

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 637 029**

51 Int. Cl.:

**C07D 417/12** (2006.01)

**A01N 43/78** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **18.05.2015 PCT/EP2015/060834**

87 Fecha y número de publicación internacional: **26.11.2015 WO15177063**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **18.05.2015 E 15724222 (3)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **14.06.2017 EP 3145927**

54 Título: **Derivados amídicos activos como insecticidas con grupos piridino o fenilo sustituidos con azufre**

30 Prioridad:

**19.05.2014 EP 14168818**

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

**10.10.2017**

73 Titular/es:

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

72 Inventor/es:

**EDMUNDS, ANDREW;  
HALL, ROGER GRAHAM;  
MUEHLEBACH, MICHEL;  
EMERY, DANIEL;  
JUNG, PIERRE JOSEPH MARCEL y  
STOLLER, ANDRÉ**

74 Agente/Representante:

**LEHMANN NOVO, María Isabel**

ES 2 637 029 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).

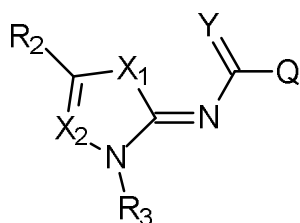
## DESCRIPCIÓN

Derivados amídicos activos como insecticidas con grupos piridino o fenilo sustituidos con azufre

- 5 La presente invención se refiere a derivados amídicos que contienen sustituyentes de tipo azufre activos como insecticidas, a procesos para su preparación, a composiciones que comprenden estos compuestos y a su uso para controlar plagas de animales (incluidos los artrópodos y en particular insectos o representantes del orden de los acáridos).
- 10 Existe constancia de compuestos amídicos con acción pesticida y se describen, por ejemplo, en los documentos WO 2013/191041, WO 2014/002754 y WO 2014/021468.

Se acaban de descubrir derivados amídicos novedosos con propiedades pesticidas.

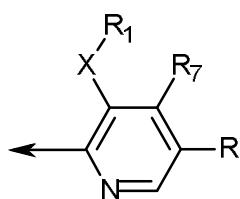
- 15 La presente invención se refiere, por lo tanto, a compuestos de fórmula I,



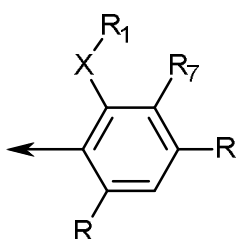
(I),

donde

- 20 X<sub>1</sub> es O, S o CR<sub>6</sub>=CH, donde R<sub>6</sub> es hidrógeno, halógeno, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> sustituido con uno o dos grupos hidroxilo, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> sustituido con uno o dos grupos metoxi, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> sustituido con uno o dos grupos ciano; o R<sub>6</sub> es haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, SF<sub>5</sub>, fenilcarboniltio, ciano, mercapto, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carbonilo, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carbonilo o -C(O)(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>);
- 25 o X<sub>1</sub> es N-R<sub>4</sub>, donde R<sub>4</sub> es hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;
- X<sub>2</sub> es N o C-R<sub>5</sub>, donde R<sub>5</sub> es hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno o ciano;
- R<sub>2</sub> es hidrógeno, halógeno, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> sustituido con uno o dos grupos hidroxilo, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> sustituido con uno o dos grupos metoxi, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> sustituido con uno o dos grupos ciano; o R<sub>2</sub> es haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, SF<sub>5</sub>, fenilcarboniltio, ciano, mercapto, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carbonilo, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carbonilo o -C(O)(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>);
- 30 R<sub>3</sub> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) o cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;
- Y es O o S;
- Q es un radical seleccionado del grupo constituido por la fórmula Q<sub>1</sub> y Q<sub>2</sub>:



Q<sub>1</sub>



Q<sub>2</sub>

- 35 donde la flecha indica el punto de unión a la parte de la amida;  
y donde X es S, SO o SO<sub>2</sub>;
- 40 cada R es, independientemente el uno del otro, hidrógeno, halógeno, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;
- cada R<sub>1</sub> es, independientemente el uno del otro, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, (cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>; y
- 45 cada R<sub>7</sub> es, independientemente el uno del otro, hidrógeno o halógeno; y sales, estereoisómeros, enantiómeros, tautómeros y N-óxidos agroquímicamente aceptables de estos compuestos.
- Los compuestos de fórmula I que tienen al menos un centro básico pueden formar, por ejemplo, sales de adición de ácido, por ejemplo, con ácidos inorgánicos fuertes tales como ácidos minerales, por ejemplo, ácido perclórico, ácido sulfúrico, ácido nítrico, ácido nitroso, un ácido fosforoso o un ácido halhídrico, con ácidos carboxílicos orgánicos

fueres, tales como ácidos (alcano C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carboxílicos que están sustituidos o no sustituidos, por ejemplo, con halógeno, por ejemplo, ácido acético, tales como ácidos dicarboxílicos saturados o insaturados, por ejemplo, ácido oxálico, ácido malónico, ácido succínico, ácido maleico, ácido fumárico o ácido ftálico, tales como ácidos hidroxicarboxílicos, por ejemplo, ácido ascórbico, ácido láctico, ácido málico, ácido tartárico o ácido cítrico, o tales como ácido benzoico, o con ácidos sulfónicos orgánicos, tales como ácidos (alcano C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)- o arilsulfónicos que están sustituidos o no sustituidos, por ejemplo, con halógeno, por ejemplo, ácido metano- o *p*-toluenosulfónico. Los compuestos de fórmula I que tienen al menos un grupo ácido pueden formar, por ejemplo, sales con bases, por ejemplo, sales minerales tales como sales con un metal alcalino o un metal alcalinotérreo, por ejemplo, sales de sodio, potasio o magnesio o sales con amoníaco o una amina orgánica, tal como morfolina, piperidina, pirrolidina, mono-, di- o trialquilamina inferior, por ejemplo, etil-, dietil-, trietil- o dimetilpropilamina, o una mono-, di- o trihidroxialquilamina inferior, por ejemplo, mono-, di- o trietanolamina.

Los grupos alquilo que aparecen en las definiciones de los sustituyentes pueden ser de cadena lineal o ramificada y son, por ejemplo, metilo, etilo, *n*-propilo, isopropilo, *n*-butilo, *sec*-butilo, isobutilo, *tert*-butilo, pentilo, hexilo, nonilo, decilo y sus isómeros ramificados. Los radicales alcoxi, alquenilo y alquinilo se obtienen a partir de los radicales alquilo mencionados. Los grupos alquenilo y alquinilo pueden ser mono- o poliinsaturados.

Halógeno equivale generalmente a flúor, cloro, bromo o yodo. Esto también se aplica, por consiguiente, a halógeno combinado con otros significados, tales como haloalquilo o haloftenilo.

Los grupos haloalquilo tienen preferentemente una cadena con una longitud de 1 a 6 átomos de carbono. Haloalquilo equivale, por ejemplo, a fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorometilo, diclorometilo, triclorometilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2-cloroetilo, pentafluoroetilo, 1,1-difluoro-2,2,2-tricloroetilo, 2,2,3,3-tetrafluoroetilo y 2,2,2-tricloroetilo; preferentemente triclorometilo, difluoroclorometilo, difluorometilo, trifluorometilo y diclorofluorometilo.

Los grupos alcoxi tienen preferentemente una cadena con una longitud preferida de 1 a 6 átomos de carbono. Alcoxi equivale, por ejemplo, a metoxi, etoxi, propoxi, *i*-propoxi, *n*-butoxi, isobutoxi, *sec*-butoxi y *tert*-butoxi y también a los radicales pentiloxi y hexiloxi isoméricos; preferentemente metoxi y etoxi.

Los grupos alcóxialquilo tienen preferentemente una cadena con una longitud de 1 a 6 átomos de carbono. Alcóxialquilo equivale, por ejemplo, a metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, *n*-propoximetilo, *n*-propoxietilo, isopropoximetilo o isopropoxietilo.

Los grupos cicloalquilo tienen preferentemente de 3 a 6 átomos de carbono anulares, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo.

Los grupos haloalcoxi tienen preferentemente una cadena con una longitud de 1 a 4 átomos de carbono. Haloalcoxi equivale, por ejemplo, a difluorometoxi, trifluorometoxi o 2,2,2-trifluoroetoxi.

De acuerdo con la presente invención, haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> es equivalente a haloalquilsulfanilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>. Los grupos haloalquilsulfanilo tienen preferentemente una longitud de cadena de 1 a 4 átomos de carbono. Haloalquilsulfanilo equivale, por ejemplo, a difluorometilsulfanilo, trifluorometilsulfanilo o 2,2,2-trifluoroetilsulfanilo. Similares consideraciones son válidas para los radicales haloalquilsulfino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, que pueden ser, por ejemplo, trifluorometilsulfino, trifluorometilsulfonilo o 2,2,2-trifluoroetilsulfonilo.

Se prefieren compuestos de fórmula I donde

X<sub>1</sub> es O, S o CR<sub>6</sub>=CH, donde R<sub>6</sub> es hidrógeno, halógeno, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> sustituido con uno o dos grupos hidroxilo; o R<sub>6</sub> es haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, O(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), SF<sub>5</sub>, fenilcarboniltio, ciano, mercapto o (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carbonilo;

o X<sub>1</sub> es N-R<sub>4</sub>, donde R<sub>4</sub> es hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

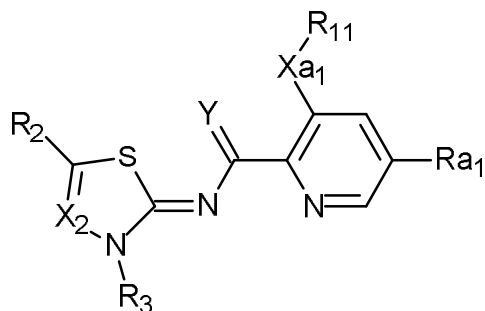
X<sub>2</sub> es N o C-R<sub>5</sub>, donde R<sub>5</sub> es hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno o ciano;

R<sub>2</sub> es hidrógeno, halógeno, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> sustituido con uno o dos grupos hidroxilo; o R<sub>2</sub> es haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, O(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), SF<sub>5</sub>, fenilcarboniltio, ciano, mercapto o (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carbonilo;

cada R es, independientemente el uno del otro, hidrógeno, halógeno o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

y sales y *N*-óxidos agroquímicamente aceptables de estos compuestos.

Un grupo preferido de compuestos de fórmula I está representado por los compuestos de fórmula I-1



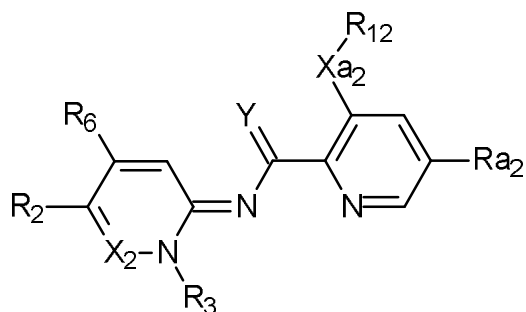
(I-1),

5 donde Y, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> y X<sub>2</sub> son como se han definido en la fórmula I anterior; y donde X<sub>a1</sub> es S, SO o SO<sub>2</sub>; Ra<sub>1</sub> es hidrógeno, halógeno o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; y R<sub>11</sub> es metilo, etilo, *n*-propilo, *i*-propilo o ciclopropilmetilo; y sales y *N*-óxidos agroquímicamente aceptables de estos compuestos.

10 En los compuestos preferidos de fórmula I-1, Y se define como O, y R<sub>3</sub> se define como metilo o etilo, preferentemente metilo. En dichos compuestos preferidos de fórmula I-1, R<sub>2</sub> es en particular pentafluoroetilo o trifluorometilo, preferentemente trifluorometilo cuando X<sub>2</sub> es N o CH.

O, en dichos compuestos preferidos de fórmula I-1, R<sub>2</sub> es en particular hidrógeno cuando X<sub>2</sub> es C-CF<sub>3</sub> o C-CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, preferentemente C-CF<sub>3</sub>.

15 Otro grupo preferido de compuestos de fórmula I está representado por los compuestos de fórmula I-2



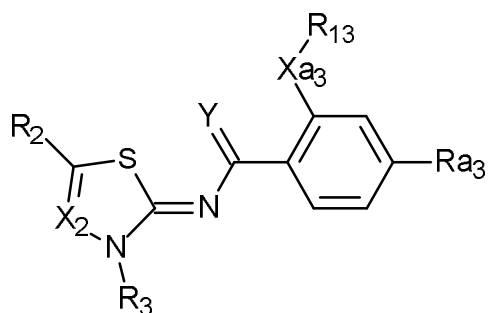
(I-2),

20 donde Y, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>6</sub> y X<sub>2</sub> son como se han definido en la fórmula I anterior; y donde X<sub>a2</sub> es S, SO o SO<sub>2</sub>; Ra<sub>2</sub> es hidrógeno, halógeno o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; y R<sub>12</sub> es metilo, etilo, *n*-propilo, *i*-propilo o ciclopropilmetilo; y sales y *N*-óxidos agroquímicamente aceptables de estos compuestos.

25 En los compuestos preferidos de fórmula I-2, Y se define como O, y R<sub>3</sub> se define como metilo o etilo, preferentemente metilo. En dichos compuestos preferidos de fórmula I-2, R<sub>2</sub> es en particular trifluorometilsulfanilo, trifluorometilsulfino, trifluorometilsulfonilo, pentafluoroetilo o trifluorometilo, preferentemente trifluorometilo cuando X<sub>2</sub> es N o CH y R<sub>6</sub> es H.

O, en dichos compuestos preferidos de fórmula I-2, R<sub>2</sub> es en particular hidrógeno cuando X<sub>2</sub> es N o CH y R<sub>6</sub> es trifluorometilsulfanilo, trifluorometilsulfino, trifluorometilsulfonilo, pentafluoroetilo o trifluorometilo, preferentemente trifluorometilo.

30 Otro grupo preferido de compuestos de fórmula I está representado por los compuestos de fórmula I-3



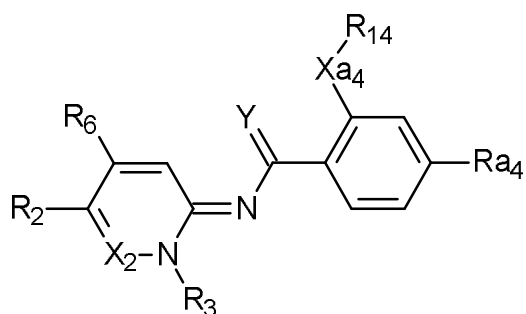
(I-3),

donde Y, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> y X<sub>2</sub> son como se han definido en la fórmula I anterior; y donde X<sub>a3</sub> es S, SO o SO<sub>2</sub>; Ra<sub>3</sub> es hidrógeno, halógeno o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; y R<sub>13</sub> es metilo, etilo, *n*-propilo, *i*-propilo o ciclopropilmetilo; y sales y *N*-óxidos agroquímicamente aceptables de estos compuestos.

