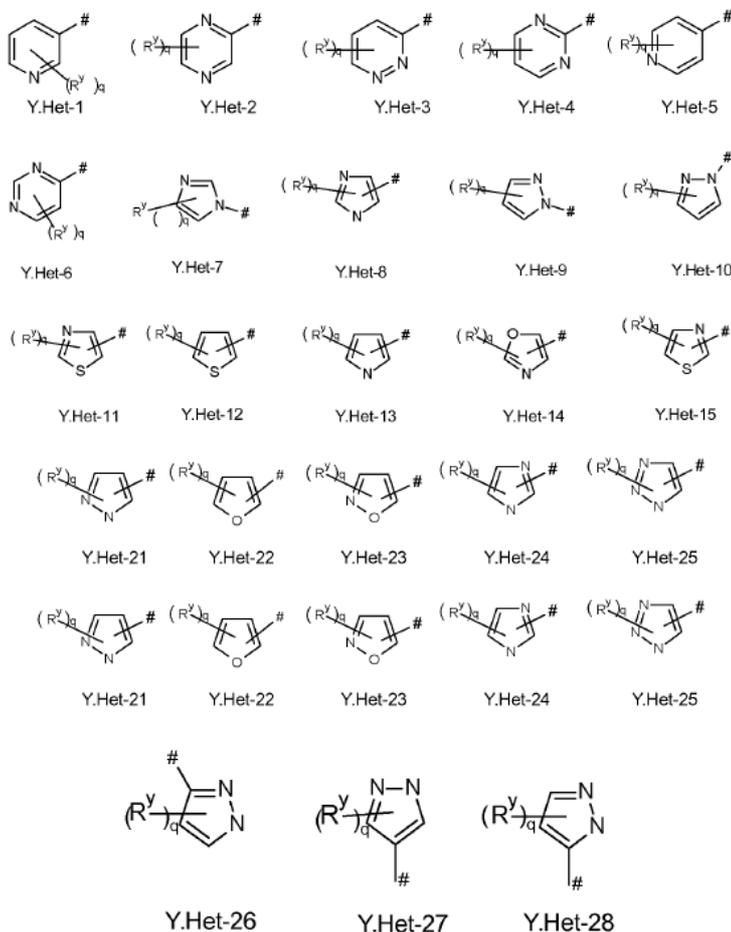
10 Se prefieren los compuestos de fórmula (I), en donde R⁵ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, C₁-C₆-alquilo, C₃-C₁₀-cicloalquilo, C₂-C₆-alquenilo o C₂-C₆-alquinilo, en donde cada uno de los cuatro últimos radicales alifáticos mencionados está sin sustituir, parcial o totalmente halogenado.

15 Se prefieren los compuestos de fórmula (I), en donde R⁵ se selecciona del grupo que consiste en SCN, C₁-C₄ alquiltio, C₃-C₆ cicloalquiltio, C₂-C₆ alqueniltio y C₂-C₆ alquiniltio, en donde cada uno de los cuatro últimos radicales alifáticos mencionados son no sustituidos, parcialmente o completamente halogenado.

Se prefieren los compuestos de fórmula (I), en donde R⁵ es fenilo o bencilo.

20 Se prefieren los compuestos de fórmula (I), en donde R⁵ es fenilo o CH₂-fenilo, en donde el anillo aromático está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que se seleccionan independientemente uno del otro del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₄ alquilo, C₁-C₄ alcoxi, en donde ambos de los dos últimos radicales alifáticos mencionados pueden estar no sustituidos o parcial o totalmente halogenados.

25 Se prefieren los compuestos de fórmula (I), en donde R⁵ es un anillo heterocíclico aromático de 5 o 6 miembros seleccionado del grupo que consiste en



en donde # indica el enlace al resto de la molécula, y en donde el enlace puede ser un enlace sencillo o enlazarse mediante un grupo CH₂ al resto de la molécula;

en donde

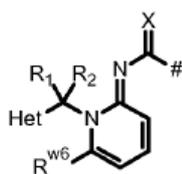
Q se selecciona de 0,1 o 2, y en la que

- 5 R^y se selecciona independientemente del valor de q e independientemente uno del otro, del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, CN, -C₁-C₄ alquilo y C₁-C₄ alcoxi, en donde ambos de los dos últimos radicales alifáticos mencionados pueden estar no sustituidos, parcial o completamente halogenados, fenilo opcionalmente sustituido con halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄ alquilo y C₁-C₄ alcoxi, en donde ambos de los dos últimos radicales alifáticos mencionados pueden estar no sustituidos, parcial o totalmente halogenados,

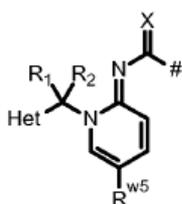
10 o

dos de R^y en átomos de carbono adyacentes pueden ser un puente seleccionado de CH=CH-CH=CH o CH=CHCH₂, y así formar junto con los átomos de carbono a los que los dos R^y están unidos, un anillo carbocíclico aromático fusionado de 5 o 6 miembros, en el que este anillo puede estar opcionalmente sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquilo o C₁-C₄-haloalquilo.

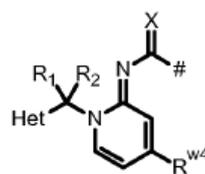
- 15 Se prefieren los compuestos de fórmula (I), en donde W¹, W², W³ y W⁴ representan un grupo de cadena de carbono conectado a N y C=N, y formando así un heterociclo que contiene nitrógeno, saturado, insaturado o parcialmente insaturado de 6 miembros seleccionado de los siguientes grupos que consisten de W.Het-1, W.Het-2, W.Het-3, W.Het-4, W.Het-5, W.Het-6, W.Het-7, W.Het-8, W.Het-9, W.Het-10, W.Het-11 y W.Het-12::



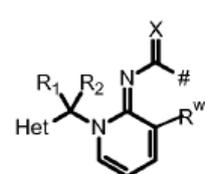
W.Het-1



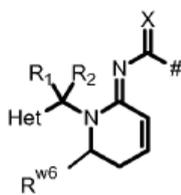
W.Het-2



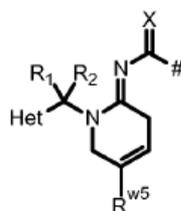
W.Het-3



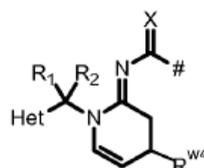
W.Het-4



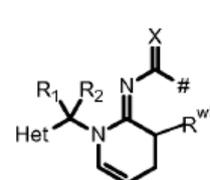
W.Het-5



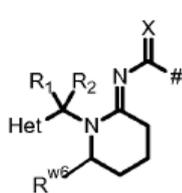
W.Het-6



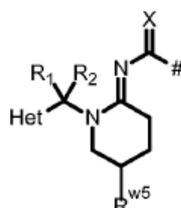
W.Het-7



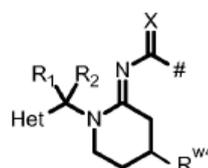
W.Het-8



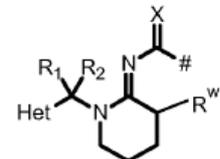
W.Het-9



W.Het-10



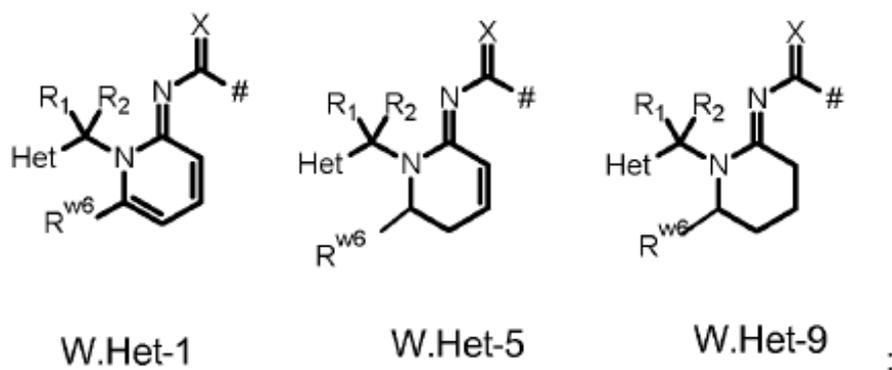
W.Het-11



W.Het-12

- 20 en donde # indica la unión al resto de la molécula; R¹, R² y Het son como se han definido anteriormente, y en donde R, R^{w3}, R^{w4}, R^{w5} y R^{w6} se seleccionan del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-alquilo, en donde ambos de los dos últimos radicales alifáticos mencionados pueden estar no sustituidos, parcial o totalmente halogenados

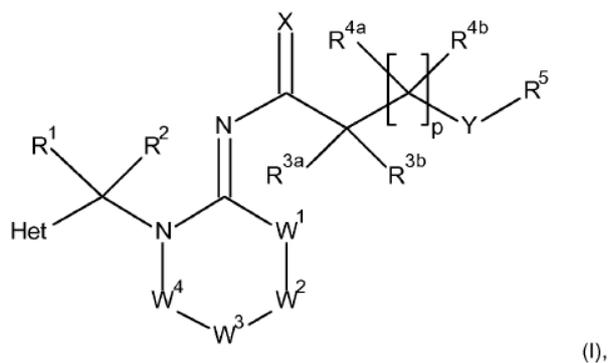
- 25 Se prefieren especialmente los compuestos de fórmula (I), en donde W¹, W², W³ y W⁴ representan un grupo de cadena de carbono conectado a N y C=N y formando así un heterociclo que contiene nitrógeno saturado, insaturado o parcialmente insaturado de 6 miembros seleccionado de W.Het-1, W.Het-5 y W.Het-9



En la que # representa el enlace al resto de la molécula, y R^{w6} se selecciona de hidrógeno, halógeno, C₁-C₄-alquilo; o C₁-C₄-haloalquilo.

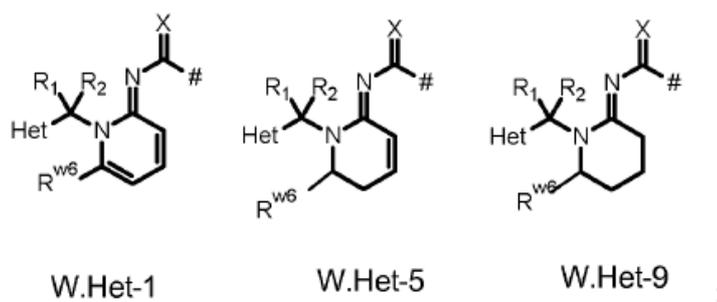
- 5 Se prefieren los compuestos de fórmula (I), en donde cada R^w se selecciona independientemente entre sí de hidrógeno, halógeno, C₁-C₄-alcoxi o C₁-C₄-alquilo, en donde ambos de los dos últimos radicales alifáticos mencionados pueden estar no sustituidos, parcial o completamente halogenados.

Los compuestos preferidos de la presente invención son compuestos de fórmula (I)



- 10 en donde

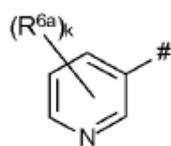
W^1 , W^2 , W^3 y W^4 representan un grupo de cadena de carbono conectado a N y C=N, y formando así un heterociclo saturado, insaturado o parcialmente insaturado que contiene nitrógeno de 6 miembros seleccionado de W.Het-1, W.Het-5 y W.Het-9



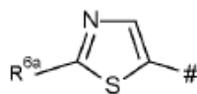
- 15 en donde # denota el enlace al resto de la molécula, y en donde R^{w6} se selecciona de hidrógeno, halógeno, C₁-C₄-alquilo; o C₁-C₄-haloalquilo;

y en donde

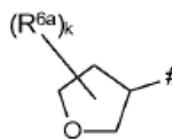
Het se selecciona del grupo que consiste en radicales de fórmulas Het-1, Het-11 a y Het-24



Het-1



Het-11a



Het-24

en donde # denota el enlace en la fórmula (I), y en donde R^{6a} se selecciona de hidrógeno, halógeno, C₁-C₄-alcoxi o C₁-C₄-alquilo, en donde los átomos de carbono de los dos últimos radicales pueden estar parcial o totalmente halogenados;

5 k es 0, 1 o 2;

y en donde además R¹, R² son independientemente uno de otro seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, C₁-C₃-alquilo, o C₁-C₃-haloalquilo;

X se selecciona de O o S;

10 R^{3a}, R^{3b} son seleccionados independientemente uno de otro de hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, o en donde R^{3a}, R^{3b} forman junto con el átomo de carbono al que están unidos, un anillo de ciclopropano, en donde cada uno de los átomos de carbono del anillo puede estar no sustituido o puede estar parcial o totalmente halogenado;

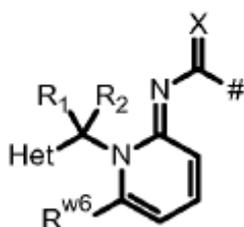
p es 0;

Y es S(O)_m, en donde m es 0, 1 o 2;

15 y

R⁵ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, CN, S-CN, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₄ alquiltio, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆ cicloalquiltio, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆ alqueniltio, C₂-C₆-alquinilo o C₂-C₆ alquinitio, en donde cada uno de los ocho últimos radicales alifáticos y cicloalifáticos mencionados son no sustituidos, parcialmente o completamente halogenados.

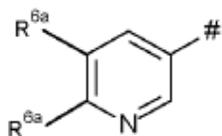
20 Son especialmente preferidos los compuestos de fórmula (I), en donde W¹, W², W³ y W⁴ representan un grupo de cadena de carbono conectado a N y C=N, y formando así un heterociclo no saturado de 6 miembros que contiene nitrógeno W.Het-1



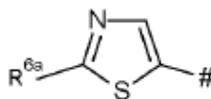
W.Het-1

25 en donde # denota el enlace al resto de la molécula, y en donde R^{w6} se selecciona de hidrógeno, halógeno, C₁-C₄-alquilo o C₁-C₄-haloalquilo;

y en donde Het es Het-1 o Het-11a



Het-1



Het-11a

en donde # denota el enlace en la fórmula (I), y

en donde R^{6a} se selecciona de hidrógeno, halógeno o C₁-C₄-haloalquilo;

R¹, R² son ambos hidrógeno;

5 X se selecciona de O o S

y en donde además

R^{3a}, R^{3b} son seleccionados independientemente uno de otro de hidrógeno o fluoro;

p es 0;

Y es S(O)_m, en donde m es 0, 1 o 2;

10 y

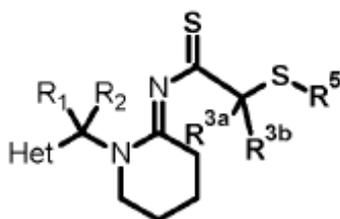
R⁵ es C₁-C₃-alquilo, que está no sustituido o parcialmente o completamente halogenado.

A continuación se dan ejemplos de compuestos preferidos y especialmente preferidos de fórmula I.

Generalmente, los compuestos preferidos de la presente invención son compuestos de las fórmulas I-A.0 a I-P.2 ilustradas en lo que sigue, en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados anteriormente.

15 Los compuestos especialmente preferidos de la fórmula (I-A.0) a la fórmula (I-P.2) descritos a continuación son aquellos en los que Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la siguiente tabla C.

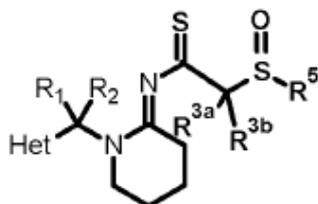
Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-A.0), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



(I-A.0)

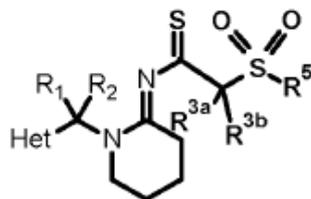
20

Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-A.1), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



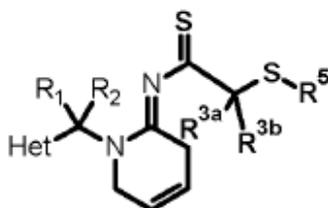
(I-A.1)

Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-A.2), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



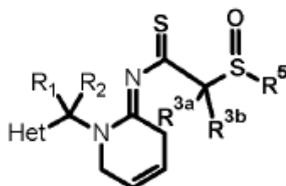
(I-A.2)

5 Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-B.0), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



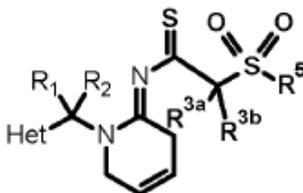
(I-B.0)

Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-B.1), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



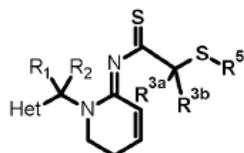
(I-B.1)

10 Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-B.2), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



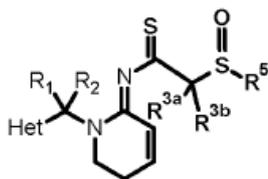
(I-B.2)

Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-C.0), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



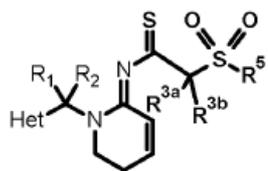
(I-C.0)

15 Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-C.1), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



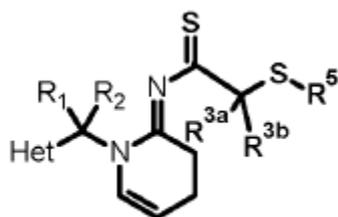
(I-C.1)

Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-C.2), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



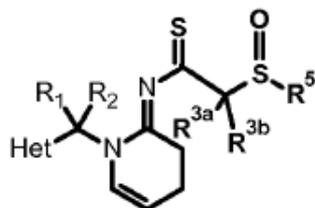
(I-C.2)

- 5 Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-D.0), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



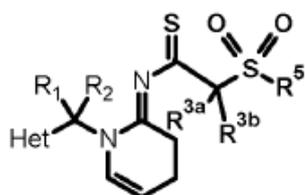
(I-D.0)

Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-D.1), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



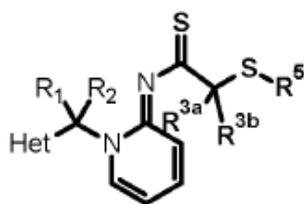
(I-D.1)

- 10 Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-D.2), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



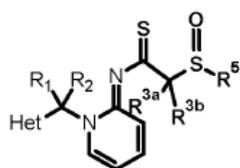
(I-D.2)

- 15 Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-E.0), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



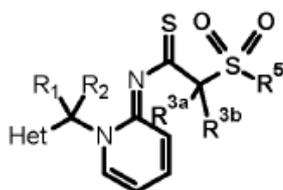
(I-E.0)

Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-E.1), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



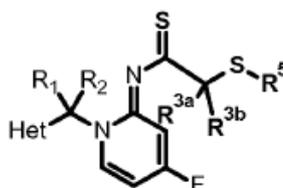
(I-E.1)

5 Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-E.2), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



(I-E.2)

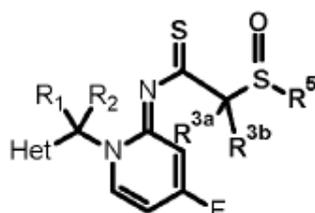
Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-F.0), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



(I-F.0)

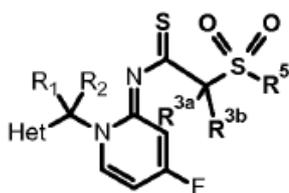
10

Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-F.1), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



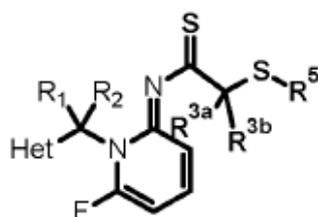
(I-F.1)

15 Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-F.2), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



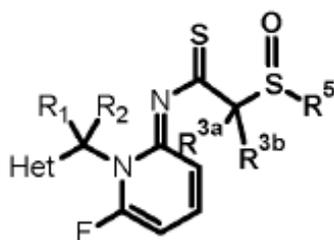
(I-F.2)

Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-G.0), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



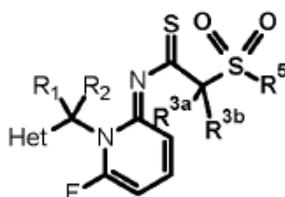
(I-G.0)

5 Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-G.1), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



(I-G.1)

Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-G.2), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



(I-G.2)

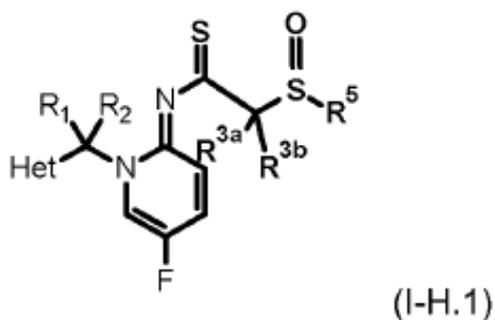
10

Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-H.0), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.

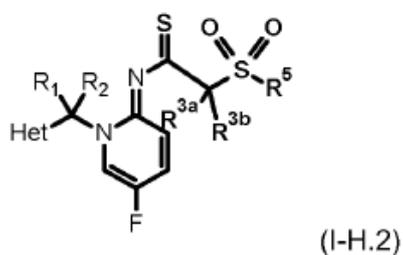


(I-H.0)

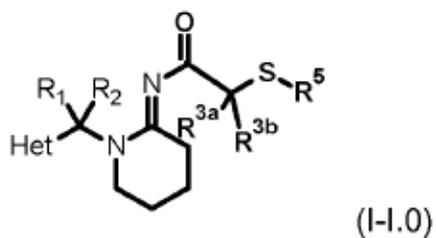
15 Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-H.1), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



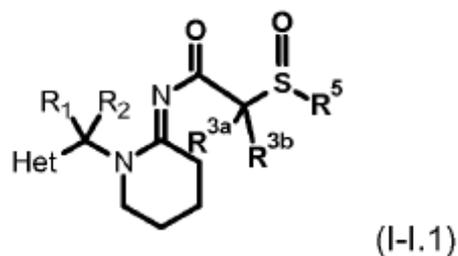
Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-H.2), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



- 5 Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-I.0), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.

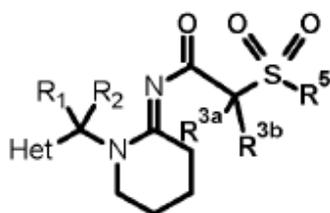


Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-I.1), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



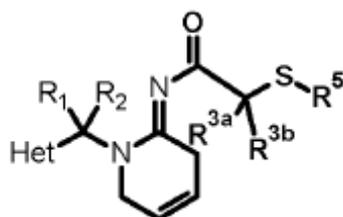
10

Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-I.2), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



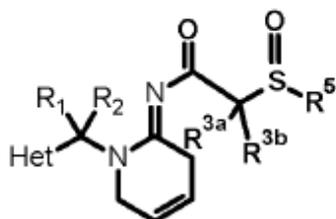
(I-I.2)

Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-J.0), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



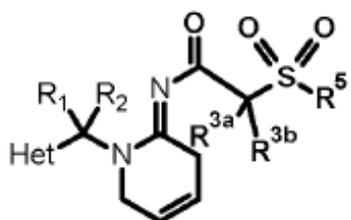
(I-J.0)

- 5 Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-J.1), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



(I-J.1)

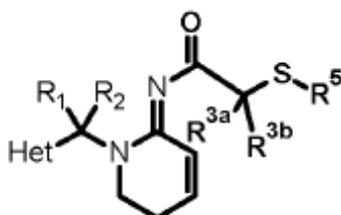
Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-J.2), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



(I-J.2)

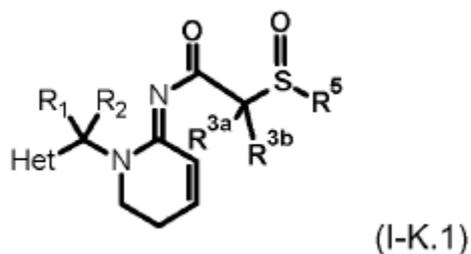
10

Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-K.0), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.

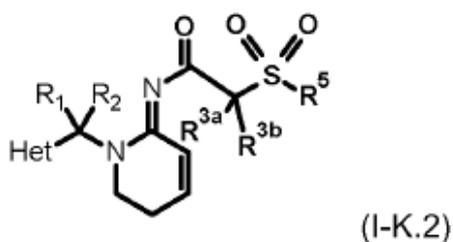


(I-K.0)

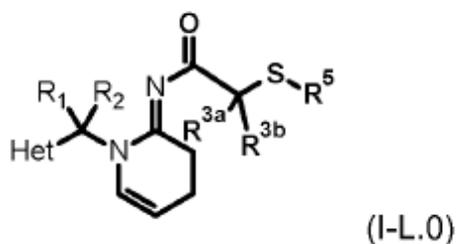
Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-K.1), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



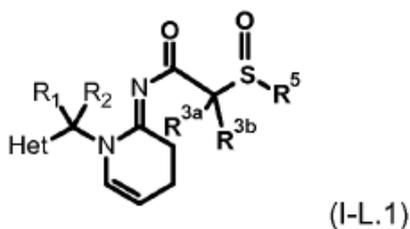
5 Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-K.2), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



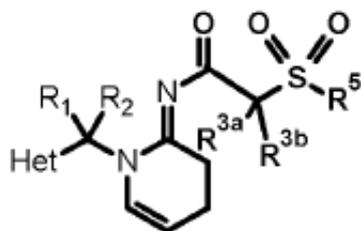
Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-L.0), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



10 Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-L.1), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.

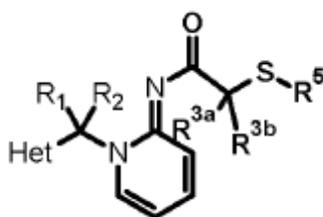


Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-L.2), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



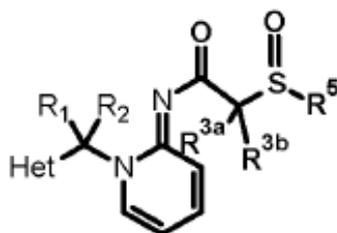
(I-L.2)

Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-M.0), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



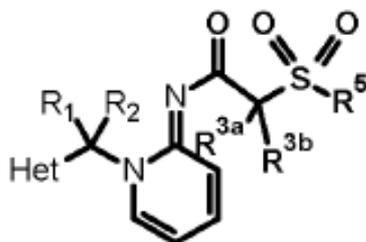
(I-M.0)

- 5 Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-M.1), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



(I-M.1)

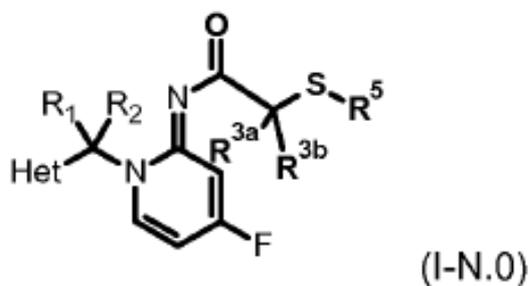
Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-M.2), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



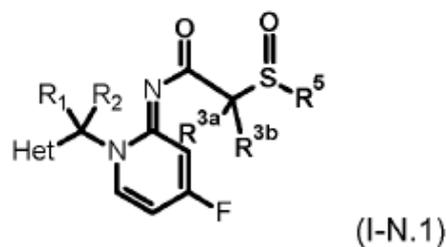
(I-M.2)

10

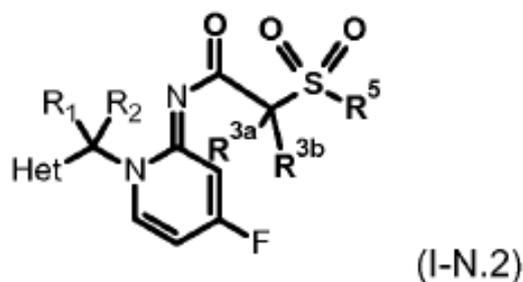
Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-N.0), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



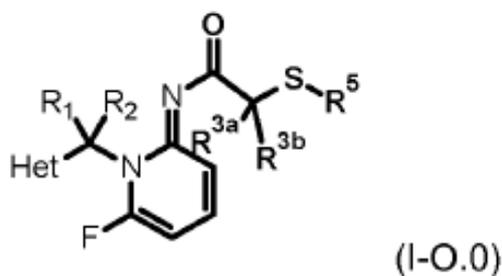
Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-N.1), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



- 5 Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-N.2), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.

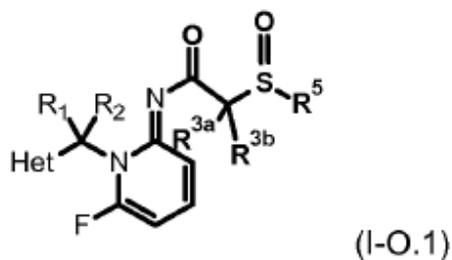


Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-O.0), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.

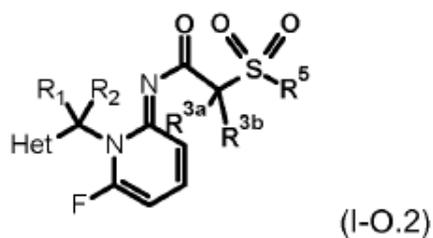


10

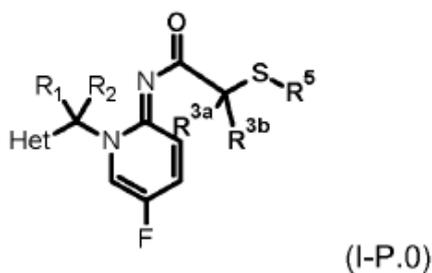
Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-O.1), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



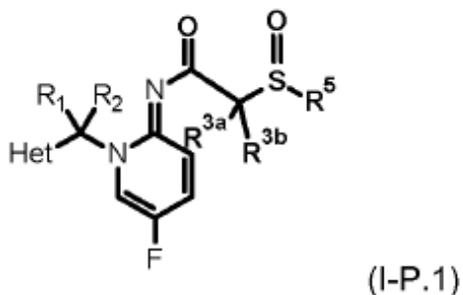
Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-O.2), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



5 Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-P.0), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.

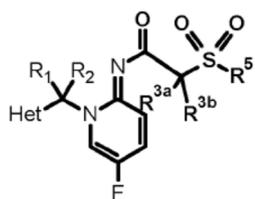


Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-P.1), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.



10

Ejemplos de tales compuestos especialmente preferidos son compuestos de fórmula (I-P.2), en donde Het, R¹, R², R^{3a}, R^{3b} y R⁵ tienen los significados dados en cualquiera de las líneas 1 a 784 de la tabla C.

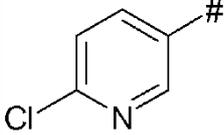
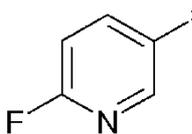
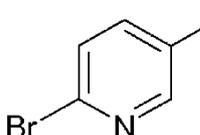
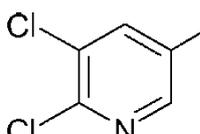
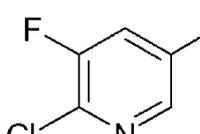
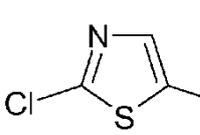
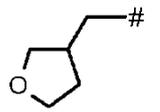
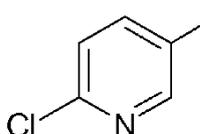


(I-P.2)

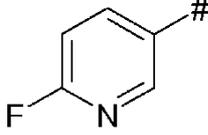
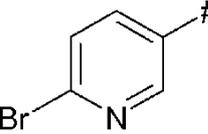
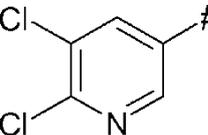
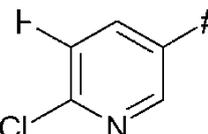
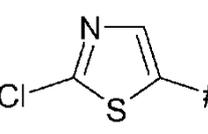
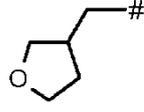
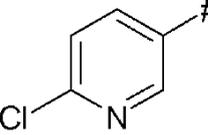
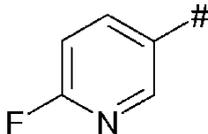
Tabla C:

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.1		H	H	H	H	CH ₃
C.2		H	H	H	H	CH ₃
C.3		H	H	H	H	CH ₃
C.4		H	H	H	H	CH ₃
C.5		H	H	H	H	CH ₃
C.6		H	H	H	H	CH ₃
C.7		H	H	H	H	CH ₃

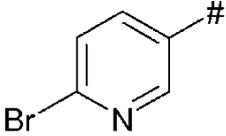
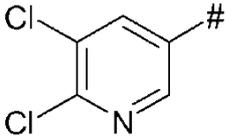
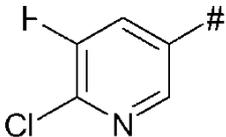
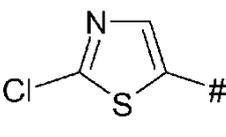
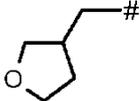
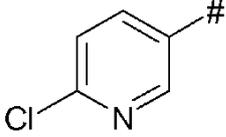
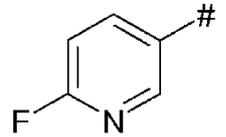
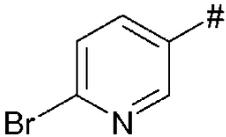
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.8		H	CH ₃	H	H	CH ₃
C.9		H	CH ₃	H	H	CH ₃
C.10		H	CH ₃	H	H	CH ₃
C.11		H	CH ₃	H	H	CH ₃
C.12		H	CH ₃	H	H	CH ₃
C.13		H	CH ₃	H	H	CH ₃
C.14		H	CH ₃	H	H	CH ₃
C.15		H	H	H	F	CH ₃

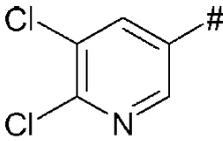
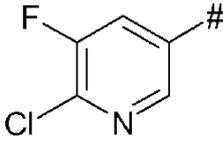
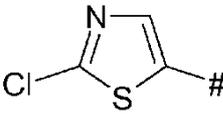
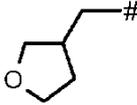
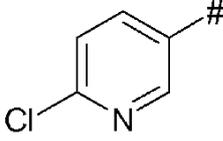
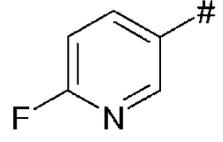
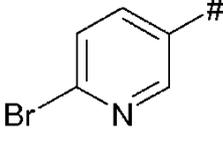
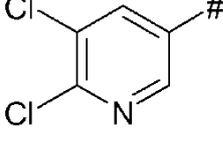
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.16		H	H	H	F	CH ₃
C.17		H	H	H	F	CH ₃
C.18		H	H	H	F	CH ₃
C.19		H	H	H	F	CH ₃
C.20		H	H	H	F	CH ₃
C.21		H	H	H	F	CH ₃
C.22		H	CH ₃	H	F	CH ₃
C.23		H	CH ₃	H	F	CH ₃

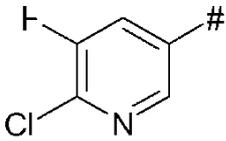
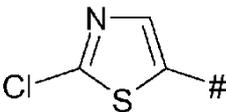
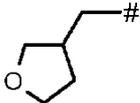
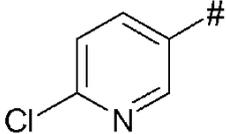
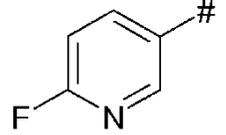
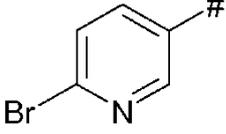
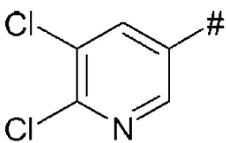
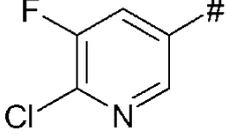
ES 2 630 373 T3

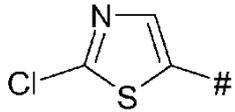
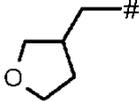
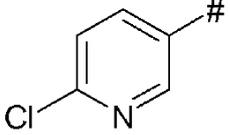
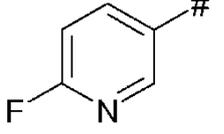
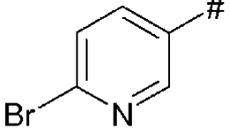
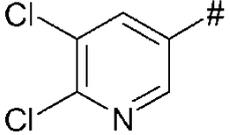
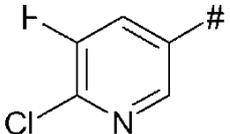
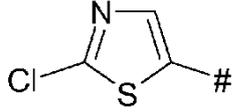
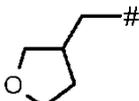
Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.24		H	CH ₃	H	F	CH ₃
C.25		H	CH ₃	H	F	CH ₃
C.26		H	CH ₃	H	F	CH ₃
C.27		H	CH ₃	H	F	CH ₃
C.28		H	CH ₃	H	F	CH ₃
C.29		H	H	F	F	CH ₃
C.30		H	H	F	F	CH ₃
C.31		H	H	F	F	CH ₃

ES 2 630 373 T3

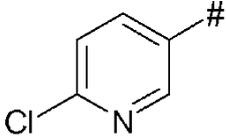
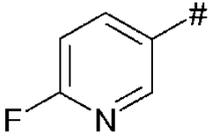
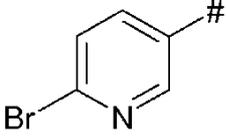
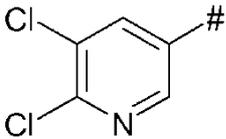
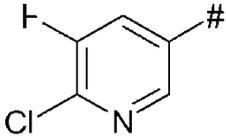
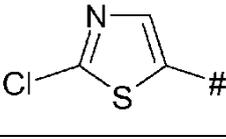
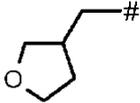
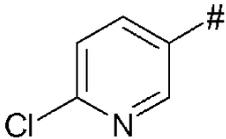
Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.32		H	H	F	F	CH ₃
C.33		H	H	F	F	CH ₃
C.34		H	H	F	F	CH ₃
C.35		H	H	F	F	CH ₃
C.36		H	CH ₃	F	F	CH ₃
C.37		H	CH ₃	F	F	CH ₃
C.38		H	CH ₃	F	F	CH ₃
C.39		H	CH ₃	F	F	CH ₃

ES 2 630 373 T3

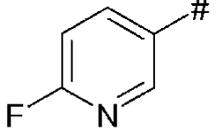
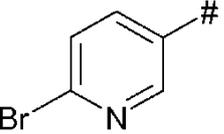
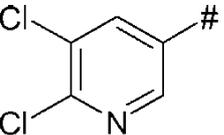
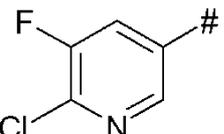
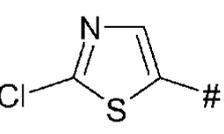
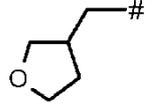
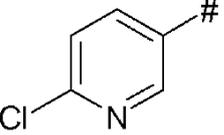
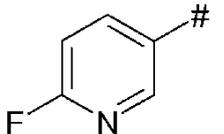
Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.40		H	CH ₃	F	F	CH ₃
C.41		H	CH ₃	F	F	CH ₃
C.42		H	CH ₃	F	F	CH ₃
C.43		H	H	H	CH ₃	CH ₃
C.44		H	H	H	CH ₃	CH ₃
C.45		H	H	H	CH ₃	CH ₃
C.46		H	H	H	CH ₃	CH ₃
C.47		H	H	H	CH ₃	CH ₃

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.48		H	H	H	CH ₃	CH ₃
C.49		H	H	H	CH ₃	CH ₃
C.50		H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃
C.51		H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃
C.52		H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃
C.53		H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃
C.54		H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃
C.55		H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃
C.56		H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃

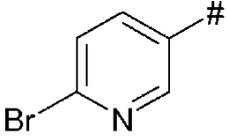
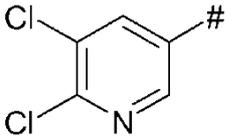
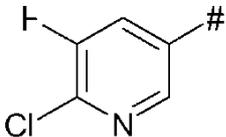
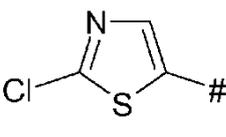
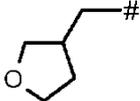
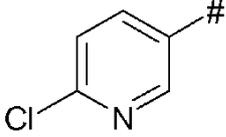
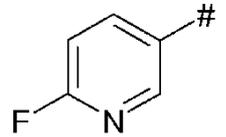
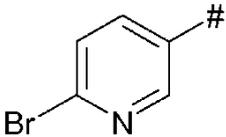
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.57		H	H	H	H	CH ₂ F
C.58		H	H	H	H	CH ₂ F
C.59		H	H	H	H	CH ₂ F
C.60		H	H	H	H	CH ₂ F
C.61		H	H	H	H	CH ₂ F
C.62		H	H	H	H	CH ₂ F
C.63		H	H	H	H	CH ₂ F
C.64		H	CH ₃	H	H	CH ₂ F

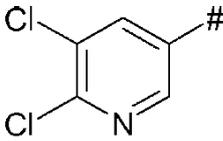
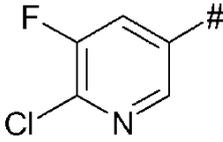
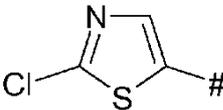
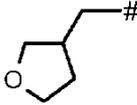
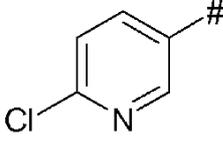
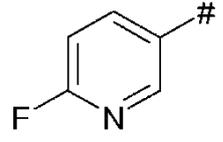
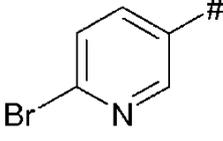
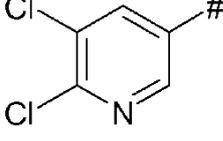
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.65		H	CH ₃	H	H	CH ₂ F
C.66		H	CH ₃	H	H	CH ₂ F
C.67		H	CH ₃	H	H	CH ₂ F
C.68		H	CH ₃	H	H	CH ₂ F
C.69		H	CH ₃	H	H	CH ₂ F
C.70		H	CH ₃	H	H	CH ₂ F
C.71		H	H	H	F	CH ₂ F
C.72		H	H	H	F	CH ₂ F

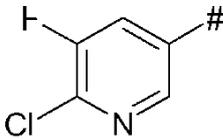
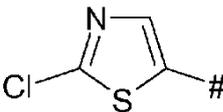
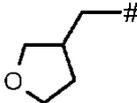
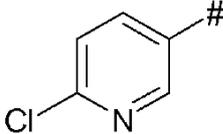
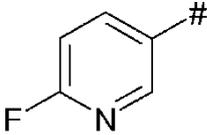
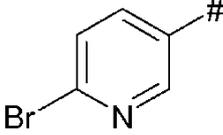
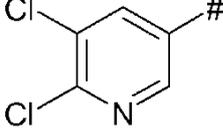
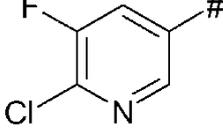
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.73		H	H	H	F	CH ₂ F
C.74		H	H	H	F	CH ₂ F
C.75		H	H	H	F	CH ₂ F
C.76		H	H	H	F	CH ₂ F
C.77		H	H	H	F	CH ₂ F
C.78		H	CH ₃	H	F	CH ₂ F
C.79		H	CH ₃	H	F	CH ₂ F
C.80		H	CH ₃	H	F	CH ₂ F

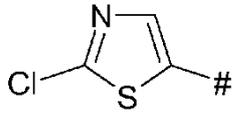
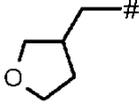
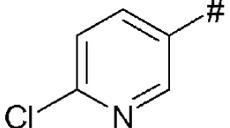
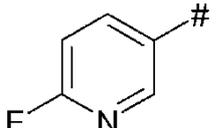
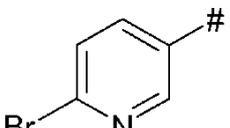
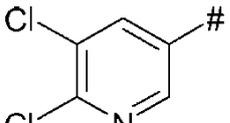
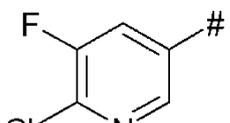
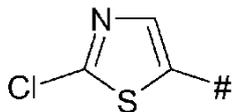
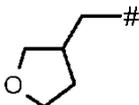
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.81		H	CH ₃	H	F	CH ₂ F
C.82		H	CH ₃	H	F	CH ₂ F
C.83		H	CH ₃	H	F	CH ₂ F
C.84		H	CH ₃	H	F	CH ₂ F
C.85		H	H	F	F	CH ₂ F
C.86		H	H	F	F	CH ₂ F
C.87		H	H	F	F	CH ₂ F
C.88		H	H	F	F	CH ₂ F

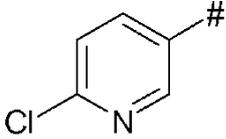
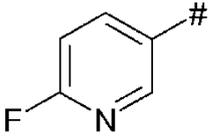
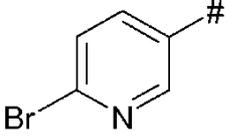
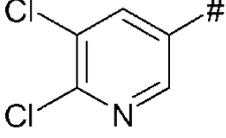
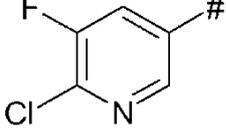
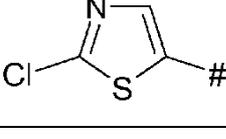
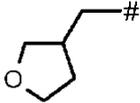
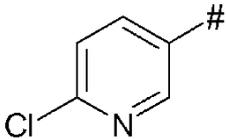
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.89		H	H	F	F	CH ₂ F
C.90		H	H	F	F	CH ₂ F
C.91		H	H	F	F	CH ₂ F
C.92		H	CH ₃	F	F	CH ₂ F
C.93		H	CH ₃	F	F	CH ₂ F
C.94		H	CH ₃	F	F	CH ₂ F
C.95		H	CH ₃	F	F	CH ₂ F
C.96		H	CH ₃	F	F	CH ₂ F

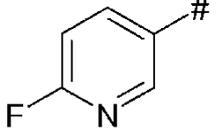
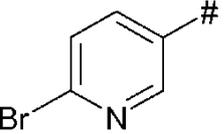
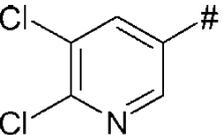
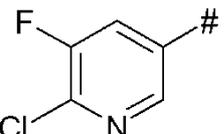
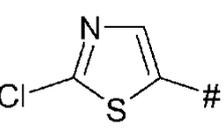
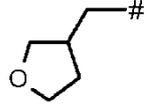
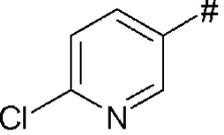
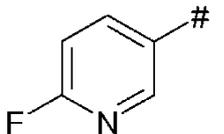
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.97		H	CH ₃	F	F	CH ₂ F
C.98		H	CH ₃	F	F	CH ₂ F
C.99		H	H	H	CH ₃	CH ₂ F
C.100		H	H	H	CH ₃	CH ₂ F
C.101		H	H	H	CH ₃	CH ₂ F
C.102		H	H	H	CH ₃	CH ₂ F
C.103		H	H	H	CH ₃	CH ₂ F
C.104		H	H	H	CH ₃	CH ₂ F
C.105		H	H	H	CH ₃	CH ₂ F

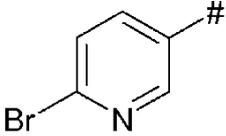
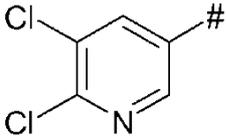
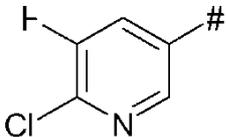
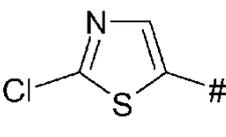
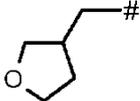
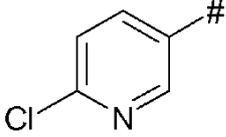
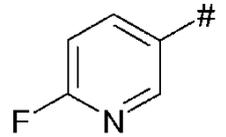
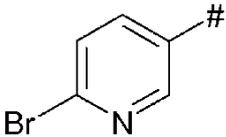
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.106		H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ F
C.107		H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ F
C.108		H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ F
C.109		H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ F
C.110		H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ F
C.111		H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ F
C.112		H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ F
C.113		H	H	H	H	CHF ₂

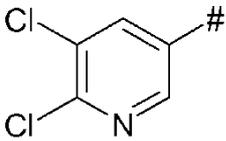
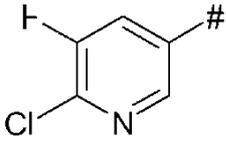
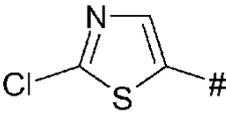
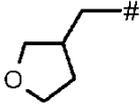
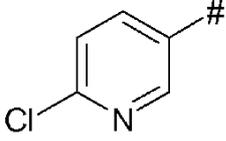
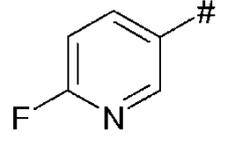
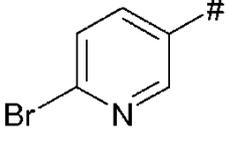
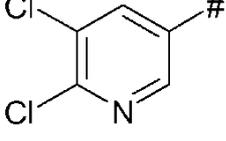
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.114		H	H	H	H	CHF ₂
C.115		H	H	H	H	CHF ₂
C.116		H	H	H	H	CHF ₂
C.117		H	H	H	H	CHF ₂
C.118		H	H	H	H	CHF ₂
C.119		H	H	H	H	CHF ₂
C.120		H	CH ₃	H	H	CHF ₂
C.121		H	CH ₃	H	H	CHF ₂

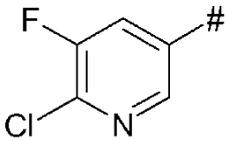
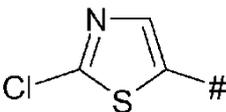
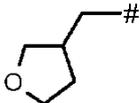
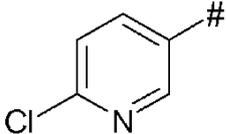
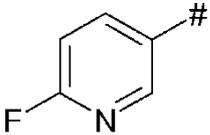
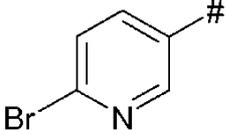
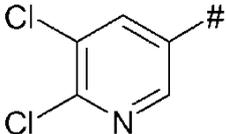
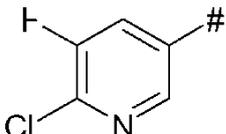
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.122		H	CH ₃	H	H	CHF ₂
C.123		H	CH ₃	H	H	CHF ₂
C.124		H	CH ₃	H	H	CHF ₂
C.125		H	CH ₃	H	H	CHF ₂
C.126		H	CH ₃	H	H	CHF ₂
C.127		H	H	H	F	CHF ₂
C.128		H	H	H	F	CHF ₂
C.129		H	H	H	F	CHF ₂

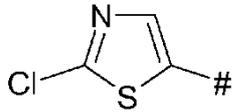
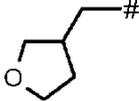
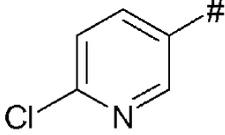
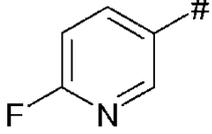
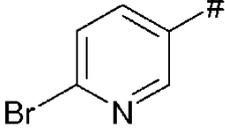
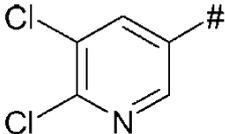
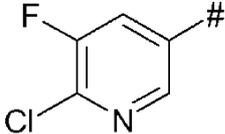
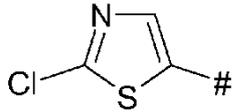
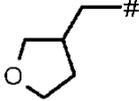
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.130		H	H	H	F	CHF ₂
C.131		H	H	H	F	CHF ₂
C.132		H	H	H	F	CHF ₂
C.133		H	H	H	F	CHF ₂
C.134		H	CH ₃	H	F	CHF ₂
C.135		H	CH ₃	H	F	CHF ₂
C.136		H	CH ₃	H	F	CHF ₂
C.137		H	CH ₃	H	F	CHF ₂

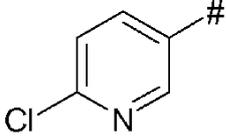
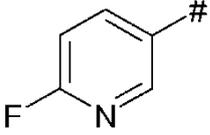
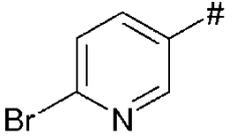
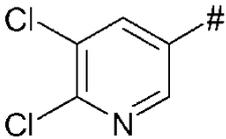
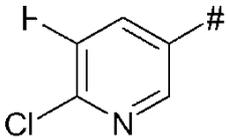
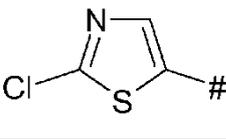
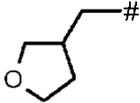
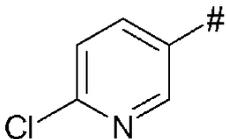
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.138		H	CH ₃	H	F	CHF ₂
C.139		H	CH ₃	H	F	CHF ₂
C.140		H	CH ₃	H	F	CHF ₂
C.141		H	H	F	F	CHF ₂
C.142		H	H	F	F	CHF ₂
C.143		H	H	F	F	CHF ₂
C.144		H	H	F	F	CHF ₂
C.145		H	H	F	F	CHF ₂