En los compuestos preferidos de fórmula I-3, Y se define como O, y R<sub>3</sub> se define como metilo o etilo, preferentemente metilo. En dichos compuestos preferidos de fórmula I-3, R<sub>2</sub> es en particular pentafluoroetilo o trifluorometilo, preferentemente trifluorometilo cuando X<sub>2</sub> es N o CH.

O, en dichos compuestos preferidos de fórmula I-1, R<sub>2</sub> es en particular hidrógeno cuando X<sub>2</sub> es C-CF<sub>3</sub> o C-CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, preferentemente C-CF<sub>3</sub>.

Otro grupo preferido de compuestos de fórmula I está representado por los compuestos de fórmula I-4



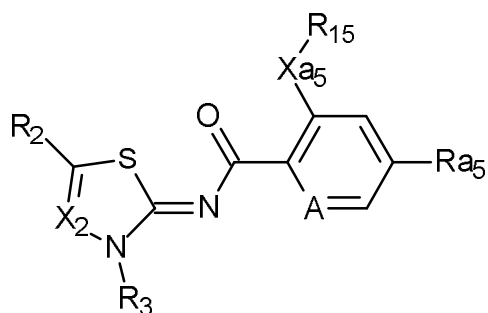
(I-4),

donde Y, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>6</sub> y X<sub>2</sub> son como se han definido en la fórmula I anterior; y donde X<sub>a4</sub> es S, SO o SO<sub>2</sub>; Ra<sub>4</sub> es hidrógeno, halógeno o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; y R<sub>14</sub> es metilo, etilo, *n*-propilo, *i*-propilo o ciclopropilmetilo; y sales y *N*-óxidos agroquímicamente aceptables de estos compuestos.

En los compuestos preferidos de fórmula I-4, Y se define como O, y R<sub>3</sub> se define como metilo o etilo, preferentemente metilo. En dichos compuestos preferidos de fórmula I-4, R<sub>2</sub> es en particular trifluorometilsulfanilo, trifluorometilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, pentafluoroetilo o trifluorometilo, preferentemente trifluorometilo cuando X<sub>2</sub> es N o CH y R<sub>6</sub> es H.

O, en dichos compuestos preferidos de fórmula I-4, R<sub>2</sub> es en particular hidrógeno cuando X<sub>2</sub> es N o CH y R<sub>6</sub> es trifluorometilsulfanilo, trifluorometilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, pentafluoroetilo o trifluorometilo, preferentemente trifluorometilo.

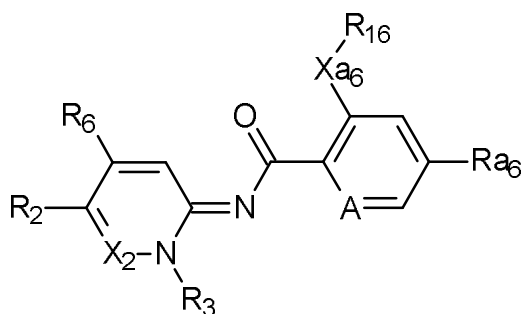
Otra realización preferida de la invención comprende compuestos de fórmula I representados por los compuestos de fórmula I-5



(I-5),

donde

- 5 A es N o CH;  
 X<sub>2</sub> es N, CH o C-(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>);  
 X<sub>a5</sub> es S, SO o SO<sub>2</sub>, en particular S o SO<sub>2</sub>;  
 Ra<sub>5</sub> es hidrógeno o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, en particular hidrógeno o CF<sub>3</sub>;  
 R<sub>15</sub> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, en particular metilo o etilo;  
 R<sub>3</sub> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, en particular metilo o etilo;  
 10 R<sub>2</sub> es haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, en particular pentafluoroetilo o trifluorometilo, cuando X<sub>2</sub> es N o CH; o  
 R<sub>2</sub> es hidrógeno cuando X<sub>2</sub> es C-(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), en particular cuando X<sub>2</sub> es C-CF<sub>3</sub> o C-CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>;  
 y sales, estereoisómeros, enantiómeros, tautómeros y *N*-óxidos agroquímicamente aceptables de los compuestos de fórmula I-5.  
 15 Otra realización preferida de la invención comprende compuestos de fórmula I representados por los compuestos de fórmula I-6



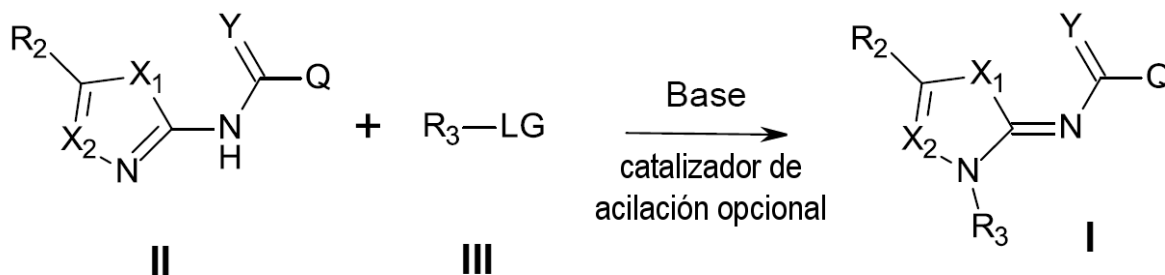
(I-6),

- 20 donde  
 A es N o CH;  
 R<sub>6</sub> es hidrógeno o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;  
 X<sub>2</sub> es N o CH;  
 X<sub>a6</sub> es S, SO o SO<sub>2</sub>, en particular S o SO<sub>2</sub>;  
 25 Ra<sub>6</sub> es hidrógeno o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, en particular hidrógeno o CF<sub>3</sub>;  
 R<sub>16</sub> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, en particular metilo o etilo; y  
 R<sub>3</sub> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, en particular metilo o etilo;  
 R<sub>2</sub> es haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfanilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, en particular  
 trifluorometilo, pentafluoroetilo, trifluorometilsulfanilo, trifluorometilsulfinilo o trifluorometilsulfonilo, cuando a la vez X<sub>2</sub>  
 30 es N o CH y R<sub>6</sub> es hidrógeno; o  
 R<sub>2</sub> es hidrógeno cuando a la vez X<sub>2</sub> es N o CH y R<sub>6</sub> es haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, en particular trifluorometilo o  
 pentafluoroetilo;  
 y sales, estereoisómeros, enantiómeros, tautómeros y *N*-óxidos agroquímicamente aceptables de los compuestos de  
 fórmula I-6.

- 35 El proceso de acuerdo con la invención para preparar compuestos de fórmula I se lleva a cabo en principio utilizando métodos conocidos por los expertos en la técnica. Más específicamente, el subgrupo de compuestos de fórmula I, donde X es SO (sulfóxido) y/o SO<sub>2</sub> (sulfona), puede obtenerse por medio de una reacción de oxidación de los compuestos de tipo sulfuro correspondientes de fórmula I, donde X es S, en la que participan reactivos tales como,  
 40 por ejemplo, ácido *m*-cloroperoxibenzoico (mCPBA), peróxido de hidrógeno, oxone, peryodato de sodio, hipoclorito de sodio o hipoclorito de *tert*-butilo entre otros oxidantes. La reacción de oxidación generalmente se lleva a cabo en presencia de un disolvente. Algunos ejemplos del disolvente que se puede utilizar en la reacción incluyen

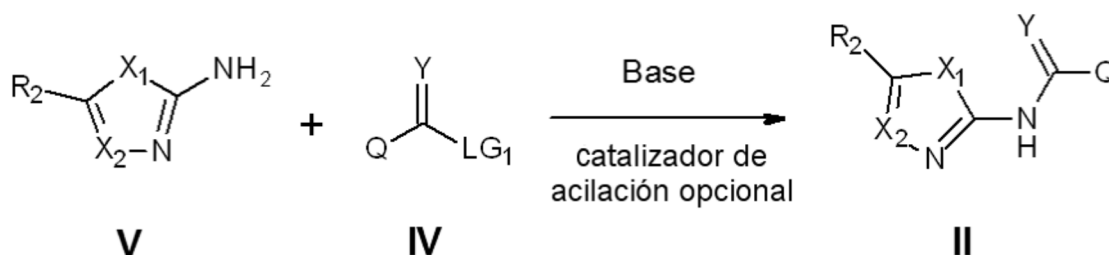
hidrocarburos halogenados alifáticos tales como diclorometano y cloroformo; alcoholes tales como metanol y etanol; ácido acético; agua; y mezclas de estos. La cantidad de oxidante que se utilizará en la reacción está comprendida generalmente entre 1 y 3 moles, preferentemente entre 1 y 1.2 moles, respecto a 1 mol de los compuestos I de tipo sulfuro para producir los compuestos I de tipo sulfóxido y, preferentemente, entre 2 y 2.2 moles de oxidante, respecto a 1 mol de los compuestos I de tipo sulfuro para producir los compuestos I de tipo sulfona. Tales reacciones de oxidación se describen, por ejemplo, en el documento WO 2013/018928.

El subgrupo de compuestos de fórmula I, donde X es S, SO o SO<sub>2</sub> e Y es O, y donde Q, X<sub>1</sub>, X<sub>2</sub>, R<sub>2</sub> y R<sub>3</sub> son como se han definido anteriormente,



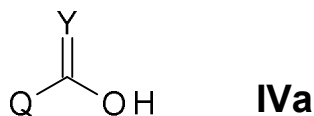
se puede preparar haciendo reaccionar un compuesto de fórmula II, donde X es S, SO o SO<sub>2</sub> e Y es O, y donde Q, X<sub>1</sub>, X<sub>2</sub> y R<sub>2</sub> son como se han definido anteriormente, con un agente alquilante de fórmula III, donde R<sub>3</sub> es como se ha definido anteriormente y donde LG es un grupo saliente tal como un halógeno (especialmente bromo o yodo), un sulfonato OSO<sub>2</sub>R<sub>38</sub> (especialmente mesilato o tosilato), donde R<sub>38</sub> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> o fenilo opcionalmente sustituido con nitro o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, o un sulfato (tal como sulfato de dimetilo), preferentemente en presencia de una base adecuada, tal como carbonatos de metales alcalinos, por ejemplo, carbonato de sodio o carbonato de potasio, o hidruros de metales alcalinos tales como hidruro de sodio, o hidróxidos de metales alcalinos tales como hidróxido de sodio e hidróxido de potasio, en un disolvente inerte a temperaturas comprendidas entre -20 y 150 °C, preferentemente entre 0 y 80 °C. Los ejemplos del disolvente que se puede utilizar incluyen éteres tales como tetrahidrofurano, éter dimetílico del etilenglicol, éter *tert*-butil metílico y 1,4-dioxano, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno y xileno, nitrilos tales como acetonitrilo o disolventes polares apróticos tales como *N,N*-dimetilformamida, *N,N*-dimetilacetamida, *N*-metil-2-pirrolidona o sulfóxido de dimetilo.

El subgrupo de compuestos de fórmula II, donde X es S, SO o SO<sub>2</sub> e Y es O, y donde Q, X<sub>1</sub>, X<sub>2</sub> y R<sub>2</sub> son como se han definido anteriormente,



se puede preparar haciendo reaccionar un compuesto de fórmula V, o una de sus sales (tal como una sal de tipo halhidrato, preferentemente una sal de tipo clorhidrato o bromhidrato, o cualquier otra sal equivalente), donde X<sub>1</sub>, X<sub>2</sub> y R<sub>2</sub> son como se han definido anteriormente, con un compuesto de fórmula IV, donde X es S, SO o SO<sub>2</sub> e Y es O, y donde Q es como se ha definido anteriormente, y donde LG<sub>1</sub> es un grupo saliente tal como un halógeno (especialmente cloro), opcionalmente en presencia de un catalizador acilante tal como 4-dimetilaminopiridina (DMAP), preferentemente en presencia de una base, tal como trietilamina, diisopropiletilamina o piridina, en un disolvente inerte a temperaturas comprendidas entre 0 y 50 °C. Los ejemplos del disolvente que se puede utilizar incluyen éteres tales como tetrahidrofurano, éter dimetílico del etilenglicol, éter *tert*-butil metílico y 1,4-dioxano, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno y xileno, hidrocarburos halogenados tales como diclorometano y cloroformo, nitrilos tales como acetonitrilo o disolventes polares apróticos tales como *N,N*-dimetilformamida, *N,N*-dimetilacetamida, *N*-metil-2-pirrolidona o sulfóxido de dimetilo.

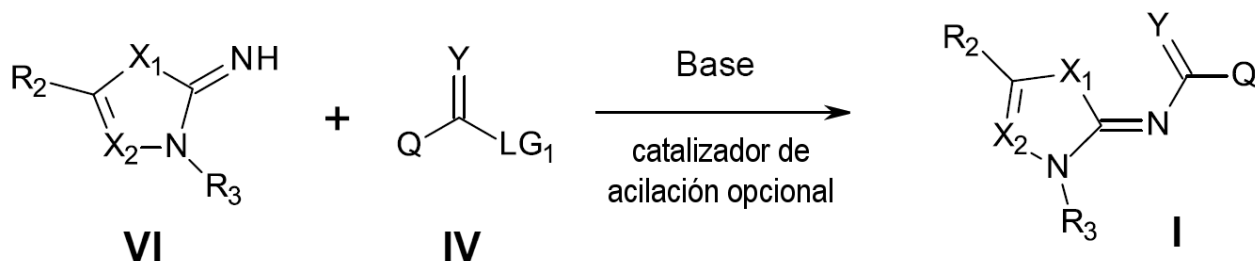
Los compuestos de fórmula V, o su sales, donde X<sub>1</sub>, X<sub>2</sub> y R<sub>2</sub> son como se han descrito anteriormente, y los compuestos de fórmula IV, donde Q, Y y LG<sub>1</sub> son como se han descrito anteriormente, son compuestos conocidos o se pueden preparar mediante métodos conocidos que se describen en la bibliografía. En particular, los compuestos de fórmula IV, donde LG<sub>1</sub> es un grupo saliente tal como un halógeno (especialmente cloro), se pueden preparar mediante la activación de un compuesto de fórmula IVa,



5 utilizando métodos conocidos por los expertos en la técnica y que se describen, por ejemplo, en *Tetrahedron*, 2005, 61 (46), 10827-10852. Por ejemplo, los compuestos IV donde LG<sub>1</sub> es un halógeno, preferentemente cloro, se forman mediante el tratamiento de IVa con, por ejemplo, cloruro de oxalilo (COCl)<sub>2</sub> o cloruro de tionilo SOCl<sub>2</sub> en presencia de cantidades catalíticas de *N,N*-dimetilformamida DMF en disolventes inertes tales como cloruro de metileno CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> o tetrahidrofurano THF a temperaturas comprendidas entre 20 y 100 °C, preferentemente 25 °C. Los compuestos de fórmula IVa, donde Q e Y son como se han descrito anteriormente, son compuestos conocidos o se pueden preparar mediante métodos conocidos, que se describen en la bibliografía.

15 El subgrupo de compuestos de fórmula II, donde X es SO (sulfóxido) y/o SO<sub>2</sub> (sulfona), puede obtenerse por medio de una reacción de oxidación de los compuestos de tipo sulfuro correspondientes de fórmula II, donde X es S, en la que participan reactivos tales como, por ejemplo, ácido *m*-cloroperoxibenzoico (mCPBA), peróxido de hidrógeno, oxone, peryodato de sodio, hipoclorito de sodio o hipoclorito de *tert*-butilo entre otros oxidantes. La reacción de oxidación generalmente se lleva a cabo en presencia de un disolvente. Algunos ejemplos del disolvente que se puede utilizar en la reacción incluyen hidrocarburos halogenados alifáticos tales como diclorometano y cloroformo; alcoholes tales como metanol y etanol; ácido acético; agua; y mezclas de estos. La cantidad de oxidante que se puede utilizar en la reacción está comprendida generalmente entre 1 y 3 moles, preferentemente entre 1 y 1.2 moles, respecto a 1 mol de los compuestos II de tipo sulfuro para producir los compuestos II de tipo sulfóxido y, preferentemente, entre 2 y 2.2 moles de oxidante respecto a 1 mol de los compuestos II de tipo sulfuro para producir los compuestos II de tipo sulfona. Tales reacciones de oxidación se describen, por ejemplo, en el documento WO 2013/018928.

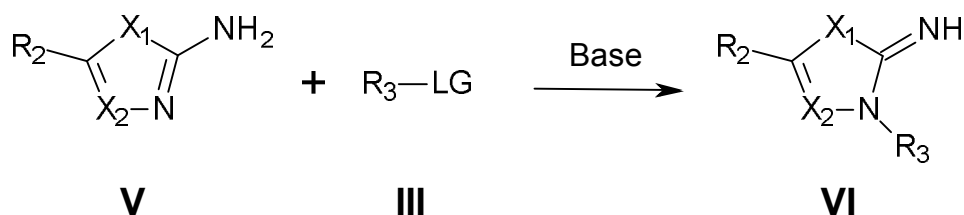
25 Como alternativa, los compuestos de fórmula I, donde X es S, SO o SO<sub>2</sub> e Y es O, y donde Q, X<sub>1</sub>, X<sub>2</sub>, R<sub>2</sub> y R<sub>3</sub> son como se han definido anteriormente,



30 se pueden preparar haciendo reaccionar un compuesto de fórmula VI, o una de sus sales (tal como una sal de tipo halhidrato, preferentemente una sal de tipo clorhidrato o bromhidrato, o cualquier otra sal equivalente), donde X<sub>1</sub>, X<sub>2</sub>, R<sub>2</sub> y R<sub>3</sub> son como se han definido anteriormente, con un compuesto de fórmula IV, donde X es S, SO o SO<sub>2</sub> e Y es O, y donde Q es como se ha definido anteriormente, y donde LG<sub>1</sub> es un grupo saliente tal como un halógeno (especialmente cloro), opcionalmente en presencia de un catalizador acilante tal como 4-dimetilaminopiridina (DMAP), preferentemente en presencia de una base, tal como trietilamina, diisopropiletilamina o piridina, en un disolvente inerte a temperaturas comprendidas entre 0 y 50 °C. Los ejemplos del disolvente que se puede utilizar incluyen éteres tales como tetrahidrofurano, éter dimetílico del etilenglicol, éter *tert*-butil metílico y 1,4-dioxano, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno y xileno, hidrocarburos halogenados tales como diclorometano y cloroformo, nitrilos tales como acetonitrilo o disolventes polares apróticos tales como *N,N*-dimetilformamida, *N,N*-dimetilacetamida, *N*-metil-2-pirrolidona o sulfóxido de dimetilo.

45 Los compuestos de fórmula VI o sus sales, donde X<sub>1</sub>, X<sub>2</sub>, R<sub>2</sub> y R<sub>3</sub> son como se han descrito anteriormente, son compuestos conocidos o se pueden preparar mediante métodos conocidos, que se describen en la bibliografía tal como, por ejemplo, el documento US4264616A. En particular, los compuestos de fórmula VI, donde X<sub>1</sub>, X<sub>2</sub>, R<sub>2</sub> y R<sub>3</sub> son como se han descrito anteriormente,





se pueden preparar haciendo reaccionar un compuesto de fórmula V, o una de sus sales (tal como una sal de tipo halhidrato, preferentemente una sal de tipo clorhidrato o bromhidrato, o cualquier otra sal equivalente), donde X<sub>1</sub>, X<sub>2</sub> y R<sub>2</sub> son como se han definido anteriormente, con un agente alquilante de fórmula III, donde R<sub>3</sub> es como se ha definido anteriormente y donde LG es un grupo saliente tal como un halógeno (especialmente bromo o yodo), un sulfonato OSO<sub>2</sub>R<sub>38</sub> (especialmente mesilato o tosilato), donde R<sub>38</sub> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> o fenilo opcionalmente sustituido con nitro o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, o un sulfato (tal como sulfato de dimetilo), opcionalmente en presencia de una base adecuada, tal como carbonatos de metales alcalinos, por ejemplo, carbonato de sodio o carbonato de potasio, o hidruros de metales alcalinos tales como hidruro de sodio, o hidróxidos de metales alcalinos tales como hidróxido de sodio e hidróxido de potasio, en un disolvente inerte a temperaturas comprendidas entre -20 y 150 °C, preferentemente entre 0 y 80 °C. Los ejemplos del disolvente que se puede utilizar incluyen éteres tales como tetrahidrofurano, éter dimetilico del etilenglicol, éter *tert*-butil metílico y 1,4-dioxano, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno y xileno, nitrilos tales como acetonitrilo o disolventes polares apróticos tales como *N,N*-dimetilformamida, *N,N*-dimetilacetamida, *N*-metil-2-pirrolidona o sulfóxido de dimetilo.

Los *N*-óxidos de los compuestos de fórmula I se pueden preparar haciendo reaccionar un compuesto de fórmula I con un agente oxidante adecuado tal como, por ejemplo, ácido *m*-cloroperoxibenzoico (mCPBA), peróxido de hidrógeno, oxone, peryodato de sodio, hipoclorito de sodio o hipoclorito de *tert*-butilo, entre otros oxidantes. La reacción de oxidación generalmente se lleva a cabo en presencia de un disolvente. Algunos ejemplos del disolvente que se puede utilizar en la reacción incluyen hidrocarburos halogenados alifáticos tales como diclorometano y cloroformo; alcoholes tales como metanol y etanol; ácido acético o ácido trifluoroacético; agua; y mezclas de estos. Otra opción implica, por ejemplo, el aducto de H<sub>2</sub>O<sub>2</sub>/urea en presencia de un anhídrido de ácido, p. ej., anhídrido trifluoroacético. Existe constancia de tales oxidaciones en la bibliografía, por ejemplo, en *J. Med. Chem.* **1989**, 32, 2561 o el documento WO 2000/15615. Opcionalmente, la reacción de oxidación se lleva a cabo en presencia de un catalizador tal como, por ejemplo, tungstato de sodio y similares.

El subgrupo de compuestos de fórmula I, donde R<sub>2</sub> es haloalquilsulfanilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, se puede oxidar para obtener compuestos de fórmula I, donde R<sub>2</sub> es haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, mediante una reacción de oxidación en la que intervienen los reactivos y las condiciones que se han descrito anteriormente, por ejemplo, utilizando oxidantes tales como ácido *m*-cloroperoxibenzoico o una solución de peróxido de hidrógeno, en presencia de un catalizador, por ejemplo, tungstato de sodio, a temperaturas comprendidas entre 0 y 80 °C. Los expertos en la técnica comprenderán que el grado de oxidación dependerán de factores tales como los equivalentes de oxidante y la temperatura de reacción.

Los reactivos pueden hacerse reaccionar en presencia de una base. Algunos ejemplos de bases adecuadas son los hidróxidos de metales alcalinos o metales alcalinotérreos, hidruros de metales alcalinos o metales alcalinotérreos, amidas de metales alcalinos o metales alcalinotérreos, alcóxidos de metales alcalinos o metales alcalinotérreos, acetatos de metales alcalinos o metales alcalinotérreos, carbonatos de metales alcalinos o metales alcalinotérreos, dialquilamidas de metales alcalinos o metales alcalinotérreos o alquilsililamidas, alquilaminas, alquilendiaminas de metales alcalinos o metales alcalinotérreos, cicloalquilaminas saturadas o insaturadas *N*-alquiladas o libres, heterociclos básicos, hidróxidos de amonio y aminas carbocíclicas. Algunos ejemplos que se pueden mencionar son hidróxido de sodio, hidruro de sodio, amiduro de sodio, metóxido de sodio, acetato de sodio, carbonato de sodio, *tert*-butóxido de potasio, hidróxido de potasio, carbonato de potasio, hidruro de potasio, diisopropilamiduro de litio, bis(trimetilsilil)amiduro de potasio, hidruro de calcio, trietilamina, diisopropiletilamina, trietilendiamina, ciclohexilamina, *N*-ciclohexil-*N,N*-dimetilamina, *N,N*-dietilnilina, piridina, 4-(*N,N*-dimetilamino)piridina, quinuclidina, *N*-metilmorfolina, hidróxido de benciltrimetilamonio y 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno (DBU).

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

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

Un compuesto de fórmula I puede convertirse de una manera conocida *per se* en otro compuesto de fórmula I reemplazando uno o más sustituyentes del compuesto de partida de fórmula I de la manera habitual por otro u otros sustituyentes de acuerdo con la invención.

- 5 Dependiendo de la elección de las condiciones de reacción y los materiales de partida que son adecuados en cada caso, es posible, por ejemplo, en un paso de reacción reemplazar solamente un sustituyente por otro sustituyente según la invención, o pueden reemplazarse una pluralidad de sustituyentes por otros sustituyentes según la invención en el mismo paso de reacción.
- 10 Las sales de los compuestos de fórmula I pueden prepararse de un modo conocido *per se*. De esta forma, por ejemplo, se obtienen sales de adición de ácido de los compuestos de fórmula I mediante el tratamiento con un ácido adecuado o un reactivo de intercambio iónico adecuado y se obtienen sales con bases mediante el tratamiento con una base adecuada o con un reactivo de intercambio iónico adecuado.
- 15 Las sales de los compuestos de fórmula I pueden convertirse de la manera habitual en compuestos libres I, sales de adición de ácido, por ejemplo, mediante el tratamiento con un compuesto básico adecuado o con un reactivo de intercambio iónico adecuado y sales con bases, por ejemplo, mediante el tratamiento con un ácido adecuado o con un reactivo de intercambio iónico adecuado.
- 20 Las sales de los compuestos de fórmula I se pueden convertir de una forma conocida *per se* en otras sales de los compuestos de fórmula I, sales de adición de ácido, por ejemplo, en otras sales de adición de ácido, por ejemplo, mediante el tratamiento de una sal de ácido inorgánico, tal como clorhidrato, con una sal de un metal adecuada, tal como una sal de sodio, bario o plata, de un ácido, por ejemplo, con acetato de plata, en un disolvente adecuado en el que una sal inorgánica que forma, por ejemplo, cloruro de plata, es insoluble y de este modo precipita en la
- 25 mezcla de reacción.

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

- 30 Los compuestos de fórmula I y, cuando sea apropiado, los tautómeros de estos, en cada caso en forma libre o en forma salina, pueden estar presentes en forma de uno de los isómeros que son posibles o como una mezcla de estos, por ejemplo, en forma de isómeros puros tales como enantiómeros y/o diastereómeros, o como mezclas de isómeros tales como mezclas de enantiómeros, por ejemplo, racematos, mezclas de diastereómeros o mezclas de racematos, dependiendo del número, la configuración absoluta y relativa de los átomos de carbono asimétricos que estén presentes en la molécula y/o dependiendo de la configuración de los dobles enlaces no aromáticos que estén presentes en la molécula; la invención se refiere a los isómeros puros y también a todas las mezclas de isómeros que sean posibles, y se debe interpretar en cada caso con este sentido en lo expuesto anteriormente y en lo sucesivo en la presente, incluso cuando no se mencionen detalles estereoquímicos específicamente en cada caso.
- 35 Las mezclas de diastereómeros o mezclas de racematos de los compuestos de fórmula I, en forma libre o en forma salina, que pueden obtenerse dependiendo de los materiales de partida y los procedimientos seleccionados, pueden separarse de un modo conocido para obtener los diastereómeros o racematos puros en función de las diferencias fisicoquímicas de los componentes, por ejemplo, mediante cromatografía, destilación y/o cristalización fraccionada.
- 40 Las mezclas de enantiómeros, tales como racematos, que pueden obtenerse de forma similar pueden resolverse para obtener los enantiómeros ópticos mediante métodos conocidos, por ejemplo, mediante recristalización en un disolvente ópticamente activo, mediante cromatografía en adsorbentes quirales, por ejemplo, cromatografía de líquidos de alta resolución (HPLC) en acetilcelulosa, con la ayuda de microorganismos adecuados, mediante escisión con enzimas inmovilizadas específicas, mediante la formación de compuestos de inclusión, por ejemplo, usando éteres corona quirales, donde únicamente un enantiómero forma el complejo, o mediante la conversión en sales diastereoméricas, por ejemplo, haciendo reaccionar un racemato del producto final básico con un ácido ópticamente activo, tal como un ácido carboxílico, por ejemplo, ácido alcanfórico, tartárico o málico, o un ácido sulfónico, por ejemplo, ácido alcanforsulfónico, y separando la mezcla de diastereómeros que puede obtenerse de esta manera, por ejemplo, mediante cristalización fraccionada en función de sus diferentes solubilidades para
- 45 proporcionar los diastereómeros, de donde puede liberarse el enantiómero deseado por acción de agentes adecuados, por ejemplo, agentes básicos.