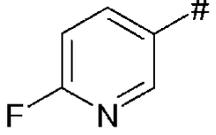
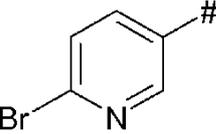
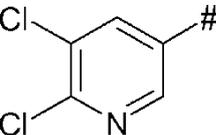
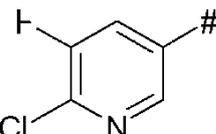
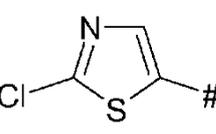
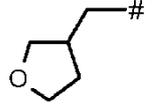
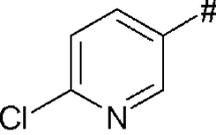
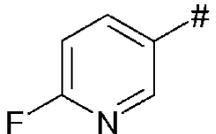
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.146		H	H	F	F	CHF ₂
C.147		H	H	F	F	CHF ₂
C.148		H	CH ₃	F	F	CHF ₂
C.149		H	CH ₃	F	F	CHF ₂
C.150		H	CH ₃	F	F	CHF ₂
C.151		H	CH ₃	F	F	CHF ₂
C.152		H	CH ₃	F	F	CHF ₂
C.153		H	CH ₃	F	F	CHF ₂
C.154		H	CH ₃	F	F	CHF ₂

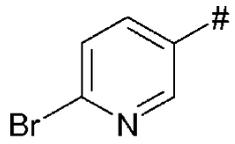
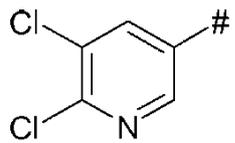
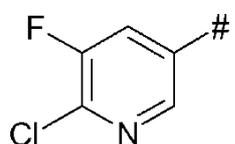
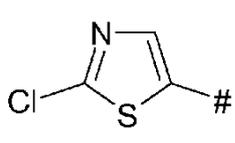
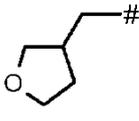
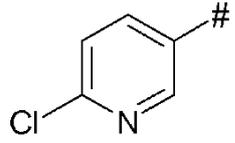
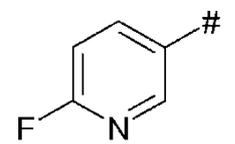
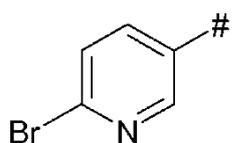
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.155		H	H	H	CH ₃	CHF ₂
C.156		H	H	H	CH ₃	CHF ₂
C.157		H	H	H	CH ₃	CHF ₂
C.158		H	H	H	CH ₃	CHF ₂
C.159		H	H	H	CH ₃	CHF ₂
C.160		H	H	H	CH ₃	CHF ₂
C.161		H	H	H	CH ₃	CHF ₂
C.162		H	CH ₃	H	CH ₃	CHF ₂

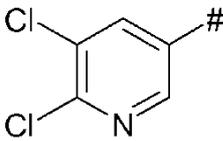
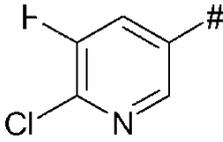
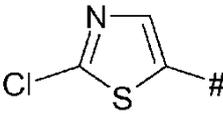
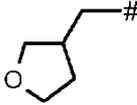
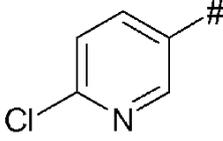
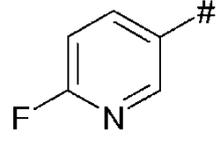
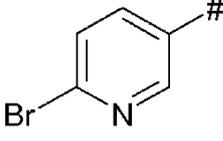
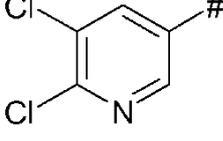
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.163		H	CH ₃	H	CH ₃	CHF ₂
C.164		H	CH ₃	H	CH ₃	CHF ₂
C.165		H	CH ₃	H	CH ₃	CHF ₂
C.166		H	CH ₃	H	CH ₃	CHF ₂
C.167		H	CH ₃	H	CH ₃	CHF ₂
C.168		H	CH ₃	H	CH ₃	CHF ₂
C.169		H	H	H	H	CF ₃
C.170		H	H	H	H	CF ₃

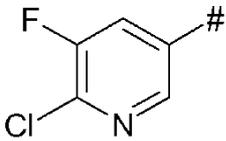
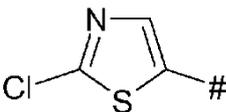
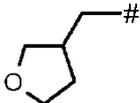
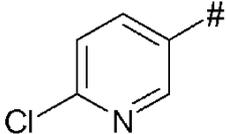
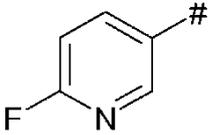
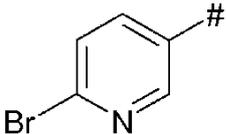
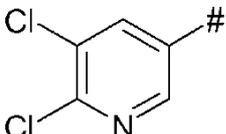
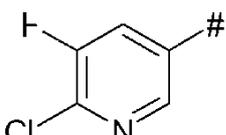
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.171		H	H	H	H	CF ₃
C.172		H	H	H	H	CF ₃
C.173		H	H	H	H	CF ₃
C.174		H	H	H	H	CF ₃
C.175		H	H	H	H	CF ₃
C.176		H	CH ₃	H	H	CF ₃
C.177		H	CH ₃	H	H	CF ₃
C.178		H	CH ₃	H	H	CF ₃

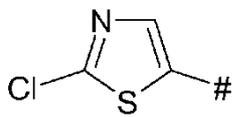
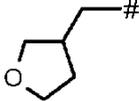
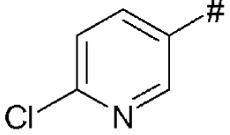
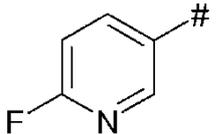
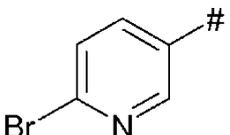
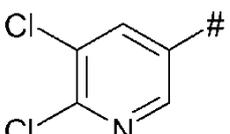
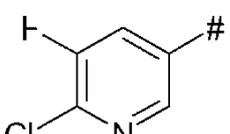
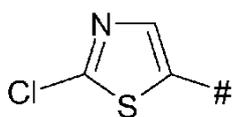
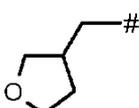
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.179		H	CH ₃	H	H	CF ₃
C.180		H	CH ₃	H	H	CF ₃
C.181		H	CH ₃	H	H	CF ₃
C.182		H	CH ₃	H	H	CF ₃
C.183		H	H	H	F	CF ₃
C.184		H	H	H	F	CF ₃
C.185		H	H	H	F	CF ₃
C.186		H	H	H	F	CF ₃

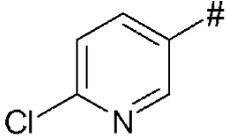
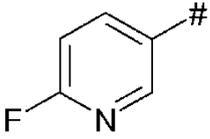
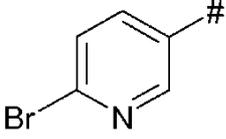
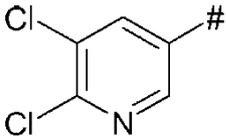
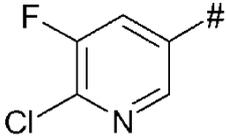
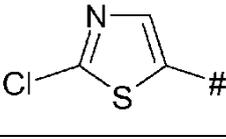
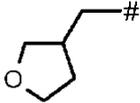
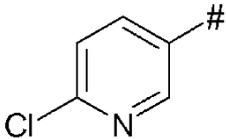
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.187		H	H	H	F	CF ₃
C.188		H	H	H	F	CF ₃
C.189		H	H	H	F	CF ₃
C.190		H	CH ₃	H	F	CF ₃
C.191		H	CH ₃	H	F	CF ₃
C.192		H	CH ₃	H	F	CF ₃
C.193		H	CH ₃	H	F	CF ₃
C.194		H	CH ₃	H	F	CF ₃

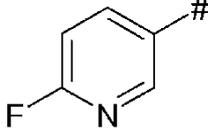
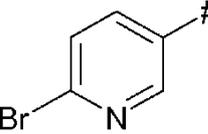
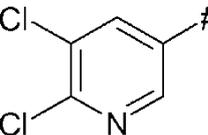
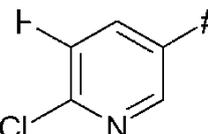
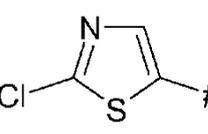
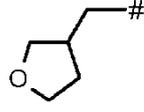
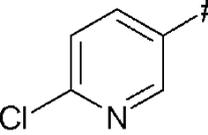
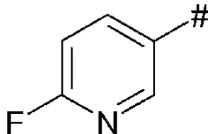
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.195		H	CH ₃	H	F	CF ₃
C.196		H	CH ₃	H	F	CF ₃
C.197		H	H	F	F	CF ₃
C.198		H	H	F	F	CF ₃
C.199		H	H	F	F	CF ₃
C.200		H	H	F	F	CF ₃
C.201		H	H	F	F	CF ₃
C.202		H	H	F	F	CF ₃
C.203		H	H	F	F	CF ₃

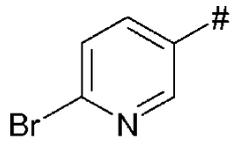
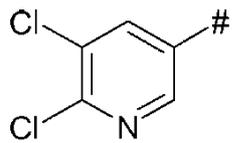
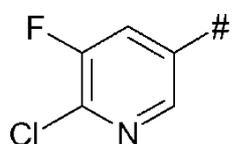
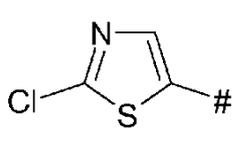
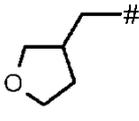
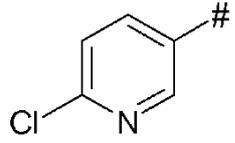
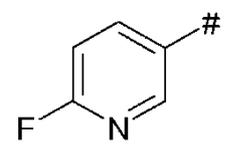
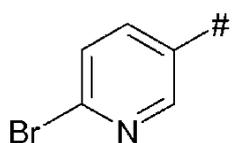
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.204		H	CH ₃	F	F	CF ₃
C.205		H	CH ₃	F	F	CF ₃
C.206		H	CH ₃	F	F	CF ₃
C.207		H	CH ₃	F	F	CF ₃
C.208		H	CH ₃	F	F	CF ₃
C.209		H	CH ₃	F	F	CF ₃
C.210		H	CH ₃	F	F	CF ₃
C.211		H	H	H	CH ₃	CF ₃

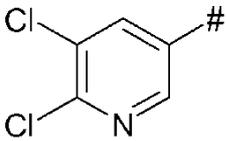
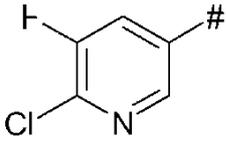
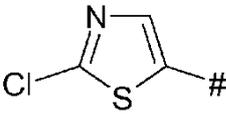
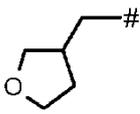
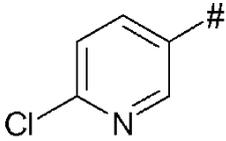
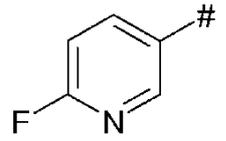
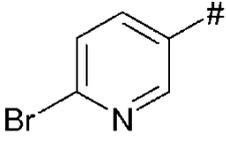
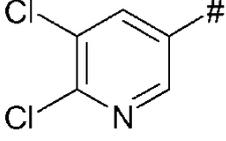
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.212		H	H	H	CH ₃	CF ₃
C.213		H	H	H	CH ₃	CF ₃
C.214		H	H	H	CH ₃	CF ₃
C.215		H	H	H	CH ₃	CF ₃
C.216		H	H	H	CH ₃	CF ₃
C.217		H	H	H	CH ₃	CF ₃
C.218		H	CH ₃	H	CH ₃	CF ₃
C.219		H	CH ₃	H	CH ₃	CF ₃

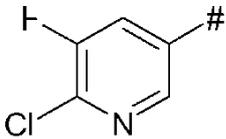
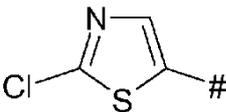
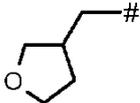
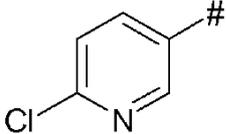
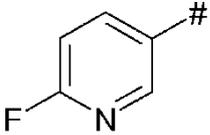
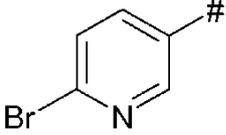
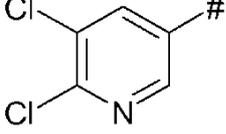
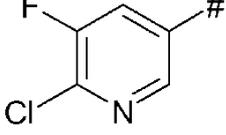
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.220		H	CH ₃	H	CH ₃	CF ₃
C.221		H	CH ₃	H	CH ₃	CF ₃
C.222		H	CH ₃	H	CH ₃	CF ₃
C.223		H	CH ₃	H	CH ₃	CF ₃
C.224		H	CH ₃	H	CH ₃	CF ₃
C.225		H	H	H	H	CF ₂ Cl
C.226		H	H	H	H	CF ₂ Cl
C.227		H	H	H	H	CF ₂ Cl

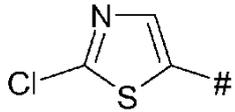
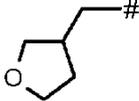
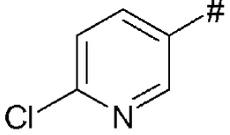
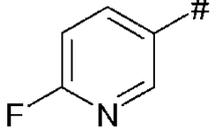
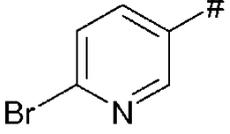
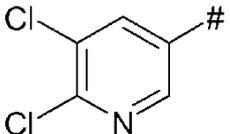
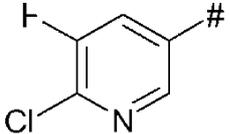
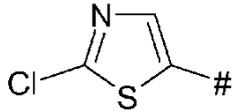
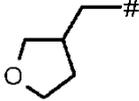
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.228		H	H	H	H	CF ₂ Cl
C.229		H	H	H	H	CF ₂ Cl
C.230		H	H	H	H	CF ₂ Cl
C.231		H	H	H	H	CF ₂ Cl
C.232		H	CH ₃	H	H	CF ₂ Cl
C.233		H	CH ₃	H	H	CF ₂ Cl
C.234		H	CH ₃	H	H	CF ₂ Cl
C.235		H	CH ₃	H	H	CF ₂ Cl

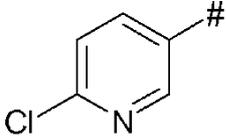
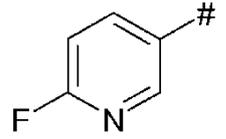
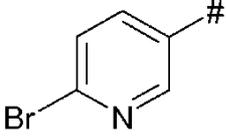
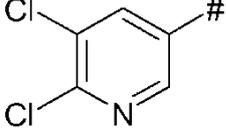
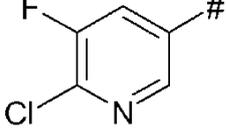
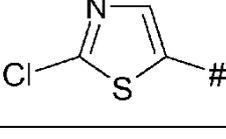
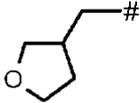
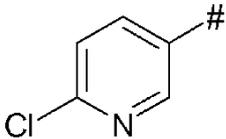
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.236		H	CH ₃	H	H	CF ₂ Cl
C.237		H	CH ₃	H	H	CF ₂ Cl
C.238		H	CH ₃	H	H	CF ₂ Cl
C.239		H	H	H	F	CF ₂ Cl
C.240		H	H	H	F	CF ₂ Cl
C.241		H	H	H	F	CF ₂ Cl
C.242		H	H	H	F	CF ₂ Cl
C.243		H	H	H	F	CF ₂ Cl

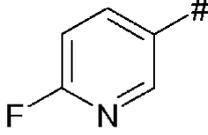
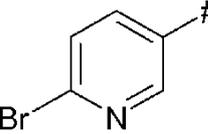
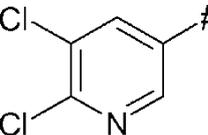
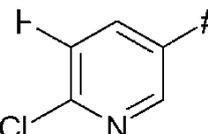
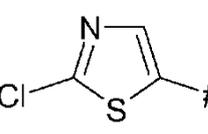
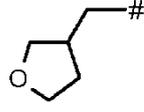
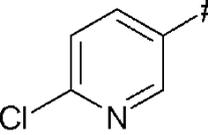
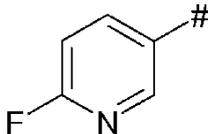
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.244		H	H	H	F	CF ₂ Cl
C.245		H	H	H	F	CF ₂ Cl
C.246		H	CH ₃	H	F	CF ₂ Cl
C.247		H	CH ₃	H	F	CF ₂ Cl
C.248		H	CH ₃	H	F	CF ₂ Cl
C.249		H	CH ₃	H	F	CF ₂ Cl
C.250		H	CH ₃	H	F	CF ₂ Cl
C.251		H	CH ₃	H	F	CF ₂ Cl
C.252		H	CH ₃	H	F	CF ₂ Cl

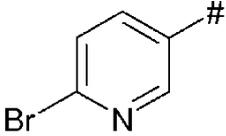
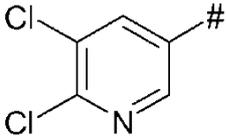
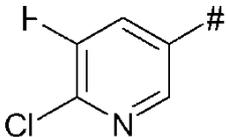
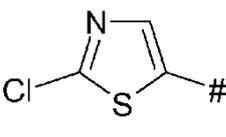
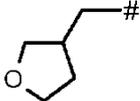
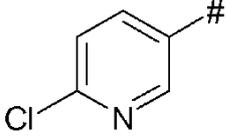
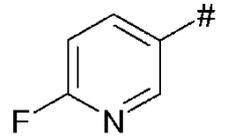
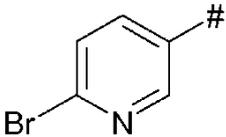
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.253		H	H	F	F	CF ₂ Cl
C.254		H	H	F	F	CF ₂ Cl
C.255		H	H	F	F	CF ₂ Cl
C.256		H	H	F	F	CF ₂ Cl
C.257		H	H	F	F	CF ₂ Cl
C.258		H	H	F	F	CF ₂ Cl
C.259		H	H	F	F	CF ₂ Cl
C.260		H	CH ₃	F	F	CF ₂ Cl

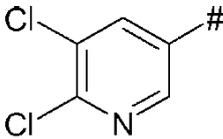
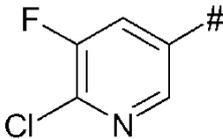
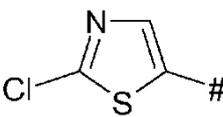
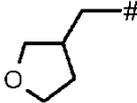
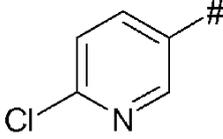
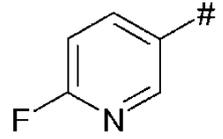
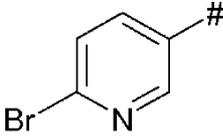
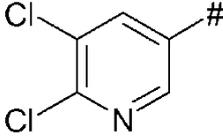
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.261		H	CH ₃	F	F	CF ₂ Cl
C.262		H	CH ₃	F	F	CF ₂ Cl
C.263		H	CH ₃	F	F	CF ₂ Cl
C.264		H	CH ₃	F	F	CF ₂ Cl
C.265		H	CH ₃	F	F	CF ₂ Cl
C.266		H	CH ₃	F	F	CF ₂ Cl
C.267		H	H	H	CH ₃	CF ₂ Cl
C.268		H	H	H	CH ₃	CF ₂ Cl

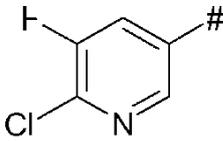
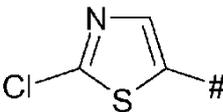
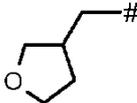
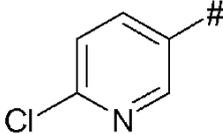
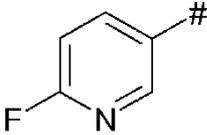
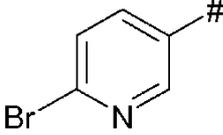
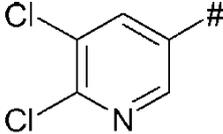
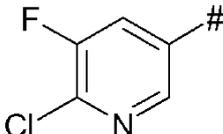
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.269		H	H	H	CH ₃	CF ₂ Cl
C.270		H	H	H	CH ₃	CF ₂ Cl
C.271		H	H	H	CH ₃	CF ₂ Cl
C.272		H	H	H	CH ₃	CF ₂ Cl
C.273		H	H	H	CH ₃	CF ₂ Cl
C.274		H	CH ₃	H	CH ₃	CF ₂ Cl
C.275		H	CH ₃	H	CH ₃	CF ₂ Cl
C.276		H	CH ₃	H	CH ₃	CF ₂ Cl

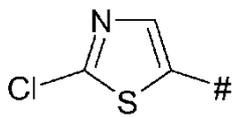
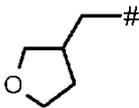
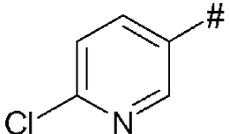
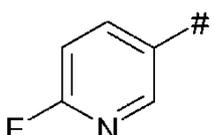
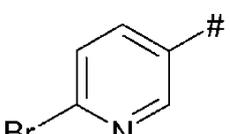
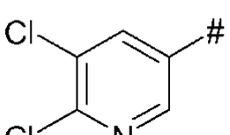
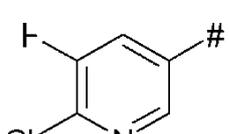
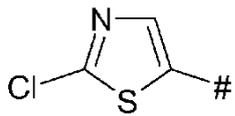
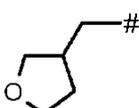
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.277		H	CH ₃	H	CH ₃	CF ₂ Cl
C.278		H	CH ₃	H	CH ₃	CF ₂ Cl
C.279		H	CH ₃	H	CH ₃	CF ₂ Cl
C.280		H	CH ₃	H	CH ₃	CF ₂ Cl
C.281		H	H	H	H	C ₂ H ₅
C.282		H	H	H	H	C ₂ H ₅
C.283		H	H	H	H	C ₂ H ₅
C.284		H	H	H	H	C ₂ H ₅

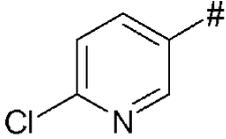
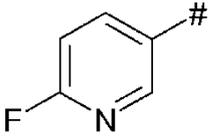
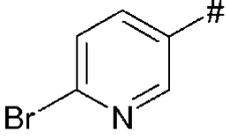
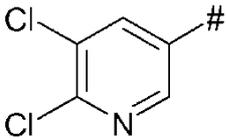
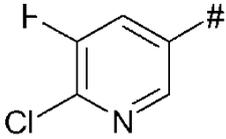
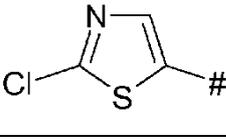
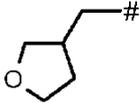
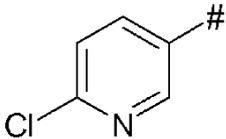
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.285		H	H	H	H	C ₂ H ₅
C.286		H	H	H	H	C ₂ H ₅
C.287		H	H	H	H	C ₂ H ₅
C.288		H	CH ₃	H	H	C ₂ H ₅
C.289		H	CH ₃	H	H	C ₂ H ₅
C.290		H	CH ₃	H	H	C ₂ H ₅
C.291		H	CH ₃	H	H	C ₂ H ₅
C.292		H	CH ₃	H	H	C ₂ H ₅

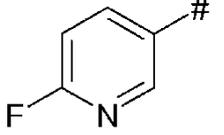
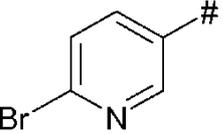
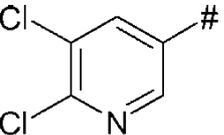
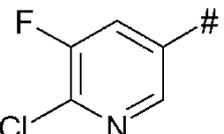
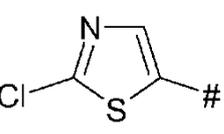
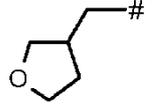
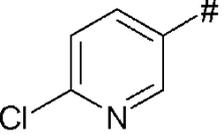
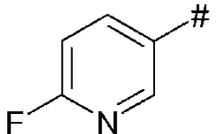
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.293		H	CH ₃	H	H	C ₂ H ₅
C.294		H	CH ₃	H	H	C ₂ H ₅
C.295		H	H	H	F	C ₂ H ₅
C.296		H	H	H	F	C ₂ H ₅
C.297		H	H	H	F	C ₂ H ₅
C.298		H	H	H	F	C ₂ H ₅
C.299		H	H	H	F	C ₂ H ₅
C.300		H	H	H	F	C ₂ H ₅
C.301		H	H	H	F	C ₂ H ₅

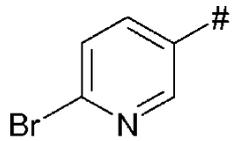
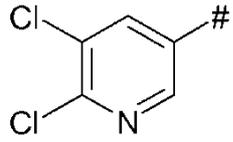
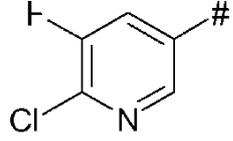
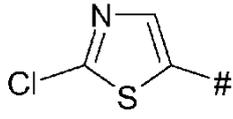
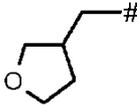
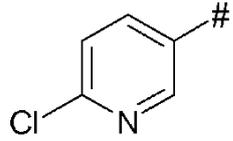
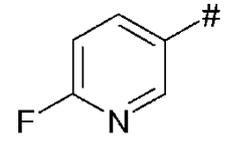
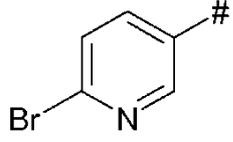
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.302		H	CH ₃	H	F	C ₂ H ₅
C.303		H	CH ₃	H	F	C ₂ H ₅
C.304		H	CH ₃	H	F	C ₂ H ₅
C.305		H	CH ₃	H	F	C ₂ H ₅
C.306		H	CH ₃	H	F	C ₂ H ₅
C.307		H	CH ₃	H	F	C ₂ H ₅
C.308		H	CH ₃	H	F	C ₂ H ₅
C.309		H	H	F	F	C ₂ H ₅

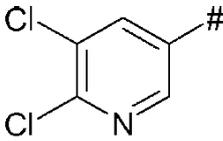
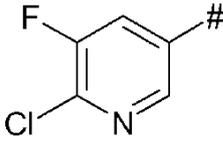
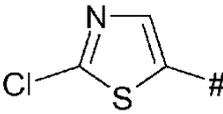
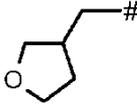
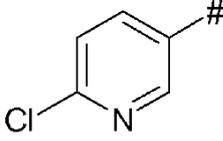
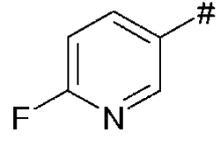
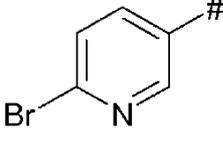
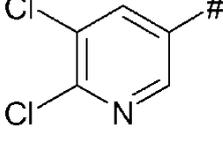
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.310		H	H	F	F	C ₂ H ₅
C.311		H	H	F	F	C ₂ H ₅
C.312		H	H	F	F	C ₂ H ₅
C.313		H	H	F	F	C ₂ H ₅
C.314		H	H	F	F	C ₂ H ₅
C.315		H	H	F	F	C ₂ H ₅
C.316		H	CH ₃	F	F	C ₂ H ₅
C.317		H	CH ₃	F	F	C ₂ H ₅

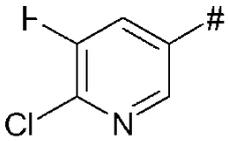
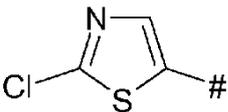
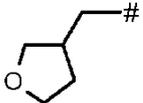
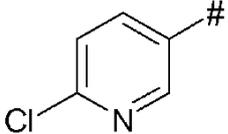
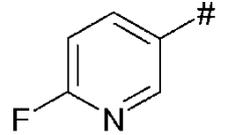
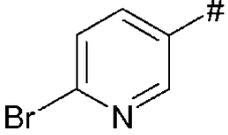
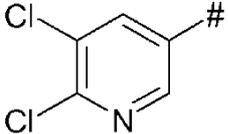
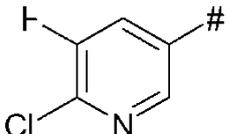
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.318		H	CH ₃	F	F	C ₂ H ₅
C.319		H	CH ₃	F	F	C ₂ H ₅
C.320		H	CH ₃	F	F	C ₂ H ₅
C.321		H	CH ₃	F	F	C ₂ H ₅
C.322		H	CH ₃	F	F	C ₂ H ₅
C.323		H	H	H	CH ₃	C ₂ H ₅
C.324		H	H	H	CH ₃	C ₂ H ₅
C.325		H	H	H	CH ₃	C ₂ H ₅

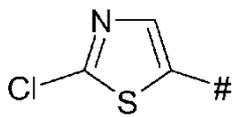
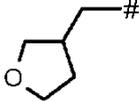
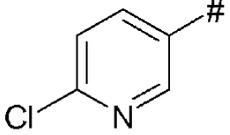
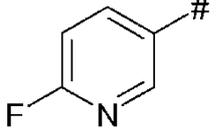
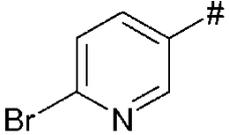
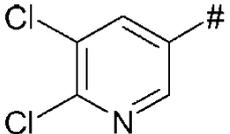
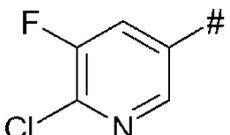
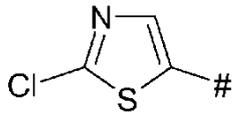
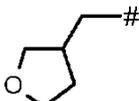
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.326		H	H	H	CH ₃	C ₂ H ₅
C.327		H	H	H	CH ₃	C ₂ H ₅
C.328		H	H	H	CH ₃	C ₂ H ₅
C.329		H	H	H	CH ₃	C ₂ H ₅
C.330		H	CH ₃	H	CH ₃	C ₂ H ₅
C.331		H	CH ₃	H	CH ₃	C ₂ H ₅
C.332		H	CH ₃	H	CH ₃	C ₂ H ₅
C.333		H	CH ₃	H	CH ₃	C ₂ H ₅

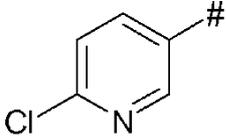
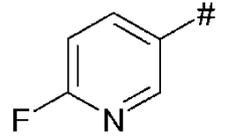
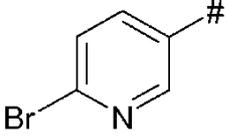
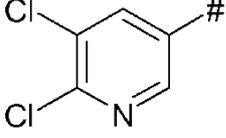
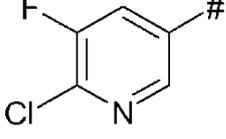
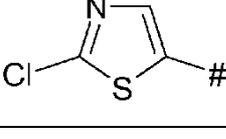
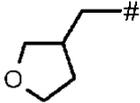
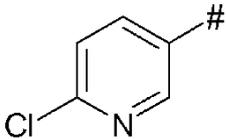
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.334		H	CH ₃	H	CH ₃	C ₂ H ₅
C.335		H	CH ₃	H	CH ₃	C ₂ H ₅
C.336		H	CH ₃	H	CH ₃	C ₂ H ₅
C.337		H	H	H	H	CF ₂ CF ₃
C.338		H	H	H	H	CF ₂ CF ₃
C.339		H	H	H	H	CF ₂ CF ₃
C.340		H	H	H	H	CF ₂ CF ₃
C.341		H	H	H	H	CF ₂ CF ₃

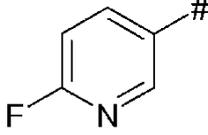
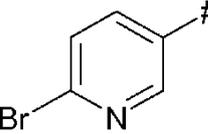
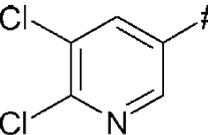
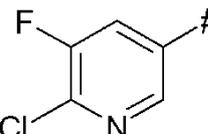
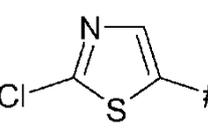
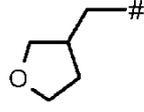
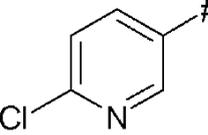
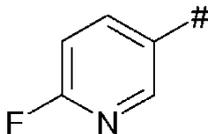
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.342		H	H	H	H	CF ₂ CF ₃
C.343		H	H	H	H	CF ₂ CF ₃
C.344		H	CH ₃	H	H	CF ₂ CF ₃
C.345		H	CH ₃	H	H	CF ₂ CF ₃
C.346		H	CH ₃	H	H	CF ₂ CF ₃
C.347		H	CH ₃	H	H	CF ₂ CF ₃
C.348		H	CH ₃	H	H	CF ₂ CF ₃
C.349		H	CH ₃	H	H	CF ₂ CF ₃
C.350		H	CH ₃	H	H	CF ₂ CF ₃

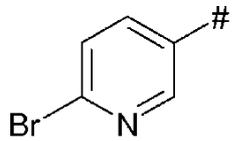
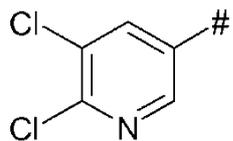
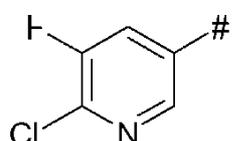
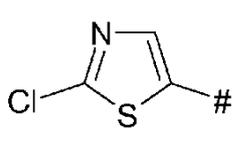
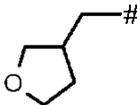
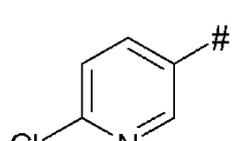
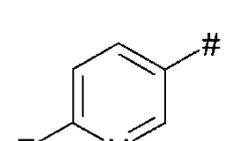
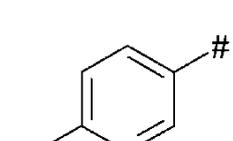
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.351		H	H	H	F	CF ₂ CF ₃
C.352		H	H	H	F	CF ₂ CF ₃
C.353		H	H	H	F	CF ₂ CF ₃
C.354		H	H	H	F	CF ₂ CF ₃
C.355		H	H	H	F	CF ₂ CF ₃
C.356		H	H	H	F	CF ₂ CF ₃
C.357		H	H	H	F	CF ₂ CF ₃
C.358		H	CH ₃	H	F	CF ₂ CF ₃

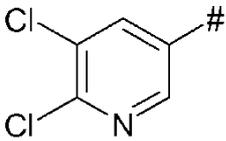
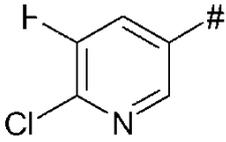
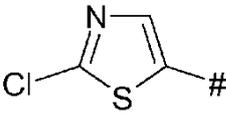
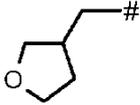
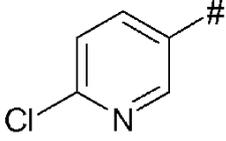
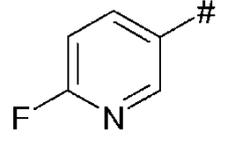
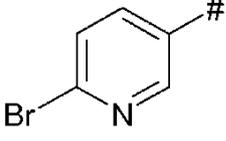
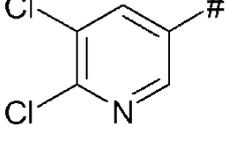
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.359		H	CH ₃	H	F	CF ₂ CF ₃
C.360		H	CH ₃	H	F	CF ₂ CF ₃
C.361		H	CH ₃	H	F	CF ₂ CF ₃
C.362		H	CH ₃	H	F	CF ₂ CF ₃
C.363		H	CH ₃	H	F	CF ₂ CF ₃
C.364		H	CH ₃	H	F	CF ₂ CF ₃
C.365		H	H	F	F	CF ₂ CF ₃
C.366		H	H	F	F	CF ₂ CF ₃

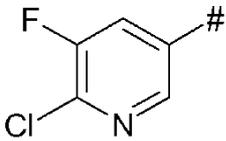
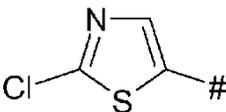
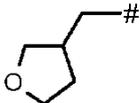
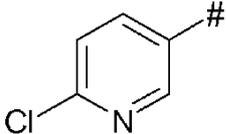
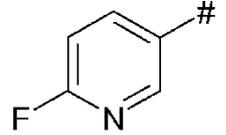
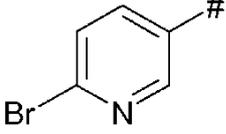
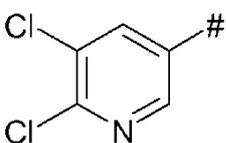
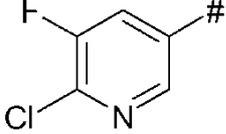
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.367		H	H	F	F	CF ₂ CF ₃
C.368		H	H	F	F	CF ₂ CF ₃
C.369		H	H	F	F	CF ₂ CF ₃
C.370		H	H	F	F	CF ₂ CF ₃
C.371		H	H	F	F	CF ₂ CF ₃
C.372		H	CH ₃	F	F	CF ₂ CF ₃
C.373		H	CH ₃	F	F	CF ₂ CF ₃
C.374		H	CH ₃	F	F	CF ₂ CF ₃

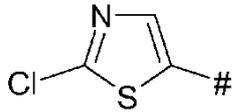
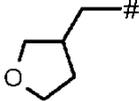
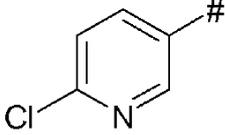
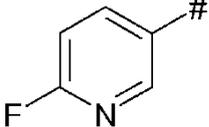
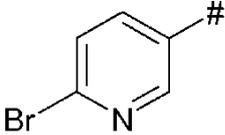
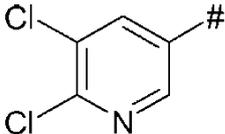
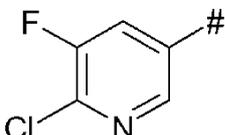
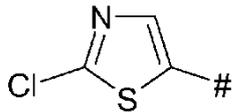
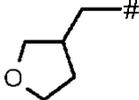
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.375		H	CH ₃	F	F	CF ₂ CF ₃
C.376		H	CH ₃	F	F	CF ₂ CF ₃
C.377		H	CH ₃	F	F	CF ₂ CF ₃
C.378		H	CH ₃	F	F	CF ₂ CF ₃
C.379		H	H	H	CH ₃	CF ₂ CF ₃
C.380		H	H	H	CH ₃	CF ₂ CF ₃
C.381		H	H	H	CH ₃	CF ₂ CF ₃
C.382		H	H	H	CH ₃	CF ₂ CF ₃

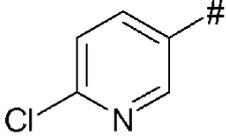
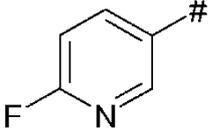
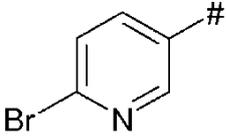
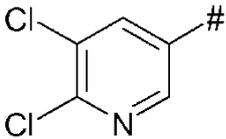
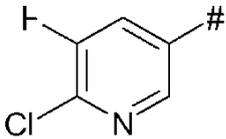
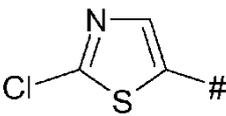
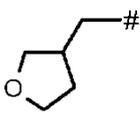
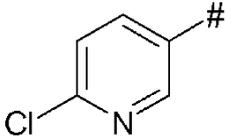
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.383		H	H	H	CH ₃	CF ₂ CF ₃
C.384		H	H	H	CH ₃	CF ₂ CF ₃
C.385		H	H	H	CH ₃	CF ₂ CF ₃
C.386		H	CH ₃	H	CH ₃	CF ₂ CF ₃
C.387		H	CH ₃	H	CH ₃	CF ₂ CF ₃
C.388		H	CH ₃	H	CH ₃	CF ₂ CF ₃
C.389		H	CH ₃	H	CH ₃	CF ₂ CF ₃
C.390		H	CH ₃	H	CH ₃	CF ₂ CF ₃

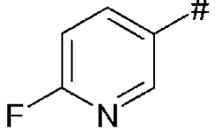
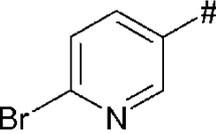
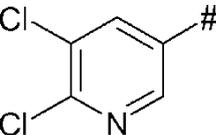
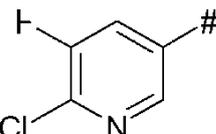
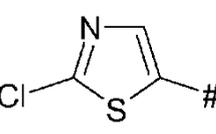
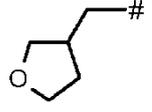
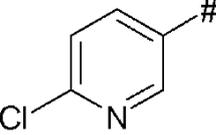
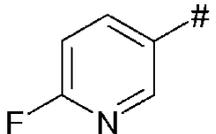
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.391		H	CH ₃	H	CH ₃	CF ₂ CF ₃
C.392		H	CH ₃	H	CH ₃	CF ₂ CF ₃
C.393		H	H	H	H	CF ₂ CF ₂
C.394		H	H	H	H	CF ₂ CF ₂
C.395		H	H	H	H	CF ₂ CF ₂
C.396		H	H	H	H	CF ₂ CF ₂
C.397		H	H	H	H	CF ₂ CF ₂
C.398		H	H	H	H	CF ₂ CF ₂
C.399		H	H	H	H	CF ₂ CF ₂

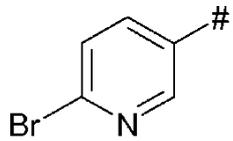
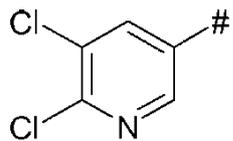
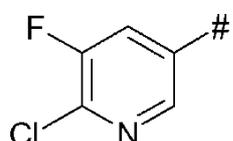
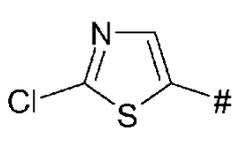
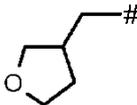
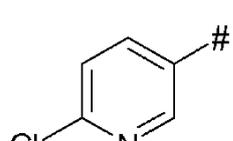
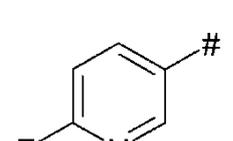
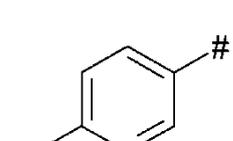
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.400		H	CH ₃	H	H	CF ₂ CF ₂
C.401		H	CH ₃	H	H	CF ₂ CF ₂
C.402		H	CH ₃	H	H	CF ₂ CF ₂
C.403		H	CH ₃	H	H	CF ₂ CF ₂
C.404		H	CH ₃	H	H	CF ₂ CF ₂
C.405		H	CH ₃	H	H	CF ₂ CF ₂
C.406		H	CH ₃	H	H	CF ₂ CF ₂
C.407		H	H	H	F	CF ₂ CF ₂

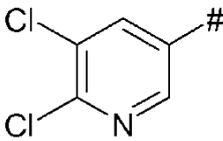
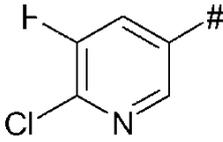
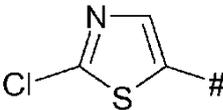
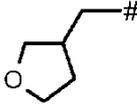
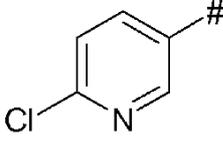
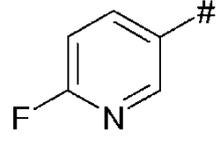
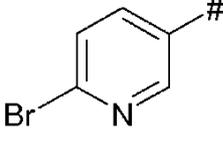
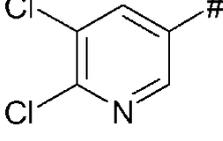
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.408		H	H	H	F	CF ₂ CF ₂
C.409		H	H	H	F	CF ₂ CF ₂
C.410		H	H	H	F	CF ₂ CF ₂
C.411		H	H	H	F	CF ₂ CF ₂
C.412		H	H	H	F	CF ₂ CF ₂
C.413		H	H	H	F	CF ₂ CF ₂
C.414		H	CH ₃	H	F	CF ₂ CF ₂
C.415		H	CH ₃	H	F	CF ₂ CF ₂

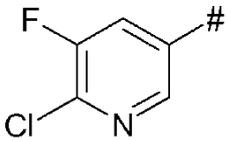
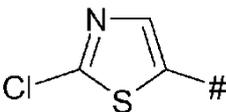
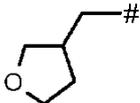
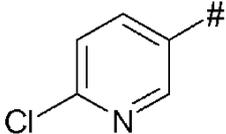
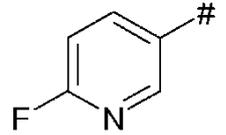
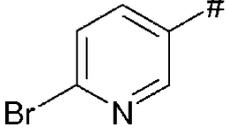
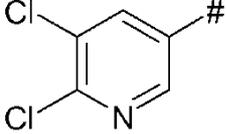
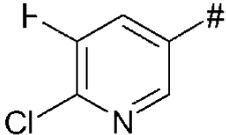
ES 2 630 373 T3

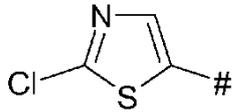
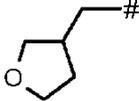
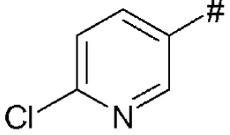
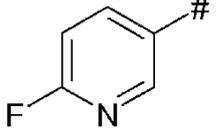
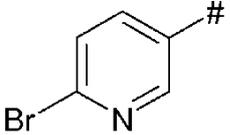
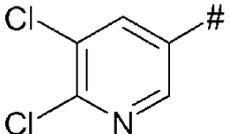
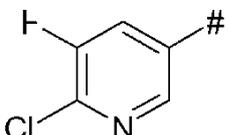
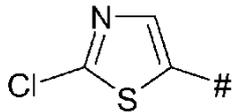
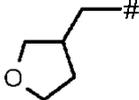
Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.416		H	CH ₃	H	F	CF ₂ CF ₂
C.417		H	CH ₃	H	F	CF ₂ CF ₂
C.418		H	CH ₃	H	F	CF ₂ CF ₂
C.419		H	CH ₃	H	F	CF ₂ CF ₂
C.420		H	CH ₃	H	F	CF ₂ CF ₂
C.421		H	H	F	F	CF ₂ CF ₂
C.422		H	H	F	F	CF ₂ CF ₂
C.423		H	H	F	F	CF ₂ CF ₂

ES 2 630 373 T3

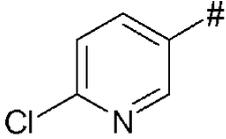
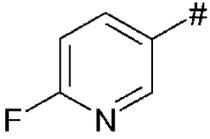
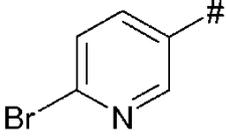
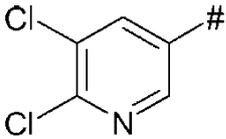
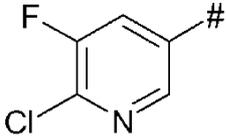
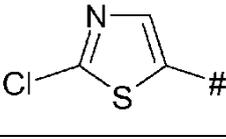
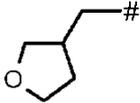
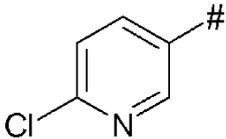
Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.424		H	H	F	F	CF ₂ CF ₂
C.425		H	H	F	F	CF ₂ CF ₂
C.426		H	H	F	F	CF ₂ CF ₂
C.427		H	H	F	F	CF ₂ CF ₂
C.428		H	CH ₃	F	F	CF ₂ CF ₂
C.429		H	CH ₃	F	F	CF ₂ CF ₂
C.430		H	CH ₃	F	F	CF ₂ CF ₂
C.431		H	CH ₃	F	F	CF ₂ CF ₂

ES 2 630 373 T3

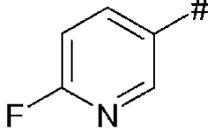
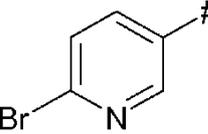
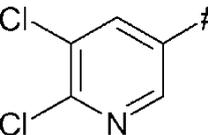
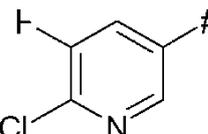
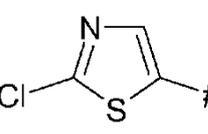
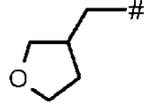
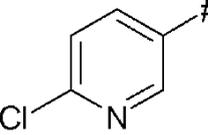
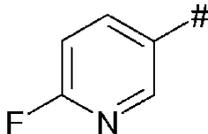
Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.432		H	CH ₃	F	F	CF ₂ CF ₂
C.433		H	CH ₃	F	F	CF ₂ CF ₂
C.434		H	CH ₃	F	F	CF ₂ CF ₂
C.435		H	H	H	CH ₃	CF ₂ CF ₂
C.436		H	H	H	CH ₃	CF ₂ CF ₂
C.437		H	H	H	CH ₃	CF ₂ CF ₂
C.438		H	H	H	CH ₃	CF ₂ CF ₂
C.439		H	H	H	CH ₃	CF ₂ CF ₂

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.440		H	H	H	CH ₃	CF ₂ CF ₂
C.441		H	H	H	CH ₃	CF ₂ CF ₂
C.442		H	CH ₃	H	CH ₃	CF ₂ CF ₂
C.443		H	CH ₃	H	CH ₃	CF ₂ CF ₂
C.444		H	CH ₃	H	CH ₃	CF ₂ CF ₂
C.445		H	CH ₃	H	CH ₃	CF ₂ CF ₂
C.446		H	CH ₃	H	CH ₃	CF ₂ CF ₂
C.447		H	CH ₃	H	CH ₃	CF ₂ CF ₂
C.448		H	CH ₃	H	CH ₃	CF ₂ CF ₂

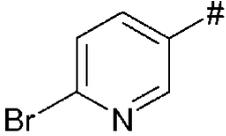
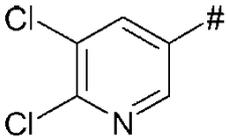
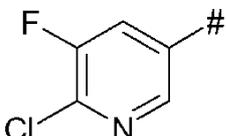
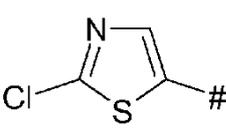
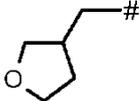
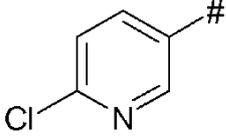
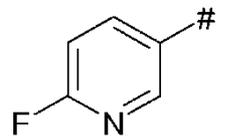
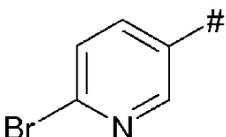
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.449		H	H	H	H	CH ₂ CF ₃
C.450		H	H	H	H	CH ₂ CF ₃
C.451		H	H	H	H	CH ₂ CF ₃
C.452		H	H	H	H	CH ₂ CF ₃
C.453		H	H	H	H	CH ₂ CF ₃
C.454		H	H	H	H	CH ₂ CF ₃
C.455		H	H	H	H	CH ₂ CF ₃
C.456		H	CH ₃	H	H	CH ₂ CF ₃

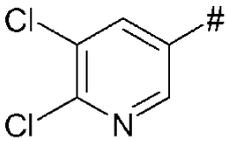
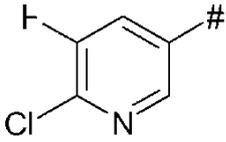
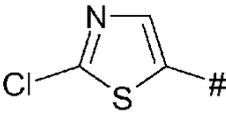
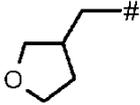
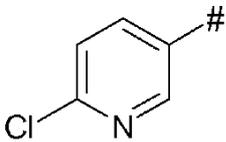
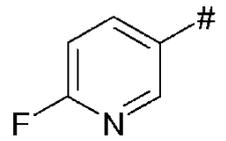
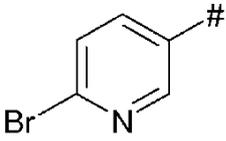
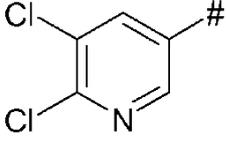
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.457		H	CH ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
C.458		H	CH ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
C.459		H	CH ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
C.460		H	CH ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
C.461		H	CH ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
C.462		H	CH ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
C.463		H	H	H	F	CH ₂ CF ₃
C.464		H	H	H	F	CH ₂ CF ₃

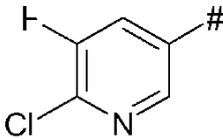
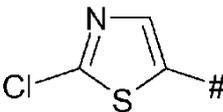
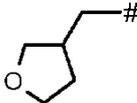
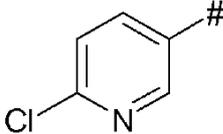
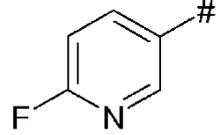
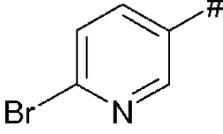
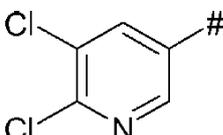
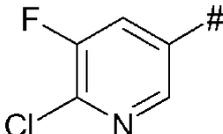
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.465		H	H	H	F	CH ₂ CF ₃
C.466		H	H	H	F	CH ₂ CF ₃
C.467		H	H	H	F	CH ₂ CF ₃
C.468		H	H	H	F	CH ₂ CF ₃
C.469		H	H	H	F	CH ₂ CF ₃
C.470		H	CH ₃	H	F	CH ₂ CF ₃
C.471		H	CH ₃	H	F	CH ₂ CF ₃
C.472		H	CH ₃	H	F	CH ₂ CF ₃

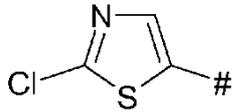
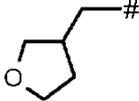
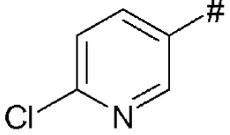
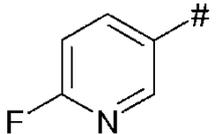
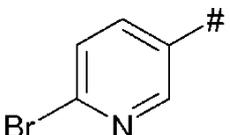
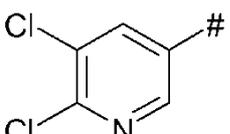
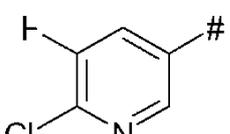
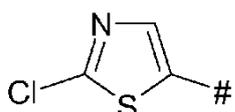
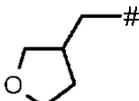
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.473		H	CH ₃	H	F	CH ₂ CF ₃
C.474		H	CH ₃	H	F	CH ₂ CF ₃
C.475		H	CH ₃	H	F	CH ₂ CF ₃
C.476		H	CH ₃	H	F	CH ₂ CF ₃
C.477		H	H	F	F	CH ₂ CF ₃
C.478		H	H	F	F	CH ₂ CF ₃
C.479		H	H	F	F	CH ₂ CF ₃
C.480		H	H	F	F	CH ₂ CF ₃

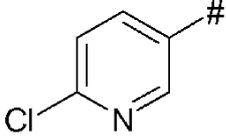
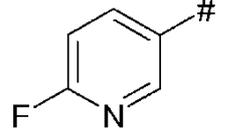
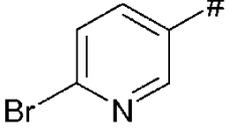
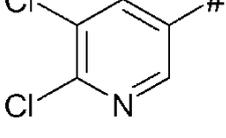
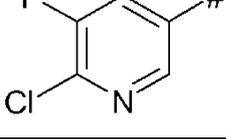
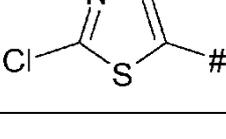
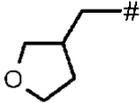
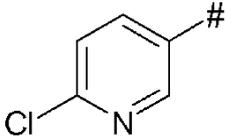
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.481		H	H	F	F	CH ₂ CF ₃
C.482		H	H	F	F	CH ₂ CF ₃
C.483		H	H	F	F	CH ₂ CF ₃
C.484		H	CH ₃	F	F	CH ₂ CF ₃
C.485		H	CH ₃	F	F	CH ₂ CF ₃
C.486		H	CH ₃	F	F	CH ₂ CF ₃
C.487		H	CH ₃	F	F	CH ₂ CF ₃
C.488		H	CH ₃	F	F	CH ₂ CF ₃

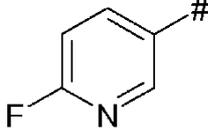
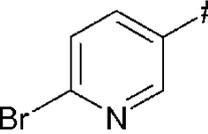
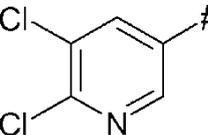
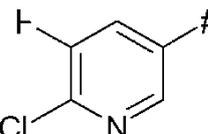
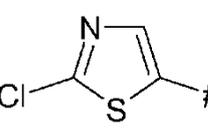
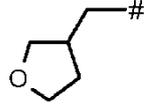
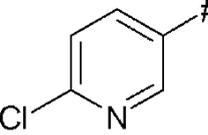
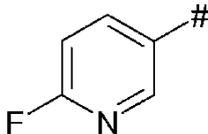
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.489		H	CH ₃	F	F	CH ₂ CF ₃
C.490		H	CH ₃	F	F	CH ₂ CF ₃
C.491		H	H	H	CH ₃	CH ₂ CF ₃
C.492		H	H	H	CH ₃	CH ₂ CF ₃
C.493		H	H	H	CH ₃	CH ₂ CF ₃
C.494		H	H	H	CH ₃	CH ₂ CF ₃
C.495		H	H	H	CH ₃	CH ₂ CF ₃
C.496		H	H	H	CH ₃	CH ₂ CF ₃
C.497		H	H	H	CH ₃	CH ₂ CF ₃

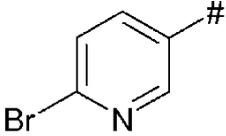
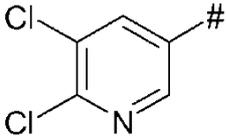
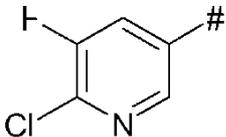
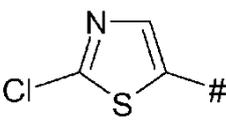
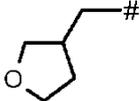
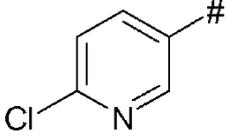
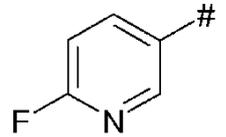
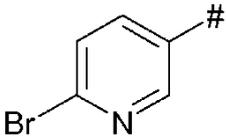
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.498		H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CF ₃
C.499		H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CF ₃
C.500		H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CF ₃
C.501		H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CF ₃
C.502		H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CF ₃
C.503		H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CF ₃
C.504		H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CF ₃
C.505		H	H	H	H	CH ₂ CCl ₃

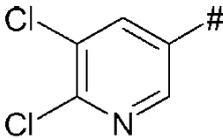
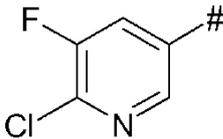
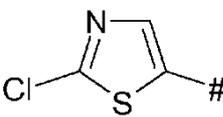
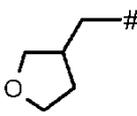
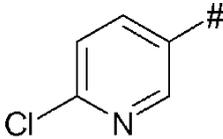
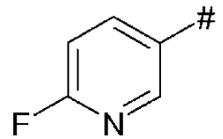
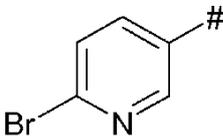
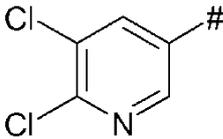
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.506		H	H	H	H	CH ₂ CCl ₃
C.507		H	H	H	H	CH ₂ CCl ₃
C.508		H	H	H	H	CH ₂ CCl ₃
C.509		H	H	H	H	CH ₂ CCl ₃
C.510		H	H	H	H	CH ₂ CCl ₃
C.511		H	H	H	H	CH ₂ CCl ₃
C.512		H	CH ₃	H	H	CH ₂ CCl ₃
C.513		H	CH ₃	H	H	CH ₂ CCl ₃

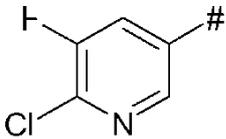
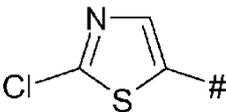
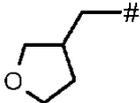
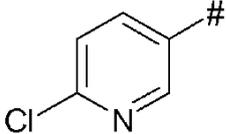
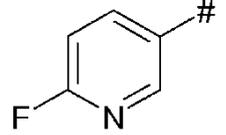
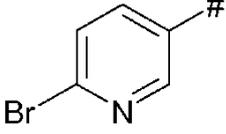
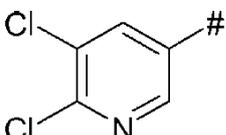
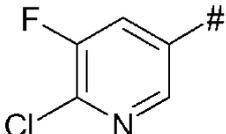
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.514		H	CH ₃	H	H	CH ₂ CCl ₃
C.515		H	CH ₃	H	H	CH ₂ CCl ₃
C.516		H	CH ₃	H	H	CH ₂ CCl ₃
C.517		H	CH ₃	H	H	CH ₂ CCl ₃
C.518		H	CH ₃	H	H	CH ₂ CCl ₃
C.519		H	H	H	F	CH ₂ CCl ₃
C.520		H	H	H	F	CH ₂ CCl ₃
C.521		H	H	H	F	CH ₂ CCl ₃

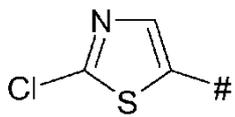
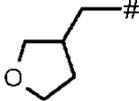
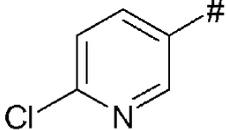
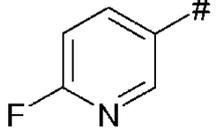
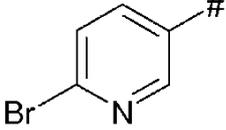
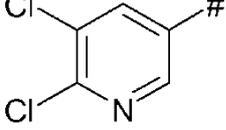
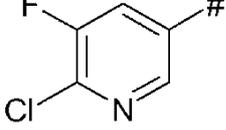
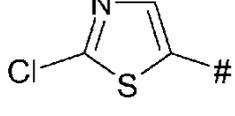
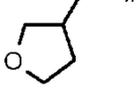
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.522		H	H	H	F	CH ₂ CCl ₃
C.523		H	H	H	F	CH ₂ CCl ₃
C.524		H	H	H	F	CH ₂ CCl ₃
C.525		H	H	H	F	CH ₂ CCl ₃
C.526		H	CH ₃	H	F	CH ₂ CCl ₃
C.527		H	CH ₃	H	F	CH ₂ CCl ₃
C.528		H	CH ₃	H	F	CH ₂ CCl ₃
C.529		H	CH ₃	H	F	CH ₂ CCl ₃

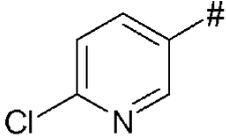
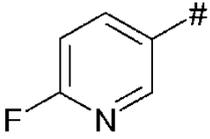
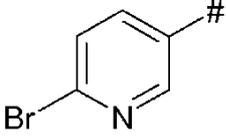
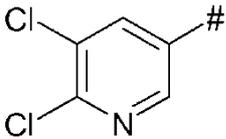
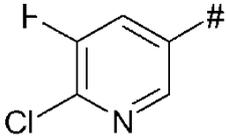
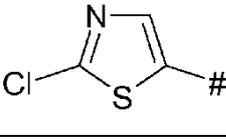
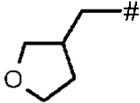
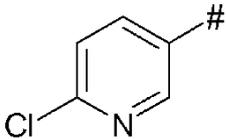
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.530		H	CH ₃	H	F	CH ₂ CCl ₃
C.531		H	CH ₃	H	F	CH ₂ CCl ₃
C.532		H	CH ₃	H	F	CH ₂ CCl ₃
C.533		H	H	F	F	CH ₂ CCl ₃
C.534		H	H	F	F	CH ₂ CCl ₃
C.535		H	H	F	F	CH ₂ CCl ₃
C.536		H	H	F	F	CH ₂ CCl ₃
C.537		H	H	F	F	CH ₂ CCl ₃

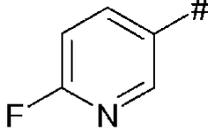
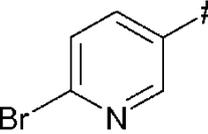
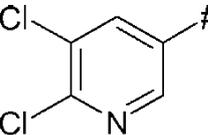
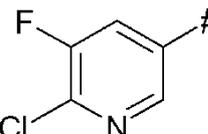
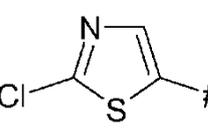
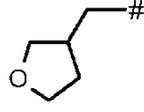
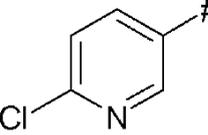
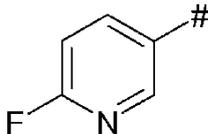
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.538		H	H	F	F	CH ₂ CCl ₃
C.539		H	H	F	F	CH ₂ CCl ₃
C.540		H	CH ₃	F	F	CH ₂ CCl ₃
C.541		H	CH ₃	F	F	CH ₂ CCl ₃
C.542		H	CH ₃	F	F	CH ₂ CCl ₃
C.543		H	CH ₃	F	F	CH ₂ CCl ₃
C.544		H	CH ₃	F	F	CH ₂ CCl ₃
C.545		H	CH ₃	F	F	CH ₂ CCl ₃
C.546		H	CH ₃	F	F	CH ₂ CCl ₃

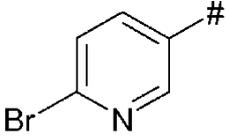
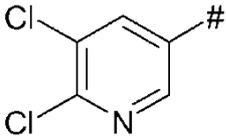
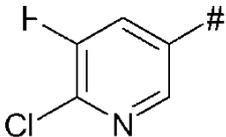
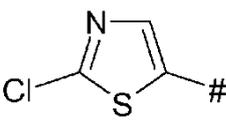
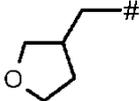
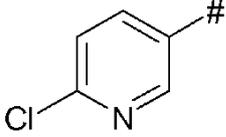
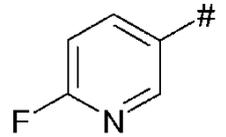
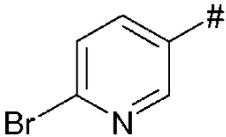
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.547		H	H	H	CH ₃	CH ₂ CCl ₃
C.548		H	H	H	CH ₃	CH ₂ CCl ₃
C.549		H	H	H	CH ₃	CH ₂ CCl ₃
C.550		H	H	H	CH ₃	CH ₂ CCl ₃
C.551		H	H	H	CH ₃	CH ₂ CCl ₃
C.552		H	H	H	CH ₃	CH ₂ CCl ₃
C.553		H	H	H	CH ₃	CH ₂ CCl ₃
C.554		H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CCl ₃

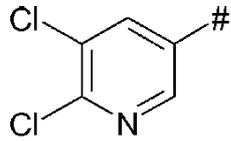
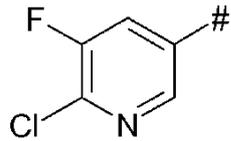
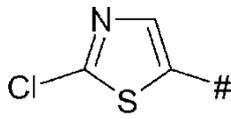
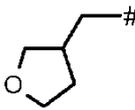
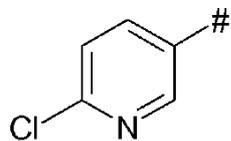
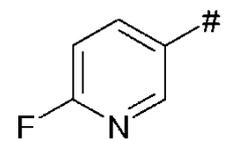
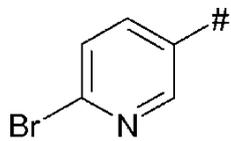
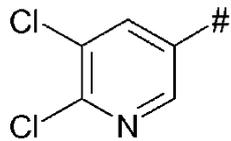
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.555		H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CCl ₃
C.556		H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CCl ₃
C.557		H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CCl ₃
C.558		H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CCl ₃
C.559		H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CCl ₃
C.560		H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ CCl ₃
C.561		H	H	H	H	n-C ₃ H ₇
C.562		H	H	H	H	n-C ₃ H ₇

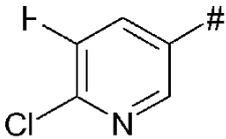
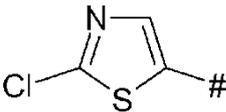
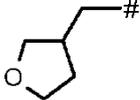
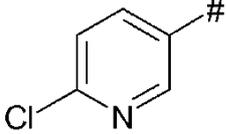
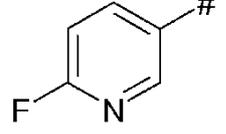
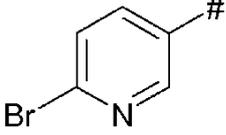
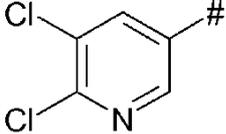
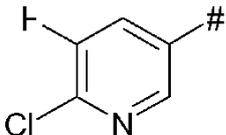
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.563		H	H	H	H	n-C ₃ H ₇
C.564		H	H	H	H	n-C ₃ H ₇
C.565		H	H	H	H	n-C ₃ H ₇
C.566		H	H	H	H	n-C ₃ H ₇
C.567		H	H	H	H	n-C ₃ H ₇
C.568		H	CH ₃	H	H	n-C ₃ H ₇
C.569		H	CH ₃	H	H	n-C ₃ H ₇
C.570		H	CH ₃	H	H	n-C ₃ H ₇

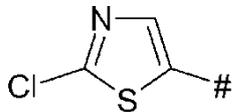
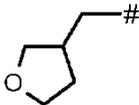
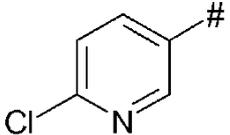
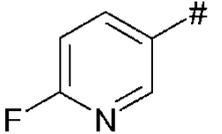
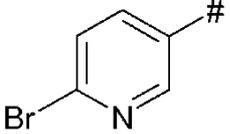
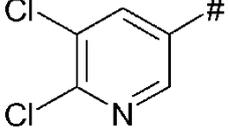
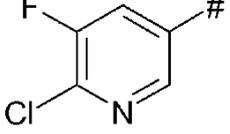
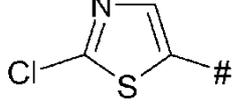
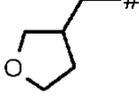
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.571		H	CH ₃	H	H	n-C ₃ H ₇
C.572		H	CH ₃	H	H	n-C ₃ H ₇
C.573		H	CH ₃	H	H	n-C ₃ H ₇
C.574		H	CH ₃	H	H	n-C ₃ H ₇
C.575		H	H	H	F	n-C ₃ H ₇
C.576		H	H	H	F	n-C ₃ H ₇
C.577		H	H	H	F	n-C ₃ H ₇
C.578		H	H	H	F	n-C ₃ H ₇

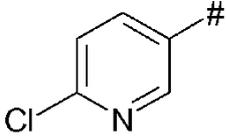
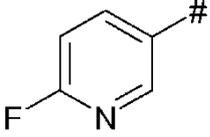
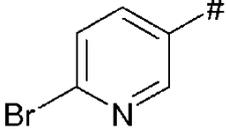
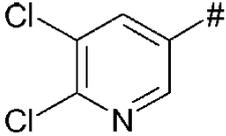
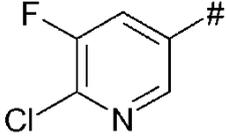
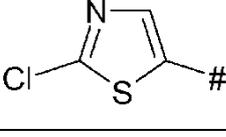
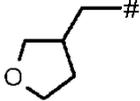
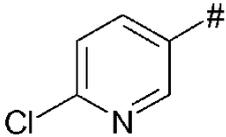
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.579		H	H	H	F	n-C ₃ H ₇
C.580		H	H	H	F	n-C ₃ H ₇
C.581		H	H	H	F	n-C ₃ H ₇
C.582		H	CH ₃	H	F	n-C ₃ H ₇
C.583		H	CH ₃	H	F	n-C ₃ H ₇
C.584		H	CH ₃	H	F	n-C ₃ H ₇
C.585		H	CH ₃	H	F	n-C ₃ H ₇
C.586		H	CH ₃	H	F	n-C ₃ H ₇

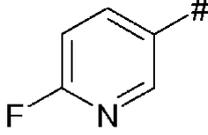
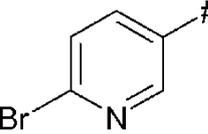
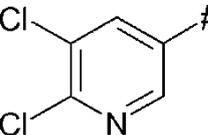
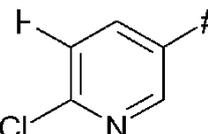
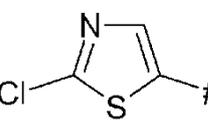
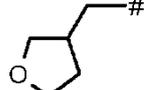
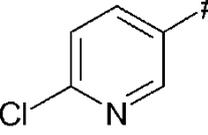
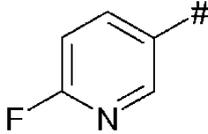
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.587		H	CH ₃	H	F	n-C ₃ H ₇
C.588		H	CH ₃	H	F	n-C ₃ H ₇
C.589		H	H	F	F	n-C ₃ H ₇
C.590		H	H	F	F	n-C ₃ H ₇
C.591		H	H	F	F	n-C ₃ H ₇
C.592		H	H	F	F	n-C ₃ H ₇
C.593		H	H	F	F	n-C ₃ H ₇
C.594		H	H	F	F	n-C ₃ H ₇
C.595		H	H	F	F	n-C ₃ H ₇

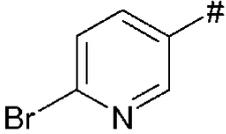
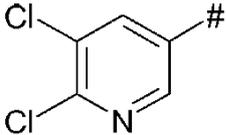
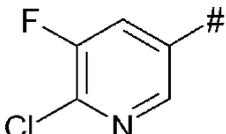
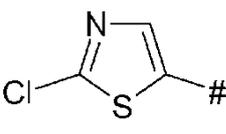
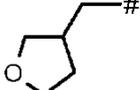
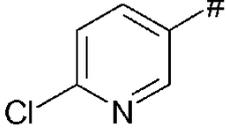
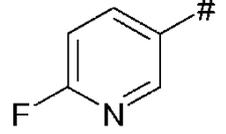
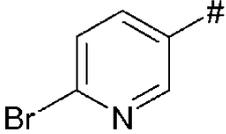
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.596		H	CH ₃	F	F	n-C ₃ H ₇
C.597		H	CH ₃	F	F	n-C ₃ H ₇
C.598		H	CH ₃	F	F	n-C ₃ H ₇
C.599		H	CH ₃	F	F	n-C ₃ H ₇
C.600		H	CH ₃	F	F	n-C ₃ H ₇
C.601		H	CH ₃	F	F	n-C ₃ H ₇
C.602		H	CH ₃	F	F	n-C ₃ H ₇
C.603		H	H	H	CH ₃	n-C ₃ H ₇

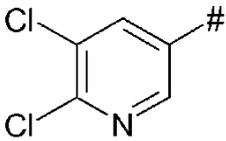
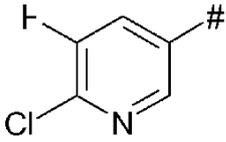
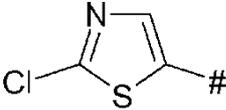
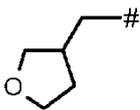
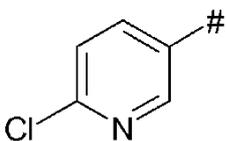
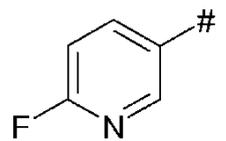
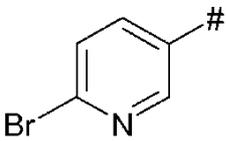
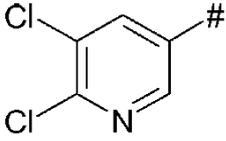
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.604		H	H	H	CH ₃	n-C ₃ H ₇
C.605		H	H	H	CH ₃	n-C ₃ H ₇
C.606		H	H	H	CH ₃	n-C ₃ H ₇
C.607		H	H	H	CH ₃	n-C ₃ H ₇
C.608		H	H	H	CH ₃	n-C ₃ H ₇
C.609		H	H	H	CH ₃	n-C ₃ H ₇
C.610		H	CH ₃	H	CH ₃	n-C ₃ H ₇
C.611		H	CH ₃	H	CH ₃	n-C ₃ H ₇

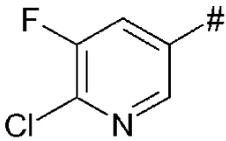
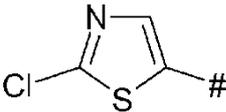
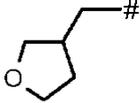
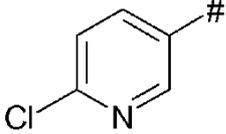
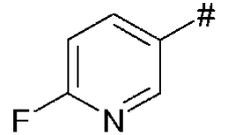
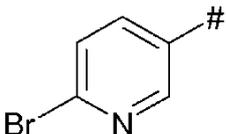
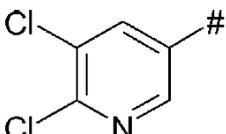
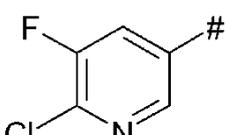
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.612		H	CH ₃	H	CH ₃	n-C ₃ H ₇
C.613		H	CH ₃	H	CH ₃	n-C ₃ H ₇
C.614		H	CH ₃	H	CH ₃	n-C ₃ H ₇
C.615		H	CH ₃	H	CH ₃	n-C ₃ H ₇
C.616		H	CH ₃	H	CH ₃	n-C ₃ H ₇
C.617		H	H	H	H	n-C ₃ F ₇
C.618		H	H	H	H	n-C ₃ F ₇
C.619		H	H	H	H	n-C ₃ F ₇

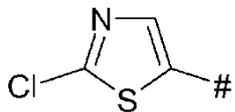
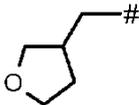
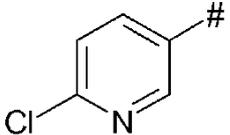
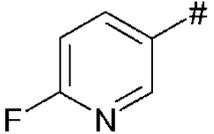
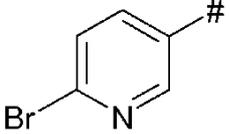
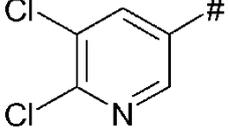
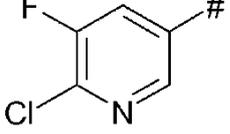
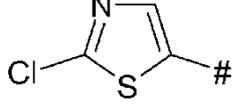
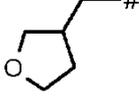
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.620		H	H	H	H	n-C ₃ F ₇
C.621		H	H	H	H	n-C ₃ F ₇
C.622		H	H	H	H	n-C ₃ F ₇
C.623		H	H	H	H	n-C ₃ F ₇
C.624		H	CH ₃	H	H	n-C ₃ F ₇
C.625		H	CH ₃	H	H	n-C ₃ F ₇
C.626		H	CH ₃	H	H	n-C ₃ F ₇
C.627		H	CH ₃	H	H	n-C ₃ F ₇

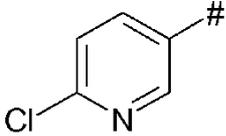
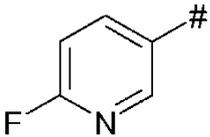
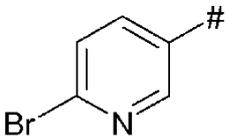
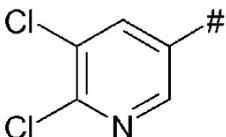
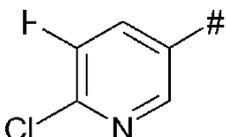
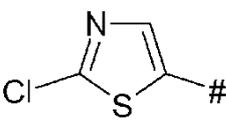
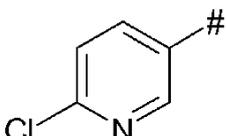
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.628		H	CH ₃	H	H	n-C ₃ F ₇
C.629		H	CH ₃	H	H	n-C ₃ F ₇
C.630		H	CH ₃	H	H	n-C ₃ F ₇
C.631		H	H	H	F	n-C ₃ F ₇
C.632		H	H	H	F	n-C ₃ F ₇
C.633		H	H	H	F	n-C ₃ F ₇
C.634		H	H	H	F	n-C ₃ F ₇
C.635		H	H	H	F	n-C ₃ F ₇

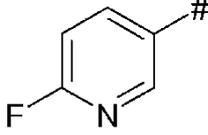
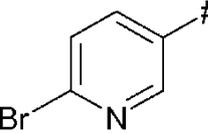
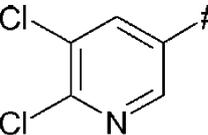
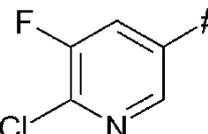
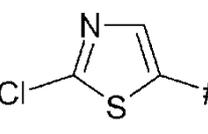
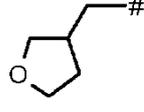
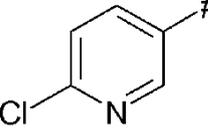
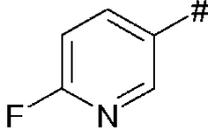
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.636		H	H	H	F	n-C ₃ F ₇
C.637		H	H	H	F	n-C ₃ F ₇
C.638		H	CH ₃	H	F	n-C ₃ F ₇
C.639		H	CH ₃	H	F	n-C ₃ F ₇
C.640		H	CH ₃	H	F	n-C ₃ F ₇
C.641		H	CH ₃	H	F	n-C ₃ F ₇
C.642		H	CH ₃	H	F	n-C ₃ F ₇
C.643		H	CH ₃	H	F	n-C ₃ F ₇
C.644		H	CH ₃	H	F	n-C ₃ F ₇

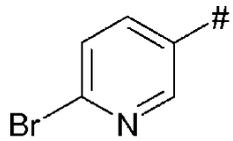
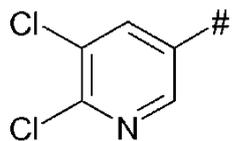
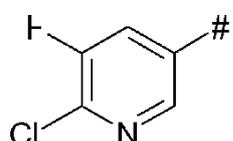
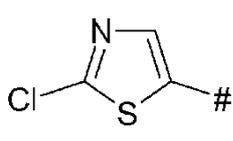
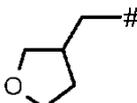
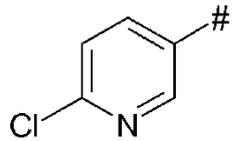
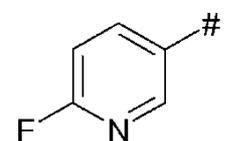
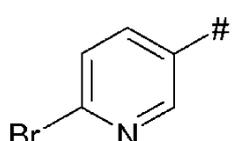
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.645		H	H	F	F	n-C ₃ F ₇
C.646		H	H	F	F	n-C ₃ F ₇
C.647		H	H	F	F	n-C ₃ F ₇
C.648		H	H	F	F	n-C ₃ F ₇
C.649		H	H	F	F	n-C ₃ F ₇
C.650		H	H	F	F	n-C ₃ F ₇
C.651		H	H	F	F	n-C ₃ F ₇
C.652		H	CH ₃	F	F	n-C ₃ F ₇

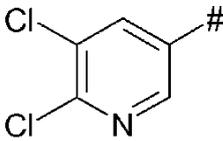
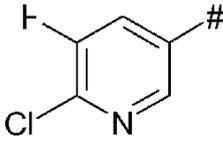
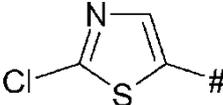
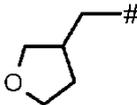
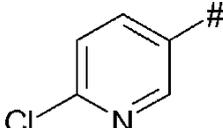
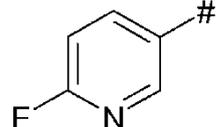
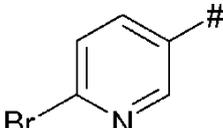
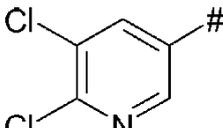
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.653		H	CH ₃	F	F	n-C ₃ F ₇
C.654		H	CH ₃	F	F	n-C ₃ F ₇
C.655		H	CH ₃	F	F	n-C ₃ F ₇
C.656		H	CH ₃	F	F	n-C ₃ F ₇
C.657		H	CH ₃	F	F	n-C ₃ F ₇
C.658		H	CH ₃	F	F	n-C ₃ F ₇
C.659		H	H	H	CH ₃	n-C ₃ F ₇
C.660		H	H	H	CH ₃	n-C ₃ F ₇

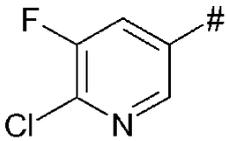
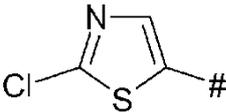
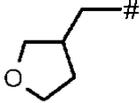
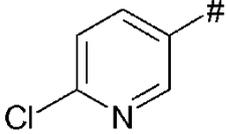
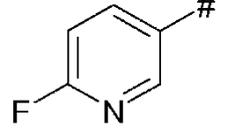
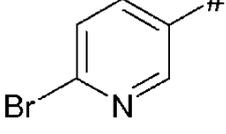
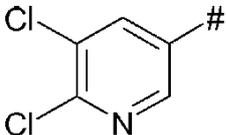
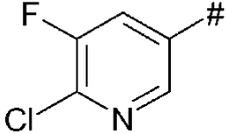
ES 2 630 373 T3

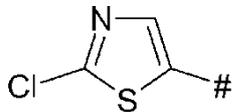
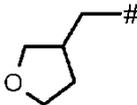
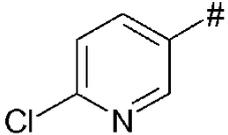
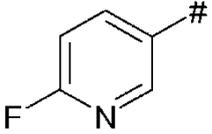
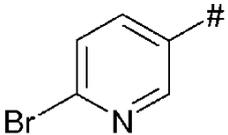
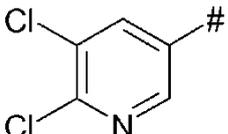
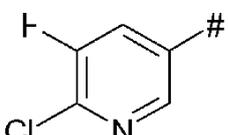
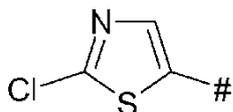
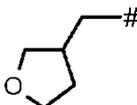
Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.661		H	H	H	CH ₃	n-C ₃ F ₇
C.662		H	H	H	CH ₃	n-C ₃ F ₇
C.663		H	H	H	CH ₃	n-C ₃ F ₇
C.664		H	H	H	CH ₃	n-C ₃ F ₇
C.665		H	H	H	CH ₃	n-C ₃ F ₇
C.666		H	CH ₃	H	CH ₃	n-C ₃ F ₇
C.667		H	CH ₃	H	CH ₃	n-C ₃ F ₇
C.668		H	CH ₃	H	CH ₃	n-C ₃ F ₇

ES 2 630 373 T3

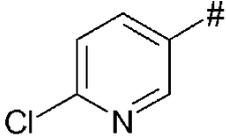
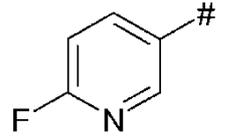
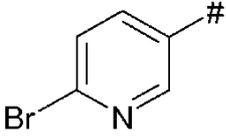
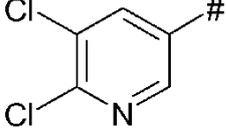
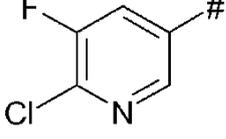
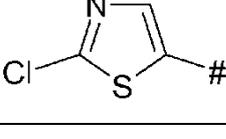
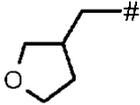
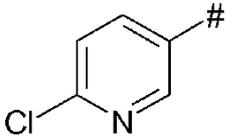
Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.669		H	CH ₃	H	CH ₃	n-C ₃ F ₇
C.670		H	CH ₃	H	CH ₃	n-C ₃ F ₇
C.671		H	CH ₃	H	CH ₃	n-C ₃ F ₇
C.672		H	CH ₃	H	CH ₃	n-C ₃ F ₇
C.673		H	H	H	H	i-C ₃ H ₇
C.674		H	H	H	H	i-C ₃ H ₇
C.675		H	H	H	H	i-C ₃ H ₇
C.676		H	H	H	H	i-C ₃ H ₇

ES 2 630 373 T3

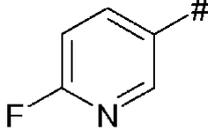
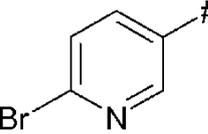
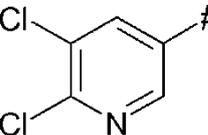
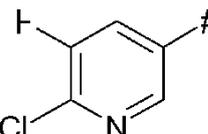
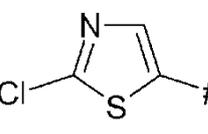
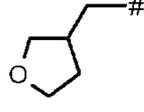
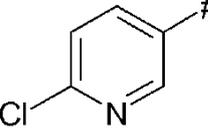
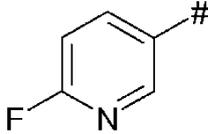
Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.677		H	H	H	H	i-C ₃ H ₇
C.678		H	H	H	H	i-C ₃ H ₇
C.679		H	H	H	H	i-C ₃ H ₇
C.680		H	CH ₃	H	H	i-C ₃ H ₇
C.681		H	CH ₃	H	H	i-C ₃ H ₇
C.682		H	CH ₃	H	H	i-C ₃ H ₇
C.683		H	CH ₃	H	H	i-C ₃ H ₇
C.684		H	CH ₃	H	H	i-C ₃ H ₇

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.685		H	CH ₃	H	H	i-C ₃ H ₇
C.686		H	CH ₃	H	H	i-C ₃ H ₇
C.687		H	H	H	F	i-C ₃ H ₇
C.688		H	H	H	F	i-C ₃ H ₇
C.689		H	H	H	F	i-C ₃ H ₇
C.690		H	H	H	F	i-C ₃ H ₇
C.691		H	H	H	F	i-C ₃ H ₇
C.692		H	H	H	F	i-C ₃ H ₇
C.693		H	H	H	F	i-C ₃ H ₇

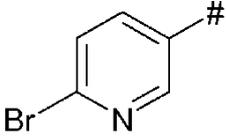
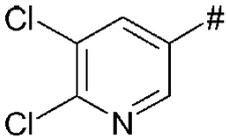
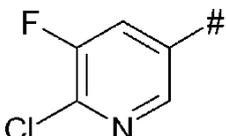
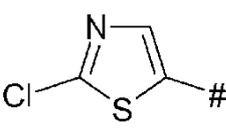
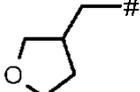
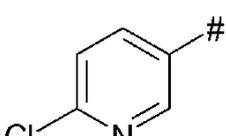
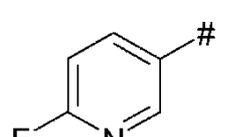
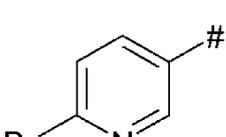
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.694		H	CH ₃	H	F	i-C ₃ H ₇
C.695		H	CH ₃	H	F	i-C ₃ H ₇
C.696		H	CH ₃	H	F	i-C ₃ H ₇
C.697		H	CH ₃	H	F	i-C ₃ H ₇
C.698		H	CH ₃	H	F	i-C ₃ H ₇
C.699		H	CH ₃	H	F	i-C ₃ H ₇
C.700		H	CH ₃	H	F	i-C ₃ H ₇
C.701		H	H	F	F	i-C ₃ H ₇

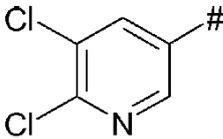
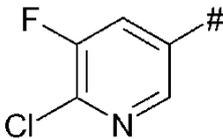
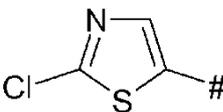
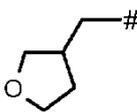
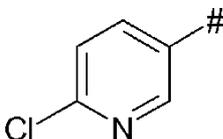
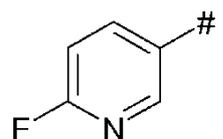
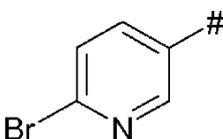
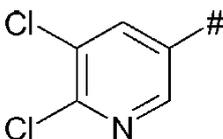
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.702		H	H	F	F	i-C ₃ H ₇
C.703		H	H	F	F	i-C ₃ H ₇
C.704		H	H	F	F	i-C ₃ H ₇
C.705		H	H	F	F	i-C ₃ H ₇
C.706		H	H	F	F	i-C ₃ H ₇
C.707		H	H	F	F	i-C ₃ H ₇
C.708		H	CH ₃	F	F	i-C ₃ H ₇
C.709		H	CH ₃	F	F	i-C ₃ H ₇

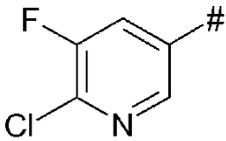
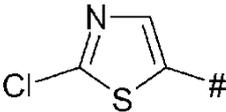
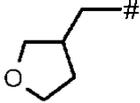
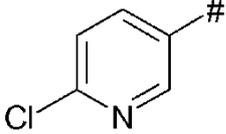
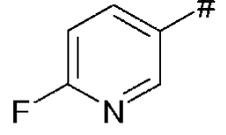
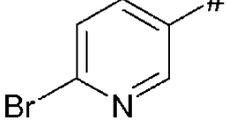
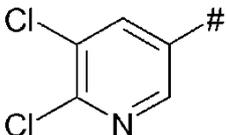
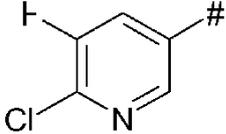
ES 2 630 373 T3

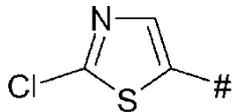
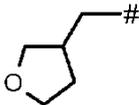
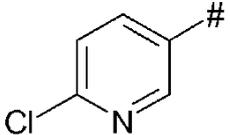
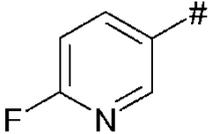
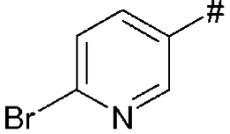
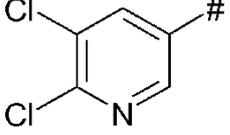
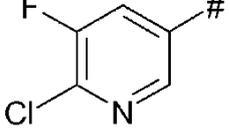
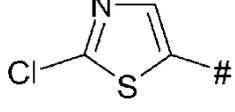
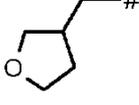
Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.710		H	CH ₃	F	F	i-C ₃ H ₇
C.711		H	CH ₃	F	F	i-C ₃ H ₇
C.712		H	CH ₃	F	F	i-C ₃ H ₇
C.713		H	CH ₃	F	F	i-C ₃ H ₇
C.714		H	CH ₃	F	F	i-C ₃ H ₇
C.715		H	H	H	CH ₃	i-C ₃ H ₇
C.716		H	H	H	CH ₃	i-C ₃ H ₇
C.717		H	H	H	CH ₃	i-C ₃ H ₇

ES 2 630 373 T3

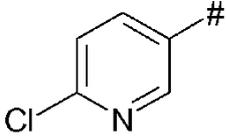
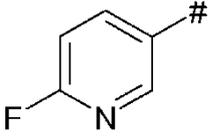
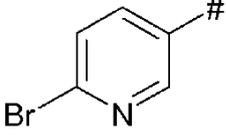
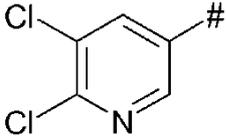
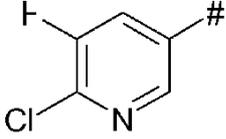
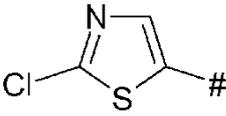
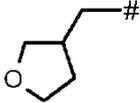
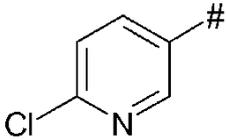
Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.718		H	H	H	CH ₃	i-C ₃ H ₇
C.719		H	H	H	CH ₃	i-C ₃ H ₇
C.720		H	H	H	CH ₃	i-C ₃ H ₇
C.721		H	H	H	CH ₃	i-C ₃ H ₇
C.722		H	CH ₃	H	CH ₃	i-C ₃ H ₇
C.723		H	CH ₃	H	CH ₃	i-C ₃ H ₇
C.724		H	CH ₃	H	CH ₃	i-C ₃ H ₇
C.725		H	CH ₃	H	CH ₃	i-C ₃ H ₇

ES 2 630 373 T3

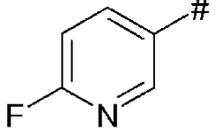
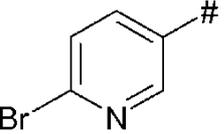
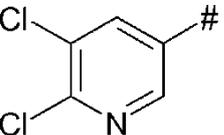
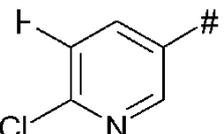
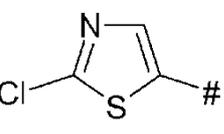
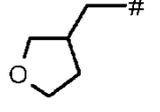
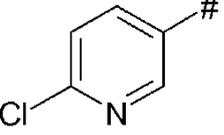
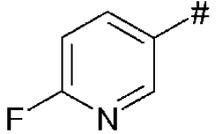
Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.726		H	CH ₃	H	CH ₃	i-C ₃ H ₇
C.727		H	CH ₃	H	CH ₃	i-C ₃ H ₇
C.728		H	CH ₃	H	CH ₃	i-C ₃ H ₇
C.729		H	H	H	H	i-C ₃ F ₇
C.730		H	H	H	H	i-C ₃ F ₇
C.731		H	H	H	H	i-C ₃ F ₇
C.732		H	H	H	H	i-C ₃ F ₇
C.733		H	H	H	H	i-C ₃ F ₇

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.734		H	H	H	H	i-C ₃ F ₇
C.735		H	H	H	H	i-C ₃ F ₇
C.736		H	CH ₃	H	H	i-C ₃ F ₇
C.737		H	CH ₃	H	H	i-C ₃ F ₇
C.738		H	CH ₃	H	H	i-C ₃ F ₇
C.739		H	CH ₃	H	H	i-C ₃ F ₇
C.740		H	CH ₃	H	H	i-C ₃ F ₇
C.741		H	CH ₃	H	H	i-C ₃ F ₇
C.742		H	CH ₃	H	H	i-C ₃ F ₇

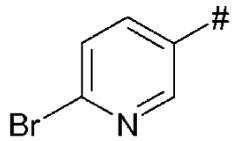
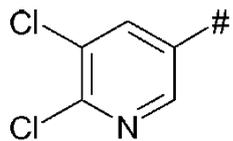
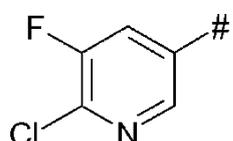
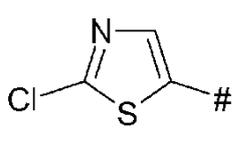
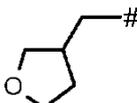
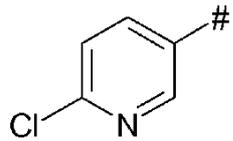
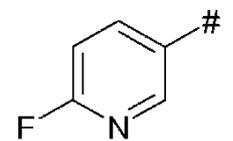
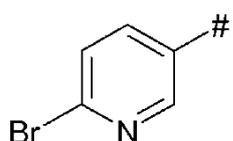
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.743		H	H	H	F	i-C ₃ F ₇
C.744		H	H	H	F	i-C ₃ F ₇
C.745		H	H	H	F	i-C ₃ F ₇
C.746		H	H	H	F	i-C ₃ F ₇
C.747		H	H	H	F	i-C ₃ F ₇
C.748		H	H	H	F	i-C ₃ F ₇
C.749		H	H	H	F	i-C ₃ F ₇
C.750		H	CH ₃	H	F	i-C ₃ F ₇

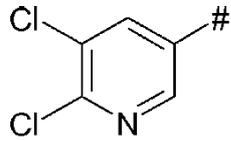
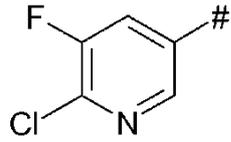
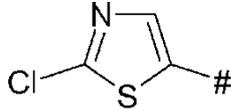
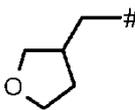
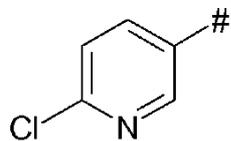
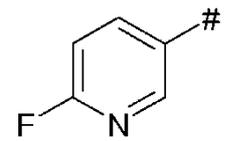
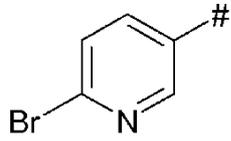
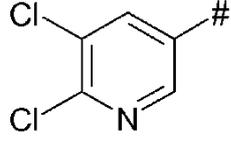
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.751		H	CH ₃	H	F	i-C ₃ F ₇
C.752		H	CH ₃	H	F	i-C ₃ F ₇
C.753		H	CH ₃	H	F	i-C ₃ F ₇
C.754		H	CH ₃	H	F	i-C ₃ F ₇
C.755		H	CH ₃	H	F	i-C ₃ F ₇
C.756		H	CH ₃	H	F	i-C ₃ F ₇
C.757		H	H	F	F	i-C ₃ F ₇
C.758		H	H	F	F	i-C ₃ F ₇

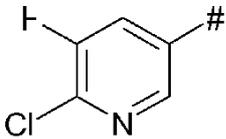
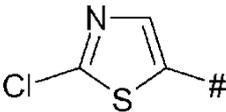
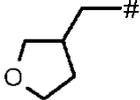
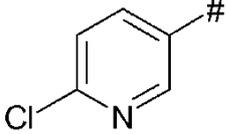
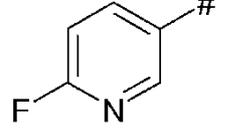
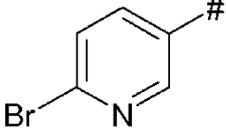
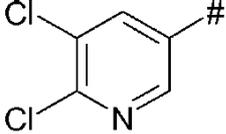
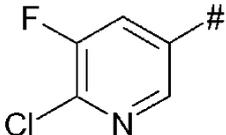
ES 2 630 373 T3

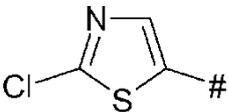
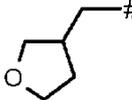
Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.759		H	H	F	F	i-C ₃ F ₇
C.760		H	H	F	F	i-C ₃ F ₇
C.761		H	H	F	F	i-C ₃ F ₇
C.762		H	H	F	F	i-C ₃ F ₇
C.763		H	H	F	F	i-C ₃ F ₇
C.764		H	CH ₃	F	F	i-C ₃ F ₇
C.765		H	CH ₃	F	F	i-C ₃ F ₇
C.766		H	CH ₃	F	F	i-C ₃ F ₇

ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.767		H	CH ₃	F	F	i-C ₃ F ₇
C.768		H	CH ₃	F	F	i-C ₃ F ₇
C.769		H	CH ₃	F	F	i-C ₃ F ₇
C.770		H	CH ₃	F	F	i-C ₃ F ₇
C.771		H	H	H	CH ₃	i-C ₃ F ₇
C.772		H	H	H	CH ₃	i-C ₃ F ₇
C.773		H	H	H	CH ₃	i-C ₃ F ₇
C.774		H	H	H	CH ₃	i-C ₃ F ₇

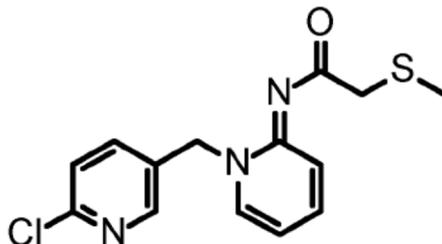
ES 2 630 373 T3

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.775		H	H	H	CH ₃	i-C ₃ F ₇
C.776		H	H	H	CH ₃	i-C ₃ F ₇
C.777		H	H	H	CH ₃	i-C ₃ F ₇
C.778		H	CH ₃	H	CH ₃	i-C ₃ F ₇
C.779		H	CH ₃	H	CH ₃	i-C ₃ F ₇
C.780		H	CH ₃	H	CH ₃	i-C ₃ F ₇
C.781		H	CH ₃	H	CH ₃	i-C ₃ F ₇
C.782		H	CH ₃	H	CH ₃	i-C ₃ F ₇

Compuesto No.	Het(*)	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵
C.783		H	CH ₃	H	CH ₃	i-C ₃ F ₇
C.784		H	CH ₃	H	CH ₃	i-C ₃ F ₇

*en donde # denota el enlace al resto de la molécula.

Por ejemplo, el siguiente compuesto especialmente preferido N-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-2-metilsulfanil-acetamida:



5 se representa en la tabla C por el compuesto C.1 de fórmula I-M.0.

Además, los significados mencionados para estas variables individuales en las tablas y más arriba son per se, independientemente de la combinación en donde se mencionan, una realización particularmente preferida de los sustituyentes en cuestión.

Métodos de preparación

10 El compuesto de fórmula (I) de acuerdo con la presente invención puede prepararse por ejemplo de acuerdo con los métodos de preparación y los esquemas de preparación como se describe a continuación.

15 Los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la presente invención se pueden preparar mediante métodos estándar de química orgánica, por ejemplo por los métodos de preparación y los esquemas de preparación como se describe a continuación. Las definiciones de Het, X, Y, R¹, R², R^{3a}, R^{3b}, R^{4a}, R^{4b} y R⁵ de las estructuras moleculares dadas en los esquemas son como se definieron anteriormente. Temperatura ambiente significa un rango de temperatura entre aproximadamente 20 y 25 °C.