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

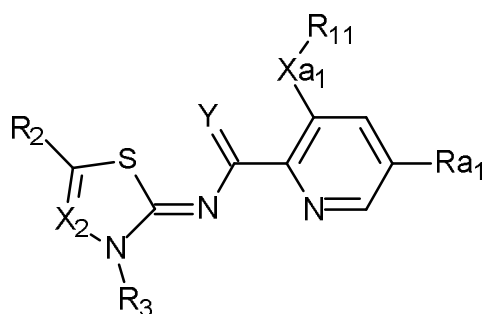
55 Se pueden preparar *N*-óxidos haciendo reaccionar un compuesto de fórmula I con un agente oxidante adecuado, por ejemplo, el aducto de H<sub>2</sub>O<sub>2</sub>/urea en presencia de un anhídrido de ácido, p. ej., anhídrido trifluoroacético. Existe constancia de tales oxidaciones en la bibliografía, por ejemplo, en *J. Med. Chem.* 32 (12), 2561-73, 1989 o el documento WO 00/15615.

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

5 Los compuestos de fórmula I y, cuando proceda, los tautómeros de estos, en cada caso en forma libre o en forma salina, también pueden obtenerse, si procede, en forma hidratada y/o incluir otros disolventes, por ejemplo, los que se hayan podido emplear para la cristalización de los compuestos que están presentes en forma sólida.

10 Los compuestos de acuerdo con las siguientes Tablas 1-12 que se indican a continuación pueden prepararse de acuerdo con los métodos descritos anteriormente. Los siguientes ejemplos pretenden ser ilustrativos de la invención y muestran compuestos de fórmula I preferidos.

15 Tabla 1: Esta tabla expone los 12 compuestos de 1.001 a 1.012 de fórmula I-1:



(I-1),

donde Xa<sub>1</sub> es S, Y es O, y Ra<sub>1</sub>, R<sub>11</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> y X<sub>2</sub> son como se definen a continuación:

20 Tabla 1:

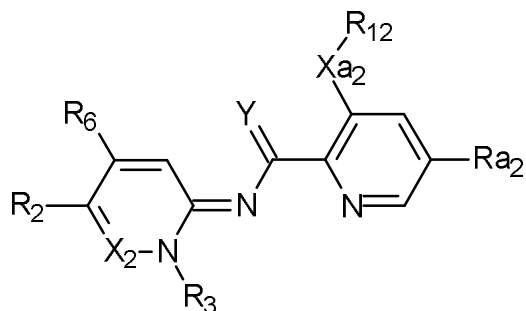
Comp. N.º	Ra <sub>1</sub>	R <sub>11</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	X <sub>2</sub>
1.001	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH
1.002	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	N
1.003	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH
1.004	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	N
1.005	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	C-CF <sub>3</sub>
1.006	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	C-CF <sub>3</sub>
1.007	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH
1.008	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	N
1.009	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH
1.010	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	N
1.011	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	C-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
1.012	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	C-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>

y los N-óxidos de los compuestos de la Tabla 1.

25 Tabla 2: Esta tabla expone los 12 compuestos de 2.001 a 2.012 de fórmula I-1, donde Xa<sub>1</sub> es SO, Y es O, y Ra<sub>1</sub>, R<sub>11</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> y X<sub>2</sub> son como se definen en la Tabla 1.

30 Tabla 3: Esta tabla expone los 12 compuestos de 3.001 a 3.012 de fórmula I-1, donde Xa<sub>1</sub> es SO<sub>2</sub>, Y es O, y Ra<sub>1</sub>, R<sub>11</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> y X<sub>2</sub> son como se definen en la Tabla 1.

Tabla 4: Esta tabla expone los 16 compuestos de 4.001 a 4.016 de fórmula I-2:



(I-2),

donde Xa<sub>2</sub> es S, Y es O, y Ra<sub>2</sub>, R<sub>12</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>6</sub> y X<sub>2</sub> son como se definen a continuación:

5 Tabla 4:

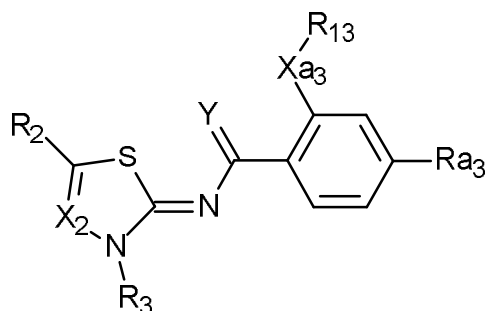
Comp. N.º	Ra <sub>2</sub>	R <sub>12</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	R <sub>6</sub>	X <sub>2</sub>
4.001	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH
4.002	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	N
4.003	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH
4.004	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	N
4.005	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH
4.006	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	N
4.007	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH
4.008	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	N
4.009	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SCF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH
4.010	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SCF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	N
4.011	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SCF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH
4.012	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SCF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	N
4.013	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH
4.014	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	N
4.015	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH
4.016	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	N

y los N-óxidos de los compuestos de la Tabla 4.

10 Tabla 5: Esta tabla expone los 16 compuestos de 5.001 a 5.016 de fórmula I-2, donde Xa<sub>2</sub> es SO, Y es O, y Ra<sub>2</sub>, R<sub>12</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>6</sub> y X<sub>2</sub> son como se definen en la Tabla 4.

Tabla 6: Esta tabla expone los 16 compuestos de 6.001 a 6.016 de fórmula I-2, donde Xa<sub>2</sub> es SO<sub>2</sub>, Y es O, y Ra<sub>2</sub>, R<sub>12</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>6</sub> y X<sub>2</sub> son como se definen en la Tabla 4.

15 Tabla 7: Esta tabla expone los 12 compuestos de 7.001 a 7.012 de fórmula I-3:



(I-3),

20 donde Xa<sub>3</sub> es S, Y es O, y Ra<sub>3</sub>, R<sub>13</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> y X<sub>2</sub> son como se definen a continuación:

Tabla 7:

Comp. N.º	Ra <sub>3</sub>	R <sub>13</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	X <sub>2</sub>
-----------	-----------------	-----------------	----------------	----------------	----------------

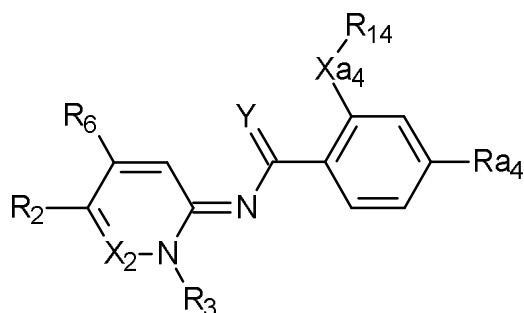
Comp. N.º	Ra <sub>3</sub>	R <sub>13</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	X <sub>2</sub>
7.001	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH
7.002	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	N
7.003	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH
7.004	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	N
7.005	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	C-CF <sub>3</sub>
7.006	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	C-CF <sub>3</sub>
7.007	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH
7.008	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	N
7.009	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH
7.010	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	N
7.011	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	C-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
7.012	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	C-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>

y los N-óxidos de los compuestos de la Tabla 7.

5 Tabla 8: Esta tabla expone los 12 compuestos de 8.001 a 8.012 de fórmula I-3, donde Xa<sub>1</sub> es SO, Y es O, y Ra<sub>3</sub>, R<sub>13</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> y X<sub>2</sub> son como se definen en la Tabla 7.

Tabla 9: Esta tabla expone los 12 compuestos de 9.001 a 9.012 de fórmula I-3, donde Xa<sub>1</sub> es SO<sub>2</sub>, Y es O, y Ra<sub>3</sub>, R<sub>13</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> y X<sub>2</sub> son como se definen en la Tabla 7.

10 Tabla 10: Esta tabla expone los 16 compuestos de 10.001 a 10.016 de fórmula I-4:



(I-4),

donde Xa<sub>4</sub> es S, Y es O, y Ra<sub>4</sub>, R<sub>14</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>6</sub> y X<sub>2</sub> son como se definen a continuación:

15

Tabla 10:

Comp. N.º	Ra <sub>2</sub>	R <sub>12</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	R <sub>6</sub>	X <sub>2</sub>
10.001	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH
10.002	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	N
10.003	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH
10.004	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	N
10.005	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH
10.006	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	N
10.007	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH
10.008	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	N
10.009	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SCF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH
10.010	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SCF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	N
10.011	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SCF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH
10.012	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SCF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	N
10.013	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH
10.014	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	N
10.015	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH
10.016	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	N

y los N-óxidos de los compuestos de la Tabla 10.

20

Tabla 11: Esta tabla expone los 16 compuestos de 11.001 a 11.016 de fórmula I-4, donde Xa<sub>4</sub> es SO, Y es O, y Ra<sub>4</sub>, R<sub>14</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>6</sub> y X<sub>2</sub> son como se definen en la Tabla 10.

Tabla 12: Esta tabla expone los 16 compuestos de 12.001 a 12.016 de fórmula I-4, donde  $Xa_4$  es  $SO_2$ , Y es O, y  $Ra_4$ ,  $R_{14}$ ,  $R_2$ ,  $R_3$ ,  $R_6$  y  $X_2$  son como se definen en la Tabla 10.

5 Los compuestos de fórmula I de acuerdo con la invención son principios activos valiosos desde el punto de vista de la prevención y/o curación en el área del control de plagas, incluso con tasas de aplicación bajas, que tienen un espectro biocida muy favorable y son bien tolerados por las especies de sangre caliente, peces y plantas. Los principios activos de acuerdo con la invención actúan contra fases de desarrollo individuales o contra todas las fases de desarrollo de plagas de animales normalmente sensibles, pero también resistentes, tales como insectos o representantes del orden de los acáridos. La actividad insecticida o acaricida de los principios activos de acuerdo con la invención puede manifestarse directamente, es decir, en la destrucción de las plagas, la cual se produce inmediatamente o cuando ha transcurrido poco tiempo, por ejemplo, durante la ecdisis, o indirectamente, por ejemplo, en una tasa reducida de oviposición y/o eclosión, donde una buena actividad corresponde a una tasa de destrucción (mortalidad) de al menos un 50 a un 60%.

15 Algunos ejemplos de las plagas de animales mencionadas previamente son:

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

25 del orden de los anopluros, por ejemplo, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Pemphigus* spp. y *Phylloxera* spp.;

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

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

del orden de los hemípteros, por ejemplo, *Acanthocoris scabrator*, *Acrosternum* spp, *Adelphocoris lineolatus*, *Amblypelta nitida*, *Bathycyba thalassina*, *Blissus* spp, *Cimex* spp., *Clavigralla tomentosicollis*, *Creontiades* spp, *Distantiella theobroma*, *Dichelops furcatus*, *Dysdercus* spp., *Edessa* spp, *Euchistus* spp., *Eurydema pulchrum*, *Eurygaster* spp., *Halyomorpha halys*, *Horcias nobilellus*, *Leptocoris* spp., *Lygus* spp, *Margarodes* spp, *Murgantia histrionica*, *Neomegalotomus* spp, *Nesidiocoris tenuis*, *Nezara* spp., *Nysius simulans*, *Oebalus insularis*, *Piesma* spp., *Piezodorus* spp, *Rhodnius* spp., *Sahlbergella singularis*, *Scaptocoris castanea*, *Scotinophara* spp., *Thyanta* spp., *Triatoma* spp., *Vatiga illudens*;

del orden de los homópteros, por ejemplo, *Acyrtosium pisum*, *Adalgas* spp, *Agalliana ensigera*, *Agonoscena targionii*, *Aleurodicus* spp, *Aleurocanthus* spp, *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrix floccosus*, *Aleyrodes brassicae*, *Amarasca biguttula*, *Amritodus atkinsoni*, *Aonidiella* spp., *Aphididae*, *Aphis* spp., *Aspidiotus* spp., *Aulacorthum solani*, *Bactericera cockerelli*, *Bemisia* spp, *Brachycaudus* spp, *Brevicoryne brassicae*, *Cacopsylla* spp, *Cavariella aegopodii* Scop., *Ceroplaster* spp., *Chrysomphalus aonidium*, *Chrysomphalus dictyospermi*, *Cicadella* spp, *Cofana spectra*, *Cryptomyzus* spp, *Cicadulina* spp, *Coccus hesperidum*, *Dalbulus maidis*, *Dialeurodes* spp, *Diaphorina citri*, *Diuraphis noxia*, *Dysaphis* spp, *Empoasca* spp., *Eriosoma larigerum*, *Erythroneura* spp., *Gascardia* spp., *Glycaspis brimblecombei*, *Hyadaphis pseudobrassicae*, *Hyalopterus* spp, *Hyperomyzus pallidus*, *Idioscopus clypealis*, *Jacobiasca lybica*, *Laodelphax* spp., *Lecanium corni*, *Lepidosaphes* spp., *Lopaphis erysimi*, *Lyogenys maidis*, *Macrosiphum* spp., *Mahanarva* spp, *Metcalfa pruinosa*, *Metopolophium dirhodum*, *Myndus crudus*, *Myzus* spp., *Neotoxoptera* sp, *Nephotettix* spp., *Nilaparvata* spp., *Nippolachnus piri* Mats, *Odonaspis ruthae*, *Oregma lanigera* Zehnter, *Parabemisia myricae*, *Paratrioza cockerelli*, *Parlatoria* spp., *Pemphigus* spp., *Peregrinus maidis*, *Perkinsiella* spp, *Phorodon humuli*, *Phylloxera* spp, *Planococcus* spp., *Pseudaulacaspis* spp., *Pseudococcus* spp., *Pseudatomoscelis seriatus*, *Psylla* spp., *Pulvinaria aethiopica*, *Quadraspidotus* spp., *Quesada gigas*, *Recilia dorsalis*,

Rhopalosiphum spp., Saissetia spp., Scaphoideus spp., Schizaphis spp., Sitobion spp., Sogatella furcifera, Spissistilus festinus, Tarophagus Proserpina, Toxoptera spp, Trialeurodes spp, Tridiscus sporoboli, Trionymus spp, Trioza erytraeae, Unaspis citri, Zyginia flammigera, Zyginidia scutellaris;

5 del orden de los himenópteros, por ejemplo, Acromyrmex, Arge spp, Atta spp., Cephus spp., Diprion spp., Diprionidae, Gilpinia polytoma, Hoplocampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Neodiprion spp., Pogonomyrmex spp, Slenopsis invicta, Solenopsis spp. y Vespa spp.;

10 del orden de los isópteros, por ejemplo, Coptotermes spp, Cornitermes cumulans, Incisitermes spp, Macrotermes spp, Mastotermes spp, Microtermes spp, Reticulitermes spp.; Solenopsis geminata