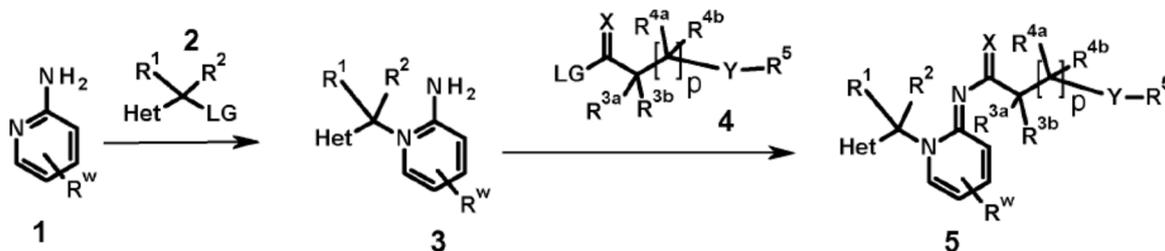
20 En el Esquema A se muestra a continuación un ejemplo de un método general para la preparación de compuestos de fórmula (I). Por lo tanto, la construcción del elemento piridina 3 presente en los compuestos de fórmula (I) se puede conseguir, por ejemplo, mediante alquilación del compuesto apropiado 2-aminopiridilo precursor 1 con el reactivo apropiado de fórmula 2. La transformación se lleva a cabo preferiblemente en solventes polares tales como acetonitrilo, acetona, diclorometano, tetrahidrofurano, N,N-dimetilformamida o un alcohol C₁-C₆ comprendido entre temperatura ambiente y la temperatura de reflujo del solvente. Las condiciones de reacción representativas para la alquilación de precursores de piridina análogas a la fórmula 1 se dan en Tett. Lett. 2011, 52(23), 3033-3037. La síntesis de precursores de fórmula 5 se puede conseguir por acilación del nitrógeno de piridina en compuestos de fórmula 3

25 usando ácidos 4 que se activan in situ. La transformación se lleva a cabo preferiblemente en solventes polares tales como acetonitrilo, acetona, tetrahidrofurano, N,N-dimetilformamida, o en un solvente inerte tal como diclorometano, 1,2-dicloroetano o 1,2-dimetoxietano a temperaturas que oscilan entre la temperatura ambiente y la temperatura de reflujo del solvente. Un procedimiento representativo de condiciones para la acilación de piridinas 2-sustituidas se dan en Journal of Medicinal Chemistry, 1988, 31, 4, 807-814. Ejemplos de grupos salientes adecuados (LG) en las fórmulas 2 y 4 incluyen, pero no se limitan a halógeno, alquilsulfonato o haloalquil sulfonato, alquilsulfonato y diversos ésteres

30 activados derivados de la reacción del ácido carbónico libre con un reactivo de acoplamiento peptídico en presencia de una base de amina. Una inversión del orden de estos dos pasos también daría como resultado una síntesis aceptable de los compuestos deseados. En los casos en que Y es S, el átomo de azufre puede ser oxidado al sulfóxido

o la sulfona siguiendo las condiciones de reacción estándar usando mCPBA, H₂O₂ y NaIO₄ como el oxidor terminal. Un procedimiento representativo para la oxidación se puede encontrar en Tetrahedron Letters, 1982, 23, 22, 2269 - 2272 o Journal of Heterocyclic Chemistry, 1978, 15, 1361-1366.

Esquema A:



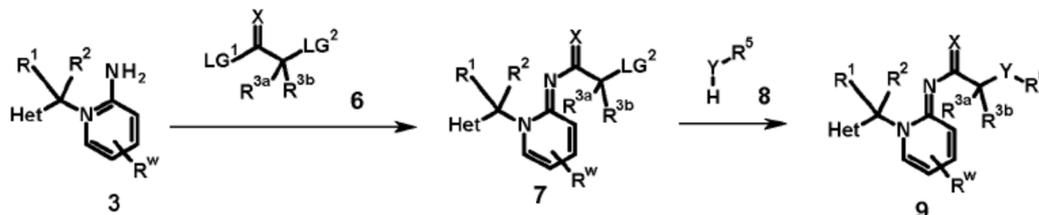
5

Un ejemplo de un método general para la preparación de compuestos de fórmula (I) de la subclase 9 se presenta en el Esquema B. Los compuestos de tipo estructural 9 representan una subestructura de compuestos de fórmula (I) con $p=0$. Una solución del compuesto 3 que se prepara como se ha descrito anteriormente en el Esquema A puede acilarse con el reactivo 6 usando las condiciones descritas para la síntesis de 5 para proporcionar un compuesto de la clase 7. Las opciones para LG² incluyen pero no se limitan a: cloruro, bromuro, yoduro, alquilsulfonato y arilsulfonato. En una reacción subsecuente, un nucleófilo 8 desplazará a LG² para generar el compuesto 9 deseado. La reacción se realiza idealmente en un solvente polar tal como acetonitrilo, acetona, dimetilsulfóxido, N,N-dimetilformamida, N,N-metilacetamida, N-metilpirrolidinona, o dimetoxietano a una temperatura comprendida entre la temperatura ambiente y la temperatura de reflujo del solvente, en presencia de una base tal como hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio, carbonato de potasio, carbonato de sodio, carbonato de litio, bicarbonato de sodio, t-butoxido de potasio, t-butoxido de sodio, t-butoxido de litio. Se puede encontrar un procedimiento representativo en Journal of Medicinal Chemistry, 2003, 46, 12, 2361 - 2375.

10

15

Esquema B:



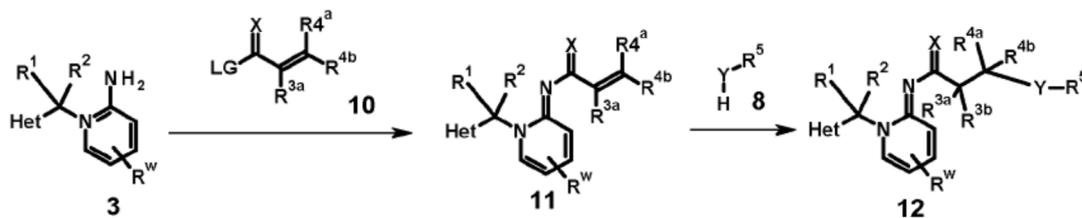
20

Un ejemplo de un método general para la preparación de compuestos de fórmula (I) de la subclase 12 se presenta en el Esquema C. Los compuestos de tipo estructural 12 representan una subestructura de compuestos de fórmula (I) con $p=1$. Una solución del compuesto 3 que se prepara como se ha descrito anteriormente en el Esquema A se puede acilar con el reactivo 10 usando las condiciones descritas para la síntesis de 5 para proporcionar un compuesto de la clase 11. Las opciones para LG en el compuesto 10 incluyen pero no se limitan a: cloruro, bromuro, yoduro, alquilsulfonato y arilsulfonato. En una reacción subsecuente, un nucleófilo 8 se añadirá a la olefina en 11 para generar el compuesto 12 deseado. La reacción se realiza mejor en un solvente inerte o polar: diclorometano, tetrahydrofurano, 1,2-dicloroetano, 1,2-dimetoxietano, 1,4-dioxano, dimetilsulfóxido, N,N-dimetilformamida, N,N-metilacetamida, N-metilpirrolidinona, agua en presencia de una base tal como: trietilamina, diisopropilamina, piridina, piperadina, hidróxido de trimetilbenceno carbonato de potasio, carbonato de sodio, carbonato de litio, o bicarbonato de sodio. La reacción se lleva a cabo a una temperatura entre 0 °C y la temperatura de reflujo del solvente. Un procedimiento representativo puede encontrarse en Journal of the American Chemical Society, 2008, 130, 16295 - 16309

25

30

Esquema C:



Si no se pueden preparar compuestos individuales a través de las rutas anteriormente descritas, se pueden preparar por derivación de otros compuestos (I) o mediante modificaciones habituales de las rutas de síntesis descritas.

- 5 Las mezclas de reacción se manipulan de la manera usual, por ejemplo mezclando con agua, separando las fases y, si es apropiado, purificando los productos crudos por cromatografía, por ejemplo sobre alúmina o sílica gel. Algunos de los productos intermediarios y finales pueden obtenerse en forma de aceites viscosos incoloros o marrones pálidos, que se liberan o se purifican a partir de componentes volátiles bajo presión reducida y a temperatura moderadamente elevada. Si los productos intermediarios y productos finales se obtienen como sólidos, pueden purificarse por recristalización o digestión.

Plagas

- 10 Los compuestos de la fórmula I y sus sales son en particular adecuados para controlar eficientemente plagas artrópodos tales como arácnidos, myriápedes e insectos, así como nematodos.

Los compuestos de la fórmula I son especialmente adecuados para combatir eficazmente las siguientes plagas:

- 15 insectos del orden de los lepidópteros (*Lepidoptera*), por ejemplo *Acronicta major*, *Adox-ophyes orana*, *Aedia leucomelas*, *Agrotis* spp. tales como *Agrotis fucosa*, *Agrotis segetum*, *Agrotis ypsilon*; *Alabama argillacea*, *Anticarsia gemmatalis*, *Anticarsia* spp., *Argyresthia conjugella*, *Autographa gamma*, *Barathra brassicae*, *Bucculatrix thurberella*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia murinana*, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Carpocapsa pomonella*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo* spp. tales como *Chilo suppressalis*; *Choristoneura fumiferana*, *Choristoneura occidentalis*, *Cirphis unipuncta*, *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocerus* spp., *Cydia pomonella*, *Dendrolimus pini*, *Diaphania nitidalis*, *Diatraea grandiosella*, *Earias insulana*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Ephestia cautella*, *Ephestia kuehniella*, *Eupoecilia ambiguella*,
20 *Euproctis chrysorrhoea*, *Euxoa* spp., *Evetria bouliana*, *Feltia* spp. tales como *Feltia subterranean*; *Galleria mellonella*, *Grapholitha funebrana*, *Grapholitha molesta*, *Helicoverpa* spp. tales como *Helicoverpa armigera*, *Helicoverpa zea*; *Heliothis* spp. tales como *Heliothis armigera*, *Heliothis virescens*, *Heliothis zea*; *Hellula undalis*, *Hibernia defoliaria*, *Hofmannophila pseudospretella*, *Homona magnanima*, *Hyphantria cunea*, *Hyponomeuta padella*, *Hyponomeuta malinellus*, *Keiferia lycopersicella*, *Lambdina fiscellaria*, *Laphygma* spp. tales como *Laphygma exigua*; *Leucoptera coffeella*, *Leucoptera scitella*, *Lithocolletis blancardella*, *Lithophane antennata*, *Lobesia botrana*, *Loxagrotis albicosta*, *Loxostege sticticalis*, *Lymantria* spp. tales como *Lymantria dispar*, *Lymantria monacha*; *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*, *Mamestra* spp. tales como *Mamestra brassicae*; *Mocis repanda*, *Mythimna separata*, *Orgyia pseudotsugata*, *Oria* spp., *Ostrinia* spp. tales como *Ostrinia nubilalis*; *Oulema oryzae*, *Panolis flammea*, *Pectinophora* spp. tales como *Pectinophora gossypiella*; *Peridroma saucia*, *Phalera bucephala*, *Phthorimaea* spp. tales como *Phthorimaea operculella*; *Phyllocnistis citrella*, *Pieris* spp. tales como *Pieris brassicae*, *Pieris rapae*; *Plathypena scabra*, *Plutella maculipennis*, *Plutella xylostella*, *Prodenia* spp., *Pseudaletia* spp., *Pseudoplusia includens*, *Pyrausta nubilalis*, *Rhyacionia frustrana*, *Scrobipalpula absoluta*, *Sitotroga cerealella*, *Sparganothis pilleriana*, *Spodoptera* spp. tales como *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera littoralis*, *Spodoptera litura*; *Thaumatopoea pityocampa*, *Thermesia gemmatalis*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia* spp. tales como *Trichoplusia ni*; *Tuta absoluta*, y
35 *Zeiraphera canadensis*,

- escaabajos (*Coleoptera*), por ejemplo *Acanthoscehdes obtectus*, *Adoretus* spp., *Agelastica alni*, *Agrilus sinuatus*, *Agriotes* spp. tales como *Agriotes fuscicollis*, *Agriotes lineatus*, *Agriotes obscurus*; *Amphimallus solstitialis*, *Anisandrus dispar*, *Anobium punctatum*, *Anomala rufocuprea*, *Anoplophora* spp. tales como *Anoplophora glabripennis*; *Anthonomus* spp. tales como *Anthonomus grandis*, *Anthonomus pomorum*; *Anthrenus* spp., *Aphthona euphoridae*,
40 *Apogonia* spp., *Athous haemorrhoidalis*, *Atomaria* spp. tales como *Atomaria linearis*; *Attagenus* spp., *Aulacophora femoralis*, *Blastophagus piniperda*, *Blitophaga undata*, *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp. tales como *Bruchus lentis*, *Bruchus pisorum*, *Bruchus rufimanus*; *Byctiscus betulae*, *Callosobruchus chinensis*, *Cassida nebulosa*, *Cerotoma trifurcata*, *Cetonia aurata*, *Ceuthorrhynchus* spp. tales como *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Ceuthorrhynchus napi*; *Chaetocnema tibialis*, *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp. tales como *Conoderus vespertinus*; *Cosmopolites* spp.,
45 *Costelytra zealandica*, *Crioceris asparagi*, *Cryptorhynchus lapathi*, *Ctenicera* ssp. tales como *Ctenicera destructor*; *Curculio* spp., *Dectes texanus*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp. tales como *Diabrotica 12-punctata* *Diabrotica speciosa*, *Diabrotica longicornis*, *Diabrotica semipunctata*, *Diabrotica virgifera*; *Epilachna* spp. tales como *Epilachna varivestis*, *Epilachna vigintioctomaculata*; *Epitrix* spp. tales como *Epitrix hirtipennis*; *Eutinobothrus brasiliensis*, *Faustinus cubae*, *Gibbium psylloides*, *Heteronychus arator*, *Hylamorpha elegans*, *Hyllobius abietis*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera brunneipennis*, *Hypera postica*, *Hypothenemus* spp., *Ips typographus*, *Lachnosterna consanguinea*, *Lema bilineata*, *Lema melanopus*, *Leptinotarsa* spp. tales como *Leptinotarsa decemlineata*; *Limonius californicus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lixus* spp., *Lyctus* spp. tales como *Lyctus bruneus*; *Melanotus communis*, *Meligethes* spp. tales como *Meligethes aeneus*; *Melolontha hippocastani*, *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp. tales como *Monochamus alternatus*; *Naupactus xanthographus*, *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzae-philus surinamensis*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Otiorrhynchus ovatus*, *Otiorrhynchus sulcatus*,
55 *Oulema oryzae*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllobius pyri*, *Phyllopertha horticola*, *Phyllophaga* spp., *Phyllotreta* spp. tales como *Phyllotreta chrysocephala*, *Phyllotreta nemorum*, *Phyllotreta striolata*; *Phyllophaga* spp., *Phyllopertha horticola*, *Popillia japonica*, *Premnotypes* spp., *Psylliodes chrysocephala*, *Ptinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizopertha dominica*, *Sitona lineatus*, *Sitophilus* spp. tales como *Sitophilus granaria*, *Sitophilus zeamais*;
60 *Sphenophorus* spp. tales como *Sphenophorus levis*; *Sternechus* spp. tales como *Sternechus subsignatus*;

Symphyletes spp., *Tenebrio molitor*, *Tribolium* spp. tales como *Tribolium castaneum*; *Trogoderma* spp., *Tychius* spp., *Xylotrechus* spp., y *Zabrus* spp. tales como *Zabrus tenebrioides*,

- moscas mosquitos (*Diptera*), por ejemplo *Aedes* spp. tales como *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes vexans*; *Anastrepha ludens*, *Anopheles* spp. tales como *Anopheles albimanus*, *Anopheles crucians*, *Anopheles freeborni*, *Anopheles gambiae*, *Anopheles leucosphyrus*, *Anopheles maculipennis*, *Anopheles minimus*, *Anopheles quadrimaculatus*, *Anopheles sinensis*; *Bibio hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*, *Calliphora vicina*, *Ceratitis capitata*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomya* spp. tales como *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*; *Chrysops atlanticus*, *Chrysops discalis*, *Chrysops silacea*, *Cochliomyia* spp. tales como *Cochliomyia hominivorax*; *Contarinia* spp. tales como *Contarinia sorghicola*; *Cordylobia anthropophaga*, *Culex* spp. tales como *Culex nigripalpus*, *Culex pipiens*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex tarsalis*, *Culex tri-taeniorhynchus*; *Culicoides furens*, *Culiseta inornata*, *Culiseta mela nura*, *Cuterebra* spp., *Dacus cucurbitae*, *Dacus oleae*, *Dasineura brassicae*, *Delia* spp. tales como *Delia antiqua*, *Delia coarctata*, *Delia platura*, *Delia radicum*; *Dermatobia hominis*, *Drosophila* spp., *Fannia* spp. tales como *Fannia canicularis*; *Gastrophilus* spp. tales como *Gastrophilus intestinalis*; *Geomyza tripunctata*, *Glossina fuscipes*, *Glossina morsitans*, *Glossina palpalis*, *Glossina tachinoides*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hippelates* spp., *Hylemyia* spp. tales como *Hylemyia platura*; *Hypoderma* spp. tales como *Hypoderma lineata*; *Hyppobosca* spp., *Leptoconops torrens*, *Liriomyza* spp. tales como *Liriomyza sativae*, *Liriomyza trifolii*, *Lucilia* spp. tales como *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*; *Lycoria pectoralis*, *Mansonina titillanus*, *Mayetiola* spp. tales como *Mayetiola destructor*; *Musca* spp. tales como *Musca autumnalis*, *Musca domestica*; *Muscina stabulans*, *Oestrus* spp. tales como *Oestrus ovis*; *Opomyza florum*, *Oscinella* spp. tales como *Oscinella frit*; *Pegomya hysocymii*, *Phlebotomus argentipes*, *Phorbia* spp. tales como *Phorbia antiqua*, *Phorbia brassicae*, *Phorbia coarctata*; *Prosimulium mixtum*, *Psila rosae*, *Psorophora columbiae*, *Psorophora discolor*, *Rhagoletis cerasi*, *Rhagoletis pomonella*, *Sarcophaga* spp. tales como *Sarcophaga haemorrhoidalis*; *Simulium vittatum*, *Stomoxys* spp. tales como *Stomoxys calcitrans*; *Tabanus* spp. tales como *Tabanus atratus*, *Tabanus bovinus*, *Tabanus lineola*, *Tabanus similis*; *Tannia* spp., *Tipula oleracea*, *Tipula paludosa*, y *Wohlfahrtia* spp.,
- tripsos (*Thysanoptera*), por ejemplo *Baliothrips biformis*, *Dichromothrips corbetti*, *Dichromothrips ssp.*, *Enneothrips flavens*, *Frankliniella* spp. tales como *Frankliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella tritici*; *Heliothrips* spp., *Hercinothrips femoralis*, *Kakothrips* spp., *Rhipiphorotherips cruentatus*, *Scirtothrips* spp. tales como *Scirtothrips citri*; *Taeniothrips cardamoni*, *Thrips* spp. tales como *Thrips oryzae*, *Thrips palmi*, *Thrips tabaci*;
- termitas (*Isoptera*), por ejemplo *Calotermes flavicollis*, *Coptotermes formosanus*, *Heterotermes aureus*, *Heterotermes longiceps*, *Heterotermes tenuis*, *Leucotermes flavipes*, *Odontotermes* spp., *Reticulitermes* spp. tales como *Reticulitermes speratus*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes grassei*, *Reticulitermes lucifugus*, *Reticulitermes santonensis*, *Reticulitermes virginicus*; *Termes natalensis*,
- cucarachas (*Blattaria - Blattodea*), por ejemplo *Acheta domesticus*, *Blatta orientalis*, *Blattella asahinae*, *Blattella germanica*, *Grylotalpa* spp., *Leucophaea maderae*, *Locusta* spp., *Melanoplus* spp., *Periplaneta americana*, *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta japonica*,
- bichos, áfidos, saltamontes, moscas blancas, cohinillas, cigarras (*Hemiptera*), por ejemplo *Acrosternum* spp. tales como *Acrosternum hilare*; *Acyrtosiphon* spp. tales como *Acyrtosiphon onobrychis*, *Acyrtosiphon pisum*; *Adelges laricis*, *Aeneolamia* spp., *Agonoscena* spp., *Aleurodes* spp., *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus* spp., *Amrasca* spp., *Anasa tristis*, *Antestiopsis* spp., *Anuraphis cardui*, *Aonidiella* spp., *Aphanostigma piri*, *Aphidula nasturtii*, *Aphis* spp. tales como *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis gossypii*, *Aphis grossulariae*, *Aphis pomi*, *Aphis sambuci*, *Aphis schneideri*, *Aphis spiraecola*; *Arboridia apicalis*, *Arilus critatus*, *Aspidiella* spp., *Aspidiotus* spp., *Atanus* spp., *Aulacorthum solani*, *Bemisia* spp. tales como *Bemisia argentifolii*, *Bemisia tabaci*; *Blissus* spp. tales como *Blissus leucopterus*; *Brachycaudus cardui*, *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycaudus persicae*, *Brachycaudus prunicola*, *Brachycolus* spp., *Brevicoryne brassicae*, *Calligypona marginata*, *Calocoris* spp., *Campylomma livida*, *Capitophorus horni*, *Carneocephala fulgida*, *Cavelerius* spp., *Ceraplastes* spp., *Ceratovacuna lanigera*, *Cercopidae*, *Cerosiphia gossypii*, *Chaetosiphon fragaefolii*, *Chionaspis tegalensis*, *Chlorita onukii*, *Chromaphis juglandicola*, *Chrysomphalus ficus*, *Cicadulina mbila*, *Cimex* spp. tales como *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*; *Coccomytilus halli*, *Coccus* spp., *Creontiades dilutus*, *Cryptomyzus ribis*, *Cryptomyzus ribis*, *Cyrtopeltis notatus*, *Dalbulus* spp., *Dasyneus piperis*, *Dialeurades* spp., *Diaphorina* spp., *Diaspis* spp., *Dichelops furcatus*, *Diconocoris hewetti*, *Doralis* spp., *Dreyfusia nordmanniana*, *Dreyfusia piceae*, *Drosicha* spp., *Dysaphis* spp. tales como *Dysaphis plantaginea*, *Dysaphis piri*, *Dysaphis radicola*; *Dysaulacorthum pseudosolani*, *Dysdercus* spp. tales como *Dysdercus cingulatus*, *Dysdercus intermedius*; *Dysmicoccus* spp., *Empoasca* spp. tales como *Empoasca fabae*, *Empoasca solana*; *Eriosoma* spp., *Erythroneura* spp., *Eurygaster* spp. tales como *Eurygaster integriceps*; *Euscelis bilobatus*, *Euschistus* spp. tales como *Euschistus heros*, *Euschistus impictiventris*, *Euschistus servus*; *Geococcus coffeae*, *Halyomorpha* spp. tales como *Halyomorpha halyis*; *Heliopeltis* spp., *Homalodisca coagulata*, *Horcias nobilellus*, *Hyalopterus pruni*, *Hyperomyzus lactucae*, *Icerya* spp., *Idiocerus* spp., *Idioscopus* spp., *Laodelphax striatellus*, *Lecanium* spp., *Lepidosaphes* spp., *Leptocorisa* spp., *Leptoglossus phyllopus*, *Lipaphis erysimi*, *Lygus* spp. tales como *Lygus hesperus*, *Lygus lineolaris*, *Lygus pratensis*; *Macropes excavatus*, *Macrosiphum* spp. tales como *Macrosiphum rosae*, *Macrosiphum avenae*, *Macrosiphum euphorbiae*; *Mahanarva fimbriolata*, *Megacocta cribraria*, *Megoura viciae*, *Melanaphis pyramis*, *Melanaphis sacchari*, *Metcafiella* spp., *Metopolophium dirhodum*, *Miridae* spp., *Monellia costalis*, *Monelliopsis pecanalis*, *Myzus* spp. tales como *Myzus ascalonicus*, *Myzus cerasi*, *Myzus persicae*, *Myzus varians*; *Nasonovia ribis-nigri*, *Nephotettix* spp. tales como *Nephotettix malayanus*, *Nephotettix nigropictus*, *Nephotettix parvus*, *Nephotettix*

- 5 *virescens*; *Nezara* spp. tales como *Nezara viridula*; *Nilaparvata lugens*, *Oebalus* spp., *Oncometopia* spp., *Orthezia praelonga*, *Parabemisia myricae*, *Paratrioza* spp., *Parlatoria* spp., *Pemphigus* spp. tales como *Pemphigus bursarius*; *Pentomidae*, *Peregrinus maidis*, *Perkinsiella sac charicida*, *Phenacoccus* spp., *Phloeomyzus passerinii*, *Phorodon humuli*, *Phylloxera* spp., *Piesma quadrata*, *Piezodorus* spp. tales como *Piezodorus guildinii*, *Pinnaspis aspidistrae*, *Planococcus* spp., *Protopulvinaria pyriformis*, *Psallus seriatus*, *Pseudacysta perseae*, *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pseudococcus* spp. tales como *Pseudococcus comstocki*; *Psylla* spp. tales como *Psylla mali*, *Psylla piri*; *Pteromalus* spp., *Pyrilla* spp., *Quadraspidiotus* spp., *Quesada gigas*, *Rastrococcus* spp., *Reduvius senilis*, *Rhodnius* spp., *Rhopalomyzus ascalonicus*, *Rhopalosiphum* spp. tales como *Rhopalosiphum pseudobrassicis*, *Rhopalosiphum insertum*, *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum padi*; *Sagatodes* spp., *Sahlbergella singularis*, *Saissetia* spp., *Sappaphis mala*, *Sappaphis mali*, *Scaphoides titanus*, *Schizaphis graminum*, *Schizoneura lanuginosa*, *Scotinophora* spp., *Selenaspis articulatus*, *Sitobion avenae*, *Sogata* spp., *Sogatella furcifera*, *Solubea insularis*, *Stephanitis nashi*, *Stictocephala festina*, *Tenalaphara malayensis*, *Thyanta* spp. tales como *Thyanta perditor*; *Tibraca* spp., *Tinocallis caryaefoliae*, *Tomaspis* spp., *Toxoptera* spp. tales como *Toxoptera aurantii*; *Trialeurodes* spp. tales como *Trialeurodes vaporariorum*; *Triatoma* spp., *Triozia* spp., *Typhlocyba* spp., *Unaspis* spp. tales como *Unaspis yanonensis*; y *Viteus vitifolii*,
- 20 hormigas, abejas, avispas, moscas de sierra (Hymenoptera), por ejemplo *Athalia rosae*, *Atta capiguara*, *Atta cephalotes*, *Atta cephalotes*, *Atta laevigata*, *Atta robusta*, *Atta sexdens*, *Atta texana*, *Bombus* spp., *Camponotus floridanus*, *Crematogaster* spp., *Dasymutilla occidentalis*, *Diprion* spp., *Dolichovespula maculata*, *Hoplocampa* spp. tales como *Hoplocampa minuta*, *Hoplocampa testudinea*; *Lasius* spp. tales como *Lasius niger*, *Linepithema humile*, *Monomorium pharaonis*, *Paravespula germanica*, *Paravespula pennsylvanica*, *Paravespula vulgaris*, *Pheidole megacephala*, *Pogonomyrmex barbatus*, *Pogonomyrmex californicus*, *Polistes rubiginosa*, *Solenopsis geminata*, *Solenopsis invicta*, *Solenopsis richteri*, *Solenopsis xyloni*, *Vespa* spp. tales como *Vespa crabro*, y *Vespula squamosa*,
- 25 grillos, saltamontes, langostas (Orthoptera), por ejemplo *Acheta domestica*, *Calliptamus italicus*, *Chortoicetes terminifera*, *Dociostaurus maroccanus*, *Gryllotalpa africana*, *Gryllotalpa gryllotalpa*, *Hieroglyphus daganensis*, *Kraussaria angulifera*, *Locusta migratoria*, *Locustana pardalina*, *Melanoplus bivittatus*, *Melanoplus femurrubrum*, *Melanoplus mexicanus*, *Melanoplus sanguinipes*, *Melanoplus spretus*, *Nomadacris septemfasciata*, *Oedaleus senegalensis*, *Schistocerca americana*, *Schistocerca gregaria*, *Tachycines asynamorus*, y *Zonozelus variegatus*,
- 30 arácnidos (Arachnida), tales como acari, por ejemplo of the families Argasidae, Ixodidae y Sarcoptidae, tales como *Amblyomma* spp. (por ejemplo *Amblyomma americanum*, *Amblyomma variegatum*, *Amblyomma maculatum*), *Argas* spp. (por ejemplo *Argas persicus*), *Boophilus* spp. (por ejemplo *Boophilus annulatus*, *Boophilus decoloratus*, *Boophilus microplus*), *Dermacentor silvarum*, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor variabilis*, *Hyalomma* spp. (por ejemplo *Hyalomma truncatum*), *Ixodes* spp. (por ejemplo *Ixodes ricinus*, *Ixodes rubicundus*, *Ixodes scapularis*, *Ixodes holocyclus*, *Ixodes pacificus*), *Ornithodoros* spp. (por ejemplo *Ornithodoros moubata*, *Ornithodoros hermsi*, *Ornithodoros turicata*), *Ornithonyssus bacoti*, *Otobius megnini*, *Dermanyssus gallinae*, *Psoroptes* spp. (por ejemplo *Psoroptes ovis*), *Rhipicephalus* spp. (por ejemplo *Rhipicephalus sanguineus*, *Rhipicephalus appendiculatus*, *Rhipicephalus evertsi*), *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp. (por ejemplo *Sarcoptes scabiei*), y Eriophyidae spp. tales como *Acaria sheldoni*, *Aculops* spp. (por ejemplo *Aculus pelekassi*) *Aculus* spp. (por ejemplo *Aculus schlechtendali*), *Epitrimerus piri*, *Phyllocoptura oleivora* y *Eriophyes* spp. (por ejemplo *Eriophyes sheldoni*); *Tarsonemidae* spp. tales como *Hemitarsonemus* spp., *Phytonemus pallidus* y *Polyphagotarsonemus latus*, *Stenotarsonemus* spp.;
- 40 *Tenuipalpidae* spp. tales como *Brevipalpus* spp. (por ejemplo *Brevipalpus phoenicis*); *Tetranychidae* spp. tales como *Eotetranychus* spp., *Eutetranychus* spp., *Oligonychus* spp., *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus kanzawai*, *Tetranychus pacificus*, *Tetranychus telarius* y *Tetranychus urticae*; *Bryobia praetiosa*, *Panonychus* spp. (por ejemplo *Panonychus ulmi*, *Panonychus citri*), *Metatetranychus* spp. y *Oligonychus* spp. (por ejemplo *Oligonychus pratensis*), *Vasates lycopersici*; Araneida, por ejemplo *Latrodectus mactans*, y *Loxosceles reclusa*. And *Acarus siro*, *Chorioptes* spp., *Scorpio maurus*
- 45 pulgas (*Siphonaptera*), por ejemplo *Ceratophyllus* spp., *Ctenocephalides felis*, *Ctenocephalides canis*, *Xenopsylla cheopis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, y *Nosopsyllus fasciatus*,
- pececillo de plata, insecto del fuego (*Thysanura*), por ejemplo *Lepisma saccharina* y *Thermobia domestica*,
- 50 ciempiés (*Chilopoda*), por ejemplo *Geophilus* spp., *Scutigera* spp. tales como *Scutigera coleoptrata*;
- milípedos (*Diplopoda*), por ejemplo *Blaniulus guttulatus*, *Narceus* spp.,
- tijeretas (*Dermaptera*), por ejemplo *forficula auricularia*,
- piojos (*Phthiraptera*), por ejemplo *Damalinia* spp., *Pediculus* spp. tales como *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*; *Pthirus pubis*, *Haematopinus* spp. tales como *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus suis*; *Linognathus* spp. tales como *Linognathus vituli*; *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*, *Menacanthus stramineus* y *Solenopotes capillatus*, *Trichodectes* spp.,
- 55 springtails (*Collembola*), por ejemplo *Onychiurus* ssp. tales como *Onychiurus armatus*,

También son adecuados para controlar nemátodos: nemátodos parásitos de plantas tales como nemátodos de nudos de raíz, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica* y otras especies de *Meloidogyne*; nemátodos que forman quistes, *Globodera rostochiensis* y otras especies de *Globodera*; *Heterodera avenae*, *Heterodera glycines*, *Heterodera schachtii*, *Heterodera trifolii* y otras especies de *Heterodera*; nemátodos carcomedores de semillas, especies de *Anguina*; nemátodos de tallo y foliar, especies de *Aphelenchoides* tales como *Aphelenchoides besseyi*; nemátodos de aguijón, *Belonolaimus longicaudatus* y otras especies *Belonolaimus*; nemátodos de pino, *Bursaphelenchus lignicolus* *Mamiya* y *Kiyohara*, *Bursaphelenchus xylophilus* y otras especies de *Bursaphelenchus*; nemátodos de anillo, especies de *Criconema*, especies de *Criconemella*, especies de *Criconemoides*, especies de *Mesocriconema*; nemátodos de tallos y bulbo, *Ditylenchus destructor*, *Ditylenchus dipsaci* y otras especies de *Ditylenchus*; nemátodos de puzón, especies de *Dolichodorus*; nemátodos espirales, *Helicotylenchus multinctus* y otras especies de *Helicotylenchus*; nemátodos de vaina y vainoides, especie de *Hemicycliophora* y especie de *Hemicriconemoides*; especies de *Hirshmanniella*; nemátodos de Lance, especies de *Hoploaimus*; nemátodos falsos de nódulo radicular, especies de *Nacobbus*; nemátodos de agujas, *Longidorus elongatus* y otras especies de *Longidorus*; nemátodos de lesiones, *Pratylenchus brachyurus*, *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus curvatus*, *Pratylenchus goodeyi* y otras especies de *Pratylenchus*; nemátodos excavadores, *Radopholus similis* y otras especies de *Radopholus*; nemátodos reniformes, *Rotylenchus robustus*, *Rotylenchus reniformis* y otras especies de *Rotylenchus*; Especies de *Scutellonema*; nemátodos de raíces achaparrados, *Trichodorus primitivus* y otras especies de *Trichodorus*, especies de *Paratrichodorus*; Nemátodos atrofiados, *Tylenchorhynchus claytoni*, *Tylenchorhynchus dubius* y otras especies de *Tylenchorhynchus*; nemátodos cítricos, especies de *Tylenchulus* tales como *Tylenchulus semipenetrans*; nemátodos de daga, especies de *Xiphinema*; y otras especies de nemátodos parasíticos de plantas.

Ejemplos de especies de plagas adicionales que pueden ser controlados por los compuestos de fórmula (I) incluyen: de la clase de las *Bivalva*, por ejemplo, *Dreissena* spp.; de la clase de los *Gastropoda*, por ejemplo, *Arion* spp., *Biomphalaria* spp., *Bulinus* spp., *Deroceras* spp., *Galba* spp., *Lymnaea* spp., *Oncomelania* spp., *Succinea* spp.; de la clase de los *helminths*, por ejemplo, *Ancylostoma duodenale*, *Ancylostoma ceylanicum*, *Ancylostoma braziliensis*, *Ancylostoma* spp., *Ascaris lubricoides*, *Ascaris* spp., *Brugia malayi*, *Brugia timori*, *Bunostomum* spp., *Chabertia* spp., *Clonorchis* spp., *Cooperia* spp., *Dicrocoelium* spp., *Dictyocaulus filaria*, *Diphylobothrium latum*, *Dracunculus medinensis*, *Echinococcus granulosus*, *Echinococcus multilocularis*, *Enterobius vermicularis*, *Faciola* spp., *Haemonchus* spp. tales como *Haemonchus contortus*; *Heterakis* spp., *Hymenolepis nana*, *Hyostromgulus* spp., *Loa loa*, *Nematodirus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Opisthorchis* spp., *Onchocerca volvulus*, *Ostertagia* spp., *Paragonimus* spp., *Schistosomen* spp., *Strongyloides fuelleborni*, *Strongyloides stercoraria*, *Strongyloides* spp., *Taenia saginata*, *Taenia solium*, *Trichinella spiralis*, *Trichinella nativa*, *Trichinella britovi*, *Trichinella nelsoni*, *Trichinella pseudopsiralis*, *Trichostrongylus* spp., *Trichuris trichuria*, *Wuchereria bancrofti*; del orden de los *Isopoda*, por ejemplo, *Armadillidium vulgare*, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*; del orden de los *Symphyla*, por ejemplo, *Scutigera immaculata*.

Ejemplos adicionales de especies de plagas que pueden controlarse mediante compuestos de fórmula (I) incluyen:

Anisoplia austriaca, *Apamea* spp., *Austroasca viridigrisea*, *Baliothrips biformis*, *Caenorhabditis elegans*, *Cephus* spp., *Ceutorhynchus napi*, *Chaetocnema aridula*, *Chilo auricilius*, *Chilo indicus*, *Chilo polychrysus*, *Chortiocetes terminifera*, *Cnaphalocroci medinalis*, *Cnaphalocrosis* spp., *Colias eurytheme*, *Collops* spp., *Cornitermes cumulans*, *Creontiades* spp., *Cyclocephala* spp., *Dalbulus maidis*, *Deraceras reticulatum*, *Diatrea saccharalis*, *Dichelops furcatus*, *Dicladispa armigera*, *Diloboderus* spp. tales como *Diloboderus abderus*; *Edessa* spp., *Epinotia* spp., *Formicidae*, *Geocoris* spp., *Globitermes sulfureus*, *Gryllotalpidae*, *Halotydeus destructor*, *Hipnodes bicolor*, *Hydrellia philippina*, *Julus* spp., *Laodelphax* spp., *Leptocorsia acuta*, *Leptocorsia oratorius*, *Liogenys fuscus*, *Lucillia* spp., *Lyogenys fuscus*, *Mahanarva* spp., *Maladera matrida*, *Marasmia* spp., *Mastotermes* spp., *Mealybugs*, *Megascelis* ssp, *Metamasius hemipterus*, *Microtheca* spp., *Mocis latipes*, *Murgantia* spp., *Mythemina separata*, *Neocapritermes opacus*, *Neocapritermes parvus*, *Neomegalotomus* spp., *Neotermes* spp., *Nymphula depunctalis*, *Oebalus pugnax*, *Orseolia* spp. tales como *Orseolia oryzae*; *Oxycaraenus hyalinipennis*, *Plusia* spp., *Pomacea canaliculata*, *Procornitermes* ssp, *Procornitermes triacifer*, *Psyllodes* spp., *Rachiplusia* spp., *Rhodopholus* spp., *Scaptocoris castanea*, *Scaptocoris* spp., *Scirpophaga* spp. tales como *Scirpophaga incertulas*, *Scirpophaga innotata*; *Scotinophara* spp. tales como *Scotinophara coarctata*; *Sesamia* spp. tales como *Sesamia inferens*, *Sogaella frucifera*, *Solenopsis geminata*, *Spissistilus* spp., *Stalk borer*, *Stenchaetothrips biformis*, *Steneotarsonemus spinki*, *Sylepta derogata*, *Telehin licus*, *Trichostrongylus* spp..

Formulaciones

La invención también se refiere a composiciones agroquímicas que comprenden un agente auxiliar y al menos un compuesto I de acuerdo con la invención.

Una composición agroquímica comprende una cantidad efectiva como pesticida de un compuesto I. El término "cantidad efectiva" denota una cantidad de la composición o de los compuestos I, que es suficiente para controlar plagas dañinas en plantas cultivadas, material de propagación de plantas o cultivos o en la protección de los materiales y que no resulte en un daño sustancial a las plantas tratadas. Tal cantidad puede variar en un amplio rango y depende de diversos factores, tales como las especies de plagas que se van a controlar, la planta o material cultivado tratado, las condiciones climáticas y el compuesto I específico usado.

- Los compuestos I, sus N-óxidos y sales se pueden convertir en tipos usuales de composiciones agroquímicas, por ejemplo, soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, pulverizables, pastas, gránulos, prensados, cápsulas y mezclas de los mismos. Ejemplos de tipos de composición son suspensiones (por ejemplo, SC, OD, FS), concentrados emulsionables (por ejemplo EC), emulsiones (por ejemplo EW, EO, ES, ME), cápsulas (por ejemplo, CS, ZC), pastas, pastillas, pulverizables humectables o polvos (Por ejemplo, WP, SP, WS, DP, DS), prensados (por ejemplo, BR, TB, DT), gránulos (por ejemplo, WG, SG, GR, FG, GG, MG), artículos insecticidas (por ejemplo, LN) así como formulaciones en gel para el tratamiento de materiales de propagación de plantas tales como semillas (por ejemplo, GF). Estos y otros tipos de composiciones se definen en el " Catalogue of pesticide formulation types and international coding system", Monografía Técnica No. 2, 6ª Ed. Mayo de 2008, CropLife International.
- 5
- 10 Las composiciones se preparan de una manera conocida, tal como se describe por Mollet y Grubemann, Tecnología de Formulación, Wiley VCH, Weinheim, 2001; o Knowles, New developments in crop protection product formulation, Agron Reports DS243, T&F Informa, London, 2005.
- Ejemplos de agentes auxiliares adecuados son solventes, vehículos líquidos, vehículos o agentes de relleno, surfactantes, dispersantes, emulsionantes, humectantes, adyuvantes, solubilizantes, potenciadores de penetración, coloides protectores, agentes de adhesión, espesantes, humectantes, repelentes, atrayentes, estimulantes de alimentación, compatibilizadores, bactericidas, agentes anticongelantes, agentes antiespumantes, colorantes, agentes aglutinantes y aglomerantes.
- 15
- Solventes y vehículos líquidos adecuados son agua y solventes orgánicos, tales como fracciones de aceite mineral de punto de ebullición medio a alto, por ejemplo queroseno, aceite diesel; aceites de origen vegetal o animal; hidrocarburos alifáticos, cíclicos y aromáticos, por ejemplo tolueno, parafina, tetrahidronaftaleno, naftalenos alquilados; alcoholes, por ejemplo etanol, propanol, butanol, alcohol bencílico, ciclohexanol; glicoles; DMSO; cetonas, por ejemplo ciclohexanona; ésteres, por ejemplo lactatos, carbonatos, ésteres de ácidos grasos, gamma-butirolactona; ácidos grasos; fosfonatos; aminas; amidas, po ejemplo N-metilpirrolidona, dimetilamidas de ácidos grasos; y mezclas de los mismos.
- 20
- 25 Los vehículos o agentes de relleno sólidos adecuados son tierras minerales, por ejemplo silicatos, geles de sílica, talco, caolines, caliza, cal, tiza, arcillas, dolomita, tierra de diatomáceas, bentonita, sulfato de calcio, sulfato de magnesio, óxido de magnesio; polisacáridos en polvo, por ejemplo celulosa, almidón; fertilizantes, por ejemplo sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, ureas; productos de origen vegetal, por ejemplo harina de cereales, harina de corteza de árbol, harina de madera, harina de cáscara de nuez, y mezclas de los mismos.
- 30
- Surfactantes adecuados son compuestos con actividad de superficie, tales como surfactantes aniónicos, catiónicos, no iónicos y anfóteros, polímeros de bloques, polielectrolitos y mezclas de los mismos. Tales surfactantes se pueden usar como emulsionantes, dispersantes, solubilizantes, humectantes, potenciadores de penetración, coloide protector o adyuvantes. Ejemplos de surfactantes se listan en McCutcheon' s, Vol.1: Emulsifiers & Detergents, McCutcheon' s Directories, Glen Rock, EE.UU., 2008 (International Ed. or North American Ed.)
- 35
- 40 Surfactantes aniónicos adecuados son sales alcalinas, alcalinotérreas o de amonio de sulfonatos, sulfatos, fosfatos, carboxilatos y mezclas de los mismos. Ejemplos de sulfonatos son alquilarilsulfonatos, sulfonatos de alfa-olefina, sulfonatos de lignina, sulfonatos de ácidos grasos y aceites, sulfonatos de alquilfenoles etoxilados, sulfonatos de arilfenoles alcoxilados, sulfonatos de naftalenos condensados, sulfonatos de dodecil- y tridecilbencenos, sulfonatos de naftalenos y alquilnaftalenos, sulfosuccinatos o sulfosuccinamatos. Ejemplos de sulfatos son sulfatos de ácidos grasos y aceites, de alquilfenoles etoxilados, de alcoholes, de alcoholes etoxilados o de ésteres de ácidos grasos. Ejemplos de fosfatos son ésteres de fosfato. Ejemplos de carboxilatos son carboxilatos de alquilo y alcohol ecarboxilado o etoxilatos de alquilfenol.
- 45
- Surfactantes no iónicos adecuados son alcoxilatos, amidas de ácidos grasos sustituidos en N, óxidos de amina, ésteres, surfactantes basados en azúcar, surfactantes poliméricos y mezclas de los mismos. Ejemplos de alcoxilatos son compuestos tales como alcoholes, alquilfenoles, aminas, amidas, arilfenoles, ácidos grasos o ésteres de ácidos grasos que han sido alcoxilados con 1 a 50 equivalentes. Se pueden emplear óxido de etileno y/u óxido de propileno para la alcoxilación, preferiblemente óxido de etileno. Ejemplos de amidas de ácido graso sustituidas en N son glucamidas de ácidos grasos o alcanolamidas de ácidos grasos. Ejemplos de ésteres son ésteres de ácidos grasos, ésteres de glicerol o monoglicéridos. Ejemplos de surfactantes basados en azúcar son sorbitanos, sorbitanos etoxilados, ésteres de sacarosa y glucosa o alquilpoliglucósidos. Ejemplos de surfactantes poliméricos son homo- o copolímeros de vinilpirrolidona, vinilalcoholes o acetato de vinilo.
- 50
- Surfactantes catiónicos adecuados son surfactantes cuaternarios, por ejemplo compuestos de amonio cuaternario con uno o dos grupos hidrófobos, o sales de aminas primarias de cadena larga. Surfactantes anfotéricos adecuados son alquilbetainas e imidazolininas. Los polímeros de bloques adecuados son polímeros de bloques del tipo A-B o A-B-A que comprenden bloques de óxido de polietileno y óxido de polipropileno, o del tipo A-B-C que comprende alcohol, óxido de polietileno y óxido de polipropileno. Los polielectrolitos adecuados son poliácidos o polibases. Ejemplos de poliácidos son sales alcalinas de ácido poliacrílico o polímeros de poliácidos en forma de peine. Ejemplos de polibases son polivinilaminas o polietilenaminas.
- 55

Los adyuvantes adecuados son compuestos, que tienen una actividad despreciable o incluso ninguna actividad pesticida por sí mismos, y que mejoran el rendimiento biológico del compuesto I en el objetivo. Ejemplos son surfactantes, aceites minerales o vegetales, y otros auxiliares. Ejemplos adicionales están listados por Knowles, Adjuvants and additives, Agrow Reports DS256, T & F Informa UK, 2006, chapter 5.

- 5 Los espesantes adecuados son polisacáridos (por ejemplo, goma de xantano, carboximetilcelulosa), arcillas orgánicas (orgánicamente modificadas o no modificadas), policarboxilatos y silicatos.

Los bactericidas adecuados son derivados de bronopol e isotiazolinona tales como alquilisotiazolinonas y bencisotiazolinonas.

Agentes anticongelantes adecuados son etilenglicol, propilenglicol, urea y glicerina.

- 10 Los agentes antiespumantes adecuados son siliconas, alcoholes de cadena larga y sales de ácidos grasos.

Los colorantes adecuados (por ejemplo, en rojo, azul o verde) son pigmentos de baja solubilidad en agua y tintes solubles en agua. Ejemplos son colorantes inorgánicos (por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, hexacianoferrato de hierro) y colorantes orgánicos (por ejemplo, colorantes de alizarina, azo- y ftalocianina).

- 15 Aglutinantes o aglomerantes adecuados son polivinilpirrolidonas, poli(vinilacetatos), polivinil alcoholes, poliacrilatos, ceras biológicas o sintéticas y éteres de celulosa.

Ejemplos de tipos de composición y su preparación son:

i) Concentrados solubles en agua (SL, LS)

- 20 10-60 % en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención y 5-15 % en peso de agente humectante (por ejemplo alcoxilatos de alcohol) se disuelven en agua y/o en un solvente soluble en agua (por ejemplo, alcoholes) hasta 100 % en peso. La sustancia activa se disuelve por dilución con agua.

ii) Concentrados dispersables (DC)

5-25 % en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención y 1-10 % en peso de dispersante (por ejemplo, polivinilpirrolidona) se disuelven en hasta 100 % en peso de solvente orgánico (por ejemplo ciclohexanona). La dilución con agua da una dispersión.

- 25 iii) Concentrados emulsionables (EC)

15-70 % en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención y 5-10 % en peso de emulsionantes (por ejemplo dodecilmecanosulfonato de calcio y etoxilato de aceite de ricino) se disuelven en hasta 100 % en peso de solvente orgánico insoluble en agua (por ejemplo, hidrocarburo aromático). La dilución con agua da una emulsión.

iv) Emulsiones (EW, EO, ES)

- 30 5-40 % en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención y 1-10 % en peso de emulsionantes (por ejemplo, dodecilmecanosulfonato de calcio y etoxilato de aceite de ricino) en 20-40 % en peso de solvente orgánico insoluble en agua (por ejemplo hidrocarburo aromático). Esta mezcla se introduce en hasta un 100 % en peso de agua por medio de una máquina emulsionante y se convierte en una emulsión homogénea. La dilución con agua da una emulsión.

- 35 v) Suspensiones (SC, OD, FS)

En un molino de bolas con agitación, el 20-60 % en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención se tritura con adición de 2-10 % en peso de dispersantes y agentes humectantes (por ejemplo lignosulfonato sódico y alcohol etoxilado), 0,1-2 % en peso de espesante (Por ejemplo, goma de xantano) y hasta un 100 % en peso de agua para dar una suspensión fina de sustancia activa. La dilución con agua da una suspensión estable de la sustancia activa.

40 Para la composición de tipo FS se añade hasta 40 % en peso de aglomerante (por ejemplo alcohol polivinílico).

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

- 45 50-80 % en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención se trituran finamente con adición de hasta 100 % en peso de dispersantes y agentes humectantes (por ejemplo lignosulfonato de sodio y etoxilato de alcohol) y se preparan como gránulos dispersables en agua o solubles en agua mediante medios de aparatos técnicos (Por ejemplo, extrusión, torre de pulverización, lecho fluidizado). La dilución con agua proporciona una dispersión o solución estable de la sustancia activa.

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

50-80 % en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención se trituran en un molino rotor-estator con adición de 1-5 % en peso de dispersantes (por ejemplo lignosulfonato de sodio), 1-3 % en peso de agentes humectantes (por

ejemplo, alcohol etoxilado) y hasta 100 % en peso de vehículo sólido, por ejemplo sílica gel. La dilución con agua proporciona una dispersión o solución estable de la sustancia activa.

viii) Gel (GW, GF)

5 En un molino de bolas con agitación, el 5 - 25 % en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención se tritura con adición de 3-10 % en peso de dispersantes (por ejemplo lignosulfonato de sodio), 1-5 % en peso de espesante (por ejemplo carboximetilcelulosa) y hasta 100 en peso de agua para dar una suspensión fina de la sustancia activa. La dilución con agua da una suspensión estable de la sustancia activa.

ix) Microemulsión (ME)

10 5-20 % en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención se añaden a 5-30 % en peso de mezcla de solvente orgánico (por ejemplo, dimetilamida de ácido graso y ciclohexanona), 10-25 % en peso de mezcla de surfactante (por ejemplo, etoxilato de alcoholes y etoxilato de arilfenol) y agua hasta el 100 %. Esta mezcla se agita durante 1 h para producir espontáneamente una microemulsión termodinámicamente estable.

x) Microcápsulas (CS)

15 Una fase oleosa que comprende 5-50 % en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención, 0-40 % en peso de solvente orgánico insoluble en agua (por ejemplo hidrocarburo aromático), 2-15 % en peso de monómeros acrílicos (por ejemplo metacrilato de metilo, ácido metacrílico y un dior triacrilato) se dispersan en una solución acuosa de un coloide protector (por ejemplo alcohol polivinílico). La polimerización radical iniciada por un iniciador radical da como resultado la formación de microcápsulas de poli(met)acrilato. Alternativamente, una fase oleosa que comprende 5-50 % en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención, 0-40 % en peso de solvente orgánico insoluble en agua
20 (por ejemplo, hidrocarburo aromático) y un monómero de isocianato (por ejemplo difenilmeteno-4,4'-diisocianatos) Se dispersan en una solución acuosa de un coloide protector (por ejemplo alcohol polivinílico). La adición de una poliamina (por ejemplo, hexametildiamina) da como resultado la formación de microcápsulas de poliurea. Los monómeros ascienden a 1 - 10 % en peso. El porcentaje en peso se refiere a la composición total de CS.

xi) Polvos pulverizables (DP, DS)

25 1-10 % en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención se trituran finamente y se mezclan íntimamente con hasta 100 % en peso de vehículo sólido, por ejemplo caolín finamente dividido.

xii) Gránulos (GR, FG)

30 0,5-30 % en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención se tritura finamente y se asocia con hasta 100 % en peso de vehículo sólido (por ejemplo, silicato). La granulación se consigue mediante extrusión, secado por aspersión o el lecho fluidizado.

xiii) Líquidos de volumen ultra bajo (UL)

1-50 % en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención se disuelven en hasta 100 % en peso de solvente orgánico, por ejemplo hidrocarburo aromático.

35 Las composiciones de los tipos i) a xiii) pueden comprender opcionalmente agentes auxiliares adicionales, tales como 0,1 - 1 % en peso de bactericidas, 5 - 15 % en peso de agentes anticongelantes, 0,1 - 1 % en peso de agentes antiespumantes y 0, 1 % en peso de colorantes.

Las composiciones agroquímicas comprenden generalmente entre 0,01 y 95 %, preferiblemente entre 0,1 y 90 %, y lo más preferiblemente entre 0,5 y 75 %, en peso de sustancia activa. Las sustancias activas se emplean en una pureza de 90 % a 100 %, preferiblemente de 95 % a 100 % (de acuerdo con el espectro de RMN).

40 Se emplean usualmente concentrados solubles en agua (LS), Suspoemulsiones (SE), concentrados fluidos (FS), polvos para tratamiento en seco (DS), polvos dispersables en agua para el tratamiento en suspensión (WS), polvos solubles en agua (SS), emulsiones, concentrados emulsionables (CE) y geles (GF) para el tratamiento de materiales de propagación de plantas, particularmente semillas. Las composiciones en cuestión dan, después de dilución de dos a diez veces, concentraciones de sustancia activa de 0,01 a 60 % en peso, preferiblemente de 0,1 a 40 % en peso,
45 en las preparaciones listas para el uso. La aplicación puede realizarse antes o durante la siembra. Los métodos para aplicar o tratar el compuesto I y composiciones de los mismos, respectivamente, sobre el material de propagación de la planta, especialmente las semillas, incluyen métodos de revestimiento, recubrimiento, granulación, pulverización, remojo y aplicación en surco del material de propagación. Preferiblemente, el compuesto I o las composiciones de los mismos, respectivamente, se aplican sobre el material de propagación de la planta mediante un método tal que no se induce la germinación, por ejemplo, mediante recubrimiento de semillas, granulación, recubrimiento y el espolvoreo.
50

Cuando se emplean en la protección de las plantas, las cantidades de sustancias activas aplicadas son, dependiendo del tipo de efecto deseado, de 0,001 a 2 kg por ha, preferiblemente de 0,005 a 2 kg por ha, más preferiblemente de 0,05 a 0,9 kg por ha, en particular de 0,1 a 0,75 kg por ha.

5 En el tratamiento de materiales de propagación de plantas tales como semillas, por ejemplo, por espolvoreo, recubrimiento o impregnación de semillas, cantidades de sustancia activa de 0,1 a 1000 g, preferiblemente de 1 a 1000 g, más preferiblemente de 1 a 100 g, y lo más preferiblemente de 5 a 100 g, por 100 kilogramos de material de propagación vegetal (preferiblemente semilla). Cuando se utiliza en la protección de materiales o productos almacenados, la cantidad de sustancia activa aplicada depende del tipo de área de aplicación y del efecto deseado. Las cantidades habitualmente aplicadas en la protección de materiales son de 0,001 g a 2 kg, preferiblemente de 0,005 g a 1 kg, de sustancia activa por metro cúbico de material tratado.

10 Pueden añadirse a las sustancias activas o a las composiciones que las comprenden como premezclas, o, en su caso, hasta varios tipos de aceites, humectantes, adyuvantes, fertilizantes o micronutrientes y otros plaguicidas (por ejemplo, herbicidas, insecticidas, fungicidas, reguladores del crecimiento, protectores). inmediatamente antes del uso (mezcla de tanque). Estos agentes se pueden mezclar con las composiciones de acuerdo con la invención en una relación en peso de 1: 100 a 100: 1, preferiblemente de 1:10 a 10: 1.

15 El usuario aplica la composición de acuerdo con la invención usualmente desde un dispositivo de predosificación, un pulverizador de mochila, un tanque de aspersión, un plano de aspersión o un sistema de irrigación. Usualmente, la composición agroquímica se prepara con agua, regulador y/o agentes auxiliares adicionales a la concentración de aplicación deseada y se obtiene así el licor de aspersión listo para usar o la composición agroquímica de acuerdo con la invención. Usualmente, se aplican de 20 a 2000 litros, preferiblemente de 50 a 400 litros, del licor de aspersión listo para usar por hectárea de área útil agrícola.

20 de acuerdo con una realización, los componentes individuales de la composición de acuerdo con la invención, tales como partes de un kit o partes de una mezcla binaria o ternaria, pueden ser mezclados por el propio usuario en un tanque de aspersión y se pueden añadir agentes auxiliares adicionales, si es apropiado.

25 En una realización adicional, ya sea componentes individuales de la composición de acuerdo con la invención o componentes parcialmente premezclados, por ejemplo componentes que comprenden los compuestos I y/o sustancias activas de los grupos descritos aquí más adelante, pueden ser mezclados por el usuario en un tanque de aspersión y se pueden añadir agentes auxiliares y aditivos adicionales, si es apropiado.

En una realización adicional, ya sea componentes individuales de la composición de acuerdo con la invención o componentes parcialmente premezclados, por ejemplo componentes que comprenden los compuestos I y/o sustancias activas de los grupos descritos aquí más adelante, pueden aplicarse conjuntamente (por ejemplo después de la mezcla en tanque) o consecutivamente.

30 Como se ha mencionado anteriormente, en el método de esta invención los compuestos I se pueden aplicar con otros ingredientes activos, por ejemplo como mezclas con otros pesticidas, insecticidas, herbicidas, fertilizantes tales como nitrato de amonio, urea, potasa y superfosfato, fitotóxicos y reguladores de crecimiento de plantas, protectores y nematocidas.

35 Estos ingredientes adicionales se pueden utilizar secuencialmente o en combinación con las composiciones descritas anteriormente, si es apropiado también se añaden sólo inmediatamente antes del uso (mezcla en tanque). Por ejemplo, las plantas pueden ser asperjadas con una composición de esta invención ya sea antes o después de ser tratadas con otros ingredientes activos.

Mezclas

40 La siguiente lista M de plaguicidas, agrupados y numerados de acuerdo con la Clasificación del Modo de Acción del Comité de Acción de Resistencia a Insecticidas (IRAC), junto con la cual pueden utilizarse los compuestos de acuerdo con la invención y con los cuales se podrían producir efectos sinérgicos potenciales, para ilustrar las combinaciones posibles, pero no para imponer ninguna limitación:

M.1 Inhibidores de la acetilcolina esterasa (AChE) de la clase de

45 Carbamatos M.1A, por ejemplo aldicarb, alanycarb, bendiocarb, benfuracarbo, butocarboximo, butoxicarboximo, carbarilo, carbofurano, carbosulfano, etiofencarbam, fenobucarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarbo, metiocarb, metomil, metolcarb, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodi-carb, tiofanox, trimetacarb, XMC, xililcarb y triazamato; o de la clase de

50 M.1 B organofosfatos, por ejemplo acefato, azametifos, azinfos-etilo, azinfosmetilo, cadusafos, cloretoxifos, clorofenvinfos, clormefós, clorpirifos, clorpirifos-metilo, coumafos, cianofos, demetón-Smetilo, diazinon, diclorvos/DDVP, dicrotofos, dimetoato, Dimetilvinfos, disulfoton, EPN, etion, etoprofos, famfur, fenamifos, fenitrotión, fentión, fostiazato, heptenofos, imicifos, isofenfos, isopropil O-(metoxiaminotiofosforil) salicilato, isoxatién, malatién, mecarbam, metamidofos, metidation, mevinfos, monocrotofos, ometoato, oxidemetón-metilo, paratién, parationmetilo, fenoato, forato, fosalon, fosmet, fosfamidon, foxim, pirimifosmetilo, profenofos, propetamfos, protiofos, piraclfos, piridafention, quinalfos, sulfotep, tebupirimfos, temefos, terbufos, tetraclorvinfos, tiometon, triazofos, triclorfon y vamidotion;

55

- M.2. Antagonistas del canal de cloruro controlado por GABA tales como:
- M.2A compuestos de ciclodieno organocloros, como por ejemplo endosulfan o clordano; o
- M.2B fiproles (fenilpirazoles), como por ejemplo etiprol, fipronil, flufiprol, pirafluprol y piriprol;
- M.3 Moduladores de canales de sodio de la clase de
- 5 M.3A piretroides, por ejemplo acrinatrina, aletrina, d-cis-transaletrina, d-transaletrina, bifentrina, bioaletrina, bioaletrin S-ciclopentenilo, biorremetrina, cicloprotrina, ciflutrina, betaciflutrina, cialotrina, lambda-cialotrina, gamma-cialotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, beta-cipermetrina, theta-cipermetrina, zeta-cipermetrina, cifenotrina, deltametrina, empentrina, esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerat, flucitrinato, flumetrina, tau-fluvalinato, halfenprox, heptaflutrina, imiprotrina, meperflutrina, metoflutrina, momfluorotrina, permetrina, fenotrina, praletrina, proflutrina, 10 piretrina (piretro), resmetrina, silafluofen, teflutrina, tetrametilflutrina, tetrametrina, tralometrina y translutrina; o
- M.3B moduladores del canal de sodio tales como DDT o metoxiclor;
- M.4 Agonistas nicotínicos del receptor de acetilcolina (nAChR) de la clase de
- M.4A neonicotinoides, por ejemplo acteamiprid, clotianidin, cicloxaprid, dinotefuran, imidaclo-prid, nitenpiram, tiacloprid y tiametoxam; o los compuestos
- 15 M.4A.2: (2E)-1-[(6-Cloropiridin-3-il)metil]-N'-nitro-2- Pentilidenedihidrazinacarboximidamida; o
- M4.A.3: 1-[(6-Cloropiridin-3-il)metil]-7-metil-8-nitro-5-propoxi-1,2,3,5,6,7-hexahidroimidazo[1,2-a]piridina; o de la clase M.4B nicotina;
- M.5 Activadores alostéricos del receptor nicotínico de la acetilcolina de la clase de espinosinas, por ejemplo espinosad o espinotoram;
- 20 M.6 Activadores de canal de cloro de la clase de avermectinas y milbemecinas, por ejemplo abamectina, benzoato de emamectina, ivermectina, lepimectina o milbemectina;
- M.7 Imitadores de la hormona juvenil, tales como
- M.7A Análogos de la hormona juvenil como hidropreno, kinopreno y metopreno; u otros como
- M.7B fenoxicarb o M.7C piriproxifen;
- 25 M.8 inhibidores misceláneos no específicos (multi-sitio), por ejemplo
- M.8A Haluros de alquilo como bromuro de metilo y otros haluros de alquilo, o
- M.8B cloropicrina, o M.8C fluoruro de sulfurilo, o M.8D bórax, o M.8E tártaro emético;
- M.9 Bloqueadores selectivos de la alimentación de homópteros, por ejemplo
- M.9B pimetrozina, o M.9C flonicamid;
- 30 M.10 Inhibidores del crecimiento de los ácaros, por ejemplo
- M.10A Clofentezina, hexitiazox y diflovidazina, o M.10B etoxazol;
- M.11 Disruptores microbianos de membranas de intestino medio de insectos, por ejemplo *bacillus thuringiensis* o *bacillus sphaericus* y las proteínas insecticidas que producen tales como *bacillus thuringiensis subsp. israelensis*, *bacillus sphaericus*, *bacillus thuringiensis subsp. aizawai*, *bacillus thuringiensis subsp. kurstaki* y *bacillus thuringiensis subsp. tenebrionis*, o las proteínas de cultivo Bt: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry2Ab, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb y Cry34/35Ab1;
- 35 M.12 Inhibidores de la ATP mitocondrial sintasa, por ejemplo
- M.12A diafenthiuron, o
- M.12B Acaricidas organoestánicos tales como azociclotina, ciclohexatina u óxido de fenbutatina, o
- 40 M.12C pro-pargite, o
- M.12D tetradifon;
- M.13 Desacopladores de fosforilación oxidativa mediante la interrupción del gradiente de protones, por ejemplo clorfenapir, DNOC o sulfuramid;

- M.14 Bloqueadores de canales del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR), por ejemplo análogos de nereistoxina como bensultap, clorhidrato de cartap, tiociclo o tiosultap sódico;
- 5 M.15 Inhibidores de la biosíntesis de quitina tipo 0, tales como benzoilureas como por ejemplo bistriflu-ron, clorfluazuron, diflubenzuron, flucicloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novalu-ron, noviflumuron, teflubenzuron o triflumuron;
- M.16 Inhibidores de la biosíntesis de quitina de tipo 1, como por ejemplo buprofezin;
- M.17 Disruptores de muda, Dipteran, por ejemplo ciromazina
- M.18 Agonistas del receptor Ecdyson tales como diacilhidrazinas, por ejemplo metoxifenzida, tebufenozida, halofenzida, fufenozida o cromafenzida;
- 10 M.19 Agonistas de los receptores de la octopamina, como por ejemplo amitraz;
- M.20 Inhibidores del transporte de electrones del complejo III mitocondrial, por ejemplo
- M.20A hidrametilnon, o
- M.20B acequinocilo, o
- M.20C fluacirpirim;
- 15 M.21 Inhibidores del transporte de electrones del complejo mitocondrial I, por ejemplo
- M.21A METI acaricidas e insecticidas tales como fenazaquin, fenpiroximati, pirimidifen, piridaben, tebufenpirad o tolfenpirad, o
- M.21 B rotenona;
- M.22 Bloqueadores de los canales de sodio dependientes del voltaje, por ejemplo
- 20 M.22A indoxacarb, o
- M.22B metaflumizona, o
- M.22B.1: 2-[2-(4-Cianofenil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etiliden]- N-[4-(difluorometoxi)fenil]-hidrazincarboxamida o
- M.22B.2: N-(3-Cloro-2-metilfenil)-2-[(4-clorofenil)[4-[metil(metilsulfonil)amino]fenil]metilen]-hidrazincarboxamida;
- M.23 Inhibidores de la acetil CoA carboxilasa, tales como derivados de ácido Tetronic y Tetramic, por ejemplo
- 25 espiroclorfen, espiromesifen o espirotetramat;
- M.24 Inhibidores del transporte de electrones del complejo IV mitocondrial, por ejemplo
- M.24A fosfina tal como fosfuro de aluminio, fosfuro de calcio, fosfina o fosfuro de zinc, o
- M.24B cianuro;
- M.25 Inhibidores del transporte de electrones del complejo II mitocondrial, tales como derivados de beta-cetonitrilo, por ejemplo cienopirafen o ciflumetofen;
- 30 M.28 Moduladores de receptores de Ryanodina de la clase de diamidas, como por ejemplo flubendiamida, clorantraniliprol (rynaxypyr®), ciantraniliprol (cyazypyr®), o los compuestos de ftalamida
- M.28.1: (R)-3-Clor-N1-{2-metil-4-[1,2,2,2-tetrafluor-1-(trifluorometil)etil]fenil}-N2-(1-metil-2-metilsulfoniletil) ftalamida y
- M.28.2: (S)-3-Clor-N1-{2-metil-4-[1,2,2,2 - tetrafluor-1-(trifluorometil)etil]fenil}-N2-(1-metil-2-metilsulfoniletil) ftalamida, o
- 35 el compuesto
- M.28.3: 3-bromo-N-{2-bromo-4-cloro-6-[(1-ciclopropiletil)carbamoil]fenil}-1-(3-clorpiridin-2-il)-1 H-pirazol- 5-carboxamida (Nombre ISO propuesto: cyclaniliprole), o el compuesto
- M.28.4: metil-2-[3,5-dibromo-2-([3-bromo-1-(3-clorpiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil)amino]benzoil]-1,2-dimetilhidrazincarboxilato; o un compuesto seleccionado de M.28.5a) a M.28.5i):
- 40 M.28.5a) N-[4,6-dicloro-2-[(diel-lambda-4-sulfaniliden)carbamoil]-fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil) pirazol-3-carboxamida;

- M.28.5b) N-[4-cloro-2-[(di-2-propil-lambda-4-sulfaniliden)carbamoil]-6-metil-fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil)pirazol-3-carboxamida;
- M.28.5c) N-[4-cloro-2-[(di-2-propil-lambda-4-sulfaniliden)carbamoil]-6-metil-fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil)pirazol-3-carboxamida;
- 5 M.28.5d) N-[4,6-dicloro-2-[(di-2-propil-lambda-4-sulfaniliden)carbamoil]-fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil)pirazol-3-carboxamida;
- M.28.5e) N-[4,6-dicloro-2-[(di-2-propil-lambda-4-sulfaniliden)carbamoil]-fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(difluorometil)pirazol-3-carboxamida;
- 10 M.28.5f) N-[4,6-dibromo-2-[(di-2-propil-lambda-4-sulfaniliden)carbamoil]-fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil)pirazol-3-carboxamida;
- M.28.5g) N-[4-cloro-2-[(di-2-propil-lambda-4-sulfaniliden)carbamoil]-6-ciano-fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil)pirazol-3-carboxamida;
- M.28.5h) N-[4,6-dibromo-2-[(di-2-propil-lambda-4-sulfaniliden)carbamoil]-fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil)pirazol-3-carboxamida;
- 15 M.28.5i) N-[2-(5-Amino-1,3,4-tiadiazol-2-il)-4-cloro-6-metilfenil]-3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1 H-pirazol-5-carboxamida;
- M.28.5j) 3-Cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[2,4-dicloro-6-[[1-(1-ciano-1-metiletil)amino]carbonil]fenil]-1 H-pirazol-5-carboxamida;
- M.28.5k) 3-Bromo-N-[2,4-dicloro-6-(metilcarbamoil)fenil]-1-(3,5-dicloro-2-piridil)-1H-pirazol-5-carboxamida;
- 20 M.28.5l) N-[4-Cloro-2-[[1,1-dimetiletil)amino]carbonil]-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(fluorometoxi)-1 H-pirazol-5-carboxamida;
- o un compuesto seleccionado de
- M.28.6: N-(2-cianopropan-2-il)-N-(2,4-dimetilfenil)-3-yodobenceno-1,2-dicarboxamida; o
- M.28.7: 3-Cloro-N-(2-cianopropan-2-il)-N-(2,4-dimetilfenil)-benceno-1,2-dicarboxamida;
- 25 M.28.8a) 1-(3-Cloro-2-piridinil)-N-[4-ciano-2-metil-6-[(metilamino)carbonil]fenil]-3-[[5-(trifluorometil)-2H-tetrazol-2-il]metil]-1 H-pirazol-5-carboxamida; o
- M.28.8b) 1-(3-Cloro-2-piridinil)-N-[4-ciano-2-metil-6-[(metilamino)carbonil]fenil]-3-[[5-(trifluorometil)-1H-tetrazol-1-il]metil]-1H-pirazol-5-carboxamida;
- 30 M.UN. Compuestos activos insecticidas de modo de acción desconocido o incierto, por ejemplo afidopiropen, afoxolaner, azadiractina, amidoflumet, benzoximato, bifenazato, bromopropilato, chinometionat, criolita, dicofol, flufenimer, flometoquin, fluensulfona, flupiram, flupiradifurona, fluralaner, metoxadiazono, butóxido de piperonilo, piflubumida, piridalilo, pirifluquinazon, sulfoxaflor, tiozafafen, triflumezopirim, o los compuestos
- M.UN.3: 11-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-12-hidroxi-1,4-dioxa-9-azadiespiro[4.2.4.2]-tetradec-11-en-10-ona, o el compuesto
- 35 M.UN.4: 3-(4'-fluoro-2,4-dimetilbifenil-3-il)-4-hidroxi-8-oxa-1-azaespiro[4.5]dec-3-en-2-ona, o el compuesto
- M.UN.5: 1-[2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfonil]fenil]-3-(trifluorometil)-1H-1,2,4-triazol-5-amina, o actividades sobre la base de *Bacillus firmus* (Votivo, I-1582); o un compuesto seleccionado del grupo de M.UN.6, en donde el compuesto se selecciona de M.UN.6a) a M.UN.6k):
- M.UN.6a) (E/Z)-N-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-2,2,2-trifluoro-acetamida;
- 40 M.UN.6b) (E/Z)-N-[1-[(6-cloro-5-fluoro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-2,2,2-trifluoro-acetamida;
- M.UN.6c) (E/Z)-2,2,2-trifluoro-N-[1-[(6-fluoro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]acetamida;
- M.UN.6d) (E/Z)-N-[1-[(6-bromo-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-2,2,2-trifluoro-acetamida;
- M.UN.6e) (E/Z)-N-[1-[(6-cloro-3-piridil)etil]-2-piridiliden]-2,2,2-trifluoro-acetamida;
- M.UN.6f) (E/Z)-N-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-2,2-difluoro-acetamida;
- 45 M.UN.6g) (E/Z)-2-cloro-N-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-2,2-difluoro-acetamida;

- M.UN.6h) (E/Z)-N-[1-[(2-cloropirimidin-5-il)metil]-2-piridiliden]-2,2,2-trifluoro-acetamida;
- M.UN.6i) (E/Z)-N-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-2,2,3,3,3-pentafluoro-propanamida.);
- M.UN.6j) N-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-2,2,2-trifluoro-tioacetamida o del compuesto
- M.UN.6k) N-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-2,2,2-trifluoro-N'-isopropil-acetamidina o los compuestos
- 5 M.UN.8: 8-cloro-N-[2-cloro-5-metoxifenil]sulfonil]-6-trifluorometil]-imidazo[1,2-a]piridin-2-carboxamida; o
- M.UN.9: 4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il]-2-metil-N-(1-oxotietan-3-il)benzamida; o
- M.UN.10: 5-[3-[2,6-dicloro-4-(3,3-dicloroaliloxi)fenoxi]propoxi]-1H-pirazol; o un compuesto seleccionado del grupo de M.UN.11, en donde el compuesto se selecciona de M.UN.11a) a M.UN.11p):
- 10 M.UN.11.a) 3-[benzoil(metil)amino]-N-[2-bromo-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]-6-(trifluorometil) fenil]-2-fluoro-benzamida;
- M.UN.11.b) 3-(benzoilmetilamino)-N-[2-bromo-4-[1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-(trifluorometil)propil]- 6-(trifluorometil)fenil]-2-fluoro-benzamida;
- M.UN.11.c) 3-(benzoilmetilamino)-2-fluoro-N-[2-yodo-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]- 6-(trifluorometil)fenil]-benzamida;
- 15 M.UN.11.d) N-[3-[[[2-yodo-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]-6-(trifluorometil)fenil]amino] carbonil]fenil]-N-metil-benzamida;
- M.UN.11.e) N-[3-[[[2-bromo-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]-6-(trifluorometil)fenil]amino] carbonil]-2-fluorofenil]-4-fluoro-N-metil-benzamida;
- M.UN.11.f) 4-fluoro-N-[2-fluoro-3-[[[2-yodo-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]-6-(trifluorometil)fenil]amino]carbonil]fenil]-N-metil-benzamida;
- 20 M.UN.11.g) 3-fluoro-N-[2-fluoro-3-[[[2-yodo-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]-6-(trifluorometil)fenil]amino]carbonil]fenil]-N-metil-benzamida;
- M.UN.11.h) 2-cloro-N-[3-[[[2-yodo-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]-6-(trifluorometil)fenil]amino]carbonil]fenil]- 3-piridinecarboxamida;
- 25 M.UN.11.i) 4-ciano-N-[2-ciano-5-[[2,6-dibromo-4-[1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-(trifluorometil)propil]fenil] carbamoil]fenil]-2-metil-benzamida;
- M.UN.11.j) 4-ciano-3-[(4-ciano-2-metil-benzoil)amino]-N-[2,6-dicloro-4-[1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-(trifluorometil)propil]fenil]-2-fluoro-benzamida;
- 30 M.UN.11.k) N-[5-[[2-cloro-6-ciano-4-[1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-(trifluorometil)propil]fenil]carbamoil]- 2-ciano-fenil]-4-ciano-2-metil-benzamida;
- M.UN.11.l) N-[5-[[2-bromo-6-cloro-4-[2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-(trifluorometil)etil]fenil]carbamoil]- 2-ciano-fenil]-4-ciano-2-metil-benzamida;
- M.UN.11.m) N-[5-[[2-bromo-6-cloro-4-[1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-(trifluorometil)propil]fenil]carbamoil]- 2-ciano-fenil]-4-ciano-2-metil-benzamida;
- 35 M.UN.11.n) 4-ciano-N-[2-ciano-5-[[2,6-dicloro-4-[1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-(trifluorometil)propil]fenil] carbamoil]fenil]-2-metil-benzamida;
- M.UN.11.o) 4-ciano-N-[2-ciano-5-[[2,6-dicloro-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil]carbamoil] fenil]-2-metil-benzamida;
- 40 M.UN.11.p) N-[5-[[2-bromo-6-cloro-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil]carbamoil]-2-ciano- fenil]-4-ciano-2-metil-benzamida; o un compuesto seleccionado del grupo de M.UN.12, en donde el compuesto se selecciona de M.UN.12a) a M.UN.12m):
- M.UN.12.a) 2-(1,3-Dioxan-2-il)-6-[2-(3-piridinil)-5-tiazolil]-piridina;
- M.UN.12.b) 2-[6-[2-(5-Fluoro-3-piridinil)-5-tiazolil]-2-piridinil]-pirimidina;
- M.UN.12.c) 2-[6-[2-(3-Piridinil)-5-tiazolil]-2-piridinil]-pirimidina;
- 45 M.UN.12.d) N-Metilsulfonil-6-[2-(3-piridil)tiazol-5-il]piridin-2-carboxamida

- M.UN.12.e) N-Metilsulfonil-6-[2-(3-piridil)tiazol-5-il]piridin-2-carboxamida
- M.UN.12.f) N-Etil-N-[4-metil-2-(3-piridil)tiazol-5-il]-3-metiltio-propanamida
- M.UN.12.g) N-Metil-N-[4-metil-2-(3-piridil)tiazol-5-il]-3-metiltio-propanamida
- M.UN.12.h) N,2-Dimetil-N-[4-metil-2-(3-piridil)tiazol-5-il]-3-metiltio-propanamida
- 5 M.UN.12.i) N-Etil-2-metil-N-[4-metil-2-(3-piridil)tiazol-5-il]-3-metiltio-propanamida
- M.UN.12.j) N-[4-Cloro-2-(3-piridil)tiazol-5-il]-N-etil-2-metil-3-metiltio-propanamida
- M.UN.12.k) N-[4-Cloro-2-(3-piridil)tiazol-5-il]-N,2-dimetil-3-metiltio-propanamida
- M.UN.12.l) N-[4-Cloro-2-(3-piridil)tiazol-5-il]-N-metil-3-metiltio-propanamida
- M.UN.12.m) N-[4-Cloro-2-(3-piridil)tiazol-5-il]-N-etil-3-metiltio-propanamida; o el compuesto
- 10 M.UN.13: 2-(4-metoxiiminociclohexil)-2-(3,3,3-trifluoropropilsulfonil)acetónitrilo; o los compuestos
- M.UN.14a) 1-[(6-Cloro-3-piridinil)metil]-1,2,3,5,6,7-hexahidro-5-metoxi-7-metil-8-nitro-imidazo[1,2-a]piridina; o
- M.UN.14b) 1-[(6-Cloropiridin-3-il)metil]-7-metil-8-nitro-1,2,3,5,6,7-hexahidroimidazo[1,2-a]piridin-5-ol; o el compuesto
- M.UN.15: 1-[(2-Cloro-1,3-tiazol-5-il)metil]-3-(3,5-diclorofenil)-9-metil-4-oxo-4H-pirido[1,2-a]pirimidin-1-io-2-oleato.
- 15 Los compuestos comercialmente disponibles del grupo M listados anteriormente pueden encontrarse en The Pesticide Manual, 15ª Edición, C. D. S. Tomlin, British Crop Protection Council (2011), entre otras publicaciones.
- El neonicotinoide cicloxaprida es conocido a partir de los documentos WO2012/069266 y WO2011/06946, y el compuesto neonicotinoide M.4A.2, a veces también denominado Guadipyr, es conocido a partir del documento WO2013/003977 y el compuesto neonicotinoide M.4A.3. (aprobado como paichongding en China) se conoce por WO2010/069266. El análogo de metaflumizona M.22B.1 se describe en el documento CN 10171577 y el análogo M.22B.2 en CN102126994. Las ftalamidas M.28.1 y M.28.2 son ambas conocidas por el documento WO 2007/101540. La antranilamida M.28.3 se ha descrito en el documento WO2005/077934. El compuesto de hidrazida M.28.4 se ha descrito en el documento WO 2007/043677. Las antranilamidas M.28.5a) a M.28.5h) se pueden preparar como se describe en los documentos WO 2007/006670, WO2013/024009 y WO2013/024010, el compuesto de antranilamida M.28.5i) se describe en el documento WO2011/085575, el compuesto M.28.5j) en el documento WO2008/134969, el compuesto M.28.5k) en el documento US2011/046186 y el compuesto M.28.5l) en el documento WO2012/034403. Los compuestos de diamida M.28.6 y M.28.7 se pueden encontrar en CN102613183. Los compuestos de antranilamida M.28.8a) y M.28.8b) son conocidos por WO2010/069502.
- 20 El derivado de quinolina flometoquin se muestra en el documento WO2006/013896. Los compuestos de aminofuranona flupiradifurona son conocidos por el documento WO 2007/115644. El compuesto sulfoximina sulfoxaflor se conoce por el documento WO2007/149134. Del grupo de los piretroides se conoce la momfluorotrina a partir del documento US 6908945 y la heptaflutrina del documento WO10133098. El compuesto oxadiazolona metoxadiazona se puede encontrar en JP13/166707. El pirazol acaricida piflubumida se conoce por el documento WO2007/020986. Los compuestos de isoxazolina se han descrito en las siguientes publicaciones: fluralaner en WO2005/085216, afoxolaner en WO2009/002809 y en WO2011/149749 y el compuesto de isoxazolina M.UN.9 en WO2013/050317. El derivado de piriropeno afidopiropeno se ha descrito en el documento WO 2006/129714. El nematocida tioxazafen se ha divulgado en el documento WO09023721 y nematocida fluopirma en WO2008126922, mezclas nematocidas que comprenden flupiram en WO2010108616. El compuesto de triflumezopirim se describió en WO2012/092115.
- 30 El derivado de cetoenol cíclico sustituido con espiroketal M.UN.3 se conoce por el documento WO2006/089633 y el derivado de cetoenol espirocíclico sustituido con bifenilo M.UN.4 del documento WO2008/067911. El triazoilfenilsulfuro M.UN.5 se ha descrito en el documento WO2006/043635, y agentes de control biológico basados en bacillus firmus en WO2009/124707.
- 35 Los compuestos M.UN.6a) a M.UN.6i) listados en M.UN.6 se han descrito en WO2012/029672 y los compuestos M.UN.6j) y M.UN.6k) en WO2013129688. El compuesto nematociclado M.UN.8 en WO2013/055584 y el análogo de tipo piridililo M.UN.10 en WO2010/060379. Los compuestos de carboxamida M.UN.11.a) a M.UN.11.h) se pueden preparar como se describe en el documento WO 2010/018714 y se describen la carboxamida M.UN.11.i) a M.UN.11.p) en WO2010/127926. Los piridiltiazoles M.UN.12.a) a M.UN.12.c) se conocen a partir de los documentos WO2010/006713, M.UN.12.c) y M.UN.12.d) WO2012000896 y M.UN.12 .f) a M.UN.12.m) en WO2010129497. El compuesto de malononitrilo M.UN.13 se describió en WO2009/005110. Los compuestos M.UN.14a) y M.UN.14b) son conocidos por el documento WO2007/101369. El compuesto M.UN.15 se puede encontrar en WO13192035.
- 40
- 45
- 50

En otra realización de la invención, los compuestos de fórmula (I), o sus estereoisómeros, sales, tautómeros y N-óxidos, también pueden aplicarse con fungicidas como compuesto II.

La siguiente lista F de sustancias activas, en conjunción con la que pueden utilizarse los compuestos de acuerdo con la invención, pretende ilustrar las combinaciones posibles pero no las limita:

5 F.I) Inhibidores de la respiración

FI-1) Inhibidores del complejo III en sitio Qo: estrobilurinas: azoxistrobina, coumetoxistrobina, coumoxistrobina, dimoxistrobina, enestroburina, fluoxastrobina, cresoxim-metilo, metominostrobin, orisastrobina, picoxistrobina, piraclostrobina, pirametostrobina, piraxostrobin, piribencarb, triclopircarb/clorodincarb, trifloxistrobina, metil éster del ácido 2-[2-(2,5-dimetil-fenoximetil)-fenil]-3-metoxi-acrílico y 2(2-(3-(2,6-diclorofenil)-1-metil-alilidenoaminoximetil)fenil)-2- metoxiimino-N metilacetamida;

oxazolindionas e imidazolinonas: famoxadona, fenamidona;

F.I-2) Inhibidores del complejo II (por ejemplo carboxamidas):

carboxanilidas: benodanil, benzovindiflupir, bixafen, boscalid, carboxina, fenfuram, fenhexamida, fluopiram, flutolanilo, furametpir, isopirazam, isotianil, mepronil, oxicarboxin, penflufeno, pentiopirad, sedaxano, teclotalam, tifulzamida, tiadinilo, 2-amino-4-metil-tiazol-5 carboxanilida, N-(3',4',5'trifluorobifenil-2il)-3-difluorometil-1-metil-1 H-pirazol-4 carboxamida, (fluxapi-roxad), N-(4'-trifluorometiltiobifenil- 2-il)-3 difluorometil-1-metil-1 H pirazol-4-carboxamida, N-(2-(1,3,3-trimetil-butyl)-fenil)-1,3- dimetil-5 fluoro-1 H-pirazol-4 carboxamida, 3-(difluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetilindan-4- il)pirazol-4-carboxamida, 3-(trifluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida, 1,3-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida, 3-(trifluorometil)-1,5-dimetil- N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida, 3-(difluorometil)-1,5-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan- 4-il)pirazol-4-carboxamida, 1,3,5-trimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida, 3-(difluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida, 3-(trifluorometil)-1- metil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida, 1,3-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4- il)pirazol-4-carboxamida, 3-(trifluorometil)-1,5-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida, 3-(difluorometil)-1,5-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida, 1,3,5-trimetil- N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida;

F.I-3) Inhibidores del complejo III en sitio Qi: ciazofamid, amisulbrom, [(3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[(3-acetoxi-4- metoxi-piridin-2-carbonil)amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-il] 2-metilpropanoato, [(3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[[3-(acetoximetoxi)-4-metoxi-piridin-2-carbonil]amino]-6-metil-4,9-dioxo- 1,5-dioxonan-7-il] 2-metilpropanoato, [(3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[(3-isobutoxicarboniloxi-4-metoxi-piridin- 2-carbonil)amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-il] 2-metilpropanoato, [(3S,6S,7R,8R)-8-bencil- 3-[[3-(1,3-benzodioxol-5-ilmetoxi)-4-metoxi-piridin-2-carbonil]amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan- 7-il] 2-metilpropanoato, 3S,6S,7R,8R)-3-[[[(3-hidroxi-4-metoxi-2-piridinil)carbonil]amino]-6-metil-4,9- dioxo-8-(fenilmetil)-1,5-dioxonan-7-ilo 2-metilpropanoato;

F.I-4) Otros inhibidores de la respiración (complejo I, desacopladores)

diflumetorim; (5,8-difluoroquinazolin-4-il)-{2-[2-fluoro- 4-(4-trifluorometilpiridin-2-iloxi)-fenil]-etil}-amina; tecnazen; ametocetradin; siltiofam; derivados de nitrofenilo: binapacril, dinobuton, dinocap, fluazinam, ferimzona, nitrtal-isopropilo, e incluyendo compuestos organometálicos: sales de fentina, tales como fentin-acetato, cloruro de fentina o hidróxido de fentina;

F.II) Inhibidores de la biosíntesis de esteroles (fungicidas SBI)

F.II-1) inhibidores de desmetilasa C14 (fungicidas DMI, por ejemplo, triazoles, imidazoles)

40 triazoles: azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanil, paclobutrazol, penconazol, propiconazol, protioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefón, triadimenol, triticonazol, uniconazol; 1-[rel-(2S;3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)- oxiranilmetil]-5-tiocianato-1H-[1,2,4]triazol, 2-[rel-(2S;3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)- oxiranilmetil]-2H-[1,2,4]triazol-3-tiol;

45 imidazoles: imazalil, pefurazoato, oxpoconazol, procloraz, triflumizol; pirimidinas, piridinas y piperazinas: fenarimol, nuarimol, pirifenox, triforina, 1-[rel-(2S;3R)-3-(2- clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)-oxiranilmetil]-5-tiocianato-1 H-[1,2,4]triazol, 2-[rel-(2S;3R)-3-(2- clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)-oxiranilmetil]-2H-[1,2,4]triazol-3-tiol;

F.II-2) inhibidores de reductasa Delta14 (Aminas, por ejemplo, morfollinas, piperidinas)

morfollinas: aldimorf, dodemorf, dodemorf-acetato, fenpropimorf, tridemorf; piperidinas: fenpropidina, piperalin;

50 espiroquetalaminas: espiroxamina;

F.II-3) inhibidores de 3-ceto reductasa: hidroxianilidas: fenhexamida;

F.III) Inhibidores de la síntesis de ácido nucleico

- F.III-1) ARN, síntesis de ADN
- fenilamidas o fungicidas aminoácidos acilo: benalaxil, benalaxil-M, kiralaxil, metalaxil, metalaxil-M (mefenoxam), ofurace, oxadixilo;
- isoxazoles e iosotiazolonas: himexazol, octilina;
- 5 F.III-2) inhibidores de la topoisomerasa de ADN: ácido oxolínico;
- F.III-3) metabolismo de nucleótidos (por ejemplo, adenosina-desaminasa)
- hidroxi (2-amino) -pirimidinas: bupirinato;
- F.IV) Inhibidores de la división celular y o citoesqueleto
- 10 F.IV-1) Inhibidores de tubulina: bencimidazoles y tiofanatos: benomilo, carbendazim, fuberidazol, tiabendazol, tiofanato-metilo;
- triazolopirimidinas: 5-cloro-7 (4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)-[1,2,4] triazolo[1,5 a] pirimidina
- F.IV-2) Otros inhibidores de división celular benzamidas y fenil acetamidas: dietofencarb, etaboxam, pencicuron, fluopicolide, zoxamida;
- F.IV-3) inhibidores de actina: benzofenonas: metrafenona; pirofenona;
- 15 FV) inhibidores de la síntesis de aminoácidos y proteínas
- FV-1) Inhibidores de la síntesis de metionina (anilino-pirimidinas)
- anilino-pirimidinas: ciprodinil, mepanipirim, nitrapirina, pirimetanilo;
- FV-2) inhibidores de la síntesis de proteínas (anilino-pirimidinas)
- 20 antibióticos: blastidina-S, kasugamicina, clorhidrato-hidrato de kasugamicina, mildiomicina, estreptomicina, oxitetraciclina, polioxina, validamicina A;
- F.VI) Inhibidores de la transducción de señal
- F.VI-1) MAP / inhibidores de la histidina quinasa (por ejemplo anilino-pirimidinas)
- dicarboximidas: fluoroimid, iprodiona, procimidona, vinclozolina;fenilpirroles: fenciclonil, fludioxonil;
- F.VI-2) inhibidores de la proteína G: quinoleínas: quinoxifen;
- 25 F.VII) inhibidores de la síntesis de lípidos y de membrana
- F.VII-1) Inhibidores de la biosíntesis de fosfolípidos
- compuestos organofosforados: edifenfos, iprobenfos, pirazofos;ditiolanos: isoprotilano;
- F.VII-2) Peroxidación de lípidos
- hidrocarburos aromáticos: diclorán, quintoceno, tecnaceno, tolclofos-metilo, bifenilo, cloroneb, etridiazol;
- 30 F.VII-3) amidas de ácido carboxilo (fungicidas CAA)
- amidas de ácido cinámico o mandélico: dimetomorf, flumorf, mandiproamid, pirimorf; carbamatos de valinamida: bentiavalicarb, iprovalicarb, piribencarb, valifenalato y (4-fluorofenil) éster del ácido N-(1-(1-(4-ciano-fenil)etanosulfonil)but-2-il) carbámico;
- F.VII-4) Compuestos que afectan la permeabilidad de membrana celular y acides grasos: 1-[4-[4-[5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, carbamatos: propamocarb, clorhidrato de propamocarb,
- 35 F.VII-5) Inhibidores de la amida hidrolasa de ácidos grasos: 1-[4-[4-[5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1 H-pirazol-1-il]etanona;
- F.VIII) Inhibidores con Acción en Multi Sitio
- 40 F.VIII-1) Sustancias inorgánicas activas: mezcla de Burdeos, acetato de cobre, hidróxido de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre básico, azufre;

F.VIII-2) tio- y ditiocarbamatos: ferbam, mancozeb, maneb, metam, metasulfocarb, metiram, propineb, tiram, zineb, ziram;

F.VIII-3) compuestos organoclorados (por ejemplo ftalimidas, sulfamidas, cloronitrilos):

5 anilazina, clorotalonil, captafol, captan, folpet, diclofluanida, diclorofeno, flusulfamida, hexaclorobenceno, pentaclorfenol y sus sales, ftalida, toliifluanida, N-(4-cloro-2-nitrofenil)-N-etil-4-metil-bencenosulfonamida;

F.VIII-4) Guanidinas y otros, guanidina, dodina, base libre de dodina, guazatina, guazatina-acetato, iminoctadina, iminoctadina-triacetato, iminoctadina-tris (albesilato); 2,6-dimetil-1 H,5H-[1,4]ditiino[2,3-c:5,6- c']dipirrol-1,3,5,7(2H,6H)-tetraona;

F.VIII-5) Atraquinonas: ditiánón;

10 F.IX) Inhibidores de la síntesis de la pared celular

F.IX-1) Inhibidores de la síntesis de glucano: validamicina, polioxina B;

F.IX-2) Inhibidores de la síntesis de melanina: piroquilon, triciclazol, carpropamida, diciclotmet, fenoxanilo;

F.X) Inductores de defensa de planta

FX-1) Ruta del ácido salicílico: acibenzolar-S-metilo;

15 FX-2) Otros: probenazol, isotianilo, tiadinilo, prohexadiona-calcio;

fosfonatos: fosetil, fosetil-aluminio, ácido fosforoso y sus sales;

F.XI) Modo de acción desconocido:

20 bronopol, quinometionato, ciflufenamida, cimoxanil, dazomet, debacarb, diclomezina, difenzoquat, difenzoquat-metilsulfato, difenilamina, fempirazamina, flumetover, flusulfamida, flutianil, metasulfocarb, nitrapirina, nitrotal-isopropilo, oxatiapiprolina, Oxin-cobre, proquinazid, tebufloquin, teclotalam, triazóxido, 2-butoxi-6-yodo-3-propilcromen-4-ona, N-(ciclopropilmetoxiimino-(6-difluorometoxi-2,3-difluoro-fenil)metil)-2-fenil acetamida, N'-(4-(4-cloro-3-trifluorometil-fenoxi)-2,5-dimetil-fenil)-N-etil-N metil formamidina, N'(4-(4-fluoro-3-trifluorometil-fenoxi)-2,5-dimetil-fenil)-N-etil-N-metil formamidina, N'(2-metil-5-trifluorometil-4-(3-trimetil-propoxi)-fenil)-N-etil-N-metil formamidina, N'-(5-difluorometil-2 metil-4- (3-trimetil-propoxi)-fenil)-N-etil-N-metil formamidina, metil-(1,2,3,4-
25 tetrahidro-naftalen-1-il)-amida del ácido 2-{1-[2-(5-metil-3-trifluorometil-pirazol-1-il)-acetil]-piperidin-4-il}-tiazol-4-carboxílico, metil- 4-carboxílico (R) -1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-il-amida del ácido 2-{1-[2- (5-metil-3-trifluorometil-pirazol-1-il) acetil] piperidin-4-il} -tiazole-carboxílico, 6 tert-butil-8- fluoro-2,3-dimetil-quinolin-4-il éster del ácido metoxi acético y N-metil-2-{1-[(5-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-1-il) acetil]-piperidin-4-il}-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il]-4-tiazolcarboxamida, 3-[5-(4-cloro-fenil)-2,3-dimetil-isoxazolidin-3 il]-piridina, pirisoxazol, S-alil éster de ácido 5-
30 amino-2-isopropil-3-oxo-4-orto-toluil-2,3-dihidro-pirazol-1 carbotoico, amida del ácido N-(6-metoxi-piridin-3-il) ciclopropanocarboxílico, 5-cloro-1 (4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-2-metil-1 H-benzoimidazol, 2-(4-cloro-fenil) -N- [4-(3,4-dimetoxi-fenil) isoxazol-5-il]-2-prop-2-iniloxi-acetamida;

F.XI) reguladores de crecimiento:

35 ácido abscísico, amidoclor, ancimidol, 6-bencilaminopurina, brasinolida, butralina, clormequat (cloruro de clormequat), cloruro de colina, ciclanilida, daminozida, dikegulac, dimetipin, 2,6-dimetilpuridina, etefón, flumetralina, flurprimidol, flutiacet, forclorfenurón, ácido giberélico, inabenfida, ácido indol-3-acético, hidrazida maleica, mefluidida, mepiquat (cloruro de mepiquat), ácido naftalenacético, N 6 benciladenina, paclobutrazol, prohexadiona (prohexadion-calcio), prohidrojasmon, tidiazurón, triapentenol, tributil fosforotriato, ácido 2,3,5 tri yodobenzoico, trinexapac-etilo y uniconazol;

40 F.XII) Agentes de control biológico

Ampelomyces quisqualis (por ejemplo AQ 10® de Intrachem Bio GmbH & Co. KG, Alemania), *Asper-gillus flavus* (por ejemplo AFLAGUARD® de Syngenta, CH), *Aureobasidium pullulans* (por ejemplo BOTECH-TOR® de bio-ferm GmbH, Alemania), *Bacillus pumilus* (por ejemplo NRRL Accession No. B-30087 en SONATA® y BALLAD® Plus de AgraQuest Inc., EE.UU), *Bacillus subtilis* (por ejemplo isoleato NRRL-Nr. B-21661 en RHAPSODY®, SERENADE® MAX y SERENADE ® ASO de AgraQuest Inc., EE.UU), *Bacillus subtilis* var. *amyloliquefaciens* FZB24 (por ejemplo TAEGRO® de Novozyme Biologi-cals, Inc., EE.UU), *Candida oleophila* I-82 (por ejemplo ASPIRE® de Ecogen Inc., EE.UU), *Candida sai-toana* (por ejemplo BIOCORE® (en mezcla con lisozima) y BIOCOAT® de Micro Flo Company, EE.UU (BASF SE) y Arysta), Chitosan (por ejemplo ARMOUR-ZEN de BotriZen Ltd., NZ), *Clonosta-chys rosea f. catenulata*, también denominado *Gliocladium catenulatum* (por ejemplo isoleato J1446: PRESTOP® de Verdera, Finlandia), *Coniothyrium minitans* (por ejemplo CONTANS® de Prophyta, Alemania), *Cryphonectria parasitica* (por ejemplo *Endothia parasitica* de CNICM, Francia), *Cryptococcus albidus* (por ejemplo YIELD PLUS® de Anchor Bio-Technologies, Sur África), *Fusarium oxisporum* (por ejemplo BIOFOX® de S.I.A.P.A., Italia, FUSACLEAN® de Natural

Plant Protection, Francia), *Metschnikowia fructicola* (por ejemplo SHEMER® de Agrogreen, Israel), *Microdochium dimerum* (por ejemplo ANTIBOT® de Agrauxine, Francia), *Phlebiopsis gigantea* (por ejemplo ROTSOP® de Verdera, Finlandia), *Pseudozyma flocculosa* (por ejemplo SPORODEX® de Plant Products Co. Ltd., Canada), *Pythium oligandrum* DV74 (por ejemplo POLYVERSUM® de Remeslo SSRO, Biopreparaty, Rep. Checa), *Reynoutria sachlinensis* (por ejemplo REGALIA® de Marrone Biolnnovations, EE.UU), *Talaromyces flavus* V117b (por ejemplo PROTUS® de Prophyta, Alemania), *Trichoderma asperellum* SKT-1 (por ejemplo ECO-HOPE® de Kumiai Chemical Industry Co., Ltd., Japón), *T. atroviride* LC52 (por ejemplo SENTINEL® de Agrimm Technologies Ltd, NZ), *T. harzianum* T-22 (por ejemplo PLANTSHIELD® der Firma BioWorks Inc., EE.UU), *T. harzianum* TH 35 (por ejemplo ROOT PRO® de Mycontrol Ltd., Israel), *T. harzianum* T-39 (por ejemplo TRICHODEX® y TRICHODERMA 2000® de Mycontrol Ltd., Israel y Makhteshim Ltd., Israel), *T. harzianum* y *T. viride* (por ejemplo TRICHOPEL de Agrimm Technologies Ltd, NZ), *T. harzianum* ICC012 y *T. viride* ICC080 (por ejemplo REMEDIER® WP de Isa-gro Ricerca, Italia), *T. polysporum* y *T. harzianum* (por ejemplo BINAB® de BINAB Bio-Innovation AB, Suecia), *T. stromaticum* (por ejemplo TRICOVAB® de C.E.P.L.A.C., Brasil), *T. virens* GL-21 (por ejemplo SOILGARD® de Certis LLC, EE.UU), *T. viride* (por ejemplo TRIECO® de Ecosense Labs. (India) Pvt. Ltd., Indien, BIO-CURE® F de T. Stanes & Co. Ltd., India), *T. viride* TV1 (por ejemplo T. viride TV1 de Agribiotec srl, Italia), *Ulocladium oudemansii* HRU3 (por ejemplo BOTRY-ZEN® de Botry-Zen Ltd, NZ).

Los compuestos II comercialmente disponibles del grupo F listados anteriormente pueden encontrarse en The Pesticide Manual, 15ª edición, C. D. S. Tomlin, British Crop Protection Council (2011), entre otras publicaciones. Su preparación y su actividad contra hongos nocivos es conocida (cf: <http://www.alanwood.net/pesticides/>); estas sustancias están comercialmente disponibles. También se conocen los compuestos descritos por la nomenclatura IUPAC, su preparación y su actividad fungicida (cf. Can. J. Plant Sci. 48(6), 587-94, 1968; EP A 141 317; EP-A 152 031; EP-A226 917; EP A 243 970; EP A 256 503; EP-A 428 941; EP-A 532 022; EP-A 1 028 125; EP-A 1 035 122; EP A 1 201 648; EP A 1 122 244, JP 2002316902; DE 19650197; DE 10021412; DE 102005009458; US 3,296,272; US 3,325,503; WO 98/46608; WO 99/14187; WO 99/24413; WO 99/27783; WO 00/29404; WO 00/46148; WO 00/65913; WO 01/54501; WO 01/56358; WO 02/22583; WO 02/40431; WO 03/10149; WO 03/11853; WO 03/14103; WO 03/16286; WO 03/53145; WO 03/61388; WO 03/66609; WO 03/74491; WO 04/49804; WO 04/83193; WO 05/120234; WO 05/123689; WO 05/123690; WO 05/63721; WO 05/87772; WO 05/87773; WO 06/15866; WO 06/87325; WO 06/87343; WO 07/82098; WO 07/90624, WO 11/028657).

Aplicaciones

La plaga animal, es decir, los insectos, arácnidos y nemátodos, la planta, el suelo o el agua en los que crece la planta, pueden ponerse en contacto con los presentes compuestos de fórmula I o composición que los contengan por cualquier método de aplicación conocido en la técnica. Como tal, "poner en contacto" incluye tanto el contacto directo (aplicación de los compuestos/composiciones directamente sobre la plaga animal o planta - típicamente al follaje, tallo o raíces de la planta) y contacto indirecto (aplicación de los compuestos/composiciones al locus de la plaga animal o planta).

Los compuestos de fórmula I o las composiciones plaguicidas que los comprenden pueden usarse para proteger plantas y cultivos en crecimiento contra ataque o infestación por plagas animales, especialmente insectos, acáridos o arácnidos poniendo en contacto la planta/cultivo con una cantidad efectiva como pesticidas de compuestos de fórmula I. El término "cultivo" se refiere tanto a los cultivos en crecimiento como en cosecha.

Los compuestos de la presente invención y las composiciones que los contienen son particularmente importantes en el control de una multitud de insectos en diversas plantas cultivadas, tales como cereales, cultivos de raíces, cultivos oleaginosos, hortalizas, especias, plantas ornamentales, por ejemplo semillas de trigo durum y de otros trigos, cebada, avena, centeno, maíz (maíz de mazorca/maíz de azúcar/maíz dulce y de campo), soja, cultivos oleaginosos, crucíferos, algodón, girasoles, plátanos, arroz, colza, nabo, remolacha de azúcar, tomates, puerros, calabaza/calabacín, col, lechuga iceberg, pimienta, pepinos, melones, especies de Brassica, melones, judías, guisantes, ajo, cebollas, zanahorias, plantas tuberosas tales como las patatas, caña de azúcar, tabaco, uvas, petunias, geranio/pelargonios, margaritas y balsaminas.

Los compuestos de la presente invención se emplean como tales o en forma de composiciones para tratar los insectos o las plantas, materiales de propagación de plantas, tales como semillas, suelo, superficies, materiales o habitaciones que se van a proteger del ataque insecticida con una cantidad efectiva como insecticida de los compuestos activos. La aplicación puede llevarse a cabo tanto antes como después de la infección de las plantas, materiales de propagación de la planta, tales como semillas, suelo, superficies, materiales o habitaciones por los insectos.

La presente invención también incluye un método para combatir las plagas animales que comprende poner en contacto las plagas animales, su hábitat, terrenos de crianza, suministro de alimento, plantas cultivadas, semilla, suelo, área, material o entorno en el que las plagas animales crecen o pueden crecer, o los materiales, plantas, semillas, suelos, superficies o espacios que se van a proteger contra ataque o infestación de animales con una cantidad efectiva como pesticida de una mezcla de al menos un compuesto activo I.

Además, las plagas animales pueden controlarse poniendo en contacto la plaga objetivo, su suministro de alimento, hábitat, terreno de crianza o su locus con una cantidad efectiva como pesticida de compuestos de fórmula I. Como tal,

la aplicación puede llevarse a cabo antes o después de la infección del locus, los cultivos en crecimiento o los cultivos cosechados, por la plaga.

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

5 Los compuestos de fórmula I pueden usarse también para proteger plantas en crecimiento contra ataque o infestación por plagas poniendo en contacto la planta con una cantidad efectiva como pesticida de compuestos de fórmula I. Como tal, "poner contacto" incluye tanto contacto directo (aplicación de los compuestos/composiciones directamente sobre la plaga y/o la planta - típicamente al follaje, tallo o raíces de la planta) y contacto indirecto (aplicación de los compuestos/composiciones al locus de la plaga y/o planta).