15 del orden de los lepidópteros, por ejemplo, Acleris spp., Adoxophyes spp., Aegeria spp., Agrotis spp., Alabama argillaceae, Amylois spp., Anticarsia gemmatalis, Archips spp., Argyresthia spp, Argyrotaenia spp., Autographa spp., Bucculatrix thurberiella, Busseola fusca, Cadra cautella, Carposina nipponensis, Chilo spp., Choristoneura spp., Chrysoteuchia topiaria, Clysia ambiguella, Cnaphalocrocis spp., Cnephasia spp., Cochylis spp., Coleophora spp., Colias lesbia, Cosmophila flava, Crambus spp, Crocidolomia binotalis, Cryptophlebia leucotreta, Cydalima perspectalis, Cydia spp., Diaphania perspectalis, Diatraea spp., Diparopsis castanea, Earias spp., Eldana saccharina, Ephestia spp., Epinotia spp, Estigmene acrea, Etiella zinckinella, Eucosma spp., Eupoecilia ambiguella, Euproctis spp., Euxoa spp., Feltia jaculiferia, Grapholita spp., Hedya nubiferana, Heliothis spp., Hellula undalis, 20 Herpetogramma spp, Hyphantria cunea, Keiferia lycopersicella, Lasmopalpus lignosellus, Leucoptera scitella, Lithocolletis spp., Lobesia botrana, Loxostege bifidalis, Lymantria spp., Lyonetia spp., Malacosoma spp., Mamestra brassicae, Manduca sexta, Mythimna spp, Noctua spp, Operophtera spp., Orniodes indica, Ostrinia nubilalis, Pammene spp., Pandemis spp., Panolis flammea, Papaipema nebris, Pectinophora gossypiella, Perileucoptera coffeella, Pseudaletia unipuncta, Phthorimaea operculella, Pieris rapae, Pieris spp., Plutella xylostella, Prays spp., 25 Pseudoplusia spp, Rachiplusia nu, Richia albicosta, Scirpophaga spp., Sesamia spp., Sparganothis spp., Spodoptera spp., Sylepta derogate, Synanthedon spp., Thaumetopoea spp., Tortrix spp., Trichoplusia ni, Tuta absoluta e Yponomeuta spp.;

30 del orden de los malófagos, por ejemplo, Damalinae spp. y Trichodectes spp.;

del orden de los ortópteros, por ejemplo, Blatta spp., Blattella spp., Grylotalpa spp., Leucophaea maderae, Locusta spp., Neocurtilla hexadactyla, Periplaneta spp., Scapteriscus spp y Schistocerca spp.;

35 del orden de los psocópteros, por ejemplo, Liposcelis spp.;

del orden de los sifonápteros, por ejemplo, Ceratophyllus spp., Ctenocephalides spp. y Xenopsylla cheopis;

del orden de los tisanópteros, por ejemplo, Calliothrips phaseoli, Frankliniella spp., Heliothrips spp, Hercinothrips spp., Parthenothrips spp, Scirtothrips aurantii, Sericothrips variabilis, Taeniothrips spp., Thrips spp;

40 del orden de los tisanuros, por ejemplo, Lepisma saccharina.

45 Los componentes activos de acuerdo con la invención pueden emplearse para controlar, es decir, contener o exterminar, plagas del tipo mencionado anteriormente que se manifiestan particularmente en plantas, especialmente en plantas útiles y ornamentales en agricultura, en horticultura y en bosques, o en órganos, tales como frutos, flores, follaje, tallos, tubérculos o raíces de dichas plantas y, en algunos casos, incluso los órganos de las plantas que se forman posteriormente se mantienen protegidos contra estas plagas.

50 Los cultivos diana adecuados son, en particular, cereales tales como trigo, cebada, centeno, avena, arroz, maíz o sorgo; remolacha tal como remolacha azucarera o forrajera; fruta, por ejemplo, fruta pomácea, fruta con hueso o bayas, tal como manzanas, peras, ciruelas, melocotones, almendras, cerezas o bayas, por ejemplo, fresas, frambuesas o moras; cultivos leguminosos tales como alubias, lentejas, guisantes o soja; cultivos oleosos tales como colza oleaginosa, mostaza, amapolas, aceitunas, girasoles, coco, ricino, cacao o cacahuete; cucurbitáceas tales como calabazas, pepinos o melones; plantas de fibra tales como algodón, lino, cáñamo o yute; frutos cítricos tales como naranjas, limones, pomelos o tangerinas; hortalizas tales como espinaca, lechuga, espárrago, coles, zanahorias, cebollas, tomates, patatas o pimientos morrones; lauráceas tales como aguacate, canela o alcanfor; y también tabaco, nueces, café, berenjenas, caña de azúcar, té, pimienta, vid, lúpulos, la familia de los plátanos, plantas productoras de látex y ornamentales.

60 Los principios activos de acuerdo con la invención son especialmente adecuados para controlar *Aphis craccivora*, *Diabrotica balteata*, *Heliothis virescens*, *Myzus persicae*, *Plutella xylostella* y *Spodoptera littoralis* en cultivos de algodón, hortalizas, maíz, arroz y soja. Los principios activos de acuerdo con la invención además son especialmente adecuados para controlar *Mamestra* (preferentemente en hortalizas), *Cydia pomonella* (preferentemente en manzanas), *Empoasca* (preferentemente en hortalizas, viñas), *Leptinotarsa* (preferentemente en patatas) y *Chilo suppressalis* (preferentemente en arroz).

En un aspecto adicional, la invención también puede referirse a un método para controlar los daños a las plantas y partes de estas ejercidos por nematodos parasitarios de plantas (nematodos endoparasitarios, semiendoparasitarios y ectoparasitarios), especialmente nematodos parasitarios de plantas tales como nematodos de los nudos de raíz, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica*, *Meloidogyne arenaria* y otras especies de *Meloidogyne*; nematodos formadores de quistes, *Globodera rostochiensis* y otras especies de *Globodera*; *Heterodera avenae*, *Heterodera glycines*, *Heterodera schachtii*, *Heterodera trifolii* y otras especies de *Heterodera*; nematodos de agallas de semillas, especies de *Anguina*; nematodos de tallo y foliares, especies de *Aphelenchoides*; nematodos de picadura, *Belonolaimus longicaudatus* y otras especies de *Belonolaimus*; nematodos del pino, *Bursaphelenchus xylophilus* y otras especies de *Bursaphelenchus*; nematodos de anillo, especies de *Criconema*, especies de *Criconemella*, especies de *Criconemoides*, especies de *Mesocriconema*; nematodos de tallo y bulbo, *Ditylenchus destructor*, *Ditylenchus dipsaci* y otras especies de *Ditylenchus*; nematodos de punzón, especies de *Dolichodorus*; nematodos de espiral, *Helicotylenchus multicinctus* y otras especies de *Helicotylenchus*; nematodos de vaina y envoltentes, especies de *Hemicycliophora* y especies de *Hemicriconemoides*; especies de *Hirshmanniella*; nematodos lanza, especies de *Hoploaimus*; nematodos falsos de nudo de raíz, especies de *Nacobbus*; nematodos aguja, *Longidorus elongatus* y otras especies de *Longidorus*; nematodos alfiler, especies de *Pratylenchus*; nematodos de lesiones, *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus curvatus*, *Pratylenchus goodeyi* y otras especies de *Pratylenchus*; nematodos excavadores, *Radopholus similis* y otras especies de *Radopholus*; nematodos reniformes, *Rotylenchus robustus*, *Rotylenchus reniformis* y otras especies de *Rotylenchus*; especies de *Scutellonema*; nematodos de raíz corta y gruesa, *Trichodorus primitivus* y otras especies de *Trichodorus*, especies de *Paratrichodorus*; nematodos que causan atrofia, *Tylenchorhynchus claytoni*, *Tylenchorhynchus dubius* y otras especies de *Tylenchorhynchus*; nematodos de cítricos, especies de *Tylenchulus*; nematodos daga, especies de *Xiphinema*; y otras especies de nematodos parasitarios de plantas, tales como *Subanguina* spp., *Hypsoperine* spp., *Macroposthonia* spp., *Melinius* spp., *Punctodera* spp. y *Quinisulcius* spp.

Los compuestos de la invención también pueden tener actividad contra los moluscos. Algunos ejemplos incluyen, por ejemplo, *Ampullariidae*; *Arion* (*A. ater*, *A. circumscriptus*, *A. hortensis*, *A. rufus*); *Bradybaenidae* (*Bradybaena fruticum*); *Cepaea* (*C. hortensis*, *C. nemoralis*); *ochlodina*; *Deroceras* (*D. agrestis*, *D. empiricum*, *D. laeve*, *D. reticulatum*); *Discus* (*D. rotundatus*); *Euomphalia*; *Galba* (*G. trunculata*); *Helicelia* (*H. itala*, *H. obvia*); *Helicidae* (*Helicigona arbustorum*); *Helicodiscus*; *Helix* (*H. aperta*); *Limax* (*L. cinereoniger*, *L. flavus*, *L. marginatus*, *L. maximus*, *L. tenellus*); *Lymnaea*; *Milax* (*M. gagates*, *M. marginatus*, *M. sowerbyi*); *OPEAS*; *Pomacea* (*P. canaliculata*); *Vallonia* y *Zanitoides*.

Se debe sobreentender que el término "cultivos" también incluye las plantas de cultivo que han sido transformadas mediante el uso de técnicas de ADN recombinante de tal forma que son capaces de sintetizar una o más toxinas que actúan selectivamente tales como, por ejemplo, las conocidas que proceden de bacterias que producen toxinas, especialmente las del género *Bacillus*.

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

En el contexto de la presente invención, debe entenderse por  $\delta$ -endotoxinas, por ejemplo, Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 o Cry9C, o proteínas insecticidas vegetativas (Vip), por ejemplo, Vip1, Vip2, Vip3 o Vip3A, explícitamente también toxinas híbridas, toxinas truncadas y toxinas modificadas. Las toxinas híbridas se producen de manera recombinante mediante una nueva combinación de diferentes dominios de estas proteínas (remítase, por ejemplo, al documento WO 02/15701). Existe constancia de toxinas truncadas, por ejemplo, una toxina Cry1Ab truncada. En el caso de las toxinas modificadas, se reemplazan uno o más aminoácidos de la toxina de origen natural. En tales reemplazos de aminoácidos, preferentemente se insertan secuencias de reconocimiento de proteasas artificiales en la toxina, como, por ejemplo, en el caso de Cry3A055, en el que se inserta una secuencia de reconocimiento de catepsina-G en una toxina Cry3A (remítase al documento WO 03/018810).

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



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

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

10 Existe constancia de plantas transgénicas que contienen uno o más genes que codifican resistencia a insecticidas y expresan una o más toxinas, y algunas de ellas se pueden adquirir de proveedores comerciales. Algunos ejemplos de estas plantas son: YieldGard® (variedad de maíz que expresa una toxina Cry1Ab); YieldGard Rootworm® (variedad de maíz que expresa una toxina Cry3Bb1); YieldGard Plus® (variedad de maíz que expresa una toxina Cry1Ab y una Cry3Bb1); Starlink® (variedad de maíz que expresa una toxina Cry9C); Herculex I® (variedad de maíz que expresa una toxina Cry1Fa2 y la enzima fosfotricina-*N*-acetiltransferasa (PAT) para conseguir tolerancia al herbicida glufosinato de amonio); NuCOTN 33B® (variedad de algodón que expresa una toxina Cry1Ac); Bollgard I® (variedad de algodón que expresa una toxina Cry1Ac); Bollgard II® (variedad de algodón que expresa una toxina Cry1Ac y una Cry2Ab); VipCot® (variedad de algodón que expresa una toxina Vip3A y una Cry1Ab); NewLeaf® (variedad de patata que expresa una toxina Cry3A); NatureGard®, Agrisure® GT Advantage (rasgo tolerante a glifosato GA21), Agrisure® CB Advantage (rasgo de barrenador del maíz (CB) Bt11) y Protecta®.

Otros ejemplos de tales cultivos transgénicos son:

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

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

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

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

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

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

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

60 También se describen cultivos transgénicos de plantas resistentes a insectos en el Informe del BATS (Zentrum für Biosicherheit und Nachhaltigkeit, Zentrum BATS, Clarastrasse 13, 4058 Basilea, Suiza) de 2003 (<http://bats.ch>).

5 Se debe sobreentender que el término "cultivos" también incluye plantas cultivadas que han sido transformadas mediante el uso de técnicas de ADN recombinante de tal forma que son capaces de sintetizar sustancias antipatógenas que tienen una acción selectiva, tales como, por ejemplo, las denominadas "proteínas relacionadas con la patogénesis" (PRP, remítase, por ejemplo, al documento EP-A-0 392 225). Algunos ejemplos de estas sustancias antipatógenas y de plantas transgénicas capaces de sintetizar estas sustancias antipatógenas se describen, por ejemplo, en los documentos EP-A-0 392 225, WO 95/33818 y EP-A-0 353 191. Los expertos en la técnica generalmente conocen los métodos para producir tales plantas transgénicas y estos se describen, por ejemplo, en las publicaciones mencionadas anteriormente.

10 Las sustancias antipatógenas que pueden ser expresadas por tales plantas transgénicas incluyen, por ejemplo, bloqueadores de canales iónicos, tales como bloqueadores de canales de sodio y calcio, por ejemplo, las toxinas víricas KP1, KP4 o KP6; estilbeno-sintasas; bibencil-sintasas; quitinasas; glucanasas; las denominadas "proteínas relacionadas con la patogénesis" (PRP; remítase, por ejemplo, al documento EP-A-0 392 225); sustancias antipatógenas producidas por microorganismos, por ejemplo, antibióticos peptídicos o antibióticos heterocíclicos (remítase, por ejemplo, al documento WO 95/33818) o factores proteicos o polipeptídicos que participan en la defensa de la planta contra patógenos (denominados "genes de resistencia a enfermedades de plantas", tal como se describe en el documento WO 03/000906).

20 Otras áreas de uso de las composiciones de acuerdo con la invención son la protección de mercancías almacenadas y almacenes y la protección de materias primas, tales como madera, textiles, revestimientos de suelos o edificios, y también en el sector de la higiene, especialmente la protección de seres humanos, animales domésticos y ganado productivo contra plagas del tipo mencionado.

25 La presente invención también proporciona un método para controlar plagas (tales como mosquitos y otros portadores de enfermedades; remítase también a [http://www.who.int/malaria/vector\\_control/irs/en/](http://www.who.int/malaria/vector_control/irs/en/)). En una realización, el método para controlar plagas comprende aplicar las composiciones de la invención a las plagas diana, a su emplazamiento o a una superficie o sustrato con brocha, con rodillo, mediante pulverización, difusión o inmersión. A modo de ejemplo, una aplicación de tipo IRS (siglas en inglés de pulverización residual de interiores) de una superficie, tal como la superficie de una pared, un techo o un suelo, queda contemplada por el método de la invención. En otra realización, se contempla la aplicación de dichas composiciones a un sustrato tal como un material de tipo tela o no tejido en forma de (o que puede emplearse para elaborar) mallas, ropa, ropa de cama, cortinas y tiendas de campaña.

35 En una realización, el método para controlar dichas plagas comprende aplicar una cantidad eficaz como pesticida de las composiciones de la invención a las plagas diana, a su emplazamiento o a una superficie o sustrato, con el fin de proporcionar una actividad pesticida residual eficaz en la superficie o sustrato. Una aplicación del mismo tipo puede realizarse aplicando la composición pesticida de la invención con brocha, rodillo, mediante pulverización, difusión o inmersión. A modo de ejemplo, una aplicación de tipo IRS de una superficie, tal como la superficie de una pared, un techo o un suelo, queda contemplada por el método de la invención para proporcionar una actividad pesticida residual eficaz en la superficie. En otra realización, se contempla la aplicación de dichas composiciones para el control residual de plagas en un sustrato tal como un material de tipo tela en forma de (o que puede emplearse para elaborar) mallas, ropa, ropa de cama, cortinas y tiendas de campaña.

45 Los sustratos, incluidos los materiales de tipo tela, no tejidos o las mallas, que se van a tratar pueden estar hechos de fibras naturales tales como algodón, rafia, yute, lino, sisal, arpillera o lana, o fibras sintéticas tales como poliamida, poliéster, polipropileno, poliacrilonitrilo o similares. Los poliésteres son particularmente adecuados. Los métodos de tratamiento textil se describen, por ejemplo, en los documentos WO 2008/151984, WO 2003/034823, US 5631072, WO 2005/64072, WO2006/128870, EP 1724392, WO2005113886 o WO 2007/090739.

50 Otras áreas de uso de las composiciones de acuerdo con la invención son el campo de la inyección de árboles/tratamiento de troncos para todos los árboles ornamentales, así como todo tipo de árboles de frutos secos y frutales.

55 En el campo de la inyección de árboles/tratamiento de troncos, los compuestos de acuerdo con la presente invención son especialmente adecuados para combatir los insectos barrenadores de la madera del orden de los lepidópteros, tal como se menciona anteriormente, y del orden de los coleópteros, especialmente para combatir los barrenadores de la madera que figuran en las siguientes tablas A y B:

Tabla A. Ejemplos de barrenadores de la madera exóticos importantes desde un punto de vista económico.

Familia	Especie	Hospedador o cultivo infestado
Bupréstidos	<i>Agrilus planipennis</i>	Fresno
Cerambísid	<i>Anoplua glabripennis</i>	Maderas duras
Escolitinos	<i>Xylosandrus crassiusculus</i>	Maderas duras
	<i>X. mutilatus</i>	Maderas duras
	<i>Tomicus piniperda</i>	Coníferas

Tabla B. Ejemplos de barrenadores de la madera nativos importantes desde un punto de vista económico.

Familia	Especie	Hospedador o cultivo infestado
Buprestidos	<i>Agrilus anxius</i>	Abedul
	<i>Agrilus politus</i>	Sauce, Arce
	<i>Agrilus sayi</i>	Baya, <i>Comptonia</i>
	<i>Agrilus vittaticollis</i>	Manzana, Pera, Arándano rojo, Amelanchier, Espino blanco
	<i>Chrysobothris femorata</i>	Manzana, Albaricoque, Haya, Arce negundo, Cereza, Castaña, Grosella, Olmo, Espino blanco, Almez, Nogal americano, Castaño de Indias, Tilo, Arce, Fresno de Montaña, Roble, Pecán, Pera, Melocotón, Caqui, Ciruela, Álamo, Membrillo, Ciclamor, Amelanchier, Sicomoro, Nuez, Sauce
	<i>Texania campestris</i>	Tilo Americano, Haya, Arce, Roble, Sicomoro, Sauce, Álamo amarillo
Cerambísidos	<i>Goes pulverulentus</i>	Haya, Olmo, Roble de Nuttall, Sauce, Roble negro, Roble de corteza de cerezo, Roble de agua, Sicomoro
	<i>Goes tigrinus</i>	Roble
	<i>Neoclytus acuminatus</i>	Fresno, Nogal americano, Roble, Nuez, Abedul, Haya, Arce, Carpe lupulino del este, Cornejo, Caqui, Ciclamor, Acebo, Almez, Falsa Acacia, Acacia de tres espinas, Álamo amarillo, Castaño, Naranja de Luisiana, Sassafras, Lila, Caoba de la montaña, Pera, Cereza, Ciruela, Melocotón, Manzana, Olmo, Tilo americano, Liquidámbar
	<i>Neoptychodes trilineatus</i>	Higo, Aliso, Mora, Sauce, Almez occidental
	<i>Oberea ocellata</i>	Zumaque, Manzana, Melocotón, Ciruela, Pera, Grosella, Mora
	<i>Oberea tripunctata</i>	Cornejo, Viburnum, Olmo, Oxidendro, Arándano azul, Rododendro, Azaleas, Laurel, Álamo, Sauce, Mora
	<i>Oncideres cingulata</i>	Nogal americano, Pecán, Caqui, Olmo, Oxidendro, Tilo americano, Acacia de tres espinas, Cornejo, Eucalipto, Roble, Almez, Arce, Árboles frutales
	<i>Saperda calcarata</i>	Álamo
<i>Strophiona nitens</i>	Castaño, Roble, Nogal americano, Nuez, Haya, Arce	
Escolitinos	<i>Corthylus columbianus</i>	Arce, Roble, Álamo amarillo, Haya, Arce negundo, Sicomoro, Abedul, Tilo Americano, Castaño, Olmo
	<i>Dendroctonus frontalis</i>	Pino
	<i>Dryocoetes betulae</i>	Abedul, Liquidámbar, Cereza silvestre, Haya, Pera
	<i>Monarthrum fasciatum</i>	Roble, Arce, Abedul, Castaño, Liquidámbar, Tupelo, Álamo, Nogal americano, Mimosa, Manzana, Melocotón, Pino
	<i>Phloeotribus liminaris</i>	Melocotón, Cereza, Ciruela, Cereza negra, Olmo, Mora, Fresno de montaña
	<i>Pseudopityophthorus pruinosis</i>	Roble, Haya Americana, Cereza negra, Ciruela Chickasaw, Castaño, Arce, Nogal americano, Carpes, Carpe lupulino
Sésidos	<i>Paranthrene simulans</i>	Roble, Castaña americana
	<i>Sannina uroceriformis</i>	Caqui
	<i>Synanthedon exitiosa</i>	Melocotón, Ciruela, Nectarina, Cereza,

Familia	Especie	Hospedador o cultivo infestado
		Albaricoque, Almendra, Cereza negra
	<i>Synanthedon pictipes</i>	Melocotón, Ciruela, Cereza, Haya, Cereza negra
	<i>Synanthedon rubrofascia</i>	<i>Nyssa</i>
	<i>Synanthedon scitula</i>	Cornejo, Pecán, Nogal americano, Roble, Castaño, Haya, Abedul, Cereza negra, Olmo, Fresno de la montaña, Viburno, Sauce, Manzana, Níspero, <i>Physocarpus</i> , Baya
	<i>Vitacea polistiformis</i>	Uva

5 La presente invención también se puede utilizar para controlar cualesquiera plagas de insectos que puedan estar presentes en el pasto, que incluyen, por ejemplo, escarabajos, orugas, hormigas de fuego, perlas de tierra, milipedos, cochinillas de la humedad, ácaros, grillos topo, cochinillas, gorgojos, garrapatas, cercopoideos, chinches meridionales y larvas blancas. La presente invención se puede utilizar para controlar plagas de insectos en diversas etapas de su ciclo vital, incluidos los huevos, larvas, ninfas y adultos.

10 En particular, la presente invención se puede utilizar para controlar las plagas de insectos que se alimentan de las raíces de pasto, que incluyen larvas blancas (tales como *Cyclocephala spp.* (p. ej., el escarabajo enmascarado, *C. lurida*), *Rhizotrogus spp.* (p. ej., el gusano blanco europeo, *R. majalis*), *Cotinus spp.* (p. ej., el escarabajo verde de junio, *C. nitida*), *Popillia spp.* (p. ej., el escarabajo japonés, *P. japonica*), *Phyllophaga spp.* (p. ej., el escarabajo de mayo/junio), *Ataenius spp.* (p. ej., el escarabajo negro del césped, *A. spretulus*), *Maladera spp.* (p. ej., el escarabajo del jardín asiático, *M. castanea*) y *Tomarus spp.*), perlas de tierra (*Margarodes spp.*), grillos topo (leonado, meridional y de alas cortas; *Scapteriscus spp.*, *Gryllotalpa africana*) y larvas de tipúlidos (tipúlido europeo, *Tipula spp.*).

20 La presente invención también se puede utilizar para controlar plagas de insectos del pasto que se alojan en la paja, que incluyen gardamas (como el cogollero del maíz *Spodoptera frugiperda*, y el cogollero común *Pseudaletia unipuncta*), gusanos cortadores, gorgojos (*Sphenophorus spp.*, como *S. venatus verstitus* y *S. parvulus*) y polillas del césped (como *Crambus spp.* y la polilla del césped tropical, *Herpetogramma phaeopteralis*).

25 La presente invención también se puede utilizar para controlar plagas de insectos del pasto que viven sobre el suelo y se alimentan de las hojas de pasto, incluidas chinches (como las chinches meridionales, *Blissus insularis*), ácaro de la grama común (*Eriophyes cynodontiensis*), gorgojos del pasto de rodas (*Antonina graminis*), cercopoideos de dos líneas (*Prospapia bicincta*), cicadélidos, gusanos cortadores (familia *Noctuidae*) y áfidos verdes.

30 La presente invención también puede usarse para controlar otras plagas del pasto, tales como las hormigas rojas de fuego no endémicas (*Solenopsis invicta*) que crean túmulos de hormigas en el pasto.

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

Algunos ejemplos de dichos parásitos son:

Del orden de los anopluros: *Haematopinus spp.*, *Linognathus spp.*, *Pediculus spp.* y *Phtirus spp.*, *Solenopotes spp.*.

40 Del orden de los malófagos: *Trimenopon spp.*, *Menopon spp.*, *Trinoton spp.*, *Bovicola spp.*, *Werneckiella spp.*, *Lepikentron spp.*, *Damalina spp.*, *Trichodectes spp.* y *Felicola spp.*.

45 Del orden de los dípteros y de los subórdenes de los nematóceros y braquíceros, por ejemplo, *Aedes spp.*, *Anopheles spp.*, *Culex spp.*, *Simulium spp.*, *Eusimulium spp.*, *Phlebotomus spp.*, *Lutzomyia spp.*, *Culicoides spp.*, *Chrysops spp.*, *Hybomitra spp.*, *Atylotus spp.*, *Tabanus spp.*, *Haematopota spp.*, *Philipomyia spp.*, *Braula spp.*, *Musca spp.*, *Hydrotaea spp.*, *Stomoxys spp.*, *Haematobia spp.*, *Morellia spp.*, *Fannia spp.*, *Glossina spp.*, *Calliphora spp.*, *Lucilia spp.*, *Chrysomyia spp.*, *Wohlfahrtia spp.*, *Sarcophaga spp.*, *Oestrus spp.*, *Hypoderma spp.*, *Gasterophilus spp.*, *Hippobosca spp.*, *Lipoptena spp.* y *Melophagus spp.*.

50 Del orden de los sifonápteros, por ejemplo, *Pulex spp.*, *Ctenocephalides spp.*, *Xenopsylla spp.*, *Ceratophyllus spp.*.

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

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

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

5 De los órdenes actinédidos (*Prostigmata*) y acarídidos (*Astigmata*), por ejemplo, *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Ornithocheyletia* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Listrophorus* spp., *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Choriopetes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp. y *Laminosioptes* spp..

10 Las composiciones de acuerdo con la invención también son adecuadas para la protección contra la infestación de insectos en el caso de materiales tales como madera, textiles, plásticos, adhesivos, pegamentos, pinturas, papel y cartulina, cuero, revestimientos de suelos y edificios.

15 Las composiciones de acuerdo con la invención pueden utilizarse, por ejemplo, contra las siguientes plagas: escarabajos tales como *Hylotrupes bajulus*, *Chlorophorus pilosis*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinus pecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Ernobius mollis*, *Priobium carpini*, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*, *Lyctus planicollis*, *Lyctus linearis*, *Lyctus pubescens*, *Trogoxylon aequale*, *Minthes rugicollis*, *Xyleborus* spp., *Tryptodendron* spp., *Apatos monachus*, *Bostrychus capucinus*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxylon* spp. y *Dinoderus minutus* y también himenópteros tales como *Sirex juvencus*, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigastagnus* y *Urocerus augur* y termitas tales como *Kaloterms flavicollis*, *Cryptoterms brevis*, *Heteroterms indicola*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes santonensis*, *Reticulitermes lucifugus*, *Mastoterms darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis* y *Coptotermes formosanus* y tisanuros tales como *Lepisma saccharina*.

25 Por lo tanto, la invención también se refiere a composiciones pesticidas tales como concentrados emulsionables, concentrados en suspensión, microemulsiones, aceites dispersables, soluciones que se pueden diluir o pulverizar directamente, pastas untables, emulsiones diluidas, polvos solubles, polvos dispersables, polvos humectables, polvos finos, gránulos o encapsulaciones en sustancias poliméricas que comprenden, al menos, uno de los principios activos de acuerdo con la invención y que se seleccionarán de modo que se ajusten a los objetivos previstos y las circunstancias predominantes.

30 En estas composiciones, el principio activo se emplea en forma pura, un principio activo sólido, por ejemplo, con un tamaño de partícula específico o, preferentemente, junto con, al menos, uno de los auxiliares utilizados de manera convencional en la técnica de la formulación tales como diluyentes, por ejemplo, disolventes o portadores sólidos, o tales como compuestos tensioactivos (surfactantes).