10 "Locus" significa un hábitat, terreno de crianza, planta, semilla, suelo, área, material o ambiente en el cual una plaga o parásito está creciendo o puede crecer.

15 El término "material de propagación de plantas" debe entenderse que denota todas las partes generativas de la planta tales como semillas y material vegetativo vegetal tal como cortes y tubérculos (por ejemplo, patatas), que pueden usarse para la multiplicación de la planta. Esto incluye semillas, raíces, frutas, tubérculos, bulbos, rizomas, brotes, retoños y otras partes de las plantas. También se pueden incluir las plántulas y plantas jóvenes que se trasplantan después de la germinación o después de la emergencia del suelo. Estos materiales de propagación de plantas pueden ser tratados profilácticamente con un compuesto de protección vegetal ya sea antes o durante la siembra o trasplante.

20 El término "plantas cultivadas" debe entenderse que incluye plantas que han sido modificadas por reproducción, mutagénesis o ingeniería genética. Las plantas genéticamente modificadas son plantas, cuyo material genético ha sido modificado por el uso de técnicas de ADN recombinante que bajo circunstancias naturales no pueden obtenerse fácilmente mediante cruzamientos, mutaciones o recombinación natural. Típicamente, uno o más genes han sido integrados en el material genético de una planta genéticamente modificada para mejorar ciertas propiedades de la planta. Tales modificaciones genéticas también incluyen, pero no se limitan a, modificación post-transicional
25 direccionada de proteínas (oligo- o polipéptidos) poli por ejemplo por glicosilación o adiciones de polímero tales como unidades estructurales preniladas, acetiladas o farnesiladas o unidades estructurales PEG (por ejemplo, divulgado en Biotechnol Prog. 2001 Jul-Aug;17(4):720-8., Protein Eng Des Sel. 2004 Jan;17(1):57-66, Nat Protoc. 2007;2(5):1225-35., Curr Opin Chem Biol. 2006 Oct;10(5):487-91. Epub 2006 Aug 28., Bio-materials. 2001 Mar;22(5):405-17, Bioconjug Chem. 2005 Jan-Feb;16(1):113-21).

30 El término "plantas cultivadas" debe entenderse también que incluye plantas que se han hecho tolerantes a aplicaciones de clases específicas de herbicidas, tales como inhibidores de hidroxifenilpiruvato dioxigenasa (HPPD); Inhibidores de la acetolactato sintasa (ALS), tales como sulfonil ureas (véase, por ejemplo, US 6,222,100, WO 01/82685, WO 00/26390, WO 97/41218, WO 98/02526, WO 98/02527, WO 04/106529, WO 05/20673, WO 03/14357, WO 03/13225, WO 03/14356, WO 04/16073) o imidazolinonas (véase por ejemplo US 6,222,100, WO 01/82685, WO 00/26390, WO 97/41218, WO 98/02526, WO 98/02527, WO 04/106529, WO 05/20673, WO 03/14357, WO 03/13225, WO 03/14356, WO 04/16073); inhibidores de enolpiruvil-shikimato-3-fosfato sintasa (EPSPS), tales como glifosato (véase, por ejemplo, WO 92/00377); glutamina sintetasa (GS), tales como glufosinato (véase por ejemplo EP-A-0242236, EP-A-242246) o herbicidas de oxinilo (véase, por ejemplo, US 5,559,024) como resultado de métodos convencionales de reproducción o ingeniería genética. Varias plantas cultivadas se han hecho tolerantes a los herbicidas por métodos convencionales de reproducción (mutagénesis), por ejemplo, la colza de verano Clearfield®
35 (Canola) que es tolerante a las imidazolinonas, por ejemplo, imazamox. Se han utilizado métodos de ingeniería genética para producir plantas cultivadas tales como soja, algodón, maíz, remolacha y colza, tolerantes a herbicidas, tales como glifosato y glufosinato, algunos de los cuales están disponibles comercialmente bajo los nombres comerciales RoundupReady® (glifosato) y LibertyLink® (glufosinato).

40 El término "plantas cultivadas" debe entenderse también que incluye plantas que son mediante el uso de técnicas de ADN recombinante capaces de sintetizar una o más proteínas insecticidas, especialmente aquellas conocidas del género bacteriano Bacillus, particularmente de Bacillus thuringiensis, tales como delta-endotoxinas por ejemplo CryIA (b), CryIA (c), CryIF, CryIF(a2), CryIIA(b), CryIIIA, CryIIIB(b1) o Cry9c; proteínas insecticidas vegetativas (VIP), por ejemplo VIP1, VIP2, VIP3 o VIP3A; proteínas insecticidas de bacterias que colonizan nematodos, por ejemplo Photorhabdus spp. o Xenorhabdus spp.; toxinas producidas por animales, tales como toxinas de escorpión, toxinas de arácnido, toxinas de avispas u otras neurotoxinas específicas de insectos; toxinas producidas por hongos, tales toxinas de Streptomyces, lectinas vegetales, tales como lectinas de guisantes o de cebada; aglutininas; inhibidores de proteinasa, tales como inhibidores de tripsina, inhibidores de serina proteasa, inhibidores de patatina, cistatina o papaína; proteínas inactivadoras de ribosomas (RIP), tales como ricina, maíz-RIP, abrina, luffin, saporina o bryodin; enzimas del metabolismo de los esteroides, tales como la 3-hidroxiesteroide oxidasa, la ecdiesteroide-IDP-glicosil-transferasa, las colesterol oxidadas, los inhibidores de la ecdisona o la HMG-CoA-reductasa; bloqueadores de canales iónicos, tales como bloqueadores de canales de sodio o de calcio; hormona juvenil esterasa; receptores hormonales diuréticos (receptores de helicokinina); estilben sintasa, bibencil sintasa, quitinasas o glucanasas. En el contexto de la presente invención, estas proteínas o toxinas insecticidas deben entenderse expresamente también como pre-toxinas, proteínas híbridas, proteínas truncadas o de otra mansra modificadas. Las proteínas híbridas se caracterizan por una
45 50 55 60 nueva combinación de dominios proteicos, (véase, por ejemplo, WO 02/015701). Ejemplos adicionales de tales toxinas

- o plantas genéticamente modificadas capaces de sintetizar tales toxinas se divulgan, por ejemplo, en los documentos EP-A 374 753, WO 93/007278, WO 95/34656, EP-A 427 529, EP-A 451 878, WO 03/018810 y WO 03/052073. Los métodos para producir tales plantas genéticamente modificadas son generalmente conocidos por el experto en la técnica y se describen, por ejemplo, en las publicaciones mencionadas anteriormente. Estas proteínas insecticidas contenidas en las plantas genéticamente modificadas imparten a las plantas productoras de estas proteínas protección contra plagas dañinas de ciertos grupos taxonómicos de artrópodos, particularmente a escarabajos (Coleoptera), moscas (Diptera), mariposas y polillas (Lepidoptera) y a nematodos parásitos vegetales (Nematoda).
- El término "plantas cultivadas" debe entenderse también que incluye plantas que son mediante el uso de técnicas de ADN recombinante capaces de sintetizar una o más proteínas para aumentar la resistencia o tolerancia de esas plantas a patógenos bacterianos, virales o fúngicos. Ejemplos de tales proteínas son las así llamadas "proteínas relacionadas con la patogénesis" (proteínas PR, véase, por ejemplo, EP-A 0 392 225), genes de resistencia a enfermedades de plantas (por ejemplo cultivares de papa, que expresan genes de resistencia que actúan contra *Phytophthora infestans* derivados de la patata silvestre mexicana *Solanum bulbocastanum*) o T4-lisozima (por ejemplo, cultivares de papa capaces de sintetizar estas proteínas con mayor resistencia contra bacterias como *Erwinia amylovora*). Los métodos para producir tales plantas genéticamente modificadas son generalmente conocidos por el experto en la técnica y se describen, por ejemplo, en las publicaciones mencionadas anteriormente.
- El término "plantas cultivadas" debe entenderse también que incluye plantas que son mediante el uso de técnicas de ADN recombinante capaces de sintetizar una o más proteínas para aumentar la productividad (por ejemplo, producción de masa biológica, rendimiento de grano, contenido de almidón, contenido de aceite o contenido de proteína), tolerancia a la sequía, salinidad u otros factores ambientales que limitan el crecimiento o la tolerancia a las plagas y a los patógenos fúngicos, bacterianos o virales de esas plantas.
- El término "plantas cultivadas" debe entenderse también que incluye plantas que contienen mediante el uso de técnicas de ADN recombinante una cantidad modificada de sustancias de contenido o nuevas sustancias de contenido, específicamente para mejorar la nutrición humana o animal, por ejemplo cultivos oleaginosos que producen ácidos grasos omega-3 de cadena larga que promueven la salud o ácidos grasos omega-9 insaturados (por ejemplo, colza Nexera®).
- El término "plantas cultivadas" debe entenderse también que incluye plantas que contienen mediante el uso de técnicas de ADN recombinante una cantidad modificada de sustancias de contenido o nuevas sustancias de contenido, específicamente para mejorar la producción de materia prima, por ejemplo patatas que producen cantidades incrementadas de amilopectina (por ejemplo, patata Amflora®).
- En general, "cantidad efectiva como plaguicida" significa la cantidad de ingrediente activo necesaria para lograr un efecto observable en el crecimiento, incluyendo los efectos de necrosis, muerte, retraso, prevención y eliminación, destrucción o de otra manera la disminución de la ocurrencia y actividad del organismo objetivo. La cantidad efectiva como pesticida puede variar para los diversos compuestos/composiciones utilizados en la invención. Una cantidad efectiva como pesticida de las composiciones también variará de acuerdo con las condiciones prevalentes tales como el efecto y la duración pesticida deseados, el tiempo, las especies objetivo, el locus, el modo de aplicación y similares.
- En el caso del tratamiento del suelo o de la aplicación en el lugar o nido de las plagas, la cantidad de ingrediente activo oscila entre 0,0001 y 500 g por 100 m², preferiblemente entre 0,001 y 20 g por 100 m².
- Las tasas de aplicación habituales en la protección de materiales son, por ejemplo, de 0,01 g a 1000 g de compuesto activo por m² de material tratado, deseablemente de 0,1 g a 50 g por m².
- Las composiciones insecticidas para uso en la impregnación de materiales contienen típicamente de 0,001 a 95 % en peso, preferiblemente de 0,1 a 45 % en peso, y más preferiblemente de 1 a 25 % en peso de al menos un repelente y/o insecticida.
- Para el uso en el tratamiento de plantas de cultivo, la tasa de aplicación de los ingredientes activos de esta invención puede estar en el rango de 0,1 g a 4000 g por hectárea, deseablemente de 25 g a 600 g por hectárea, más deseablemente de 50 g a 500 g por hectárea.
- Los compuestos de fórmula I son efectivos tanto a través del contacto (a través de la tierra, vidrio, pared, mosquiteros, alfombras, partes de plantas o partes de animales) como por ingestión (cebo, o parte de planta).
- Los compuestos de la invención también pueden aplicarse contra plagas de insectos que no afectan cultivos, tales como hormigas, termitas, avispas, moscas, mosquitos, grillos o cucarachas. Para el uso contra dichas plagas que no afectan cultivos, los compuestos de fórmula I se utilizan preferiblemente en una composición de cebo.
- El cebo puede ser una preparación líquida, sólida o semisólida (por ejemplo, un gel). Los cebos sólidos se pueden formar en diversas formas y formas adecuadas para la aplicación respectiva, por ejemplo gránulos, bloques, palos, discos. Los cebos líquidos se pueden llenar en diversos dispositivos para asegurar la aplicación apropiada, por ejemplo recipientes abiertos, dispositivos de aspersión, fuentes de gotitas o fuentes de evaporación. Los geles pueden estar

basados en matrices acuosas u oleosas y pueden formularse a necesidades particulares en términos de adherencia, retención de humedad o características de envejecimiento.

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

10 Para el uso en composiciones de cebo, el contenido típico de ingrediente activo es de 0,001 % en peso a 15 % en peso, deseablemente de 0,001 % en peso a 5 % en peso de compuesto activo.

15 Las formulaciones de compuestos de fórmula I como aerosoles (por ejemplo, en latas de aerosol), aerosoles de aceite o pulverizadores de bomba son muy adecuados para el usuario no profesional para controlar plagas como moscas, pulgas, garrapatas, mosquitos o cucarachas. Las recetas de aerosol se componen preferiblemente del compuesto activo, solventes tales como alcoholes inferiores (por ejemplo metanol, etanol, propanol, butanol), cetonas (por ejemplo, acetona, metil etil cetona), hidrocarburos parafínicos (por ejemplo querosenos) que tienen rangos de ebullición de aproximadamente 50 a 250 °C. dimetilformamida, N-metilpirrolidona, sulfóxido de dimetilo, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, xileno, agua, adicionalmente auxiliares tales como emulsionantes tales como monooleato de sorbitol, etoxilato de oleilo que tiene de 3-7 moles de óxido de etileno, etoxilato de alcohol graso, aceites perfumados tales como aceites etéreos, ésteres de ácidos grasos medios con alcoholes inferiores, compuestos carbonilo aromáticos, si es apropiado estabilizadores tales como benzoato de sodio, surfactantes anfotéricos, epóxidos inferiores, ortoformiato de trietilo y si se requiere propelentes tales como propano, butano, nitrógeno, aire comprimido, dimetilo éter, dióxido de carbono, óxido nitroso, o mezclas de estos gases.

20 Las formulaciones en aerosol de aceite difieren de las recetas de aerosol en que no se utilizan propelentes.

Para el uso en composiciones de aspersión, el contenido de ingrediente activo es de 0,001 a 80 % en peso, preferiblemente de 0,01 a 50 % en peso y lo más preferiblemente de 0,01 a 15 % en peso.

30 Los compuestos de fórmula I y sus composiciones respectivas también se pueden usar en mosquiteros y alambres de fumigación, cartuchos de humo, placas vaporizadoras o vaporizadores a largo plazo y también en papeles de polilla, pastillas para la polilla u otros sistemas de vaporizador independientes del calor.

35 Los métodos para el control de enfermedades infecciosas transmitidas por insectos (por ejemplo, malaria, dengue y fiebre amarilla, filariasis linfática y leishmaniasis) con compuestos de fórmula I y sus composiciones respectivas comprenden también el tratamiento de superficies de cabañas y casas, la aspersión en aire e impregnación de cortinas, tiendas, artículos de vestuario, mosquiteros, trampa para moscas tsé-tsé o similares. Las composiciones insecticidas para aplicación a fibras, tejidos, artículos de punto, telas no tejidas, material de malla o láminas y lonas comprenden preferiblemente una mezcla que incluye el insecticida, opcionalmente un repelente y al menos un aglomerante. Los repelentes adecuados son, por ejemplo, N,N-dietil-meta-toluamida (DEET), N,N-dietilfenilacetamida (DEPA), 1-(3-ciclohexan-1-ilcarbonil)-2-metilpiperina, ácido (2-hidroximetilciclohexil) acético lactona, 2-etil-1,3-hexandiol, indalona, Metil-neodecanamida (MNDA), un piretroide no utilizado para el control de insectos, tal como {(+/-) -3-ail-2-metil-4-oxociclopent-2-(+)-enil-(+)-trans-crisantemato (Esbiotrina), un repelente derivado de o idéntico a extractos vegetales como limoneno, eugenol, (+)- Eucamalol (1), (-)-1-epi-eucamalol o extractos de plantas crudas de plantas como Eucalyptus maculata, Vitex rotundifolia, Cymbopogon martinii, Cymbopogon citratus (limonaria), Cymopogon nartdus (citronella). Los aglomerantes adecuados se seleccionan, por ejemplo, a partir de polímeros y copolímeros de ésteres vinílicos de ácidos alifáticos (tales como acetato de vinilo y versatato de vinilo), ésteres acrílicos y metacrílicos de alcoholes, tales como acrilato de butilo, 2-etilhexilacrilato y acrilato de metilo, e hidrocarburos di-etilénicamente insaturados, tales como estireno, y dienos alifáticos, tales como butadieno.

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

50 Los compuestos de fórmula I y sus composiciones pueden utilizarse para proteger materiales de madera tales como árboles, cercas, durmientes, etc. y construcciones tales como casas, casas exteriores, fábricas, pero también materiales de construcción, muebles, cueros, fibras, artículos de vinilo, cables eléctricos, etc., frente a hormigas y/o termitas, y para controlar hormigas y termitas y evitar que hagan daño a cultivos o seres humanos (por ejemplo, cuando las plagas invaden las casas y las instalaciones públicas). Los compuestos de fórmula I se aplican no sólo a la superficie del suelo circundante o al suelo subterráneo para proteger los materiales de madera, sino que también pueden aplicarse a artículos elaborados de madera tales como las superficies concreto bajo el piso, soportes, vigas, aglomerados, muebles, etc., artículos de madera tales como tableros de partículas, tableros medios, etc. y artículos

de vinilo tales como alambres eléctricos recubiertos, láminas de vinilo, material aislante térmico tal como espumas de estireno, etc. En caso de aplicación contra hormigas que afectan cultivos o seres humanos, el controlador de hormigas de la presente invención se aplica a los cultivos o al suelo circundante, o se aplica directamente al nido de las hormigas o similares.

5 Tratamiento de semillas

Los compuestos de fórmula I también son adecuados para el tratamiento de semillas con el fin de proteger la semilla de las plagas de insectos, en particular de las plagas de insectos que viven en el suelo y las raíces y brotes de la planta resultantes de las plantas contra plagas del suelo e insectos foliares.

10 Los compuestos de fórmula I son particularmente útiles para la protección de las semillas frente a las plagas del suelo y las raíces y brotes resultantes de la planta contra plagas del suelo e insectos foliares. Se prefiere la protección de las raíces y brotes resultantes de la planta. Más preferido es la protección de los brotes resultantes de plantas frente a insectos perforadores y chupadores, en donde la protección frente a los áfidos es la más preferida.

15 Por lo tanto, la presente invención comprende un método para la protección de semillas frente a insectos, en particular frente a insectos del suelo y de las raíces y brotes de plántulas frente a insectos, en particular frente a insectos del suelo y foliares, comprendiendo dicho método poner en contacto las semillas antes de la siembra y/o después la pregerminación con un compuesto de la fórmula general I o una sal del mismo. En particular se prefiere un método donde las raíces y brotes de la planta son protegidos, más preferiblemente un método en donde se protegen los brotes de las plantas frente a insectos perforadores y chupadores, lo más preferiblemente un método en donde se protegen los brotes de las plantas frente a áfidos.

20 El término semilla abarca semillas y propágulos de las plantas de todas las clases incluyendo pero no limitándose a semillas verdaderas, partes de semillas, retoños, bulbos subterráneos, bulbos, frutas, tubérculos, granos, cortes, cortes de brotes y similares y en una realización preferida significa semillas verdaderas.

25 El término tratamiento de semillas comprende todas las técnicas de tratamiento de semillas adecuadas conocidas en la técnica, tales como cubrimiento de semillas, recubrimiento de semillas, pulverización de semillas, remojo de semillas y peletización de semillas. La presente invención también comprende semillas recubiertas con o que contienen el compuesto activo.

30 El término "recubierto con y/o que contiene" significa generalmente que el ingrediente activo está en su mayor parte en la superficie del producto de propagación en el momento de la aplicación, aunque una parte mayor o menor del ingrediente puede penetrar en el producto de propagación, dependiendo del método de aplicación. Cuando dicho producto de propagación es replantado, puede absorber el ingrediente activo. Las semillas adecuadas son semillas de cereales, cultivos de raíces, cultivos oleaginosos, hortalizas, especias, plantas ornamentales, por ejemplo, semillas de trigo durum y otros trigos, cebada, avena, centeno, maíz (maíz de mazorca y maíz de azúcar/maíz dulce y de campo), soja, cultivos oleaginosos, crucíferas, algodón, girasoles, plátanos, arroz, colza, colza de rábamo, remolacha de azúcar, remolacha forrajera, berenjenas, patatas, césped, pastos, hierba forrajera, tomates, puerros, calabacines/calabazas, repollo, lechuga iceberg, pimienta, cocombrillos, melones, especies de Brassica, melones, judías, guisantes, ajo, cebollas, zanahorias, plantas tuberosas tales como patatas, caña de azúcar, tabaco, uvas, petunias, geranio/pelargonios, margaritas y balsaminas.

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

40 Por ejemplo, el compuesto activo puede emplearse en el tratamiento de semillas de plantas que son resistentes a herbicidas del grupo que consiste en las sulfonilureas, imidazolinonas, glufosinato-amonio o glifosato-isopropilamónio y sustancias activas análogas (véase por ejemplo EP-A US-A-0242236, EP-A-242246) (documento WO 92/00377) (EPA-0257993, Patente de Estados Unidos No. 5,013,659) o en plantas de cultivo transgénico, por ejemplo algodón, con la capacidad de producir toxinas de *Bacillus thuringiensis* (toxinas Bt) que hacen que las plantas sean resistentes a ciertas plagas (EP-A-0142924, EP-A-0193259),

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

La aplicación de tratamiento de semillas del compuesto activo se lleva a cabo mediante aspersión o pulverización de las semillas antes de la siembra de las plantas y antes de la aparición de las plantas.

Las composiciones que son especialmente útiles para el tratamiento de semillas son, por ejemplo:

55 A Concentrados solubles (SL, LS)

D Emulsiones (EW, EO, ES)

E Suspensiones (SC, OD, FS)

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

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

5 H Formulaciones en gel (GF)

I Polvos pulverizables (DP, DS)

10 Las formulaciones de tratamiento de semillas convencionales incluyen, por ejemplo, concentrados fluidos FS, soluciones LS, polvos para tratamiento en seco DS, polvos dispersables en agua para tratamiento en suspensión WS, polvos solubles en agua SS y emulsión ES y EC y formulación en gel GF. Estas formulaciones se pueden aplicar a la semilla diluida o no diluida. La aplicación a las semillas se lleva a cabo antes de la siembra, ya sea directamente sobre las semillas o después de que estas últimas han pregerminado.

En una realización preferida, se usa una formulación FS para el tratamiento de semillas. Típicamente, una formulación de FS puede comprender 1-800 g/l de ingrediente activo, 1-200 g/l de surfactante, 0 a 200 g/l de agente anticongelante, 0 a 400 g/l de aglomerante, 0 a 200 g/l de un pigmento y hasta 1 litro de un solvente, preferiblemente agua.

15 Las formulaciones FS especialmente preferidas de los compuestos de fórmula I para el tratamiento de semillas comprenden habitualmente de 0,1 a 80 % en peso (1 a 800 g/l) del ingrediente activo, de 0,1 a 20 % en peso (1 a 200 g/l) de al menos un surfactante, por ejemplo 0,05 a 5 % en peso de un humectante y de 0,5 a 15 % en peso de un agente dispersante, hasta 20 % en peso, por ejemplo de 5 a 20 % de un agente anticongelante, de 0 a 15 % en peso, por ejemplo 1 a 15 % en peso de un pigmento y/o un colorante, de 0 a 40 % en peso, por ejemplo 1 a 40 % en peso de un aglomerante (adhesivo/agente adherente), opcionalmente hasta un 5 % en peso, por ejemplo de 0,1 a 5 % en peso de un espesante, opcionalmente de 0,1 a 2 % de un agente antiespumante, y opcionalmente un conservante tal como un biocida, antioxidante o similar, por ejemplo en una cantidad de 0,01 a 1 % en peso y un agente de relleno/vehículo hasta 100 % en peso.

25 Las formulaciones de tratamiento de semillas pueden comprender además adicionalmente aglomerantes y opcionalmente colorantes.

30 Se pueden añadir aglomerantes para mejorar la adhesión de los materiales activos sobre las semillas después del tratamiento. Los aglomerantes adecuados son homo- y copolímeros de óxidos de alquileo tales como óxido de etileno u óxido de propileno, polivinil acetato, polivinilalcoholes, polivinilpirrolidonas y copolímeros de los mismos, copolímeros de etilen-vinilo acetato, homo- y copolímeros acrílicos, polietilenaminas, polietilenamidas y polietileniminas, polisacáridos como celulosas, tilosa y almidón, homo- y copolímeros de poliolefina como copolímeros de olefina/anhídrido maleico, poliuretanos, poliésteres, homo y copolímeros de poliestireno

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

Ejemplos de un agente gelificante son carragenano (Satiagel®)

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

45 Por lo tanto, la invención se refiere también a semillas que comprenden un compuesto de la fórmula I, o una sal de I útil desde el punto de vista agrícola, como se define aquí. La cantidad del compuesto I o de la sal útil desde el punto de vista agrícola variará en general de 0,1 g a 10 kg por 100 kg de semilla, preferiblemente de 1 g a 5 kg por 100 kg de semilla, en particular de 1 g a 1000 g por 100 kg de semilla. Para cultivos específicos, como lechuga, la tasa puede ser más alta.

Sanidad animal

50 Los compuestos de la fórmula I o los enantiómeros o las sales aceptables desde el punto de vista veterinario de los mismos también son en particular adecuados para utilizarse en el combate de parásitos en y sobre animales.

Un objeto de la presente invención por lo tanto es proveer nuevos métodos para controlar parásitos en y sobre animales. Otro objeto de la invención es proveer pesticidas más seguros para animales. Otro objeto de la invención

es adicionalmente proveer pesticidas para animales que puedan ser utilizados en dosis inferiores a los pesticidas existentes. Y otro objeto de la invención es proveer pesticidas para animales, que provean un control residual prolongado de los parásitos.

5 La invención también se relaciona con composiciones que contienen una cantidad efectiva como parasiticida de los compuestos de la fórmula I o los enantiómeros o sales aceptables desde el punto de vista veterinario de los mismos y un vehículo aceptable, para combatir parásitos en y sobre animales.

10 La presente invención también proporciona un método para tratar, controlar, prevenir y proteger animales contra la infestación e infección por parásitos, que comprende administrar oralmente, por vía tópica o parenteral o aplicar a los animales una cantidad efectiva como parasiticida de un compuesto de la fórmula I o los enantiómeros o las sales aceptables desde el punto de vista veterinario de los mismos o una composición que los comprende.

La invención también provee un proceso para preparación de una composición para tratar, controlar, prevenir o proteger animales contra la infestación o infección por parásitos que comprende una cantidad efectiva como parasiticida de un compuesto de la fórmula I o los enantiómeros o sales aceptables desde el punto de vista veterinario de los mismos o una composición que los comprende.

15 La actividad de los compuestos contra las plagas agrícolas no sugiere su adecuabilidad para el control de endo y ectoparásitos en y sobre animales lo que requiere, por ejemplo, dosis bajas no eméticas, en el caso de la aplicación oral, compatibilidad metabólica con el animal, baja toxicidad y un manejo seguro.

Sorprendentemente se ha encontrado ahora que los compuestos de la fórmula I son adecuados para combatir endo y ectoparásitos en y sobre animales.

20 Los compuestos de la fórmula I o los enantiómeros o las sales aceptables desde el punto de vista veterinario de los mismos y las composiciones que los comprenden se utilizan preferiblemente para controlar y prevenir infestaciones e infecciones en animales incluyendo animales de sangre caliente (incluyendo humanos) y peces. Son adecuados por ejemplo para controlar y evitar infestaciones e infecciones en mamíferos tales como ganado, ovejas, cerdos, camellos, venados, caballos, cerdos, aves, conejos, cabras, perros y gatos, búfalos de agua, asnos, corzos y renos, y también en animales de piel tales como mink, chinchilla y mapache, aves tales como gallinas, gansos, pavos y patos y peces tales como peces de agua dulce y agua salada tales como trucha, carpa y anguilas.

Los compuestos de la fórmula I o los enantiómeros o las sales aceptables desde el punto de vista veterano de los mismos y las composiciones que los comprenden son utilizados preferiblemente para controlar y evitar infestaciones e infecciones en animales domésticos, tales como perros y gatos.

30 Las infestaciones en animales de sangre caliente y peces incluyen, pero no se limitan a, piojos, piojos mordedores, garrapatas, lombrices nasales, keds, moscas picadoras, moscas muscoides, moscas, larvas de moscas miasóticas, niguas, jejenes, mosquitos y pulgas.

35 Los compuestos de la fórmula I o los enantiómeros o las sales aceptables desde el punto de vista veterinario de los mismos y las composiciones que los comprenden son adecuados para el control sistémico y/o no sistémico de ecto y/o endoparásitos. Son activos contra todas o algunas de etapas de desarrollo.

Los compuestos de la fórmula I son especialmente útiles para combatir ectoparásitos.

Los compuestos de la fórmula I son especialmente útiles para combatir parásitos de los siguientes órdenes y especies, respectivamente:

40 pulgas (Siphonaptera), por ejemplo *Ctenocephalides felis*, *Ctenocephalides canis*, *Xenopsylla cheopis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, y *Nosopsyllus fasciatus*,

cucarchas (Blattaria - Blattodea), por ejemplo *Blattella germanica*, *Blattella asahinae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta japonica*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta australasiae*, y *Blatta orientalis*,

45 moscas, mosquitos (Diptera), por ejemplo *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Anopheles crucians*, *Anopheles albimanus*, *Anopheles gambiae*, *Anopheles freeborni*, *Anopheles leucosphyrus*, *Anopheles minimus*, *Anopheles quadrimaculatus*, *Calliphora vicina*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Chrysops discalis*, *Chrysops silacea*, *Chrysops atlanticus*, *Cochliomyia hominivorax*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culicoides furens*, *Culex pipiens*, *Culex nigripalpus*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex tarsalis*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Dermatobia hominis*, *Fannia canicularis*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Glossina palpalis*, *Glossina fuscipes*, *Glossina tachinoides*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hippelates* spp., *Hypoderma lineata*, *Leptoconops torrens*, *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Lycoria pectoralis*, *Mansonia* spp., *Musca domestica*, *Muscina stabulans*, *Oestrus ovis*, *Phlebotomus argentipes*, *Psorophora columbiae*, *Psorophora discolor*, *Prosimulium mixtum*, *Sarcophaga haemorrhoidalis*, *Sarcophaga* sp., *Simulium vittatum*, *Stomoxys calcitrans*, *Tabanus bovinus*, *Tabanus atratus*, *Tabanus lineola*, y *Tabanus similis*,

- piojos (Ftiraptera), por ejemplo *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pthirus pubis*, *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus suis*, *Linognathus vituli*, *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*, *Menacanthus stramineus* y *Solenopotes capillatus*.
- 5 garrapatas y gorgojos parasíticos (Parasitiformes): garrapatas (Ixodida), por ejemplo *Ixodes scapularis*, *Ixodes holociclus*, *Ixodes pacificus*, *Rhiphicephalus sanguineus*, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor variabilis*, *Amblyomma americanum*, *Amblyomma maculatum*, *Ornithodoros hermsi*, *Ornithodoros turicata* y parasitic mites (Mesostigmata), por ejemplo *Ornithonyssus bacoti* y *Dermanyssus gallinae*,
- 10 Actinedida (Prostigmata) y Acaridida (Astigmata) por ejemplo *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Ornithocheyletia* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Listrophorus* spp., *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp., y *Laminosioptes* spp,
- Bichos (Heteroptera): *Cimex lectularius*, *Cimex hemipterus*, *Reduvius senilis*, *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp. y *Arilus critatus*,
- Anoplurida, por ejemplo *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp., y *Solenopotes* spp,
- 15 Mallophagida (subórdenes *Arblycerinae* y *Schnocerina*), por ejemplo *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepiquentron* spp., *Trichodectes* spp., y *Felicola* spp,
- Gusanos Nematodos:
- Gusanos frotadores y Trichinosis (Trichosyringida), por ejemplo *Trichinellidae* (*Trichinella* spp.), (*Trichuridae*) *Trichuris* spp., *Capillaria* spp,
- 20 Rhabditida, por ejemplo *Rhabditis* spp, *Strongyloides* spp., *Helicephalobus* spp,
- Strongylida, por ejemplo *Strongylus* spp., *Ancylostoma* spp., *Necator americanus*, *Bunostomum* spp. (Hookworm), *Trichostrongylus* spp., *Haemonchus contortus*, *Ostertagia* spp. , *Cooperia* spp., *Nematodirus* spp., *Dictyocaulus* spp., *Cyathostoma* spp., *Oesophagostomum* spp., *Stephanurus dentatus*, *Ollulanus* spp., *Chabertia* spp., *Stephanurus dentatus* , *Singamus trachea*, *Ancylostoma* spp., *Uncinaria* spp., *Globocephalus* spp., *Necator* spp., *Metastrongylus* spp., *Muellerius capillaris*, *Protostrongylus* spp., *Angiostrongylus* spp., *Parelaphostrongylus* spp. *Aleurostrongylus abstrusus*, y *Diectophima renale*,
- 25 Gusanos intestinales (Ascaridida), por ejemplo *Ascaris lumbricoides*, *Ascaris suum*, *Ascaridia galli*, *Parascaris equorum*, *Enterobius vermicularis* (Threadworm), *Toxocara canis*, *Toxascaris leonine*, *Skrjabinema* spp., y *Oxyuris equi*,
- 30 Camallanida, por ejemplo *Dracunculus medinensis* (guinea worm)
- Spirurida, por ejemplo *Thelazia* spp. *Wuchereria* spp., *Brugia* spp., *Onchocerca* spp., *Dirofilari* spp., *Dipetalonema* spp., *Setaria* spp., *Elaeophora* spp., *Spirocerca lupi*, y *Habronema* spp.,
- Gusanos de cabeza espinosa (Acanthocephala), por ejemplo *Acanthocephalus* spp., *Macracanthorhynchus hirudinaceus* y *Oncicola* spp,
- 35 Planarios (Plathelminthes):
- Lombrices del ganado (Trematoda), por ejemplo *Faciola* spp., *Fascioloides magna*, *Paragonimus* spp., *Dicrocoelium* spp., *Fasciolopsis buski*, *Clonorchis sinensis*, *Schistosoma* spp., *Trichobilharzia* spp., *Alaria alata*, *Paragonimus* spp., y *Nanocyetes* spp,
- 40 Cercomeromorpha, en particular Cestoda (Tapeworms), por ejemplo *Dipyllobothrium* spp., *Tenia* spp., *Echinococcus* spp., *Dipylidium caninum*, *Multiceps* spp., *Himenolepis* spp., *Mesocestoides* spp., *Vampirolepis* spp., *Moniezia* spp., *Anoplocephala* spp., *Sirrometra* spp., *Anoplocephala* spp., y *Himenolepis* spp.
- Los compuestos de la fórmula I y las composiciones que los contienen son particularmente útiles para el control de plagas de los órdenes Diptera, Sifonáptera y Ixodida.
- 45 Además, se prefiere especialmente el uso de los compuestos de la fórmula I y las composiciones que los contienen para combatir mosquitos.
- El uso de los compuestos de la fórmula I y las composiciones que los contienen para combatir moscas es una realización adicional preferida de la presente invención.
- Adicionalmente, se prefiere especialmente el uso de compuestos de la fórmula I y las composiciones que los contienen para combatir pulgas.

El uso de los compuestos de la fórmula I y las composiciones que los contienen para combatir garrapatas es una realización adicional preferida de la presente invención.

Los compuestos de la fórmula I también son especialmente útiles para combatir endoparásitos (gusanos nematodos, gusanos de cabeza espinosa y planarios).

5 La administración puede llevarse a cabo tanto profiláctica como terapéuticamente.

La administración de los compuestos activos se lleva a cabo directamente o en la forma de preparaciones adecuadas, oralmente, por vía tópica/dérmica o parenteral.

10 Para la administración oral a animales de sangre caliente, los compuestos de la fórmula I pueden formularse como alimentos para animales, premezclas para alimentos de animales, concentrados para alimentación de animales, píldoras, soluciones, pastas, suspensiones, pociones, geles, tabletas, bolos y cápsulas. Además, los compuestos de la fórmula I pueden administrarse a los animales en su agua de abrevadero. Para administración oral, la forma de dosificación escogida debería proveer al animal con 0.01 mg/kg hasta 100 mg/kg de peso corporal del animal por día del compuesto de la fórmula I, preferiblemente con 0.5 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal del animal por día.

15 Alternativamente, los compuestos de la fórmula I pueden administrarse a los animales por vía parenteral, por ejemplo, por inyección intraluminal, intramuscular, intravenosa o subcutánea. Los compuestos de la fórmula I pueden dispersarse o disolverse en un vehículo fisiológicamente aceptable para inyección subcutánea. Alternativamente, los compuestos de la fórmula I pueden formularse en un implante para administración subcutánea. Además, el compuesto de la fórmula I puede administrarse por vía transdérmica a los animales. Para administración parenteral, la forma de dosificación escogida debería proveer al animal con 0.01 mg/kg hasta 100 mg/kg de peso corporal del animal por día del compuesto de la fórmula I.

25 Los compuestos de la fórmula I también pueden aplicarse por vía tópica a los animales en forma de gotas, polvos, pulverizados, collares, medallones, aspersiones, champús, formulaciones para aplicación y vertimiento y en ungüentos o en emulsiones aceite en agua o agua en aceite. Para aplicación tópica, las gotas y las aspersiones contienen usualmente 0.5 ppm a 5,000 ppm y preferiblemente de 1 ppm a 3,000 ppm del compuesto de la fórmula I. Además, los compuestos de la fórmula I pueden formularse en etiquetas para orejas para animales, particularmente cuadrúpedos tales como ganado y ovejas.

Preparaciones adecuadas son:

- Soluciones tales como soluciones orales, concentrados para administración oral después de la dilución, soluciones para el uso en la piel o cavidades corporales, formulaciones para vertimiento, geles;
- 30 - Emulsiones y suspensiones para administración oral o dérmica; preparaciones semisólidas;
- Formulaciones en las cuales el compuesto activo es procesado en una base de ungüento o en una emulsión aceite en agua o agua en aceite;
- Preparaciones sólidas tales como polvos, premezclas o concentrados, gránulos, pellas, tabletas, bolos, cápsulas; aerosoles e inhalantes, y artículos conformados que contienen el compuesto activo.

35 Las composiciones adecuadas para inyección se preparan disolviendo el ingrediente activo en un solvente adecuado y agregando opcionalmente ingredientes adicionales tales como ácidos, bases, sales reguladoras, conservantes y solubilizantes. Las soluciones se filtran y se empaquetan de manera estéril.

Solventes adecuados son solventes fisiológicamente tolerables tales como agua, alcanoles tales como etanol, butanol, alcohol bencílico, glicerol, propilenglicol, polietilenglicoles, N-metil-pirrolidona, 2-pirrolidona y mezclas de los mismos.

40 Los compuestos activos pueden disolverse opcionalmente en aceites vegetales o sintéticos fisiológicamente tolerables los cuales son adecuados para inyección.

Solubilizantes adecuados son solventes que promueven la disolución del compuesto activo en el solvente principal o evita su precipitación. Ejemplos son polivinilpirrolidona, alcohol polivinílico, aceite de castor polioxietilado y éster de sorbitano polioxietilado.

45 Conservantes adecuados son alcohol bencílico, triclorobutanol, ésteres del ácido p-hidroxibenzoico y n-butanol.

Las soluciones orales se administran directamente. Los concentrados se administran oralmente después de una dilución previa hasta la concentración de uso. Las soluciones y concentrados orales se preparan de acuerdo con el estado de la técnica y tal como se describió anteriormente para soluciones para inyección, no siendo necesarios los procedimientos estériles.

50 Las soluciones para uso sobre la piel son rociadas, esparcidas, frotadas, pulverizadas o asperjadas.

Las soluciones para uso sobre la piel se preparan de acuerdo con el estado de la técnica y de acuerdo a lo que se describe anteriormente para soluciones en inyección, no siendo necesarios los procedimientos estériles.

5 Solventes adecuados adicionales son polipropilén glicol, fenil etanol, fenoxietanol, ésteres tales como acetato de etilo o butilo, benzoato de bencilo, éteres tales como alquilenglicol alquiléter, por ejemplo, dipropilenglicol monometiléter, cetonas tales como acetona, metiletilcetona, hidrocarburos aromáticos, aceites vegetales y sintéticos, dimetilformamida, dimetilacetamida, transcutoyl y solketal, carbonato de propileno y mezclas de los mismos.

Puede ser ventajoso agregar espesantes durante la preparación. Espesantes adecuados son espesantes inorgánicos tales como bentonitas, ácido silícico coloidal, monoestearato de aluminio, espesantes orgánicos tales como derivados de celulosa, alcoholes polivinílicos y sus copolímeros, acrilatos y metacrilatos.

10 Los geles se aplican por distribución sobre la piel o se introducen en cavidades corporales. Los geles se preparan tratando soluciones que han sido preparadas tal como se describe en el caso de las soluciones para inyección con un aglomerante suficiente de tal forma que da como resultado un material claro que tiene una consistencia similar a un ungüento. Los espesantes empleados son los espesantes dados anteriormente.

15 Las formulaciones para vertimiento se vierten o se asperjan sobre áreas limitadas de la piel, penetrando el compuesto activo la piel y actuando sistémicamente.

Las formulaciones para vertimiento se preparan disolviendo, suspendiendo o emulsificando el compuesto activo en solventes o mezclas de solventes compatibles con la piel. Si es apropiado, se agregan otros auxiliares tales como colorantes, sustancias promotoras de la bioabsorción, antioxidantes, estabilizadores frente a la luz, adhesivos.

20 Solventes adecuados son: agua, alcanoles, glicoles, polietilenglicoles, polipropilenglicoles, glicerol, alcoholes aromáticos tales como alcohol bencílico, feniletanol, fenoxietanol, ésteres tales como acetato de etilo, acetato de butilo, benzoato de bencilo, éteres tales como éteres de alquilen glicol alquilo, tales como dipropilén glicol monoetil éter, dietilenglicol mono-butil éter, cetonas tales como acetona, metil etil cetona, carbonatos cíclicos tales como carbonato de propileno, carbonato de etileno, hidrocarburos aromáticos y/o alifáticos, aceites vegetales o sintéticos, DMF, dimetilacetamida, n-alquilpirrolidonas tales como metilpirrolidona, N-butilpirrolidona o n-octilpirrolidona, N-metilpirrolidona, 2-pirrolidona, 2,2-dimetil-4-oximetilén-1,3-diox-olano y glicerol formal.

25 Colorantes adecuados son todos los colorantes permitidos para uso en animales y que pueden ser disueltos o suspendidos.

30 Sustancias promotoras de la absorción adecuada son, por ejemplo, DMSO, aceites de aplicación tales como miristato de isopropilo, pelargonato de dipropilenglicol, aceites de silicona y copolímeros de los mismos con poliéteres, ésteres de ácidos grasos, triglicéridos, alcoholes grasos.

Antioxidantes adecuados son sulfitos o metabisulfitos tales como metabisulfito de potasio, ácido ascórbico, butilhidroxitolueno, butilhidroxianisol, tocoferol.

Estabilizadores frente a luz adecuados son, por ejemplo, ácido novantisólico.

35 Adhesivos adecuados son, por ejemplo, derivados de la celulosa, derivados de almidón, poliacrilatos, polímeros naturales tales como alginatos, gelatinas.

Las emulsiones pueden administrarse oralmente, por vía dérmica o como inyecciones.

Las emulsiones son bien del tipo agua en aceite o aceite en agua.

40 Se preparan disolviendo el compuesto activo, bien sea en la fase hidrófoba o en la hidrofílica y homogeneizándolas con el solvente de la otra fase con la ayuda de emulsificantes adecuados y, si es apropiado, otros auxiliares tales como colorantes, sustancias promotoras de la absorción, conservantes, antioxidantes, estabilizadores a la luz, sustancias potenciadoras de la viscosidad.

Fases hidrófobas adecuadas (aceites) son:

45 parafinas líquidas, aceites de silicona, aceites vegetales naturales tales como aceite de sésamo, aceite de almendras, aceite de castor, triglicéridos sintéticos tales como biglicéridos caprílico/cáprico, mezclas de triglicéridos con ácidos grasos vegetales de longitud de cadena C₈-C₁₂ u otros ácidos grasos naturales especialmente seleccionados, mezclas parciales de glicéridos de ácidos grasos saturados o insaturados posiblemente también con contenido de grupos hidroxilo, mono y diglicéridos de los ácidos grasos C₈-C₁₀,

50 ésteres de ácidos grasos tales como estearato de etilo, adipato de di-n-butirilo, laurato de hexilo, perlargonato de dipropilén glicol, ésteres de ácidos grasos ramificados de longitud de cadena media con alcoholes grasos saturados de longitud de cadena C₁₆-C₁₈, miristato de isopropilo, palmitato de isopropilo, ésteres de ácido caprílico/cáprico de alcoholes grasos saturados de longitud de cadena C₁₂-C₁₈, estearato de isopropilo, oleato de oleílo, oleato de decilo, oleato de etilo, lactato de etilo, ésteres de ácidos grasos cerosos tales como grasa de la glándula coccigeal de pato,

ftalato de dibutilo, adipato de diisopropilo, y mezclas de ésteres relacionadas con estos últimos, alcoholes grasos tales como alcohol isotridecílico, 2-octildodecanol, alcohol cetilestearílico, alcohol oleílico, ácidos grasos tales como ácido oleico y mezclas de los mismos.

5 Fases hidrofílicas adecuadas son: agua, alcoholes tales como propilén glicol, glicerol, sorbitol y mezclas de los mismos.

Emulsificantes adecuados son:

10 surfactantes no iónicos, por ejemplo, aceite de castor polietoxilado, monooleato de sorbitano polietoxilado, monoestearato de sorbitano, monoestearato de glicerol, estearato de polioxietilo, alquilfenol poliglicol éter; surfactantes anfólics tales como N-lauril-p-iminodipropionato de di-sodio o lecitina; surfactantes aniónicos, tales como lauril sulfato de sodio, sulfatos de éteres de alcoholes grasos, mono/dialquil poliglicol éter y sales de monoetanolamina de ésteres de ácido ortofosfórico; surfactantes activos anticaciones, tales como cloruro de cetiltrimetilamonio.

15 Auxiliares adecuados adicionales son: sustancias que potencian la viscosidad y estabilizan la emulsión, tales como carboximetilcelulosa, metilcelulosa y otros derivados de celulosa y almidón, poliacrilatos, alginatos, gelatina, goma arábica, polivinilpirrolidona, alcohol polivinílico, copolímeros de metil vinil éter y anhídrido maleico, polietilén glicoles, ceras, ácido silícico coloidal o mezclas de las sustancias mencionadas.

Las suspensiones pueden administrarse oralmente o por vía tópica/dérmica. Se preparan suspendiendo el compuesto activo en un agente de suspensión, si es apropiado con adición de otros auxiliares tales como agentes humectantes, colorantes, sustancias promotoras de la bioabsorción, conservantes, antioxidantes, estabilizadores a la luz.

Los agentes de suspensión en líquido son todos solventes y mezclas de solventes homogéneos.

20 Agentes humectantes adecuados (dispersantes) son los emulsificantes dados anteriormente.

Otros auxiliares que pueden mencionarse son los que se dan anteriormente.

Las preparaciones semisólidas pueden administrarse oralmente o por vía tópica/dérmica. Difieren de las suspensiones y emulsiones descritas anteriormente solamente por su viscosidad mayor.

25 Para la producción de preparaciones sólidas, el compuesto activo se mezcla con excipientes adecuados, si es apropiado con la adición de auxiliares, y se lleva a la forma deseada.

30 Excipientes adecuados son todas las sustancias inertes sólidas fisiológicamente tolerables. Se utilizan sustancias inorgánicas y orgánicas. Las sustancias inorgánicas son, por ejemplo, cloruro de sodio, carbonatos tales como carbonato de calcio, hidrogenocarbonatos, óxidos de aluminio, óxido de titanio, ácidos silícicos, tierras arcillosas, sílica precipitada o coloidal, o fosfatos. Las sustancias orgánicas son, por ejemplo, azúcar, celulosa, alimentos y piensos tales como leche en polvo, torta de animales, tortas y deshechos de granos y almidones.

Auxiliares adecuados son conservantes, antioxidantes y/o colorantes que se han mencionado anteriormente.

35 Otros auxiliares adecuados son lubricantes y deslizantes tales como estearato de magnesio, ácido esteárico, talco, bentonitas, sustancias promotoras de la desintegración, tales como almidón o polivinilpirrolidona entrecruzada, aglomerantes tales como almidón, gelatina o polivinilpirrolidona lineal, y aglomerantes en seco tales como celulosa microcristalina.

40 En general, "cantidad efectiva como parasitocida" significa la cantidad de ingrediente activo necesaria para alcanzar un efecto observable sobre el crecimiento, incluyendo los efectos de necrosis, muerte, retardamiento, prevención y eliminación, destrucción o disminución de alguna otra manera de la presencia y actividad del organismo objetivo. La cantidad efectiva como parasitocida puede variar para los diversos compuestos/composiciones usados en la invención. Una cantidad efectiva como parasitocida de las composiciones también variará de acuerdo con las condiciones prevalentes tales como efecto y duración parasitocidas deseados, especie objetivo, modo de aplicación y similares.

Las composiciones que pueden utilizarse en la invención pueden comprender generalmente desde aproximadamente 0.001 a 95% del compuesto de la fórmula I.

45 En general es favorable aplicar los compuestos de la fórmula I en cantidades totales de 0.5 mg/kg a 100 mg/kg por día, preferiblemente 1 mg/kg a 50 mg/kg por día.

Las preparaciones listas para el uso contienen los compuestos que actúan contra parásitos, preferiblemente ectoparásitos en concentraciones de 10 ppm a 80 por ciento en peso, preferiblemente de 0.1 a 65 por ciento en peso, más preferiblemente de 1 a 50 por ciento en peso, lo más preferiblemente de 5 a 40 por ciento en peso.

50 Las preparaciones que se diluyen antes del uso contienen los compuestos que actúan contra ectoparásitos en concentraciones de 0.5 a 90 por ciento en peso, preferiblemente de 1 a 50 por ciento en peso.

Adicionalmente, las preparaciones comprenden los compuestos de la fórmula I contra endoparásitos en concentraciones de 10 ppm a 2 por ciento en peso, preferiblemente de 0.05 a 0.9 por ciento en peso, muy particularmente de forma preferible de 0.005 a 0.25 por ciento en peso.

5 En una realización preferida de la presente invención, la composición que comprende los compuestos de la fórmula I se aplica por vía dérmica/tópica.

En una realización preferida adicional, la aplicación tópica se lleva a cabo en la forma de artículos conformados que contienen el compuesto tales como collares, medallones, etiquetas para oreja, bandas para fijar a partes del cuerpo, y tiras y láminas adhesivas.

10 En general es favorable aplicar las formulaciones sólidas que liberan los compuestos de la fórmula I en cantidades totales de 10 mg/kg a 300 mg/kg, preferiblemente 20 mg/kg a 200 mg/kg, lo más preferiblemente de 25 mg/kg a 160 mg/kg de peso corporal del animal tratado en el transcurso de tres semanas.

15 Para la preparación de los artículos conformados, se utilizan termoplásticos y plásticos flexibles así como elastómeros y elastómeros termoplásticos. Los plásticos y elastómeros adecuados son resinas de polivinilo, poliuretano, poliacrilato, resinas epoxi, celulosa, derivados de celulosa, poliamidas y poliéster que son suficientemente compatibles con los compuestos de la fórmula I. Una lista detallada de plásticos y elastómeros así como de procedimientos de preparación para los artículos conformados se da por ejemplo en WO 03/086075.

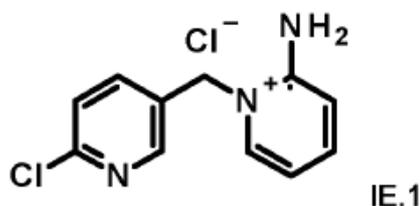
Ejemplos

La presente invención se ilustra ahora en detalle adicional mediante los siguientes ejemplos, sin imponer ninguna limitación a los mismos.

20 S. Ejemplos de Síntesis

Ejemplo de síntesis S.1: N-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-3-metoxi-propanamida (compuesto de ejemplo E1.3)

Etapas 1: Preparación de 1-[(6-cloro-3-piridil)metil]piridin-1-io-2-amina chloride (compuesto intermediario IE.1)]

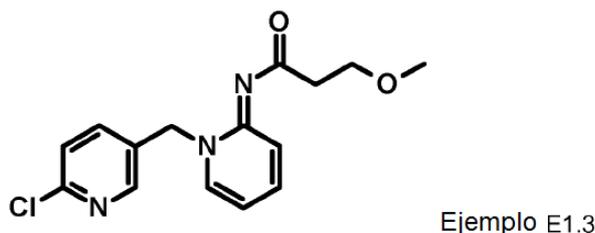


25 Se sometió a reflujo durante 24 horas una solución de 2-cloro-5-clorometil-piridina (16,20 g, 100 mmol) y 2-amino-piridina (9,60 g, 102 mmoles) en etanol (100 ml). Luego, la reacción se enfrió hasta temperatura ambiente y se concentró in vacuo. A continuación se añadieron 100 ml de fenilmetilo al residuo, y la mezcla se concentró in vacuo. Se añadieron los 75 ml de CH₂Cl₂ al residuo y la mezcla se agitó rápidamente durante 15 minutos, tiempo durante el cual se formó un precipitado. El precipitado se filtró entonces y se lavó con CH₂Cl₂ (50 ml), éter dietílico (50 ml) y se secó bajo vacío para proporcionar el producto cloruro de 1-[(6-cloro-3-piridil)metil]piridin-1-io-2-amina, como un sólido amarillo pálido que (14,0 g, 55 % de rendimiento).

30

LC-MS: masa calculada para C₁₁H₁₁ClN₃ [M]⁺ 220,1, encontrado 220,1; tR = 0,529 min.