35 Algunos ejemplos de disolventes adecuados son: hidrocarburos aromáticos no hidrogenados o parcialmente hidrogenados, preferentemente las fracciones de C<sub>8</sub> a C<sub>12</sub> de alquilbencenos, tales como mezclas de xileno, naftalenos alquilados o tetrahidronaftaleno, hidrocarburos alifáticos o cicloalifáticos, tales como parafinas o ciclohexano, alcoholes tales como etanol, propanol o butanol, glicoles y sus éteres y ésteres tales como propilenglicol, éter dipropilenglicólico, etilenglicol o éter monometílico del etilenglicol o éter monoetilico del etilenglicol, cetonas, tales como ciclohexanona, isoforona o alcohol diacetónico, disolventes polares fuertes, tales como *N*-metilpirrolid-2-ona, sulfóxido de dimetilo o *N,N*-dimetilformamida, agua, aceites vegetales epoxidados o no epoxidados, tales como aceites de colza, ricino, coco o soja y silicona epoxidados o no epoxidados.

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

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

60 Los surfactantes no iónicos adecuados son, especialmente, derivados de tipo éter poliglicólico de alcoholes alifáticos o cicloalifáticos, de ácidos grasos saturados o insaturados, o de alquilfenoles que pueden contener de aproximadamente 3 a aproximadamente 30 grupos de tipo éter glicólico y de aproximadamente 8 a aproximadamente 20 átomos de carbono en el radical hidrocarbonado (ciclo)alifático, o de aproximadamente 6 a aproximadamente 18 átomos de carbono en el resto alquilo de los alquilfenoles. También son adecuados aductos solubles en agua de óxido de polietileno con polipropilenglicol, etilendiaminopolipropilenglicol o alquilpolipropilenglicol que tienen de 1 a aproximadamente 10 átomos de carbono en la cadena del alquilo y de

aproximadamente 20 a aproximadamente 250 grupos de tipo éter etilenglicólico y de aproximadamente 10 a aproximadamente 100 grupos de tipo éter propilenglicólico. Normalmente, los compuestos mencionados anteriormente contienen de 1 a aproximadamente 5 unidades de etilenglicol por unidad de propilenglicol. Algunos ejemplos que pueden mencionarse son nonilfenoxipolietoxietanol, éter poliglicólico de aceite de ricino, aductos de polipropilenglicol/óxido de polietileno, tributifenoxipolietoxietanol, polietilenglicol u octilfenoxipolietoxietanol. También son adecuados los ésteres de ácidos grasos de sorbitán polioxi-etilenado, tales como el trioleato de sorbitán polioxi-etilenado.

Los surfactantes catiónicos son, especialmente, sales de amonio cuaternario que generalmente tienen al menos un radical alquilo de aproximadamente 8 a aproximadamente 22 átomos de C como sustituyentes y, como sustituyentes adicionales, radicales (halogenados o no halogenados) de tipo alquilo inferior o hidroxialquilo o bencilo. Las sales se presentan preferentemente en forma de haluros, metilsulfatos o etilsulfatos. Algunos ejemplos son cloruro de esteariltrimetilamonio y bromuro de bencilbis(2-cloroetil)etilamonio.

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

Por regla general, las composiciones comprenden de un 0.1 a un 99%, especialmente de un 0.1 a un 95% del principio activo y de un 1 a un 99.9%, especialmente de un 5 a un 99.9%, de al menos un adyuvante sólido o líquido, siendo posible por regla general que de un 0 a un 25%, especialmente de un 0.1 a un 20% de la composición corresponda a surfactantes (el % en cada caso significa porcentaje en peso). Si bien se suelen preferir las composiciones concentradas para artículos comerciales, el usuario final, por regla general, emplea composiciones diluidas que tienen concentraciones sustancialmente más bajas del principio activo.

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

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

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

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

Las formulaciones de premezcla para el tratamiento de semillas preferidas son los concentrados en suspensión acuosa. La formulación puede aplicarse a las semillas usando técnicas y máquinas de tratamiento convencionales, tales como técnicas en lecho fluidizado, el método de trituración con rodillo, dispositivos para el tratamiento rotoestático de semillas y dispositivos para el recubrimiento en tambor. También pueden ser útiles otros métodos,

tales como lechos con surtidores. El tamaño de las semillas puede medirse previamente antes del recubrimiento. Después del recubrimiento, las semillas generalmente se secan y luego se transfieren a una máquina de medición del tamaño para seleccionar su tamaño. Este tipo de procedimientos son conocidos en la técnica.

5 En general, las composiciones de premezcla de la invención contienen de un 0.5 a un 99.9, especialmente de un 1 a un 95, convenientemente de un 1 a un 50%, en masa de los ingredientes deseados y de un 99.5 a un 0.1, especialmente de un 99 a un 5%, en masa de un adyuvante sólido o líquido (incluido, por ejemplo, un disolvente tal como el agua), donde los auxiliares (o adyuvantes) pueden ser un surfactante en una cantidad de un 0 a un 50, especialmente de un 0.5 a un 40%, en masa, en función de la masa de la formulación de premezcla.

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

GR: gránulos

15 PH: polvos humectables

GD: gránulos dispersables en agua (povos)

20 GS: gránulos solubles en agua

SL: concentrados solubles

CE: concentrados emulsionables

25 EAg: emulsiones de aceite en agua

ME: microemulsión

30 CS: concentrado en suspensión acuosa

SC: suspensión acuosa de cápsulas

DO: concentrado en suspensión a base de aceite, y

35 SE: suspoemulsión acuosa.

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

40 HS: polvos humectables para el tratamiento de semillas en suspensión

SS: solución para el tratamiento de semillas

ES: emulsiones para el tratamiento de semillas

45 FS: concentrado en suspensión para el tratamiento de semillas

GD: gránulos dispersables en agua y

50 SC: suspensión acuosa de cápsulas.

Algunos ejemplos de los tipos de formulación adecuados para las composiciones de mezcla en tanque son soluciones, emulsiones diluidas, suspensiones o una mezcla de estas, y polvos finos.

55 Las composiciones preferidas se componen en particular, tal como se indica a continuación ( % = porcentaje en peso):

Concentrados emulsionables:

60 principio activo: de un 1 a un 95%, preferentemente de un 5 a un 20%

surfactante: de un 1 a un 30%, preferentemente de un 10 a un 20%

disolvente: de un 5 a un 98%, preferentemente de un 70 a un 85%

65 Polvos finos:

principio activo: de un 0.1 a un 10%, preferentemente de un 0.1 a un 1%

portador sólido: de un 99.9 a un 90%, preferentemente de un 99.9 a un 99%

5

Concentrados en suspensión:

principio activo: de un 5 a un 75%, preferentemente de un 10 a un 50%

10 agua: de un 94 a un 24%, preferentemente de un 88 a un 30%

surfactante: de un 1 a un 40%, preferentemente de un 2 a un 30%

Polvos humectables:

15

principio activo: de un 0.5 a un 90%, preferentemente de un 1 a un 80%

surfactante: de un 0.5 a un 20%, preferentemente de un 1 a un 15%

20 portador sólido: de un 5 a un 99%, preferentemente de un 15 a un 98%

Granulados:

25

principio activo: de un 0.5 a un 30%, preferentemente de un 3 a un 15%

portador sólido: de un 99.5 a un 70%, preferentemente de un 97 a un 85%

Ejemplos de preparación:

30

"Pf" significa punto de fusión en °C. Los radicales libres representan grupos metilo. Las medidas de <sup>1</sup>H RMN se registraron en un espectrómetro Bruker de 400 MHz, los desplazamientos químicos se proporcionan en ppm con respecto a un patrón de TMS. Los espectros se midieron en disolventes deuterados tal como se indica. Para caracterizar los compuestos, se utilizó uno de los métodos de LCMS mencionados a continuación. Los valores de LCMS característicos obtenidos para cada compuesto fueron el tiempo de retención ("t<sub>R</sub>", registrado en minutos) y el ion molecular medido (M+H)<sup>+</sup>.

35

Métodos de LCMS:

Método 1:

40

Los espectros se registraron en un espectrómetro de masas de Waters (espectrómetro de masas de cuadrupolo único ZQ) dotado de una fuente de electronebulización (polaridad: iones positivos o negativos, capilaridad: 3.00 kV, intervalo del cono: 30-60 V, extractor: 2.00 V, temperatura de la fuente: 150 °C, temperatura de desolvatación: 350 °C, flujo de gas del cono: 0 L/h, flujo del gas de desolvatación: 650 L/h; intervalo de masas: de 100 a 900 Da) y un UPLC Acquity de Waters: bomba binaria, compartimento térmico para la columna y detector de haz de diodos. Desgasificador de disolventes, bomba binaria, compartimento térmico para la columna y detector de haz de diodos. Columna: Waters UPLC HSS T3, 1.8 µm, 30 x 2.1 mm, temp: 60 °C, intervalo de longitudes de onda del DAD (nm): de 210 a 500, gradiente de disolventes: A = agua + 5% de MeOH + 0.05% de HCOOH; B= acetonitrilo + 0.05% de HCOOH; gradiente: 0 min, 0% de B, 100% de A; 2.7-3.0 min, 100% de B; flujo (mL/min): 0.85.

50

Método 2:

Los espectros se registraron en un espectrómetro de masas de Waters (espectrómetro de masas de cuadrupolo único ZQ) dotado de una fuente de electronebulización (polaridad: iones positivos o negativos, capilaridad: 3.00 kV, intervalo del cono: 30-60 V, extractor: 2.00 V, temperatura de la fuente: 150 °C, temperatura de desolvatación: 350 °C, flujo de gas del cono: 0 L/h, flujo del gas de desolvatación: 650 L/h; intervalo de masas: de 100 a 900 Da) y un UPLC Acquity de Waters: bomba binaria, compartimento térmico para la columna y detector de haz de diodos. Desgasificador de disolventes, bomba binaria, compartimento térmico para la columna y detector de haz de diodos. Columna: Waters UPLC HSS T3, 1.8 µm, 30 x 2.1 mm, temp: 60 °C, intervalo de longitudes de onda del DAD (nm): de 210 a 500, gradiente de disolventes: A = agua + 5% de MeOH + 0.05% de HCOOH; B= acetonitrilo + 0.05% de HCOOH; gradiente: 0 min 0% de B, 100% de A; 1.2-1.5 min 100% de B; flujo (mL/min): 0.85.

60

Método 3:

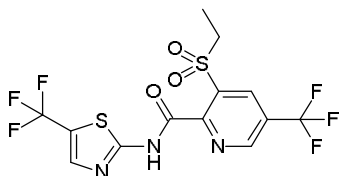
65 Aparato AN\_BASE: Agilent 1100. Bomba binaria: G1312A, desgasificador; automuestreador, Comp. col., DAD: Agilent G1315B, 220-320 nm, MSD: Agilent LC/MSD G6130B ESI, pos/neg 100-800; ELSD PL-ELS2100 flujo del



gas 1.1 mL/min, temp. del gas: 50 °C; columna: Waters XSelect™ C18, 50x2.1 mm, 3.5 μ, temp: 25 °C, flujo: 0.8 mL/min, gradiente:  $t_0 = 2\%$  de A,  $t_{3.5\text{min}} = 98\%$  de A,  $t_{6\text{min}} = 98\%$  de A, tiempo posterior: 2 min, eluyente A: 95% de acetonitrilo + 5% de bicarbonato de amonio 10 mM en agua, eluyente B: bicarbonato de amonio 10 mM en agua (pH=9.5).

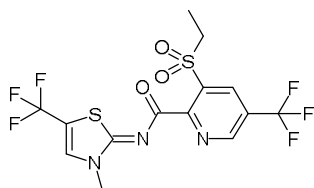
5 EJEMPLO P1: Preparación de (N)-3-etilsulfonil-N-[3-metil-5-(trifluorometil)tiazol-2-iliden]-5-(trifluorometil)piridin-2-carboxamida (compuesto P1)

10 Paso 1: Preparación de 3-etilsulfonil-5-(trifluorometil)-N-[5-(trifluorometil)tiazol-2-il]piridin-2-carboxamida



15 A una solución de clorhidrato de 5-(trifluorometil)tiazol-2-amina (130 mg, 0.64 mmol) y trietilamina (230 mg, 0.316 ml, 2.22 mmol) en tetrahidrofurano (6 ml) a 0 °C, se añadió una solución de cloruro de 3-etilsulfonil-5-(trifluorometil)piridin-2-carbonilo (210.8 mg, 0.70 mmol) en tetrahidrofurano (3 ml) gota a gota. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche. La mezcla se vertió sobre cloruro de amonio acuoso saturado, se extrajo con acetato de etilo y las fases orgánicas combinadas se lavaron con agua y salmuera, se secaron con sulfato de sodio y se evaporaron a sequedad. El residuo se purificó mediante cromatografía en gel de sílice (CombiFlash, gradiente de 0-50% de acetato de etilo en ciclohexano) para proporcionar el compuesto del título (107 mg) como un sólido, pf 198-200 °C. LCMS (método 2): 434 (M+H)<sup>+</sup>, tiempo de retención 1.02 minutos.

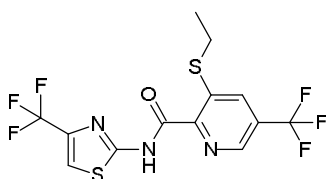
20 Paso 2: Preparación de (N)-3-etilsulfonil-N-[3-metil-5-(trifluorometil)tiazol-2-iliden]-5-(trifluorometil)piridin-2-carboxamida (compuesto del título P1)



25 A una solución de 3-etilsulfonil-5-(trifluorometil)-N-[5-(trifluorometil)tiazol-2-il]piridin-2-carboxamida (95 mg, 0.219 mmol) en *N,N*-dimetilformamida (2 ml) a 0 °C en atmósfera de argón, se añadió hidruro de sodio (11.4 mg, ~60%, 0.285 mmol) y la reacción se agitó a temperatura ambiente durante 10 minutos. A continuación, se añadió yodometano (37.3 mg, 0.0164 ml, 0.263 mmol) a 0 °C y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. Se añadió más hidruro de sodio (11.4 mg) y yodometano (0.0164 ml) a 0 °C y se continuó agitando a temperatura ambiente durante 48 horas. Se añadió cloruro de amonio acuoso saturado y éter *tert*-butil metílico a la mezcla, las fases se separaron, la fase acuosa se extrajo exhaustivamente con éter *tert*-butil metílico (3x), las fases orgánicas combinadas se lavaron con agua y salmuera, se secaron con sulfato de magnesio y se evaporaron a sequedad. El residuo se purificó mediante cromatografía en gel de sílice (CombiFlash, gradiente de 0-50% de acetato de etilo en ciclohexano) para proporcionar el compuesto del título P1 (30 mg) como un sólido amarillento, pf 194-195 °C. LCMS (método 2): 448 (M+H)<sup>+</sup>, tiempo de retención 0.97 minutos.