Etapas 2: Preparación de N-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-3-metoxipropanamida (compuesto de ejemplo E1.3)

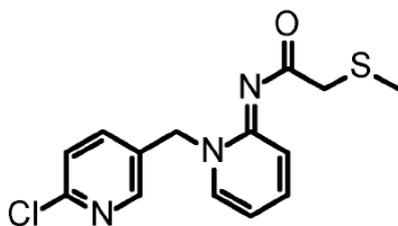


35 A una solución de sal de amina de cloruro de 1-[(6-cloro-3-piridil)metil]piridin-1-io-2-amina IE.1 (0,250 g, 0,97 mmol), ácido 3-metoxipropanoico (0,132 g, 1,26 Mmol) y trietilamina (0,267 g, 2,63 mmol) en CH₂Cl₂ a 0°C se le añadió una solución de anhídrido propilfosfórico (50 % en peso) (0,496 g, 1,55 mmol, 1 ml de una solución al 50 % en peso en

EtOAc). La reacción se dejó entonces calentar hasta temperatura ambiente y se agitó durante 60 horas. La reacción se diluyó con EtOAc (200 ml), se lavó con NaHCO₃ acuoso saturado, se separaron las capas, y la capa orgánica y se secó sobre Na₂SO₄ y se concentró in vacuo para proporcionar el producto E1.3 deseado en forma de un sólido beige (0,120 g, 40 % de rendimiento).

- 5 LC-MS: masa calculada. Para C₁₅H₁₇ClN₃O₂ [M + H]⁺ 306,1, encontrado 306,1; tR = 0,630 min.

Ejemplo de síntesis S.2: N-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-2-metilsulfanilacetamida (compuesto de ejemplo E1.9)

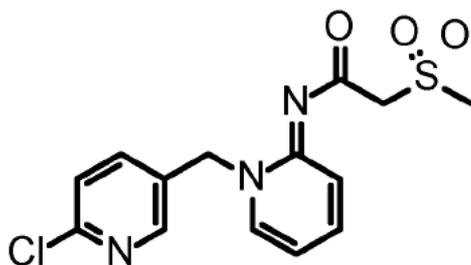


Ejemplo E1.9

Ejemplo E1.9

- 10 A una solución de sal de amina intermedia IE.1 (1,30 g, 5,08 mmol), ácido metilacético (0,70 g, 6,60 mmol) y trietilamina (1,39 g, 13,70 mmol) en CH₂Cl₂ (15 ml) a 0°C se añadió una solución de PPA (50 % en peso) (2,58 g, 1,60 mmol, 5 ml de una solución al 50 % en peso en EtOAc). La reacción se dejó entonces calentar hasta temperatura ambiente y se agitó durante 60 horas. La reacción se diluyó con EtOAc (200 ml), se lavó con NaHCO₃ acuoso saturado, se separaron las capas y la capa orgánica se secó sobre Na₂SO₄ y se concentró in vacuo para proporcionar un residuo.
- 15 El residuo se purificó usando cromatografía en sílica gel eluyendo con EtOAc al 100 %, luego MeOH al 4 %/CH₂Cl₂ para dar el producto E1.9 deseado como un sólido beige (0,750 g, 46 % de rendimiento). HRMS (ESI, Na) m/z calculado para C₁₁H₁₈N₂O₃Na (M + Na) + 249,1210, LC-MS: masa calculada para C₁₄H₁₅ClN₃OS [M+H]⁺ 308,1, encontrado 308,1; tR = 0,611 min.

- 20 **Ejemplo de síntesis S.3:** N-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-2-metilsulfonil-acetamida (compuesto de ejemplo E1.10)



Ejemplo E1.10

Ejemplo E1.10

- 25 A una solución de la amida E1.9 (0,400 g, 1,300 mmol), en CH₂Cl₂ (7 ml) a 0°C se añadió mCPBA (0,750 g, 3,250 mmol) en una porción. La reacción se agitó durante 20 minutos y luego se hizo extremadamente gruesa a medida que se formó un precipitado, luego se añadieron 7 ml de CH₂Cl₂. La reacción se agitó a continuación durante 6 horas a temperatura ambiente, luego se diluyó con NaHCO₃ acuoso saturado (100 ml), se extrajo con EtOAc (200 ml), la capa orgánica se secó sobre Na₂SO₄, se filtró y se concentró in vacuo. El residuo resultante se purificó usando cromatografía en sílica gel eluyendo con EtOAc al 100 %, luego MeOH al 4 %/CH₂Cl₂ para dar el producto E1.10 deseado como un sólido beige (0,300 g, 84 % de rendimiento).
- 30 LC-MS: masa calculada para C₁₄H₁₅ClN₃O₃S [M+H]⁺ 340,0, encontrado 340,0; tR = 0,621 min.

C. Ejemplos compuestos

Algunos ejemplos compuestos de acuerdo con la presente invención se muestran con sus datos físicos en las tablas siguientes y su actividad biológica se demuestra a continuación.

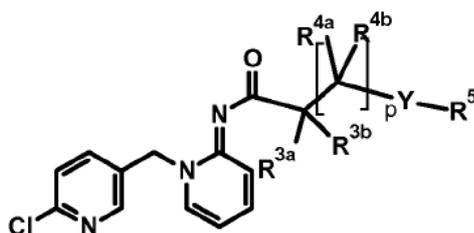
Los ejemplos compuestos se pueden caracterizar por sus datos físico-químicos ^{*)}, por ejemplo por cromatografía líquida de alto rendimiento acoplada, por espectrometría de masas (HPLC/MS) o por su punto de fusión.

^{*)} Columna UPLC analítica: Phenomenex Kinetex 1,7 µm XB-C18 100A; 50 x 2,1 mm; fase móvil: A: agua + ácido trifluoroacético al 0,1 % (TFA); B: acetonitrilo + TFA al 0,1 %; gradiente: 5-100 % de B en 1,50 minutos; 100 % B 0,20 min; flujo: 0,8-1,0 ml/min en 1,50 minutos a 60°C.

MS-método: ESI positivo.

Ejemplos y datos de los compuestos de fórmula E1 de acuerdo con la presente invención se dan en la tabla E1 a continuación.

Ejemplos compuestos de



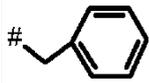
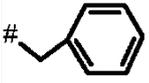
fórmula E1

10

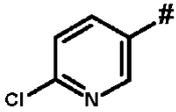
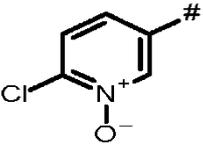
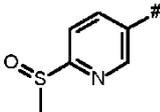
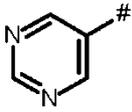
con sus datos físicoquímicos se dan en la tabla E1 a continuación.-

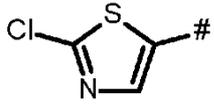
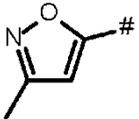
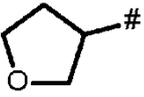
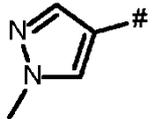
Tabla E1:

No.	R ^{3a}	R ^{3b}	p	R ^{4a}	R ^{4b}	Y	R ⁵ a)	Datos fisicoquímicos*)
E1-1	H	H	0	-	-	O	CH ₃	r.t.= 0.614 m/z = 292.1
E1-2	H	H	0	-	-	O	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	r.t.= 0.669 m/z = 336.1
E1-3	H	H	1	H	H	O	CH ₃	r.t.= 0.630 m/z = 306.1
E1-4	H	H	1	H	CH ₂ CH ₅	O	CH ₃	r.t.= 0.755 m/z = 334.1
E1-5	CH ₃	CH ₃	1	H	H	O	CH ₃	r.t.= 0.777 m/z = 334.1
E1-6	H	H	0	-	-	S	CF ₃	r.t.= 0.775 m/z = 362.1
E1-7	H	H	0	-	-	S	n-C ₃ F ₇	r.t.= 0.969 m/z = 462.2
E1-8	H	H	0	-	-	SO	CF ₃	r.t.= 0.823 m/z = 378.0
E1-9	H	H	0	-	-	S	CH ₃	r.t.= 0.611 m/z = 308.1

E1-10	H	H	0	-	-	SO ₂	CH ₃	r.t.= 0.621 m/z = 340.0
E1-11	F	F	0	-	-	S		r.t.= 1.121 m/z = 420.1
E1-12	F	F	0	-	-	SO ₂		r.t.= 1.032 m/z = 452.2
a) # denota el punto de unión al resto de la molécula; *) columna UPLC analítica (véase más adelante)								

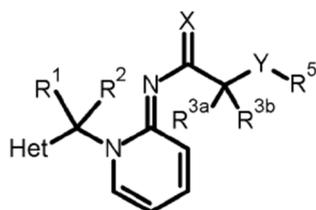
En los siguientes ejemplos y tablas E, Het se denota de acuerdo con las tablas siguientes:

Het1A	Het1B	Het1C	Het4.0
			

Het11A	Het23A	Het24.0	Het27A
			

5

E2 Compuestos de ejemplos de fórmula



E2

con sus datos físicoquímicos se dan en la tabla E2 a continuación.-

ES 2 630 373 T3

Tabla E2:

No.	Het	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵	X	Y	RT [min]	m/z [MH] ⁺
E2-1	Het1B	H	H	F	F	CH ₂ (C ₆ H ₅)	O	SO ₂	0.857	468.1
E2-2	Het1A	H	H	CH ₃	H	CF ₃	O	S	0.882	376.1
E2-3	Het1A	H	H	H	H	CF ₂ CHF ₂	O	S	0.837	394.1
E2-4	Het1A	H	H	H	H	CN	O	S	NA	NA
E2-5	Het1A	H	H	F	F	CH ₃	O	SO ₂	0.844	376.3
E2-6	Het1A	H	H	F	F	CH ₃	O	S	0.946	344.3
E2-7	Het1A	H	H	H	H	CH ₃	O	SO	0.501	324.1
E2-8	Het1A	H	H	F	F	CH ₃	S	S	0.974	360.0
E2-9	Het1A	H	H	F	F	CH ₃	O	SO	0.722	360.5
E2-10	Het1A	H	H	H	H	CH ₂ (C ₆ H ₅)	O	S	0.763	338.1
E2-11	Het1A	H	H	H	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	O	SO	1.033	478.0
E2-12	Het1A	H	H	H	H	SCH ₃	O	S	0.724	340.0
E2-13	Het1A	H	H	H	H	CH ₃	S	S	0.792	324.0
E2-14	Het1A	H	H	SCH ₃	H	CH ₃	O	O	NA	NA
E2-15	Het1A	H	H	H	H	CF ₂ CHF ₂	O	SO	0.826	432.1
E2-16	Het1A	H	H	CH ₃	H	CF ₃	O	SO	0.873	392.5
E2-17	Het1A	H	H	H	H	SCH ₂ CH ₃	O	S	0.794	353.8
E2-18	Het11A	H	H	H	H	CH ₃	O	S	0.662	314.2
E2-19	Het1A	CH ₃	H	F	F	CH ₃	O	S	1.017	358.3
E2-20	Het1A	CH ₃	H	H	H	CH ₃	O	SO ₂	0,591	354.3
E2-21	Het1A	H	H	H	H	CF ₂ CF ₃	O	S	0.918	412.5
E2-22	Het1A	H	H	F	F	(2-fluorofenil)metilo	O	S	1.160	438.6
E2-23	Het1A	H	H	F	F	(2,5-diclorofenil)metilo	O	S	1.277	490.4
E2-24	Het1A	H	H	F	F	(2,4-diclorofenil)metilo	O	S	1.296	490.4
E2-25	Het1A	H	H	F	F	(CH ₂) ₃ OC ₆ H ₅	O	S	1.219	465.0
E2-26	Het1A	H	H	F	F	(4-fluorofenil)metilo	O	S	1.162	440.6
E2-27	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	O	S	1.160	386.5
E2-28	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	O	S	0.976	416.6
E2-29	Het1A	H	H	F	F	cC ₆ H ₁₁	O	S	1.233	412.9
E2-30	Het1A	H	H	F	F	(4-clorofenil)metilo	O	S	1.227	456.3

ES 2 630 373 T3

No.	Het	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵	X	Y	RT [min]	m/z [MH] ⁺
E2-31	Het1A	H	H	F	F	(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	O	S	1.199	434.6
E2-32	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₃	O	S	1.229	400.6
E2-33	Het1A	H	H	F	F	CH(CH ₃)(CH ₂ CH ₃)	O	S	1.154	386.5
E2-34	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CO ₂ CH(CH ₃) ₂	O	S	1.071	430.6
E2-35	Het1A	H	H	F	F	2-furilmetilo	O	S	1.079	410.7
E2-36	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	O	S	1.223	400.5
E2-37	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CO ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	O	S	1.144	444.9
E2-38	Het1A	H	H	F	F	CHCH ₃ CO ₂ CH ₂ CH ₃	O	S	1.067	430.9
E2-39	Het1A	H	H	F	F	(3-clorofenil)metilo	O	S	1.221	456.2
E2-40	Het1A	H	H	F	F	o-tolilmetilo	O	S	1.205	434.6
E2-41	Het1A	H	H	F	F	(2-clorofenil)metilo	O	S	1.209	454.6
E2-42	Het1A	H	H	F	F	(3,4-diclorofenil)metilo	O	S	1.283	490.3
E2-43	Het1A	H	H	F	F	m-tolilmetilo	O	S	1.201	433.8
E2-44	Het1A	H	H	F	F	3-(trifluorometil)fenilo	O	S	1.221	473.8
E2-45	Het1A	H	H	F	F	4-(4-metoxifenoksi)fenilo	O	S	1.270	527.9
E2-46	Het1A	H	H	F	F	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo	O	S	1.108	467.8
E2-47	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CO ₂ (CH ₂) ₅ CH(CH ₃) ₂	O	S	1.343	499.9
E2-48	Het1A	H	H	F	F	3-cloro-4-fluoro-fenilo	O	S	1.217	457.7
E2-49	Het1A	H	H	F	F	3,5-bis(trifluorometil)fenilo	O	S	1.324	541.8
E2-50	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	O	S	1.002	401.8
E2-51	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CF ₃	O	S	1.065	411.7
E2-52	Het1A	H	H	F	F	p-tolilmetilo	O	S	1.202	433.8
E2-53	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	O	S	0.952	387.9
E2-54	Het1A	H	H	F	F	(CH ₂) ₄ OC ₆ H ₅	O	S	1.242	477.8
E2-55	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	S	1.156	385.8
E2-56	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CHCH ₂	O	S	1.047	369.7
E2-57	Het1A	CH ₃	H	H	H	CH ₃	O	S	0.660	322.3
E2-58	Het1A	CH ₃	H	F	F	CH ₃	O	SO ₂	0.782	374.3

ES 2 630 373 T3

No.	Het	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵	X	Y	RT [min]	m/z [MH] ⁺
E2-59	Het1A	CH ₃	H	F	F	CH ₃	O	SO	NA	NA
E2-60	Het1A	H	H	F	F	(4-metoxifenil)metilo	O	SO ₂	1.057	481.8
E2-61	Het1A	H	H	F	F	(2-fluorofenil)metilo	O	SO ₂	1.064	469.7
E2-62	Het1A	H	H	F	F	(2,5-diclorofenil)metilo	O	SO ₂	1.168	521.7
E2-63	Het1A	H	H	F	F	(2,4-diclorofenil)metilo	O	SO ₂	1.185	521.6
E2-64	Het1A	H	H	F	F	(CH ₂) ₃ OC ₆ H ₅	O	SO ₂	1.139	495.8
E2-65	Het1A	H	H	F	F	(4-fluorofenil)metilo	O	SO ₂	1.073	469.8
E2-66	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	O	SO ₂	1.049	417.8
E2-67	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	O	SO ₂	0.931	447.8
E2-68	Het1A	H	H	F	F	(4-clorofenil)metilo	O	SO ₂	1.129	487.5
E2-69	Het1A	H	H	F	F	(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	O	SO ₂	1.119	465.8
E2-70	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₃	O	SO ₂	1.111	431.7
E2-71	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CO ₂ CH(CH ₃) ₂	O	SO ₂	1.031	461.7
E2-72	Het1A	H	H	F	F	2-furilmetilo	O	SO ₂	0.993	441.8
E2-73	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	O	SO ₂	1.107	431.8
E2-74	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃	O	SO ₂	0.994	461.7
E2-75	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CO ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	O	SO ₂	1.099	461.7
E2-76	Het1A	H	H	F	F	CHCH ₃ CO ₂ CH ₂ CH ₃	O	SO ₂	1.018	461.8
E2-77	Het1A	H	H	F	F	(3-clorofenil)metilo	O	SO ₂	1.124	487.5
E2-78	Het1A	H	H	F	F	o-tolilmetilo	O	SO ₂	1.109	465.8
E2-79	Het1A	H	H	F	F	(2-clorofenil)metilo	O	SO ₂	1.106	485.7
E2-80	Het1A	H	H	F	F	(3,4-diclorofenil)metilo	O	SO ₂	1.183	519.7
E2-81	Het1A	H	H	F	F	4-Cl-C ₆ H ₄	O	S	1.200	441.5
E2-82	Het1A	H	H	F	F	5-metilo-1,3,4-tiadiazol-2-ilo	O	S	0.934	427.7
E2-83	Het1A	H	H	F	F	5-(trifluorometil)-2-piridilo	O	S	1.139	474.7
E2-84	Het1A	H	H	F	F	2,5-diclorofenilo	O	S	1.245	475.6
E2-85	Het1A	H	H	F	F	3-ciclopropil-1H-1,2,4-triazol-5-ilo	O	S	0.840	436.8

ES 2 630 373 T3

No.	Het	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵	X	Y	RT [min]	m/z [MH] ⁺
E2-86	Het1A	H	H	F	F	4-(4-clorofenil)tiazol-2-ilo	O	S	1.283	522.8
E2-87	Het1A	H	H	F	F	3-Cl-C ₆ H ₄	O	S	1.197	441.5
E2-88	Het1A	H	H	F	F	4-F-C ₆ H ₄	O	S	1.135	423.7
E2-89	Het1A	H	H	F	F	2,6-diclorofenilo	O	S	1.191	475.6
E2-90	Het1A	H	H	F	F	2-Cl-C ₆ H ₄	O	S	1.160	439.7
E2-91	Het1A	H	H	F	F	2-F-C ₆ H ₄	O	S	1.115	423.7
E2-92	Het1A	H	H	F	F	1 H-imidazol-2-ilo	O	S	0.683	395.7
E2-93	Het1A	H	H	F	F	1,3-benzotiazol-2-ilo	O	S	1.148	462.7
E2-94	Het1A	H	H	F	F	m-tolilmetilo	O	SO ₂	1.117	466.6
E2-95	Het1A	H	H	F	F	3-(trifluorometil)fenilo	O	SO ₂	1.159	506.7
E2-96	Het1A	H	H	F	F	4-metoxifenilo	O	SO ₂	1.050	468.6
E2-97	Het1A	H	H	F	F	4,6-dimetoxipirimidin-2-ilo	O	SO ₂	1.037	500.6
E2-98	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CO ₂ (CH ₂) ₅ CH(CH ₃) ₂	O	SO ₂	1.314	532.7
E2-99	Het1A	H	H	F	F	3-cloro-4-fluorofenilo	O	SO ₂	1.155	492.3
E2-100	Het1A	H	H	F	F	3,5-bis(trifluorometil)fenilo	O	SO ₂	1.268	574.8
E2-101	Het1A	H	H	F	F	3-isopropil-1H-1,2,4-triazol-5-ilo	O	SO ₂	1.201	481.0
E2-102	Het1A	H	H	F	F	p-tolilmetilo	O	SO ₂	1.119	466.6
E2-103	Het1A	H	H	F	F	(CH ₂) ₄ OC ₆ H ₅	O	SO ₂	1.174	511.0
E2-104	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	SO ₂	1.057	420.5
E2-105	Het1A	H	H	F	F	4-Cl-C ₆ H ₄	O	SO ₂	1.126	473.5
E2-106	Het1A	H	H	F	F	5-metilo-1,3,4-tiadiazol-2-ilo	O	SO ₂	0.959	459.7
E2-107	Het1A	H	H	F	F	5-(trifluorometil)-2-piridilo	O	SO ₂	1.080	506.7
E2-108	Het1A	H	H	F	F	3-ciclopropil-1H-1,2,4-triazol-5-ilo	O	SO ₂	0.886	468.8
E2-109	Het1A	H	H	F	F	4-(4-clorofenil)tiazol-2-ilo	O	SO ₂	1.228	555.8
E2-110	Het1A	H	H	F	F	1-metiloimidazol-2-ilo	O	SO ₂	0.870	441.8

ES 2 630 373 T3

No.	Het	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵	X	Y	RT [min]	m/z [MH] ⁺
E2-111	Het1A	H	H	F	F	3-Cl-C ₆ H ₄	O	SO ₂	1.124	473.5
E2-112	Het1A	H	H	F	F	2-piridilo	O	SO ₂	0.912	438.7
E2-113	Het1A	H	H	F	F	4-F-C ₆ H ₄	O	SO ₂	1.063	455.8
E2-114	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	SO ₂	0.998	403.3
E2-115	Het24.0	H	H	H	H	CH ₃	O	S	0.508	267.4
E2-116	Het24.0	H	H	F	F	CH ₃	O	S	0.818	302.7
E2-117	Het24.0	H	H	F	F	CH ₃	O	SO	0.633	319.5
E2-118	Het24.0	H	H	F	F	CH ₃	O	SO ₂	0.732	334.7
E2-119	Het24.0	H	H	H	H	CH ₃	O	SO ₂	0.428	298.7
E2-120	Het1A	H	H	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	O	O	0.729	350.6
E2-121	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	S	1.055	371.7
E2-122	Het24.0	H	H	F	F	CH ₂ CH ₃	O	S	0.881	317.5
E2-123	Het24.0	H	H	F	F	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	S	0.967	309.6
E2-124	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CH ₃	O	S	1,01	357,7
E2-125	Het1A	H	H	F	F	CH(CH ₃) ₂	O	S	1,068	371,7
E2-126	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CH ₃	O	SO	NA	NA
E2-127	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	SO	0.855	388.6
E2-128	Het1A	H	H	SCH ₂ CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	O	S	0.878	382.6
E2-129	Het1A	H	H	SCH ₃	H	CH ₃	O	S	0.767	354.5
E2-130	Het1A	H	H	O(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	4-Cl-C ₆ H ₄	O	O	1.194	516.6
E2-131	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CH ₃	O	SO ₂	0.965	403.7
E2-132	Het1A	H	H	F	F	CH(CH ₃) ₂	O	SO ₂	0.965	404.3
E2-133	Het4.0	H	H	H	H	CH ₃	O	S	0.447	275.5
E2-134	Het27A	H	H	F	F	CH ₃	O	S	0.763	313.3
E2-135	Het27A	H	H	F	F	CH ₃	O	SO ₂	0.682	345.3
E2-136	Het24.0	H	H	F	F	CH ₂ CH ₃	O	SO	0.702	332.8
E2-137	Het24.0	H	H	F	F	CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	SO	0.768	346.8
E2-138	Het4.0	H	H	F	F	CH ₃	O	S	0.729	311.5
E2-139	Het1A	H	H	H	H	CF ₂ CF ₃	O	SO	0.935	427.7
E2-140	Het1A	H	H	SCH(CH ₃) ₂	H	CH(CH ₃) ₂	O	S	1.146	432.7
E2-141	Het1C	H	H	F	F	CH ₃	O	S	0.754	371.7
E2-142	Het4.0	H	H	F	F	CH ₃	O	SO	0.568	327.5
E2-143	Het23A	H	H	F	F	CH ₃	O	S	0.882	314.3
E2-144	Het23A	H	H	F	F	CH ₃	O	SO ₂	0.762	346.3

ES 2 630 373 T3

No.	Het	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵	X	Y	RT [min]	m/z [MH] ⁺
E2-145	Het1A	H	H	F	F	CH(CH ₃) ₂	O	SO ₂	0.941	403.7
E2-146	Het1A	H	H	F	F	CH(CH ₃) ₂	O	SO	1.053	371.8
E2-147	Het1A	H	H	F	F	2-piridilo	O	S	0.905	406.7
E2-148	Het1A	H	H	F	F	(CH ₂) ₇ CH ₃	O	S	1.376	441.8
E2-149	Het1A	H	H	F	F	(CH ₂) ₆ CH ₃	O	S	1.316	427.8
E2-150	Het1A	H	H	F	F	C ₆ H ₅	O	S	1.084	427.7
E2-151	Het1A	H	H	F	F	(CH ₂) ₉ CH ₃	O	S	1.488	469.9
E2-152	Het1A	H	H	F	F	4-piridilo	O	S	0.721	406.7
E2-153	Het24.0	H	H	F	F	CH ₂ CH ₃	O	SO ₂	NA	NA
E2-154	Het1A	H	H	SCH ₃	H	CH ₂ CH ₃	O	O	0.746	308.3
E2-155	Het1A	H	H	SCH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	O	O	0.804	366.3
E2-156	Het1A	H	H	SCH ₃	H	C(CH ₃) ₃	O	O	0.842	380.4
E2-157	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	O	SO ₂	0.942	433.8
E2-158	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	O	SO ₂	0.875	419.7
E2-159	Het1A	H	H	F	F	C ₆ H ₅	O	SO ₂	1.048	437.3
E2-160	Het1A	H	H	F	F	(CH ₂) ₇ CH ₃	O	SO ₂	1.324	473.5
E2-161	Het1A	H	H	F	F	(CH ₂) ₆ CH ₃	O	SO ₂	1.267	459.5
E2-162	Het1A	H	H	F	F	(CH ₂) ₉ CH ₃	O	SO ₂	1.439	501.5
E2-163	Het1A	H	H	SCH ₂ CH ₃	H	CH ₃	O	S	0.835	368.3
E2-164	Het1A	H	H	SCH(CH ₃) ₂	H	CH ₃	O	S	0.898	382.3
E2-165	Het1A	H	H	SCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	H	CH(CH ₃)(CH ₂ CH ₃)	O	S	1.141	437.4
E2-166	Het1A	H	H	SCH ₂ CF ₃	H	CH ₂ CF ₃	O	S	1.125	489.8
E2-167	Het1A	H	H	F	F	(4-metoxifenil)metilo	O	SO	0.988	465.4
E2-168	Het1A	H	H	F	F	(2-fluorofenil)metilo	O	SO	1.003	453.4
E2-169	Het1A	H	H	F	F	(2,5-diclorofenil)metilo	O	SO	1.155	505.1
E2-170	Het1A	H	H	F	F	(2,4-diclorofenil)metilo	O	SO	1.195	505.1
E2-171	Het1A	H	H	F	F	(4-fluorofenil)metilo	O	SO	1.072	453.3
E2-172	Het1A	H	H	F	F	(CH ₂) ₃ OC ₆ H ₅	O	SO	1.055	479.4
E2-173	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	O	SO	1.016	401.4
E2-174	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₃	O	SO	0.908	431.3
E2-175	Het1A	H	H	F	F	cC ₆ H ₁₁	O	SO	1.080	427.4

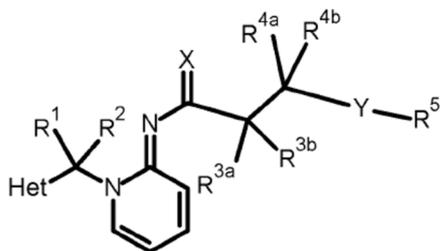
ES 2 630 373 T3

No.	Het	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵	X	Y	RT [min]	m/z [MH] ⁺
E2-176	Het1A	H	H	F	F	(4-clorofenil)metilo	O	SO	1.126	469.3
E2-177	Het1A	H	H	F	F	(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	O	SO	1.075	449.3
E2-178	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₃	O	SO	1.074	415.4
E2-179	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CO ₂ CH(CH ₃) ₂	O	SO	1.027	445.4
E2-180	Het1A	H	H	F	F	2-furilmetilo	O	SO	0.978	425.3
E2-181	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	O	SO	1.018	415.4
E2-182	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CH ₂ CO ₂ CH ₂ CH ₃	O	SO	0.917	445.3
E2-183	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CO ₂ (CH ₂) ₃ CH ₃	O	SO	1.049	459.4
E2-184	Het1A	H	H	F	F	CHCH ₃ CO ₂ CH ₂ CH ₃	O	SO	0.960	445.4
E2-185	Het1A	H	H	F	F	(3-clorofenil)metilo	O	SO	1.065	469.3
E2-186	Het1A	H	H	F	F	o-tolilmetilo	O	SO	1.043	449.4
E2-187	Het1A	H	H	F	F	(2-clorofenil)metilo	O	SO	1.044	469.3
E2-188	Het1A	H	H	F	F	(3,4-diclorofenil)metilo	O	SO	1.127	505.1
E2-189	Het1A	H	H	F	F	3-(trifluorometil)fenilo	O	SO	1.157	489.4
E2-190	Het1A	H	H	F	F	4-metoxifenilo	O	SO	1.038	451.3
E2-191	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ (C ₆ H ₅)	O	SO	1.048	435.4
E2-192	Het1A	H	H	F	F	3-cloro-4-fluoro-fenilo	O	SO	1.158	473.3
E2-193	Het1A	H	H	F	F	3,5-bis(trifluorometil)fenilo	O	SO	1.303	557.4
E2-194	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	O	SO	0.939	417.4
E2-195	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CF ₃	O	SO	1.020	427.3
E2-196	Het1A	H	H	F	F	p-tolilmetilo	O	SO	1.103	449.4
E2-197	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	O	SO	0.869	403.3
E2-198	Het1A	H	H	F	F	(CH ₂) ₄ OC ₆ H ₅	O	SO	1.150	493.4
E2-199	Het1A	H	H	F	F	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	SO	1.019	401.3
E2-200	Het1A	H	H	F	F	m-tolilmetilo	O	SO	1.117	449.4
E2-201	Het1A	H	H	F	F	4-(4-clorofenil)tiazol-2-ilo	O	SO	1.164	538.8
E2-202	Het1A	H	H	F	F	2,5-diclorofenilo	O	SO	1.105	489.9
E2-203	Het1A	H	H	F	F	3-Cl-C ₆ H ₄	O	SO	1.028	457.6
E2-204	Het1A	H	H	F	F	4-F-C ₆ H ₄	O	SO	0.967	439.8

ES 2 630 373 T3

No.	Het	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ⁵	X	Y	RT [min]	m/z [MH] ⁺
E2-205	Het1A	H	H	F	F	2,6-diclorofenilo	O	SO	1.038	491.8
E2-206	Het1A	H	H	F	F	2-Cl-C ₆ H ₄	O	SO	1.017	457.6
E2-207	Het1A	H	H	F	F	4-Cl-C ₆ H ₄	O	SO	1.028	457.6
E2-208	Het1A	H	H	F	F	5-(trifluorometil)-2-piridilo	O	SO	1.020	490.7
E2-209	Het1A	H	H	F	F	4-metilotiazol-2-ilo	O	SO	0.925	442.7
E2-210	Het1A	H	H	F	F	C ₆ H ₅	O	SO	0.939	421.8
E2-211	Het1A	H	H	F	F	(CH ₂) ₇ CH ₃	O	SO	1.191	457.8
E2-212	Het1A	H	H	F	F	(CH ₂) ₆ CH ₃	O	SO	1.129	443.9
E2-213	Het1A	H	H	F	F	(CH ₂) ₉ CH ₃	O	SO	1.313	485.9
E2-214	Het1A	H	H	CH ₃	H	3,4-diclorofenilo	O	O	0.971	435.7
E2-215	Het1A	H	H	-CH ₂ -CH ₂ -		CH ₃	O	S	0.747	333.7
E2-216	Het1A	H	H	-CH ₂ -CH ₂ -		CH ₃	O	SO ₂	0.737	366.3
E2-217	Het1A	H	H	-CH ₂ -CH ₂ -		H	O	O	0.609	304.4

E3. Compuestos de ejemplos de fórmula



E3

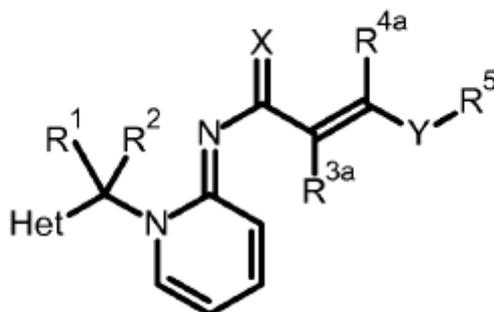
con sus datos físicoquímicos se dan en la tabla E3 a continuación.

5

Tabla E3:

No.	Het	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	X	Y	RT [min]	m/z [MH] ⁺
E3-1	Het1A	H	H	H	H	H	H	CH ₃	O	S	0.730	322.1
E3-2	Het1A	H	H	H	H	H	H	CH ₃	O	SO ₂	0.532	354.1
E3-3	Het1A	H	H	H	H	=O		CH ₂ CH ₃	S	O	0.839	372.1
E3-4	Het4.0	H	H	H	H	H	H	CH ₃	O	S	0.502	289.5
E3-5	Het1A	H	H	H	H	OCH ₃	H	CH ₃	O	O	0.635	335.8
E3-6	Het1A	H	H	H	H	H	H	CH ₃	O	SO	0.440	338.1
E3-7	Het1A	H	H	H	H	=O		CH ₂ CH ₃	O	O	0.689	334.1
E3-8	Het1A	CH ₃	H	H	H	=O		CH ₂ CH ₃	O	O	NA	NA
E3-9	Het1A	CH ₃	H	F	F	=O		CH ₃	O	O	NA	NA
E3-10	Het1A	H	H	H	H	=S		CH ₂ CH ₃	O	O	0.671	370.1

E4. Compuestos de ejemplos de fórmula



E4

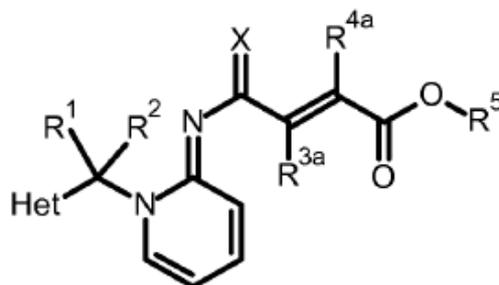
con sus datos físicoquímicos se dan en la tabla E4 a continuación.

Tabla E4:

No.	Het	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{4a}	R ⁵	X	Y	RT [min]	m/z [MH] ⁺
E4-1	Het1A	H	H	H	H	CH ₂ CH ₃	O	S	NA	NA

5

E5. Compuestos de ejemplos de fórmula



E5

con sus datos físicoquímicos se dan en la tabla E5 a continuación.

Tabla E5:

No.	Het	R ¹	R ²	R ^{3a}	R ^{4a}	R ⁵	X	RT [min]	m/z [MH] ⁺
E5-1	Het1A	H	H	H	H	CH ₂ CH ₃	O	0.750	346.5

10

B. Ejemplos biológicos

La actividad biológica de los compuestos de fórmula I de la presente invención puede evaluarse en pruebas biológicas como se describe en lo que sigue.

15 Condiciones generales: Si no se especifica otra cosa, la mayoría de las soluciones de prueba se prepararán como sigue: El compuesto activo se disolverá a la concentración deseada en una mezcla de agua destilada 1: 1 (vol: vol): acteon. Además, las soluciones de prueba deben prepararse en el día de uso (y, si no se especifica lo contrario, en general a concentraciones de peso/vol).

B.1 Áfido verde del melocotón (Myzus persicae)

20 Los compuestos activos se formularon mediante un manipulador de líquido Tecan en 100 % de ciclohexanona como una solución de 10.000 ppm suministrada en tubos. La solución de 10.000 ppm se diluyó en serie en ciclohexanona al 100 % para obtener soluciones provisionales. Éstas sirvieron como soluciones de reserva para las cuales se hicieron diluciones finales con Tecan en 50 % de acetona: 50 % de agua (v/v) en viales de vidrio de 5 o 10 ml. Se incluyó un

surfactante no iónico (Kinetic®) en la solución a un volumen de 0,01 % (v/v). Los viales se insertaron entonces en un aspersor electrostático automatizado equipado con una boquilla atomizadora para aplicación a plantas/insectos.

5 Las plantas de pimiento verde en la primera etapa de hoja verdadera se infestaron antes del tratamiento colocando hojas fuertemente infestadas de la colonia principal encima de las plantas de tratamiento. Se permitió que los áfidos se transfirieran durante la noche para conseguir una infestación de 30-50 áfidos por planta y se retiraron las hojas huésped. Las plantas infestadas se asperjaron entonces mediante un aspersor de plantas electrostático automatizado equipado con una boquilla atomizadora de aspersión. Las plantas se secaron en la campana aspersora de humos, se retiraron y luego se mantuvieron en una sala de crecimiento bajo iluminación fluorescente en un fotoperíodo de 24 horas a aproximadamente 25°C y aproximadamente 20-40 % de humedad relativa. La mortalidad de los áfidos en las plantas tratadas, en relación con la mortalidad en plantas de control no tratadas, se determinó después de 5 días.

10 En esta prueba, los compuestos E1-6, E1-7, E1-8, E1-9, E1-10, E2- 1, E2- 2, E2- 3, E2- 4, E2- 5, E2- 6, E2- 7, E2- 8, E2- 9, E2- 10, E2- 11, E2- 12, E2- 13, E2- 14, E2- 15, E2- 16, E2- 17, E2- 18, E2- 19, E2- 20, E2- 21, E2- 22, E2- 26, E2- 27, E2- 28, E2- 30, E2- 31, E2- 32, E2- 33, E2- 34, E2- 35, E2- 36, E2- 37, E2- 38, E2- 42, E2- 44, E2- 45, E2- 46, E2- 50, E2- 51, E2- 53, E2- 54, E2- 55, E2- 57, E2- 58, E2- 59, E2- 60, E2- 62, E2- 63, E2- 64, E2- 66, E2- 67, E2- 69, E2- 70, E2- 71, E2- 72, E2- 74, E2- 75, E2- 76, E2- 77, E2- 78, E2- 79, E2- 80, E2- 82, E2- 83, E2- 84, E2- 87, E2- 88, E2- 89, E2- 90, E2- 91, E2- 92, E2- 95, E2- 97, E2- 98, E2- 99, E2- 100, E2- 101, E2- 102, E2- 103, E2- 104, E2- 105, E2- 108, E2- 109, E2- 110, E2- 111, E2- 112, E2- 113, E2- 114, E2- 120, E2- 121, E2- 122, E2- 123, E2- 124, E2- 125, E2- 126, E2- 127, E2- 128, E2- 129, E2- 131, E2- 132, E2- 133, E2- 134, E2- 135, E2- 138, E2- 139, E2- 140, E2- 141, E2- 142, E2- 144, E2- 145, E2- 146, E2- 147, E2- 150, E2- 152, E2- 154, E2- 155, E2- 156, E2- 157, E2- 158, E2- 159, E2- 161, E2- 163, E2- 164, E2- 165, E2- 166, E2- 167, E2- 168, E2- 169, E2- 170, E2- 171, E2- 172, E2- 173, E2- 174, E2- 175, E2- 176, E2- 177, E2- 178, E2- 179, E2- 180, E2- 181, E2- 182, E2- 183, E2- 184, E2- 185, E2- 187, E2- 188, E2- 189, E2- 191, E2- 192, E2- 193, E2- 194, E2- 195, E2- 196, E2- 200, E2- 201, E2- 203, E2- 205, E2- 207, E2- 208, E2- 209, E2- 211, E3- 1, E3- 2, E3- 5, E3- 6, E3- 7, E3- 8, E3- 9, E4- 1, y E5- 1 a 2500 ppm mostraron al menos 75 % de mortalidad en comparación con los controles no tratados.

25 B.2 Áfido del algarrobo (*Megoura viciae*)

Para evaluar el control del áfido del algarrobo (*Megoura viciae*) a través de medios de contacto o sistémicos, la unidad de prueba consistió en placas de microtitulación de 24 pozos que contenían discos anchos de hojas de frijol.

30 Los compuestos se formularon usando una solución que contenía 75 % v/v de agua y 25 % v/v de DMSO. Se asperjaron diferentes concentraciones de compuestos formulados sobre los discos de hojas a 2,5 µl, usando un microatomizador construido a medida, en dos repeticiones.

Después de la aplicación, los discos de hojas se secaron al aire y se colocaron 5-8 áfidos adultos en los discos de hojas dentro de los pozos de placas de microtitulación. Después se dejó que los áfidos succionaran los discos de hojas tratadas y se incubaron a aproximadamente 23 ± 1 °C y aproximadamente 50 ± % de humedad relativa durante 5 días. A continuación, se evaluó visualmente la mortalidad y la fecundidad de los áfidos.

35 En esta prueba, los compuestos E1-6, E1-8, E1-9, E1-10, E2- 1, E2- 2, E2- 3, E2- 4, E2- 5, E2- 6, E2- 7, E2- 8, E2- 9, E2- 10, E2- 11, E2- 12, E2- 13, E2- 14, E2- 15, E2- 16, E2- 17, E2- 19, E2- 20, E2- 21, E2- 24, E2- 27, E2- 28, E2- 31, E2- 33, E2- 34, E2- 36, E2- 44, E2- 45, E2- 50, E2- 51, E2- 53, E2- 55, E2- 57, E2- 58, E2- 59, E2- 63, E2- 66, E2- 69, E2- 71, E2- 72, E2- 74, E2- 75, E2- 76, E2- 82, E2- 87, E2- 95, E2- 98, E2- 99, E2- 104, E2- 105, E2- 109, E2- 110, E2- 111, E2- 112, E2- 114, E2- 120, E2- 121, E2- 124, E2- 125, E2- 126, E2- 127, E2- 128, E2- 129, E2- 131, E2- 132, E2- 135, E2- 138, E2- 139, E2- 140, E2- 141, E2- 142, E2- 145, E2- 146, E2- 147, E2- 150, E2- 152, E2- 154, E2- 155, E2- 156, E2- 157, E2- 158, E2- 159, E2- 163, E2- 164, E2- 165, E2- 166, E2- 167, E2- 168, E2- 169, E2- 170, E2- 171, E2- 172, E2- 173, E2- 174, E2- 176, E2- 177, E2- 178, E2- 179, E2- 180, E2- 181, E2- 182, E2- 183, E2- 184, E2- 185, E2- 187, E2- 188, E2- 189, E2- 191, E2- 192, E2- 194, E2- 195, E2- 200, E2- 203, E2- 205, E2- 207, E2- 208, E2- 209, E2- 211, E3- 1, E3- 2, E3- 5, E3- 6, E3- 8, E3- 9, E4- 1, y E5- 1 a 2500 ppm mostraron al menos 75 % de mortalidad en comparación con los controles no tratados.

45 B.3 Áfido del algodón (*Aphis gossypii*)

50 Los compuestos activos se formularon mediante un manipulador de líquido Tecan en 100 % de ciclohexanona como una solución de 10.000 ppm suministrada en tubos. La solución de 10.000 ppm se diluyó en serie en ciclohexanona al 100 % para obtener soluciones provisionales. Éstas sirvieron como soluciones de reserva para las cuales se hicieron diluciones finales con Tecan en 50 % de acetona: 50 % de agua (v/v) en viales de vidrio de 5 o 10 ml. Se incluyó un surfactante no iónico (Kinetic®) en la solución a un volumen de 0,01 % (v/v). Los viales se insertaron entonces en un aspersor electrostático automatizado equipado con una boquilla atomizadora para aplicación a plantas/insectos.

55 Las plantas de algodón en la etapa del cotiledón fueron infestadas con áfidos antes del tratamiento colocando una hoja fuertemente infestada de la colonia principal de áfidos encima de cada cotiledón. Se permitió que los áfidos se transfirieran durante la noche para lograr una infestación de 80-100 áfidos por planta y se retiró la hoja huésped. Las plantas infestadas se pulverizaron entonces mediante un pulverizador de plantas electrostáticas automatizado equipado con una boquilla atomizadora de pulverización. Las plantas se secaron en la campana aspersora de humos, se retiraron del aspersor y luego se mantuvieron en una sala de crecimiento bajo iluminación fluorescente en un

fotoperíodo de 24 horas a 25°C y una humedad relativa del 20-40 %. La mortalidad de los áfidos en las plantas tratadas, en relación con la mortalidad en plantas de control no tratadas, se determinó después de 5 días.

En esta prueba, los compuestos E1-8, E2- 4, E2- 14, E2- 139, E2- 154, E2-155, E2- 159 y E2-184 a 500 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75 % en comparación con los controles no tratados.

5 B.4 Ápido del caupí (*Aphis craccivora*)

El compuesto activo se disolvió a la concentración deseada en una mezcla de 1:1 (vol:vol) de agua destilada: acetona. Se añadió surfactante (Alkamuls® EL 620) a una tasa de 0,1 % (vol/vol). La solución de prueba se preparó el día de uso.

10 Las plantas de caupí en maceta se colonizaron con aproximadamente 50 - 100 áfidos de divesas etapas transfiriendo manualmente un corte de tejido de hoja de planta infestada 24 horas antes de la aplicación. Las plantas se asperjaron después de que se registró la población de plagas. Las plantas tratadas se mantuvieron en carros livianos a aproximadamente 28 °C. El porcentaje de mortalidad se evaluó después de 72 horas.

15 En esta prueba, los compuestos E1-6, E1-8, E1-9, E1-10, E2- 2, E2- 3, E2- 4, E2- 5, E2- 6, E2- 7, E2- 8, E2- 9, E2- 12, E2- 13, E2- 14, E2- 15, E2- 16, E2- 17, E2- 19, E2- 20, E2- 21, E2- 26, E2- 28, E2- 34, E2- 51, E2- 57, E2- 58, E2- 59, E2- 61, E2- 66, E2- 71, E2- 74, E2- 75, E2- 76, E2- 82, E2- 95, E2- 98, E2- 99, E2- 101, E2- 105, E2- 107, E2- 111, E2- 112, E2- 113, E2- 114, E2- 115, E2- 120, E2- 124, E2- 125, E2- 126, E2- 127, E2- 128, E2- 129, E2- 131, E2- 133, E2- 138, E2- 139, E2- 141, E2- 142, E3- 1, E3- 2, E3- 5, E3- 6, E3- 7, E3- 8, E3- 9, E4- 1, y E5- 1 a 500 ppm mostraron al menos 75 % de mortalidad en comparación con los controles no tratados.

B.5 Mosca blanca de las hojas plateadas (*bemisia argentifolii*)

20 Los compuestos activos se formularon mediante un manipulador de líquido Tecan en 100 % de ciclohexanona como una solución de 10.000 ppm suministrada en tubos. La solución de 10.000 ppm se diluyó en serie en ciclohexanona al 100 % para obtener soluciones provisionales. Éstas sirvieron como soluciones de reserva para las cuales se hicieron diluciones finales con Tecan en 50 % de acetona: 50 % de agua (v/v) en viales de vidrio de 5 o 10 ml. Se incluyó un surfactante no iónico (Kinetic®) en la solución a un volumen de 0,01 % (v/v). Los viales se insertaron entonces en un aspersor electrostático automatizado equipado con una boquilla atomizadora para aplicación a plantas/insectos.

30 Las plantas de algodón en la etapa de cotiledón (una planta por pozo) fueron asperjadas mediante un aspersor de plantas electrostático automatizado con una boquilla pulverizadora atomizadora. Las plantas se secaron en la campana aspersora de humos y luego se retiraron del aspersor. Cada maceta se colocó en una taza de plástico y se introdujeron aproximadamente 10 a 12 adultos de mosca blanca (aproximadamente 3-5 días de edad). Los insectos se recogieron utilizando un aspirador y un tubo Tygon® no tóxico conectado a una punta de pipeta de barrera. La punta, que contenía los insectos recogidos, se introdujo suavemente en el suelo que contenía la planta tratada, permitiendo a los insectos arrastrarse fuera de la punta para alcanzar el follaje para su alimentación. Las tazas se cubrieron con una tapa reutilizable. Las plantas de ensayo se mantuvieron en una sala de crecimiento a aproximadamente 25°C y aproximadamente 20-40 % de humedad relativa durante 3 días, evitando la exposición

35 directa a luz fluorescente (fotoperíodo de 24 horas) para evitar el atrapamiento de calor dentro de la taza. La mortalidad se evaluó 3 días después del tratamiento, en comparación con las plantas de control no tratadas.

En esta prueba, los compuestos E1-8, E2- 4, E2- 5, E2- 9, E2- 14, E2- 139, E2- 143, E2- 147, E2- 155, y E2- 189 a 500 ppm mostraron al menos 75 % de mortalidad en comparación con los controles no tratados.

B.6 Tisanópteros de la orquídea (*dichromothrips corbettii*)

40 *Dichromothrips corbettii* adultos utilizados para el bioensayo se obtuvieron a partir de una colonia mantenida continuamente bajo condiciones de laboratorio. Para fines de prueba, el compuesto de prueba se diluye en una mezcla 1: 1 de acetona: agua (vol: vol), más 0,01 % vol/vol de surfactante Alkamuls® EL 620.

45 La potencia de los trips de cada compuesto se evaluó usando una técnica de inmersión floral. Se utilizaron placas de petri plásticas como campos de prueba. Todos los pétalos de las flores de orquídeas individuales, intactas se sumergieron en solución de tratamiento y se dejaron secar. Las flores tratadas se colocaron en placas de petri individuales junto con aproximadamente 20 trips adultos. Las placas de petri se cubrieron entonces con tapas. Todos los campos de prueba se mantuvieron bajo luz continua y una temperatura de aproximadamente 28 °C durante la duración del ensayo. Después de 3 días, el número de trips vivos se contaron en cada flor, y a lo largo de las paredes internas de cada placa de petri. El porcentaje de mortalidad se registró 72 horas después del tratamiento.

50 En esta prueba, los compuestos E1-8, E1-10, E2- 2, E2- 4, E2- 5, E2- 6, E2- 7, E2- 9, E2- 11, E2- 12, E2- 14, E2- 15, E2- 16, E2- 17, E2- 19, E2- 20, E2- 21, E2- 25, E2- 28, E2- 32, E2- 35, E2- 45, E2- 46, E2- 47, E2- 48, E2- 50, E2- 51, E2- 56, E2- 58, E2- 59, E2- 61, E2- 64, E2- 66, E2- 71, E2- 72, E2- 74, E2- 75, E2- 76, E2- 77, E2- 79, E2- 80, E2- 82, E2- 86, E2- 91, E2- 95, E2- 98, E2- 99, E2- 107, E2- 113, E2- 114, E2- 117, E2- 120, E2- 124, E2- 126, E2- 128, E2- 129, E2- 131, E2- 133, E2- 138, E2- 139, E2- 140, E3- 5, E3- 6, E3- 9, E4- 1, y E5- 1 a 500 ppm mostraron al menos

55 75 % de mortalidad en comparación con los controles no tratados.

B.7 Saltamontes verde del arroz (*Nephotettix virescens*)

5 Las plántulas de arroz se limpiaron y se lavaron 24 horas antes de la aspersión. Los compuestos activos se formularon en acetona: agua (vol:vol) 50:50, y se añadió surfactante 0,1 % vol/vol (EL 620). Las plántulas de arroz en maceta se asperjaron con 5 ml de solución de prueba, se secaron al aire, se pusieron en jaulas y se inocularon con 10 adultos. Las plantas de arroz tratadas se mantuvieron a aproximadamente 28- 29 °C y humedad relativa de aproximadamente 50 - 60 %. El porcentaje de mortalidad se registró después de 72 horas.

10 En esta prueba, los compuestos E1-6, E1-8, E1-9, E1-10, E2- 3, E2- 4, E2- 5, E2- 6, E2- 7, E2- 8, E2- 9, E2- 10, E2- 11, E2- 12, E2- 14, E2- 15, E2- 16, E2- 17, E2- 19, E2- 20, E2- 21, E2- 28, E2- 34, E2- 35, E2- 45, E2- 50, E2- 51, E2- 53, E2- 56, E2- 57, E2- 58, E2- 59, E2- 71, E2- 74, E2- 75, E2- 76, E2- 82, E2- 98, E2- 112, E2- 114, E2- 116, E2- 117, E2- 118, E2- 120, E2- 121, E2- 124, E2- 125, E2- 126, E2- 127, E2- 128, E2- 129, E2- 131, E2- 132, E2- 134, E2- 135, E2- 136, E2- 138, E2- 139, E2- 141, E2- 142, E2- 144, E3- 2, E3- 5, E3- 6, E3- 9, y E4- 1 a 500 ppm mostraron al menos 75 % de mortalidad en comparación con los controles no tratados.

B.8 Saltamontes marrón del arroz (*Nilaparvata lugens*)

15 Las plántulas de arroz se limpiaron y se lavaron 24 horas antes de la aspersión. Los compuestos activos se formularon en acetona: agua 50:50 (vol: vol) y se añadió surfactante 0,1 % vol/vol (EL 620). Las plántulas de arroz en maceta se asperjaron con 5 ml de solución de prueba, se secaron al aire, se pusieron en jaulas y se inocularon con 10 adultos. Las plantas de arroz tratadas se mantuvieron a aproximadamente 28-29°C y humedad relativa de aproximadamente 50 - 60 %. El porcentaje de mortalidad se registró después de 72 horas.

20 En esta prueba, los compuestos E1-6, E1-9, E1-10, E2- 3, E2- 4, E2- 5, E2- 6, E2- 7, E2- 8, E2- 9, E2- 12, E2- 13, E2- 14, E2- 15, E2- 17, E2- 19, E2- 20, E2- 21, E2- 28, E2- 34, E2- 35, E2- 45, E2- 50, E2- 51, E2- 56, E2- 57, E2- 58, E2- 59, E2- 71, E2- 74, E2- 75, E2- 76, E2- 98, E2- 114, E2- 120, E2- 126, E2- 129, E2- 131, E2- 133, E2- 135, E2- 139, E2- 142, E3- 5, E3- 6, y E4- 1 a 500 ppm mostraron al menos 75 % de mortalidad en comparación con los controles no tratados.

B.9 Gorgojo de la cápsula (*Anthonomus grandis*)

25 Para evaluar el control del gorgojo de la cápsula (*Anthonomus grandis*), la unidad de prueba consistió en placas de microtitulación de 96 pozos que contenían una dieta de insectos y 5-10 huevos de *A. grandis*.

Los compuestos se formularon usando una solución que contenía 75 % v/v de agua y 25 % v/v de DMSO. Diferentes concentraciones de compuestos formulados se asperjaron sobre la dieta de insectos a 5 µl, usando un micro atomizador construido a medida, en dos repeticiones.

30 Después de la aplicación, las placas de microtitulación se incubaron a aproximadamente 25 ± 1 °C y aproximadamente 75 ± 5°C de humedad relativa durante 5 días. La mortalidad de huevos y larvas se evaluó visualmente.

35 En esta prueba, los compuestos E2- 2, E2- 4, E2- 6, E2- 7, E2- 14, E2- 15, E2- 17, E2- 33, E2- 39, E2- 49, E2- 53, E2- 57, E2- 66, E2- 74, E2- 82, E2- 84, E2- 99, E2- 100, E2- 110, E2- 112, E2- 113, E2- 116, E2- 122, E2- 123, E2- 126, E2- 132, E2- 154, E2- 159, E2- 180, E2- 189, y E2- 195 a 500 ppm mostraron al menos 75 % de mortalidad en comparación con los controles no tratados.

B.10 Mosca de la fruta mediterránea (*Ceratitis capitata*)

Para evaluar el control de la mosca de la fruta del Mediterráneo (*Ceratitis capitata*) la unidad de prueba consistió en placas de microtitulación que contenían una dieta de insectos y 50-80 huevos de *C. capitata*.

40 Los compuestos se formularon usando una solución que contenía 75 % v/v de agua y 25 % v/v de DMSO. Diferentes concentraciones de compuestos formulados se asperjaron sobre la dieta de insectos a 5 µl, usando un micro atomizador construido a medida, en dos repeticiones.

Después de la aplicación, las placas de microtitulación se incubaron a aproximadamente 28 ± 1 °C y aproximadamente 80 ± 5 % de humedad relativa durante 5 días. La mortalidad de huevos y larvas se evaluó visualmente.

45 En esta prueba, los compuestos E2- 3, E2- 4, E2- 7, E2- 12, E2- 15, E2- 17, E2- 35, E2- 39, E2- 46, E2- 63, E2- 66, E2- 69, E2- 72, E2- 74, E2- 76, E2- 78, E2- 92, E2- 95, E2- 97, E2- 99, E2- 100, E2- 105, E2- 107, E2- 108, E2- 109, E2- 110, E2- 121, E2- 140, E2- 159, y E3- 6 a 2500 ppm mostraron al menos 75 % de mortalidad en comparación con los controles no tratados.

B.11 Gusano del cogollo del tabaco (*Heliothis virescens*)

50 Para evaluar el control del gusano del cogollo del tabaco (*Heliothis virescens*), la unidad de ensayo consistió en placas de microtitulación de 96 pozos que contenían una dieta de insectos y 15-25 huevos de *H. virescens*.

ES 2 630 373 T3

Los compuestos se formularon usando una solución que contenía 75 % v/v de agua y 25 % v/v de DMSO. Diferentes concentraciones de compuestos formulados se asperjaron sobre la dieta de insectos a 10 µl, usando un microatomizador construido a medida, en dos repeticiones.

- 5 Después de la aplicación, las placas de microtitulación se incubaron a aproximadamente 28 + 1°C y aproximadamente 80 + 5 % de humedad relativa durante 5 días. La mortalidad de huevos y larvas se evaluó visualmente.

En esta prueba, los compuestos E2- 2, E2- 4, E2- 13, E2- 14, E2- 15, E2- 26, E2- 44, E2- 49, E2- 51, E2- 66, E2- 105, E2- 109, E2- 110, E2- 113, E2- 116, E2- 132, E2- 153, E2- 155, E2- 156, E2- 159, E2- 193, E3- 1, y E3- 2, a 2500 ppm mostraron al menos 75 % de mortalidad en comparación con los controles no tratados.

B.12 Polilla dorso de diamante (*Plutella xylostella*)

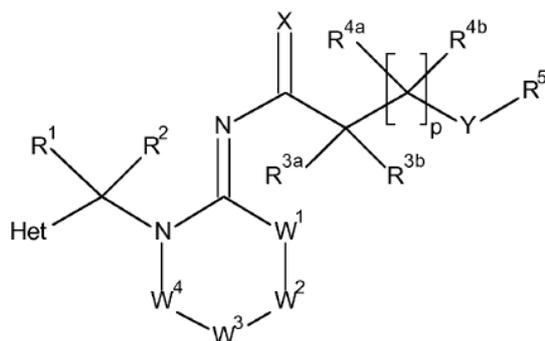
- 10 El compuesto activo se disuelve a la concentración deseada en una mezcla de 1:1 (vol: vol) de agua destilada: acetona. Se añade surfactante (Alkamuls® EL 620) a una tasa de 0,1 % (vol/vol). La solución de prueba se prepara el día de uso.

- 15 Las hojas de repollo se sumergieron en solución de prueba y se secaron al aire. Las hojas tratadas se colocaron en una placa petri forrada con papel de filtro húmedo y se inocularon con diez larvas de 3er estadio. La mortalidad se registró 72 horas después del tratamiento. También se registraron los daños en alimentación usando una escala del 0-100 %.

En esta prueba, los compuestos E2- 5, E2- 6, E2- 9, E2- 19, E2- 44, E2-49, E2- 51, E2- 58, E2- 59, E2- 113, E2- 124, y E2- 145 a 500 ppm mostraron al menos 75 % de mortalidad en comparación con los controles no tratados.

REIVINDICACIONES

1. Compuestos de piridilidencarbonilo N-sustituídos de fórmula (I):



(I)

en donde

5 p es un entero seleccionado de 0, 1, 2, 3, 4, 5 o 6;

X es O o S;

Y es O o S(O)m, en donde m es 0, 1, 2;

10 Het es un sistema de anillo heterocíclico o heteroaromático unido a carbono de 5 o 6 miembros u opcionalmente unido a nitrógeno, cada uno de los miembros del anillo seleccionados de átomos de carbono y al menos uno, hasta tres heteroátomos seleccionados independientemente de azufre, oxígeno o nitrógeno, en donde los miembros de anillo de carbono, azufre y nitrógeno pueden ser independientemente oxidados parcial o totalmente, y en el que cada anillo está opcionalmente sustituido con sustituyentes k seleccionados de R^{6a}, en donde k es un entero seleccionado de 1, 2, 3, 4, o 5, y dos o más sustituyentes R^{6a} se seleccionan independientemente unos de otros;

15 W¹, W², W³ y W⁴ representan un grupo de cadena de carbono conectado a N y C=N, y forman así un heterociclo que contiene nitrógeno de 5 o 6 miembros saturado, insaturado o parcialmente insaturado,

20 en donde W¹, W², W³ y W⁴ cada uno representa independientemente CR^w, en donde cada R^w se selecciona independientemente uno de otro de hidrógeno, halógeno, ciano, azido, nitro, SCN, SF₅, C₁-C₁₀-alquilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₂-C₁₀-alqueno, C₂-C₁₀-alquino, y en donde los átomos de carbono de los radicales alifáticos y cicloalifáticos anteriormente mencionados pueden estar no sustituidos o pueden estar parcial o totalmente halogenados o pueden estar opcionalmente además sustituidos independientemente uno de otro con uno o más R⁷;

OR⁸, NR^{9a}R^{9b}, S(O)_nR⁸, S(O)_nNR^{9a}R^{9b}, C(=O)R⁷, C(=O)NR^{9a}R^{9b}, C(=O)OR⁸, C(=S)R⁷, C(=S)NR^{9a}R^{9b}, C(=S)OR⁸, C(=S)SR⁸, C(=NR^{9a})R⁷, C(=NR^{9a})NR^{9a}R^{9b}, Si(R¹¹)₂R¹²;

fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R¹⁰;

25 un anillo heterocíclico aromático saturado, parcialmente saturado o insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R¹⁰, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden estar opcionalmente oxidados;

o

30 dos de R^w presentes en un átomo de carbono del anillo pueden formar juntos =O, =CR¹³R¹⁴, =S =NR^{17a}, =NOR¹⁶; =NNR^{17a};

o

dos R^w de átomos de carbono adyacentes, pueden formar ambos juntos y junto con el enlace existente un doble enlace entre los átomos de carbono adyacentes;

y en donde

35 uno de W² o W³ puede opcionalmente representar un enlace simple o doble entre los átomos de carbono adyacentes;

R¹, R² son independientemente uno de otro seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, CN, SCN, nitro C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, en donde cada uno de los radicales mencionados anteriormente está no sustituido, parcialmente o completamente halogenado o puede llevar cualquier combinación de uno o más radicales

R^7 ; $Si(R^{11})_2R^{12}$, OR^{16} , OSO_2R^{16} , $S(O)_nR^{16}$, $S(O)_nNR^{17a}R^{17b}$, $NR^{17a}R^{17b}$, $C(=O)NR^{17a}R^{17b}$, $C(=S)NR^{17a}R^{17b}$, $C(=O)OR^{16}$, $C(=O)R^{15}$, $C(=S)R^{15}$;

5 fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más, por ejemplo 1, 2, 3, 4 o sustituyentes R^{10} , que se seleccionan independientemente unos de otros, un anillo heterocíclico aromático saturado, parcialmente saturado o insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3 o 4, sustituyentes R^{10} , seleccionados independientemente uno de otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden estar opcionalmente oxidados,

o

10 R^1 y R^2 forman, junto con el átomo de carbono al que se unen, un anillo carbocíclico o heterocíclico saturado o parcialmente insaturado de 3 a 6 miembros, en donde cada uno de los átomos de carbono de dicho ciclo no está sustituido o puede llevar cualquier combinación de 1 o 2 radicales R^7 ,

o

R^1 y R^2 pueden ser juntos $=O$, $=CR^{13}R^{14}$; $=S$; $=NR^{17a}$, $=NOR^{16}$; $=NNR^{17a}$;

15 R^{3a} , R^{3b} se seleccionan cada uno independientemente uno del otro del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, CN, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -alcoxi, C_1 - C_6 -alquiltio, C_1 - C_6 -alquilsulfonilo, C_1 - C_6 -alquilsulfonilo y C_3 - C_8 -cicloalquilo, en donde cada uno de los seis últimos radicales mencionados están sin sustituir, parcial o totalmente halogenados, OR^8 , OSO_2R^8 , $S(O)_nR^8$, $S(O)_nNR^{9a}R^{9b}$, $NR^{9a}R^{9b}$, $C(=O)NR^{9a}R^{9b}$, $C(=S)NR^{9a}R^{9b}$, $C(=O)R^7$, $C(=S)R^7$,

fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más, por ejemplo 1, 2, 3, 4 o sustituyentes R^{10} , que se seleccionan independientemente unos de otros,

20 un anillo heterocíclico aromático saturado, parcialmente saturado o insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3 o 4, sustituyentes R^{10} , seleccionados independientemente uno de otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden estar opcionalmente oxidados,

o

25 en donde R^{3a} y R^{3b} pueden formar junto con el átomo de carbono al que están unidos, un anillo alifático de 3, 4 o 5 miembros, en donde cada uno de los átomos de carbono del anillo puede estar no sustituido o puede estar parcial o totalmente halogenado,

o

en donde R^{3a} y R^{3b} pueden formar juntos $=O$, $=CR^{13}R^{14}$; $=S$, $=NR^{17a}$, $=NOR^{16}$; $=NNR^{17a}$,

30 y, si p es 1 o más, entonces uno de R^{3a} o R^{3b} pueden formar un doble enlace con el R^{4a} o R^{4b} del átomo de carbono adyacente R^{4a} , R^{4b} se seleccionan cada uno independientemente uno de otro e independientemente del entero de p del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, CN, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -alcoxi, C_1 - C_6 -alquiltio, C_1 - C_6 -alquilsulfonilo, C_1 - C_6 -alquilsulfonilo y C_3 - C_8 -cicloalquilo, en donde cada uno de los seis últimos radicales mencionados están sin sustituir, parcial o totalmente halogenados,

35 o

en donde R^{4a} y R^{4b} pueden formar junto con el átomo de carbono al que están unidos, un anillo carbocíclico alifático de 3, 4 o 5 miembros, en donde cada uno de los átomos de carbono del anillo puede estar no sustituido o puede estar parcial o totalmente halogenado,

o

40 en donde R^{4a} y R^{4b} pueden formar juntos $=O$, $=CR^{13}R^{14}$; $=S$, $=NR^{17a}$, $=NOR^{16}$; $=NNR^{17a}$,

o, si p es 1 o más,

45 uno de R^{4a} o R^{4b} puede formar un doble enlace con R^{3a} o R^{3b} o con otro R^{4a} , o R^{4b} de los átomos de carbono adyacentes. R^5 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, ciano, C_1 - C_6 -alquilo, C_7 - C_{12} -alquilo, C_1 - C_6 -alquiltio, C_1 - C_6 -alquilsulfonilo, C_1 - C_6 -alquilsulfonilo, C_3 - C_8 -cicloalquilo, C_3 - C_8 -cicloalquiltio, C_3 - C_8 -cicloalquilsulfonilo, C_3 - C_8 -cicloalquilsulfonilo, C_2 - C_6 -alqueno, C_2 - C_6 -alquenoiltio, C_2 - C_6 -alqueniilsulfonilo, C_2 - C_6 -alqueniilsulfonilo, C_2 - C_6 -alquini, C_2 - C_6 -alquiniiltio, C_2 - C_6 -alquiniilsulfonilo y C_2 - C_6 -alquiniilsulfonilo en donde los átomos de carbono de los últimos radicales alifáticos y cicloalifáticos antes mencionados están sin sustituir, parcial o totalmente halogenados o pueden llevar cualquier combinación de uno o más radicales R^7 ;

$C(=O)NR^{9a}R^{9b}$ $C(=S)NR^{9a}R^{9b}$, $C(=O)R^7$, $C(=S)R^7$;

fenilo o CH₂-fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más, por ejemplo 1, 2, 3, 4 o sustituyentes R¹⁰, que se seleccionan independientemente unos de otros;

5 un anillo heterocíclico aromático saturado, parcialmente saturado o insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituido con q sustituyentes R^y, seleccionados independientemente de q e independientemente unos de otros, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden estar opcionalmente oxidados, en donde el anillo heterocíclico puede unirse directamente o enlazarse mediante un grupo CH₂ al resto de la molécula, y en donde

q es un entero seleccionado de 1, 2, 3 o 4, y

10 R^y se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, C₁-C₁₀-alquilo, C₂-C₁₀-alqueno, en donde los átomos de carbono de los radicales alifáticos anteriormente mencionados pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o más R¹⁵, que se seleccionan independientemente unos de otros,

OR¹⁶, -S(O)_nR¹⁶, S(O)_nNR^{17a}R^{17b}, NR^{17a}R^{17b} C(=O)R¹⁵, C(=O)OR¹⁶, -C(=NR^{17a})R¹⁵, C(=O)NR^{17a}R^{17b}, C(=S)NR^{17a}R^{17b},

o

15 dos R^y presentes juntos en un átomo de un heterocíclico parcialmente saturado pueden ser =O, =CR¹³R¹⁴, =NR^{17a}, =NOR¹⁶ o =NNR^{17a};

o

20 Dos R^y en átomos de carbono adyacentes puede ser un puente seleccionado de CH₂CH₂CH₂CH₂, CH=CH-CH=CH, N=CH-CH=CH, CH=N-CH=CH, N=CH-N=CH, CH₂CH₂CH₂, CH=CHCH₂, CH₂CH₂NR^{17a}, CH₂CH=N, CH=CH-NR^{17a}, y forman junto con los átomos de carbono a los que los dos R^y están unidos, un anillo carbocíclico o heterocíclico aromático fusionado parcialmente saturado o insaturado, de 5 miembros o de 6 miembros, en donde el anillo puede estar opcionalmente sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados de =O, OH, CH₃, OCH₃, halógeno, ciano, halometilo o halometoxi;

25 R^{6a} se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, azido, nitro, SCN, SF₅, C₁-C₁₀-alquilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₂-C₁₀-alqueno, C₂-C₁₀-alquino, y en donde los átomos de carbono de los radicales alifáticos y cicloalifáticos anteriormente mencionados pueden opcionalmente estar además sustituidos independientemente uno de otro con uno o más R⁷,

OR⁸, NR^{9a}R^{9b}, S(O)_nR⁸, S(O)_nNR^{9a}R^{9b}, C(=O)R⁷, C(=O)NR^{9a}R^{9b}, C(=O)OR⁸, C(=S)R⁷, C(=S)NR^{9a}R^{9b}, C(=S)OR⁸, C(=S)SR⁸, C(=NR^{9a})R⁷, C(=NR^{9a})NR^{9a}R^{9b}, Si(R¹¹)₂R¹²;

fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R¹⁰;

30 un anillo heterocíclico aromático saturado, parcialmente saturado o insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R¹⁰, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden estar opcionalmente oxidados;

35 o dos de R^{6a} presentes en un átomo de carbono o de azufre del anillo pueden formar juntos =O, =CR¹³R¹⁴; =S;; =NR^{17a}, =NOR¹⁶; =NNR^{17a};

40 o dos R^{6a} juntos forman una cadena de C₂-C₇ alqueno, formando así, junto con los átomos del anillo a los que están unidos, un anillo de 3, 4, 5, 6, 7 o 8 miembros, donde la cadena de alqueno puede estar interrumpida por 1 o 2 O, S y/o NR^{17a} y/o 1 o 2 de los grupos CH₂ de la cadena alqueno pueden ser reemplazados por un grupo C=O, C=S y/o C=NR^{17a}, y/o la cadena alqueno puede estar sustituida por uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-haloalquiltio, C₃-C₈-cicloalquilo, C₃-C₈-halocicloalquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-haloalqueno, C₂-C₆-alquino, C₂-C₆-haloalquino, penilo que puede estar sustituido por uno o más por ejemplo 1, 2, 3, 4 o 5 radicales R¹⁰, y un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o aromático de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados de N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros de anillo, donde el anillo heterocíclico puede estar sustituido por uno o más radicales R¹⁰;

45 R⁷ es cada uno independientemente uno de otro seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, azido, nitro, -SCN, SF₅, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alquilsulfino, C₁-C₆-alquilsulfonilo, C₁-C₆-haloalquiltio, C₃-C₈-cicloalquilo, C₃-C₈-halocicloalquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-haloalqueno, C₂-C₆-alquino, C₂-C₆ haloalquino, Si(R¹¹)₂R¹², OR¹⁶, OSO₂R¹⁶, S(O)_nR¹⁶, S(O)_nNR^{17a}R^{17b}, NR^{17a}R^{17b}, C(=O)NR^{17a}R^{17b}, C(=S)NR^{17a}R^{17b}, C(=O)OR¹⁶, C(=O)R¹⁵, C(=S)R¹⁵, C(=NR^{17a})R¹⁵,

50 fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R¹⁰, que se seleccionan independientemente unos de otros,

un anillo heterocíclico aromático saturado, parcialmente saturado o insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3 o 4 sustituyentes R¹⁰, seleccionados independientemente uno de otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden estar opcionalmente oxidados;

5 o

dos R⁷ presentes en un átomo de carbono pueden formar juntos =O, =CR¹³R¹⁴; =S;;, =NR^{17a}, =NOR¹⁶;=NNR^{17a};

o

dos R⁷ Pueden formar un anillo carbocíclico o heterocíclico saturado o parcialmente insaturado de 3, 4, 5, 6, 7 o 8 miembros junto con los átomos de carbono a los que están unidos los dos R⁷;

10 R⁸ es cada uno independientemente uno de otro seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno, ciano, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alquilsulfinilo, C₁-C₆-alquilsulfonilo, C₁-C₆-haloalquiltio, C₃-C₈-cicloalquilo, C₄-C₈-alquilcicloalquilo, C₃-C₈-halocicloalquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₂-C₆ haloalquinilo, -Si(R¹¹)₂R¹², S(O)_nR¹⁶, S(O)_nNR^{17a}R^{17b}, NR^{17a}R^{17b}, -N=CR¹³R¹⁴, -C(=O)R¹⁵, C(=O)NR^{17a}R^{17b}, C(=S)NR^{17a}R^{17b}, C(=O)OR¹⁶, fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R¹⁰; que se seleccionan independientemente unos de otros,

15 un anillo heterocíclico aromático saturado, parcialmente saturado o insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3 o 4 sustituyentes R¹⁰, seleccionados independientemente uno de otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden estar opcionalmente oxidados;

20 R^{9a}, R^{9b} son cada uno independientemente uno de otro seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-haloalquiltio, C₃-C₈-cicloalquilo, C₃-C₈-halocicloalquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₂-C₆ haloalquinilo, S(O)_nR¹⁶, -S(O)_nNR^{17a}R^{17b}, C(=O)R¹⁵, C(=O)OR¹⁶, C(=O)NR^{17a}R^{17b}, C(=S)R¹⁵, C(=S)SR¹⁶, C(=S)NR^{17a}R^{17b}, C(=NR^{17a})R¹⁵; fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más, por ejemplo 1, 2, 3 o 4, sustituyentes R¹⁰, que se seleccionan independientemente unos de otros;

25 un anillo heterocíclico aromático saturado, parcialmente saturado o insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3 o 4 sustituyentes R¹⁰, seleccionados independientemente uno de otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden estar opcionalmente oxidados;

30 o, R^{9a} y R^{9b} son juntos una cadena C₂-C₇ alquileo y forman un anillo aromático saturado, parcialmente saturado o insaturado de 3, 4, 5, 6, 7 u 8 miembros junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, en donde la cadena alquileo puede contener uno o dos heteroátomos seleccionados de oxígeno, azufre o nitrógeno, y puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-haloalquiltio, C₃-C₈-cicloalquilo, C₃-C₈-halocicloalquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₂-C₆ haloalquinilo,

35 fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R¹⁰; que se seleccionan independientemente unos de otros, un anillo heterocíclico aromático saturado, parcialmente saturado o insaturado de 3, 4, 5, 6, o 7 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R¹⁰, seleccionados independientemente uno de otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden estar opcionalmente oxidados;

40 o R^{9a} y R^{9b} juntos pueden formar un radical =CR¹³R¹⁴, =NR¹⁷ o =NOR¹⁶;

R¹⁰ es cada uno independientemente uno de otro seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, azido, nitro, SCN, SF₅, C₁-C₁₀-alquilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₂-C₁₀-alquenilo, C₂-C₁₀-alquinilo, en donde los átomos de carbono de los radicales alifáticos y cicloalifáticos anteriormente mencionados pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o más R¹⁵, que se seleccionan independientemente unos de otros, Si(R¹¹)₂R¹², OR¹⁶, OS(O)_nR¹⁶, -S(O)_nR¹⁶, S(O)_nNR^{17a}R^{17b}, NR^{17a}R^{17b}, C(=O)R¹⁵, C(=S)R¹⁵, C(=O)OR¹⁶, -C(=NR^{17a})R¹⁵, C(=O)NR^{17a}R^{17b}, C(=S)NR^{17a}R^{17b}, fenilo, opcionalmente sustituido con halógeno, ciano, nitro, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi o C₁-C₆-haloalcoxi,

45 un anillo heterocíclico aromático saturado, parcialmente saturado o insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente uno de otro de halógeno, ciano, NO₂, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi o C₁-C₆-haloalcoxi, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden estar opcionalmente oxidados;

o

50 dos R¹⁰ presentes juntos en un átomo de un heterocíclico parcialmente saturado pueden ser =O, =CR¹³R¹⁴ =NR^{17a}, =NOR¹⁶ o =NNR^{17a};

o,

dos R¹⁰ en átomos de carbono adyacentes puede ser un puente seleccionado de CH₂CH₂CH₂CH₂, CH=CH-CH=CH, N=CH-CH=CH, CH=N-CH=CH, N=CH-N=CH, OCH₂CH₂CH₂, OCH=CHCH₂, CH₂OCH₂CH₂, OCH₂CH₂O, OCH₂OCH₂, CH₂CH₂CH₂, CH=CHCH₂, CH₂CH₂O, CH=CHO, CH₂OCH₂, CH₂C(=O)O, C(=O)OCH₂, O(CH₂)O, SCH₂CH₂CH₂, SCH=CHCH₂, CH₂SCH₂CH₂, SCH₂CH₂S, SCH₂SCH₂, CH₂CH₂S, CH=SCH₂, CH₂C(=S)S, C(=S)SCH₂, S(CH₂)S, CH₂CH₂NR^{17a}, CH₂CH=N, CH=CH-NR^{17a}, OCH=N, SCH=N y forman junto con los átomos de carbono a los que los dos R¹⁰ están unidos, un anillo carbocíclico o heteocíclico aromático parcialmente saturado o insaturado de 5 miembros o 6 miembros, en donde el anillo puede estar opcionalmente sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados de =O, OH, CH₃, OCH₃, halógeno, ciano, halometilo o halometoxi;

10 R¹¹, R¹² (son cada uno independientemente uno de otro seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ haloalquilo, C₁-C₆ alcoxi, C₁-C₆ alcoxi-alquilo, C₂-C₆ alqueno, C₂-C₆ haloalqueno, C₂-C₆ alquino, C₂-C₆ haloalquino, C₃-C₈ cicloalquilo, C₃-C₈ halocicloalquilo, C₁-C₆ alcoxialquilo, C₁-C₆ haloalcoxialquilo y fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R¹⁰; que se seleccionan independientemente unos de otros;

15 R¹³, R¹⁴ son cada uno independientemente uno de otro seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno, C₁-C₄ alquilo, C₁-C₆ cicloalquilo, C₁-C₄ alcoxialquilo, fenilo y bencilo;

R¹⁵ es cada uno independientemente uno de otro seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, OH, SH, SCN, SF₅, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alquilsulfino, C₁-C₆-alquilsulfonilo, C₁-C₆-haloalquiltio, trimetilsililo, trietilsililo, *tert*butildimetilsililo,

20 C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₃-C₈-cicloalquilo, en donde los cuatro últimos radicales alifáticos y cicloalifáticos mencionados pueden estar no sustituidos, parcial o totalmente halogenados y/o oxigenados y/o pueden llevar 1 o 2 radicales seleccionados de C₁-C₄ alcoxi;

fenilo, bencilo, piridilo, fenoxi, en el que los cuatro últimos radicales pueden estar no sustituidos, parcial o totalmente halogenados y/o llevar 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados de C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, (C₁-C₆-alcoxi)carbonilo, (C₁-C₆-alquil)amino o di-(C₁-C₆-alquil)amino,

25 o

dos R¹⁵ presentes en el mismo átomo de carbono pueden ser juntos =O, =CH(C₁-C₄), =C(C₁-C₄-alquil)C₁-C₄-alquilo, =N(C₁-C₆-alquil) o =NO(C₁-C₆-alquil);

30 R¹⁶ es cada uno independientemente uno de otro seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno, ciano, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alquilsulfino, C₁-C₆-alquilsulfonilo, C₁-C₆-haloalquiltio, trimetilsililo, trietilsililo, *tert*butildimetilsililo, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₃-C₈-cicloalquilo, en donde los cuatro últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos, parcial o totalmente halogenados y/o oxigenados y/o pueden llevar 1 o 2 radicales seleccionados de C₁-C₄ alcoxi, fenilo, bencilo, piridilo, fenoxi, en el que los cuatro últimos radicales pueden estar no sustituidos, parcial o totalmente halogenados y/o llevar 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados de C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi o (C₁-C₆-alcoxi)carbonilo;

35 R^{17a}, R^{17b} son cada uno independientemente uno de otro seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno, ciano, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alquilsulfino, C₁-C₆-alquilsulfonilo, C₁-C₆-haloalquiltio, trimetilsililo, trietilsililo, *tert*butildimetilsililo,

40 C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₃-C₈-cicloalquilo, en donde los cuatro últimos radicales alifáticos y cicloalifáticos mencionados pueden estar no sustituidos, parcial o totalmente halogenados y/o oxigenados y/o pueden llevar 1 o 2 radicales seleccionados de C₁-C₄-alcoxi,

fenilo, bencilo, piridilo, fenoxi, en donde los cuatro últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos, parcial o totalmente halogenados y/o llevar 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados de C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi o (C₁-C₆-alcoxi)carbonilo,

o,

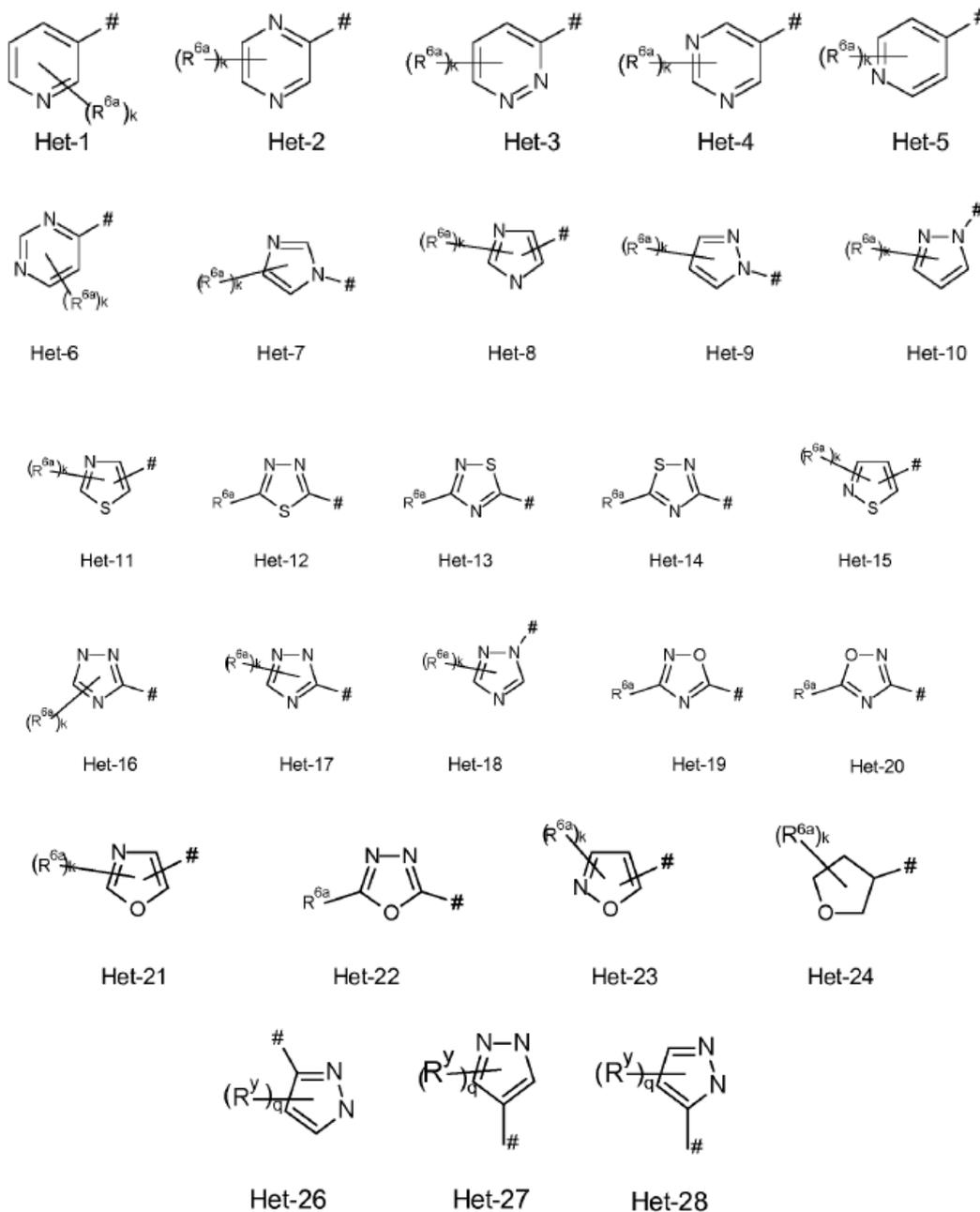
45 R^{17a} y R^{17b} pueden ser juntos una cadena C₂-C₆ alqueno que forma un anillo saturado, parcialmente saturado o insaturado de 3 a 7 miembros, junto con el átomo de nitrógeno R^{17a} y R^{17b} al que están unidos, en donde la cadena de alqueno puede contener 1 o 2 heteroátomos seleccionados de oxígeno, azufre o nitrógeno, y puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi o C₁-C₄-haloalcoxi, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden estar opcionalmente oxidados;

50 n es un entero seleccionado independientemente uno de otro de 0, 1 o 2;

y/o un enantiómero, diastereómero, E/Z-isómero o sales aceptables desde el punto de vista agrícola o veterinario de los mismos para controlar y/o combatir las plagas animales.

2. Los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, en donde

Het se selecciona del grupo que consiste en radicales de las siguientes fórmulas Het-1 a Het-28:



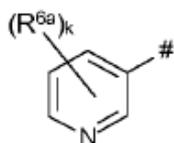
5 en donde # denota el enlace en la fórmula (I), y en donde

k es 0, 1 o 2; y

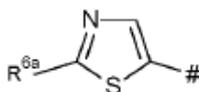
10 R^{6a} es cada uno independientemente uno de otro seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, C_1 - C_6 -alquilo, C_3 - C_8 -cicloalquilo, C_2 - C_6 -alqueno, C_2 - C_6 -alquino y en donde los átomos de carbono de los radicales alifáticos y cicloalifáticos anteriormente mencionados pueden opcionalmente estar además sustituidos independientemente uno de otro con uno o más R^7 , OR^8 , $NR^{9a}R^{9b}$, $S(O)_nR^8$, $S(O)_nNR^{9a}R^{9b}$, $C(=O)R^7$, $C(=O)NR^{9a}R^{9b}$, $C(=O)OR^8$, $C(=S)R^7$, $C(=S)NR^{9a}R^{9b}$, $C(=NR^{9a})R^7$, $C(=NR^{9a})NR^{9a}R^{9b}$.

3. Los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 2, en donde

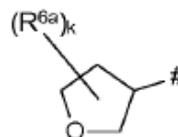
Het se selecciona del grupo que consiste en radicales de fórmulas Het-1, Het-11a y Het-24:



Het-1



Het-11a



Het-24

en donde # denota el enlace en la fórmula (I), y en donde

R^{6a} se selecciona de hidrógeno, halógeno, C_1 - C_4 -alcoxi o C_1 - C_4 -alquilo, en donde los átomos de carbono de los dos últimos radicales pueden estar parcial o totalmente halogenados;

5 k es 0, 1 o 2.

4. Los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde

R^1 , R^2 son independientemente uno de otro seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, CN, C_1 - C_6 -alquilo, C_3 - C_6 -cicloalquilo, C_1 - C_6 -haloalquilo, C_2 - C_6 -halocicloalquilo;

o

10 R^1 y R^2 pueden ser juntos =O, = $CR^{13}R^{14}$ o =S;

o

R^1 y R^2 forman, junto con el átomo de carbono, al que están unidos, un anillo carbocíclico saturado de 3 a 5 miembros, en particular

R^1 y R^2 son ambos hidrógeno,

15 o

R^1 es hidrógeno y R^2 es CH_3 .

5. Los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde

20 R^{3a} , R^{3b} se seleccionan cada uno independientemente uno del otro del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, CN, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -haloalquilo, C_1 - C_6 -alcoxi, C_1 - C_6 -haloalcoxi, C_1 - C_6 -haloalquiltio, C_1 - C_6 -alquiltio y OR^8 , en donde R^8 es $C(=O)R^{15}$, y R^{15} es C_1 - C_6 -alquilo, en donde el radical alifático puede estar no sustituido, parcial o totalmente halogenado, en particular

R^{3a} , R^{3b} se seleccionan cada uno independientemente uno del otro del grupo que consiste en hidrógeno, flúor, CN, C_1 - C_6 -alquilo y C_1 - C_6 -haloalquilo, o

25 R^{3a} , R^{3b} forman junto con el átomo de carbono al que están unidos, un anillo de ciclopropano, en donde cada uno de los átomos de carbono del anillo puede estar no sustituido o puede estar parcial o totalmente halogenado.

6. Los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, en donde

p es 0.

7. Los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde

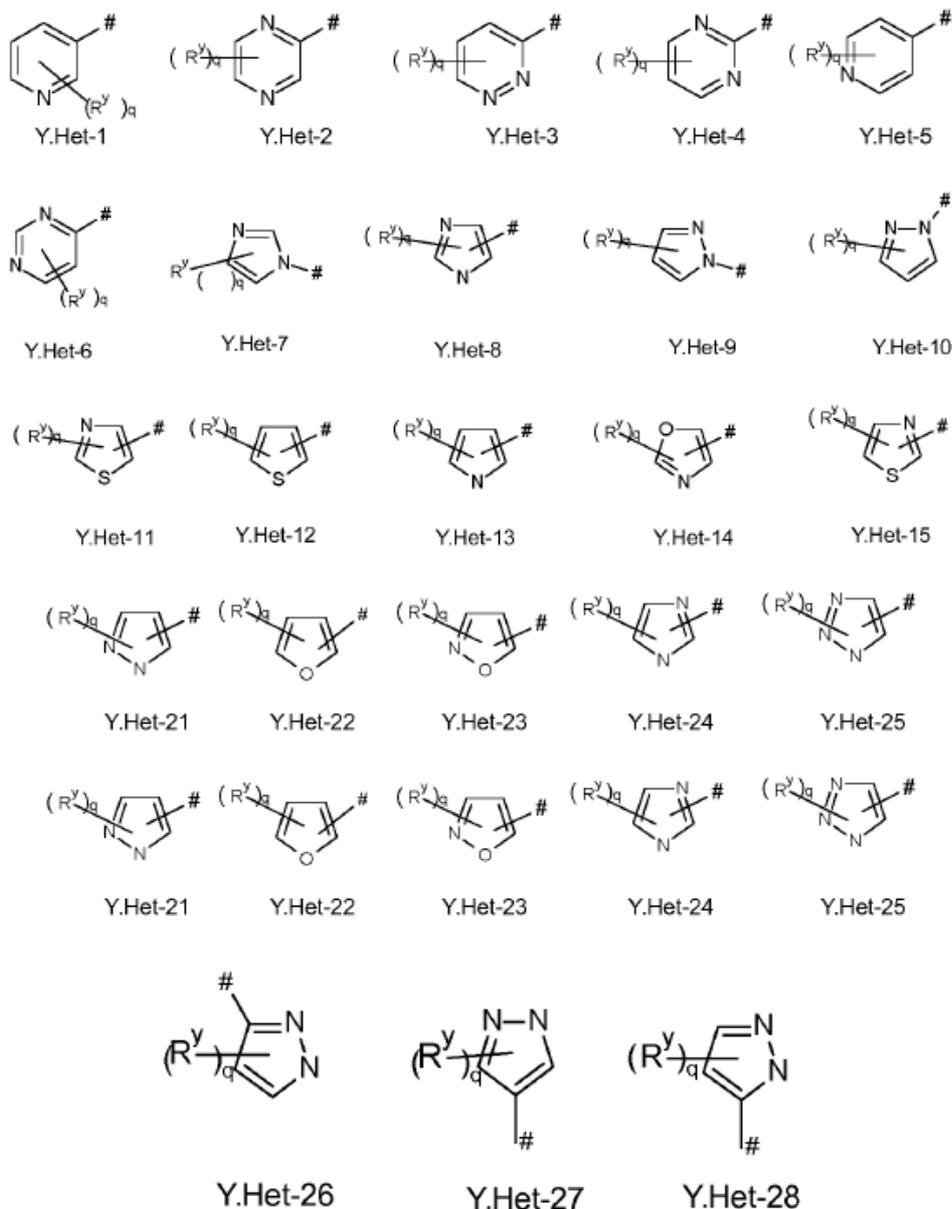
Y se selecciona de S, S=O o S(O)₂.

30 8. Los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde

R^5 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, ciano, C_1 - C_6 -alquilo, C_7 - C_{10} -alquilo, C_3 - C_{10} -cicloalquilo, C_2 - C_6 -alqueno y C_2 - C_6 -alquino, en donde los átomos de la cadena de carbono de los cuatro radicales alifáticos y cicloalifáticos anteriormente mencionados están no sustituidos, parcialmente o completamente halogenados o pueden llevar cualquier combinación de uno o más radicales R^7 , en donde R^7 es seleccionados independientemente uno de otro de halógeno, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -haloalquilo, C_1 - C_6 -alcoxi, C_1 - C_6 -haloalcoxi o $C(=O)O-R^{16}$, en donde R^{16} es - independientemente uno del otro - C_1 - C_6 -alquilo, en donde el radical alquilo puede estar no sustituido, parcial o totalmente halogenado y/o pueden llevar 1 o 2 radicales seleccionados de C_1 - C_4 alcoxi;

35

- fenilo o CH₂-fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes, que se seleccionan independientemente unos de otros de hidrógeno, halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi o fenoxi;
- 5 un anillo heterocíclico aromático saturado, parcialmente saturado o insaturado de 5 o 6 miembros seleccionado de piridina, furano, oxazol, oxadiazol, isoxazol, tiazol, tiadiazol o isotiazol, en donde el anillo heterocíclico puede unirse directamente o enlazarse mediante un grupo CH₂ al resto de la molécula, en donde el anillo heterocíclico está no sustituido u opcionalmente sustituido con uno, dos o tres sustituyentes R^y seleccionados independientemente uno de otro, y en donde el
- 10 R^y se selecciona del grupo que consiste de halógeno, ciano y C₁-C₄-alquilo, en donde los átomos de carbono del radical alquilo pueden estar no sustituidos o parcial o totalmente halogenados y/o pueden llevar 1,2, o 3 radicales seleccionados de C₁-C₄ alcoxi,
- en particular
- R⁵ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, ciano, C₁-C₆-alquilo, C₃-C-cicloalquilo, C₂-C₆-alqueno y C₂-C₆-alquino, en donde cada uno de los cuatro últimos radicales alifáticos mencionados están sin sustituir, parcial o completamente halogenados
- 15 o
- R⁵ es del grupo que consiste en S-CN, C₁-C₄ alquiltio, C₃-C₆ cicloalquiltio, C₂-C₆ alquenoiltio y C₂-C₆ alquinoiltio, en donde cada uno de los cuatro últimos radicales alifáticos mencionados están sin sustituir, parcial o completamente halogenados
- o
- 20 R⁵ es fenilo o CH₂-fenilo, en donde el anillo aromático está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que se seleccionan independientemente unos de otros del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₄ alquilo, C₁-C₄ alcoxi, en donde ambos de los dos últimos radicales alifáticos mencionados pueden estar no sustituidos o parcial o completamente halogenados.
9. Los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde
- 25 R⁵ es un anillo heterocíclico aromático de 5 o 6 miembros seleccionado del grupo que consiste en



en donde # denota el enlace al resto de la molécula, y

en donde el enlace puede ser un enlace sencillo o enlazado mediante un grupo CH₂ al resto de la molécula;

en donde

- 5 R^y se selecciona independientemente del valor de q e independientemente de otro, del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₄ alquilo y C₁-C₄ alcoxi, en donde ambos de los dos últimos radicales alifáticos mencionados pueden estar no sustituidos, parcial o completamente halogenados;

fenilo, opcionalmente sustituido con halógeno, ciano, C₁-C₄ alquilo y C₁-C₄ alcoxi, en donde ambos de los dos últimos radicales alifáticos mencionados pueden estar no sustituidos, parcial o completamente halogenados;

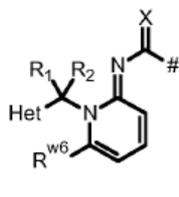
- 10 o

dos de R^y en átomos de carbono adyacentes pueden ser un puente seleccionado de CH=CH-CH=CH o CH=CHCH₂, y forman así junto con los átomos de carbono a los que los dos R^y están unidos un anillo carbocíclico aromático fusionado de 5 miembros o 6 miembros, en donde este anillo puede estar opcionalmente sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquilo o C₁-C₄-haloalquilo.

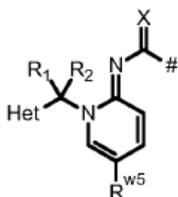
10. Los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde

W^1 , W^2 , W^3 y W^4 representan un grupo de cadena de carbono conectado a N y C=N, y formando así un heterociclo saturado, insaturado o parcialmente insaturado de 6 miembros que contiene nitrógeno seleccionado del grupo siguiente que consiste en W.Het-1, W.Het-2, W.Het-3, W.Het-4, W.Het-5, W.Het-6, W.Het-7, W.Het-8, W.Het-9, W.Het-10, W.Het-11 y W.Het-12:

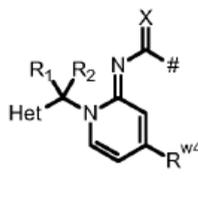
5



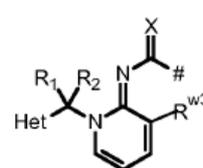
W.Het-1



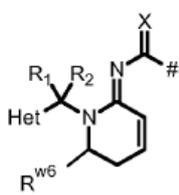
W.Het-2



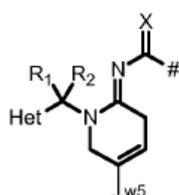
W.Het-3



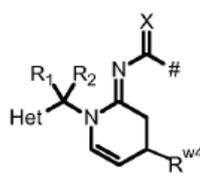
W.Het-4



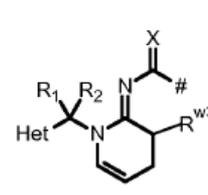
W.Het-5



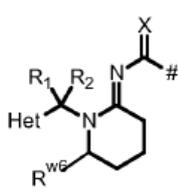
W.Het-6



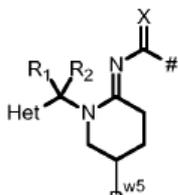
W.Het-7



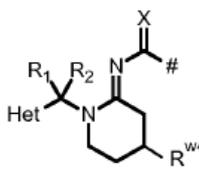
W.Het-8



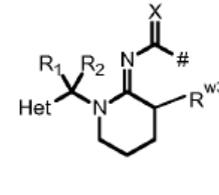
W.Het-9



W.Het-10



W.Het-11



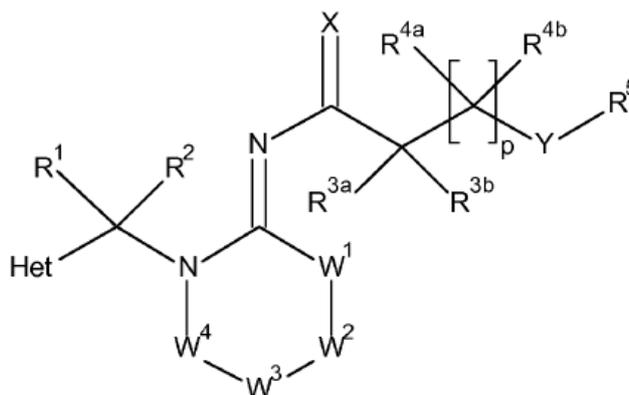
W.Het-12

en donde # denota el enlace al resto de la molécula; R^1 , R^2 y Het son como se definen en la reivindicación 1, y en donde

10

R^{w3} , R^{w4} , R^{w5} y R^{w6} se seleccionan de hidrógeno, halógeno, C_1 - C_4 -alcoxi y C_1 - C_4 -alquilo, en donde ambos de los dos últimos radicales alifáticos mencionados pueden estar no sustituidos, parcial o completamente halogenados.

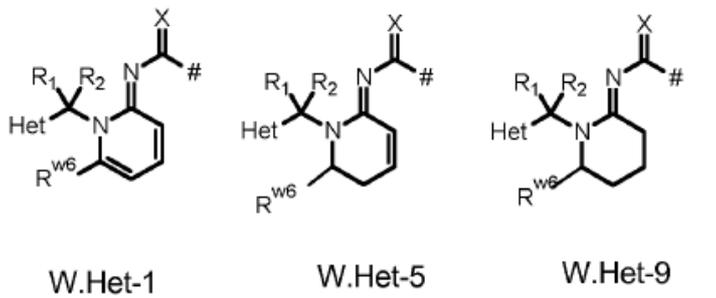
11. Los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1



(I),

en donde

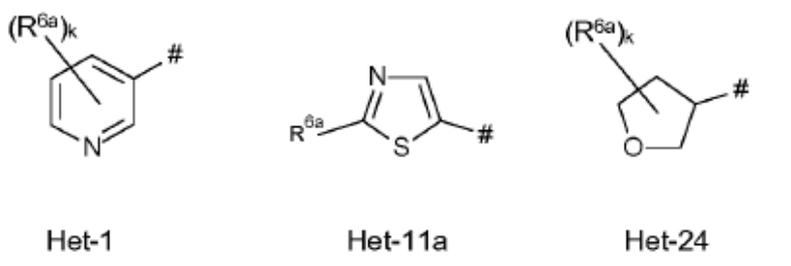
W¹, W², W³ y W⁴ representan un grupo de cadena de carbono conectado a N y C=N, y formando así un heterociclo saturado, insaturado o parcialmente insaturado que contiene nitrógeno de 6 miembros seleccionado de W.Het-1, W.Het- 5 y W.Het-9



5 en donde # denota el enlace al resto de la molécula, R^{w6} se selecciona de hidrógeno, halógeno, C₁-C₄-alquilo; o C₁-C₄-haloalquilo;

y en donde

Het se selecciona del grupo que consiste en radicales de fórmulas Het-1, Het-11a y Het-24



10 en donde # denota el enlace en la fórmula (I), y en donde

R^{6a} se selecciona de hidrógeno, halógeno, C₁-C₄-alcoxi o C₁-C₄-alquilo, en donde los átomos de carbono de los dos últimos radicales pueden estar parcial o totalmente halogenados;

k es 0, 1 o 2;

15 R¹, R² son independientemente uno de otro seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, C₁-C₃-alquilo, o C₁-C₃-haloalquilo;

X se selecciona de O o S;

y en donde

R^{3a}, R^{3b} son seleccionados independientemente uno de otro de hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, o en donde

20 R^{3a}, R^{3b} forman junto con el átomo de carbono al que están unidos, un anillo de ciclopropano, en donde cada uno de los átomos de carbono del anillo puede estar no sustituido o puede estar parcial o totalmente halogenado;

p es 0;

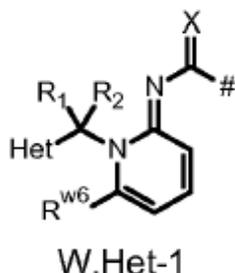
Y es S(O)_m, en donde m es 0, 1 o 2;

y

25 R⁵ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, CN, S-CN, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₄ tioalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆ cicloalquiltio, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆ alquenoiltio, C₂-C₆-alquiniltio o C₂-C₆ alquiniltio, en donde cada uno de los ocho últimos radicales alifáticos y cicloalifáticos mencionados son no sustituidos, parcialmente o completamente halogenados.

12. Los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 11, en donde

W¹, W², W³ y W⁴ representan un grupo de cadena de carbono conectado a N y C=N, y formando así un heterociclo no saturado de 6 miembros que contiene nitrógeno W.Het-1

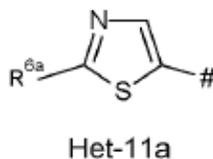
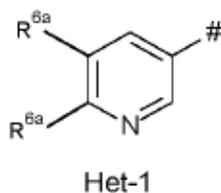


5 en donde # denota el enlace al resto de la molécula, R^{w6} se selecciona de hidrógeno, halógeno, C₁-C₄-alquilo o C₁-C₄-haloalquilo;

en donde

Het es

Het-1 o Het-11a



10 en donde # denota el enlace en la fórmula (I), y en donde R^{6a} se selecciona de hidrógeno, halógeno o C₁-C₄-haloalquilo;
R¹, R² son ambos hidrógeno;

X se selecciona de O o S y en donde

R^{3a}, R^{3b} son seleccionados independientemente uno de otro de hidrógeno o flúor;

p es 0;

15 Y es S(O)_m, en donde m es 0, 1 o 2;

y

R⁵ es C₁-C₃-alquilo, que está no sustituido o parcialmente o completamente halogenado.

20 13. Una composición agrícola o veterinaria para combatir plagas animales que comprende al menos un compuesto como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12 y al menos un vehículo líquido inerte y/o sólido aceptable y opcionalmente, si se desea, al menos un surfactante.

14. Un método no terapéutico para combatir o controlar plagas de invertebrados del grupo de insectos, arácnidos o nemátodos, método que comprende poner en contacto dicha plaga o su suministro de alimento, hábitat o zonas de reproducción con una cantidad efectiva como plaguicida de al menos un compuesto como se define en una cualquier de las reivindicaciones 1 a 12.

25 15. Un método para proteger plantas en crecimiento contra ataque o infestación por plagas de invertebrados del grupo de insectos, arácnidos o nemátodos, método que comprende poner en contacto una planta, o el suelo o el agua en donde la planta está creciendo, con una cantidad efectiva como pesticida de al menos un compuesto como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12.

30 16. Un método para la protección de material de propagación de plantas, especialmente semillas, contra insectos del suelo y de las raíces de plántulas y brotes contra insectos del suelo y foliares, que comprende poner en contacto el material de propagación vegetal antes de la siembra y/o después de la pregerminación con al menos un compuesto como se define en una cualquier de las reivindicaciones 1 a 12.