40 EJEMPLO P2: Preparación de (N)-3-etilsulfonil-N-[3-metil-4-(trifluorometil)tiazol-2-iliden]-5-(trifluorometil)piridin-2-carboxamida (compuesto P2):

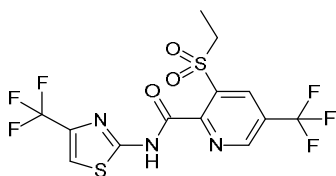
Paso 1: Preparación de 3-etilsulfonil-5-(trifluorometil)-N-[4-(trifluorometil)tiazol-2-il]piridin-2-carboxamida



45 A una solución de 4-(trifluorometil)tiazol-2-amina (400 mg, 2.38 mmol), 4-dimetilaminopiridina (3 mg) y trietilamina (361 mg, 0.495 ml, 3.57 mmol) en diclorometano (36 ml) a 0-5 °C, se añadió una solución de cloruro de 3-etilsulfonil-

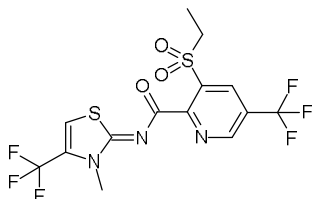
5-(trifluorometil)piridin-2-carbonilo (642 mg, 2.38 mmol) en diclorometano (4 ml) gota a gota. La mezcla de reacción se agitó a 0-5 °C durante una hora. La mezcla se vertió sobre agua, se extrajo con acetato de etilo (3x) y las fases orgánicas combinadas se lavaron con agua y salmuera, se secaron con sulfato de sodio y se evaporaron a sequedad. El residuo se purificó mediante cromatografía en gel de sílice (acetato de etilo/heptano 1:4) para proporcionar el compuesto del título (650 mg) como un sólido, pf 126-128 °C. LCMS (método 1): 402 (M+H)<sup>+</sup>, tiempo de retención 1.99 minutos.

Paso 2: Preparación de 3-etilsulfonil-5-(trifluorometil)-N-[4-(trifluorometil)tiazol-2-il]piridin-2-carboxamida



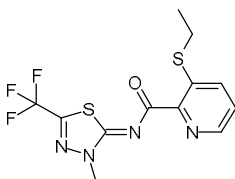
A una solución de 3-etilsulfanil-5-(trifluorometil)-N-[4-(trifluorometil)tiazol-2-il]piridin-2-carboxamida (600 mg, 1.49 mmol) en diclorometano (20 ml) a 10 °C, se añadió ácido *meta*-cloroperoxibenzoico (722 mg, mCPBA, ~75%, 3.14 mmol) en dos porciones y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 60 horas. La mezcla se vertió sobre agua, las fases se separaron y la fase orgánica se lavó con bicarbonato de sodio acuoso saturado (3x), una solución acuosa al 10% de NaHSO<sub>3</sub> y salmuera, se secó con sulfato de magnesio y se evaporó a sequedad. El residuo se suspendió en éter *tert*-butil metílico, la suspensión se agitó a temperatura ambiente y el sólido se filtró y se secó al vacío para proporcionar el compuesto del título (420 mg) como un sólido blanco, pf 204-206 °C. LCMS (método 1): 434 (M+H)<sup>+</sup>, tiempo de retención 1.58 minutos.

Paso 3: Preparación de (N)-3-etilsulfonil-N-[3-metil-4-(trifluorometil)tiazol-2-iliden]-5-(trifluorometil)piridin-2-carboxamida (compuesto del título P2):



A una solución de 3-etilsulfonil-5-(trifluorometil)-N-[4-(trifluorometil)tiazol-2-il]piridin-2-carboxamida (320 mg, 0.74 mmol) en *N,N*-dimetilformamida (3 ml), se añadió yodometano (109 mg, 0.048 ml, 0.77 mmol) y a continuación carbonato de potasio (306 mg, 2.22 mmol) y la reacción se agitó a temperatura ambiente durante una hora. La mezcla se vertió sobre cloruro de amonio acuoso saturado, se extrajo con acetato de etilo (3x) y las fases orgánicas combinadas se lavaron con agua y salmuera, se secaron con sulfato de sodio y se evaporaron a sequedad. El residuo se purificó mediante cromatografía en gel de sílice (CombiFlash, gradiente de 0-30% de acetato de etilo en heptano) para proporcionar en primer lugar 3-etilsulfonil-N-metil-5-(trifluorometil)-N-[4-(trifluorometil)tiazol-2-il]piridin-2-carboxamida (273 mg) como un sólido, pf 113-115 °C. La elución adicional proporcionó el compuesto del título deseado P2 (18 mg) como un sólido, pf 163-165 °C. LCMS (método 1): 448 (M+H)<sup>+</sup>, tiempo de retención 1.48 minutos.

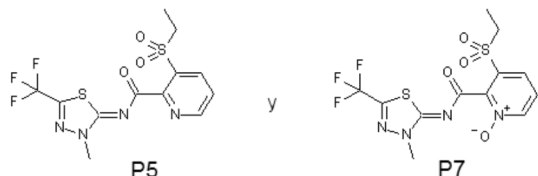
EJEMPLO P3: Preparación de (N)-3-etilsulfanil-N-[3-metil-5-(trifluorometil)-1,3,4-tiadiazol-2-iliden]piridin-2-carboxamida (compuesto P3):



A una solución de 3-metil-5-(trifluorometil)-1,3,4-tiadiazol-2-imina (US4264616A) (225 mg, 1.23 mmol) y trietilamina (186.5 mg, 0.257 ml, 1.84 mmol) en tetrahidrofurano (5 ml) a 0-5 °C, se añadió una solución de cloruro de 3-etilsulfanilpiridin-2-carbonilo (260 mg, 1.29 mmol) en tetrahidrofurano (2 ml) gota a gota. La mezcla de reacción se agitó a 0-10 °C durante una hora y a continuación se concentró a sequedad al vacío. El residuo se trató con acetato de etilo, se lavó dos veces con una solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y a continuación con agua y salmuera. Las fases acuosas básicas se volvieron a extraer una vez con acetato de etilo, las fases orgánicas

combinadas se secaron con sulfato de sodio y se evaporaron a sequedad. El residuo se purificó mediante cromatografía en gel de sílice (acetato de etilo/ciclohexano 1:2) para proporcionar el compuesto del título P3 (270 mg) como un sólido, pf 96-98 °C. LCMS (método 1): 349 (M+H)<sup>+</sup>, tiempo de retención 1.48 minutos.

- 5 **EJEMPLO P4:** Preparación de (N)-3-etilsulfonil-N-[3-metil-5-(trifluorometil)-1,3,4-tiadiazol-2-iliden]piridin-2-carboxamida (compuesto P5) y (N)-3-etilsulfonil-N-[3-metil-5-(trifluorometil)-1,3,4-tiadiazol-2-iliden]-1-oxidopiridin-1-io-2-carboxamida (compuesto P7)



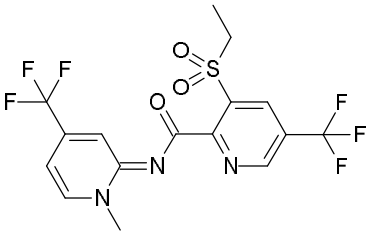
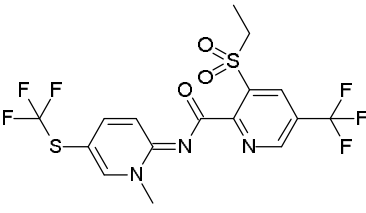
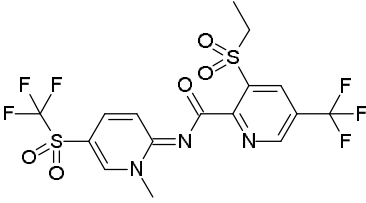
- 10 A una solución de (N)-3-etilsulfonil-N-[3-metil-5-(trifluorometil)-1,3,4-tiadiazol-2-iliden]piridin-2-carboxamida (190 mg, 0.55 mmol) en diclorometano (5 ml) a 10 °C, se añadió ácido *meta*-cloroperoxibenzoico (282 mg, mCPBA, ~70%, 1.15 mmol) y la mezcla de reacción se agitó a 10 °C durante 2 horas, a continuación a temperatura ambiente durante 60 horas. La mezcla se diluyó con éter *tert*-butil metílico, se lavó con una solución acuosa al 10% de NaHSO<sub>3</sub> (4x), a continuación con bicarbonato de sodio acuoso saturado (4x) y salmuera, se secó con sulfato de sodio y se evaporó a sequedad. El residuo se purificó mediante cromatografía en gel de sílice (acetato de etilo/ciclohexano 1:2) para proporcionar en primer lugar el compuesto del título P5 (111 mg) como un sólido, pf 157.5-159 °C. LCMS (método 1): 381 (M+H)<sup>+</sup>, tiempo de retención 1.23 minutos. <sup>1</sup>H-RMN (CDCl<sub>3</sub>, ppm) 1.37 (3H), 3.68 (2H), 4.12 (3H), 7.60 (1H), 8.39 (1H), 8.90 (1H).
- 15
- 20 La elución adicional proporcionó el compuesto del título P7 (25 mg) como un sólido, pf 181.5-182,5 °C. LCMS (método 1): 397 (M+H)<sup>+</sup>, tiempo de retención 0.97 minutos. <sup>1</sup>H-RMN (CDCl<sub>3</sub>, ppm) 1.34 (3H), 3.44 (2H), 4.08 (3H), 7.51 (1H), 7.85 (1H), 8.44 (1H).

Tabla P1: Ejemplos de compuestos de fórmula (I)

Compuesto N.º	Estructuras	Punto de fusión	MS/RMN
P1		194-195 °C	LC/MS (método 2): 448 (M+H) <sup>+</sup> t <sub>R</sub> = 0.97 minutos
P2		163-165 °C	LC/MS (método 1): 448 (M+H) <sup>+</sup> t <sub>R</sub> = 1.48 minutos
P3		96-98 °C	LC/MS (método 1): 349 (M+H) <sup>+</sup> t <sub>R</sub> = 1.48 minutos
P4		137-138 °C	<sup>1</sup> H-RMN (CDCl <sub>3</sub> , ppm) 1,41 (3H), 3,00 (2H), 4,22 (3H), 7,89 (1H), 8,74 (1H). LCMS (método 3): 417 (M+H) <sup>+</sup> , t <sub>R</sub> = 4.00 minutos.

ES 2 637 029 T3

Compuesto N.º	Estructuras	Punto de fusión	MS/RMN
P5		157,5-159 °C	LC/MS (método 1): 381 (M+H) <sup>+</sup> t <sub>R</sub> = 1.23 minutos
P6		169-170 °C	<sup>1</sup> H-RMN (CDCl <sub>3</sub> , ppm) 1,40 (3H), 3,71 (2H), 4,14 (3H), 8,63 (1H), 9,15 (1H). LC/MS (método 3): 449 (M+H) <sup>+</sup> , t <sub>R</sub> = 3.73 minutos.
P7		181,5-182,5 °C	LC/MS (método 1): 397 (M+H) <sup>+</sup> t <sub>R</sub> = 0.97 minutos
P8		87-88 °C	LC/MS (método 2): 411 (M+H) <sup>+</sup> t <sub>R</sub> = 1.04 minutos
P9		113-115 °C	LC/MS (método 2): 443 (M+H) <sup>+</sup> t <sub>R</sub> = 0.94 minutos
P10		195-197 °C	LC/MS (método 2): 448 (M+H) <sup>+</sup> t <sub>R</sub> = 1.14 minutos
P11		123-125 °C	LC/MS (método 2): 499 (M+H) <sup>+</sup> t <sub>R</sub> = 1.13 minutos

Compuesto N.º	Estructuras	Punto de fusión	MS/RMN
P12		153-155 °C	LC/MS (método 2): 442 (M+H) <sup>+</sup> t <sub>R</sub> = 0.93 minutos
P13		167-169 °C	LC/MS (método 2): 474 (M+H) <sup>+</sup> t <sub>R</sub> = 0.99 minutos
P14		Sólido	LC/MS (método 2): 506 (M+H) <sup>+</sup> t <sub>R</sub> = 1.02 minutos

Ejemplos de formulación ( % = porcentaje en peso):

Ejemplo F1: Concentrados de emulsión

	a)	b)	c)
Principio activo	25%	40%	50%
Dodecibencenosulfonato de calcio	5%	8%	6%
Éter polietilenglicólico de aceite de ricino (36 mol de OE)	5%	-	-
Éter tributilfenoxipolietilenglicólico (30 mol de OE)	-	12%	4%
Ciclohexanona	-	15%	20%
Mezcla de xilenos	65%	25%	20%

5 Se pueden preparar emulsiones de cualquier concentración deseada a partir de estos concentrados diluyendo con agua.

Ejemplo F2: Soluciones

	a)	b)	c)	d)
Principio activo	80 %	10 %	5 %	95 %
Éter monometílico del etilenglicol	20 %	-	-	-
Polietilenglicol PM 400	-	70 %	-	-
N-Metilpirrolid-2-ona	-	20 %	-	-
Aceite de coco epoxidado	-	-	1 %	5 %
Éter de petróleo (intervalo de ebullición: 160-190°)	-	-	94 %	-

10 Las soluciones son adecuadas para su uso en forma de microgotas.

Ejemplo F3: Gránulos

	a)	b)	c)	d)
Principio activo	5 %	10 %	8 %	21 %
Caolín	94 %	-	79 %	54 %
Sílice altamente dispersa	1 %	-	13 %	7 %
Atapulgita	-	90 %	-	18 %

15 Se disuelve el principio activo en diclorometano, se pulveriza la solución sobre el/los portador(es) y posteriormente se evapora el disolvente al vacío.

Ejemplo F4: Polvos finos

	a)	b)
Principio activo	2 %	5 %

Sílice altamente dispersa	1 %	5 %
Talco	97 %	-
Caolín	-	90 %

Se obtienen polvos finos listos para usar mezclando íntimamente los portadores y el principio activo.

Ejemplo F5: Polvos humectables

	a)	b)	c)
Principio activo	25 %	50 %	75 %
Lignosulfonato de sodio	5 %	5 %	-
Laurilsulfato de sodio	3 %	-	5 %
Diisobutilnaftalenosulfonato de sodio	-	6 %	10 %
Éter octilfenoxipolietilenglicólico (7-8 mol de OE)	-	2 %	-
Sílice altamente dispersa	5 %	10 %	10 %
Caolín	62 %	27 %	-

- 5 Se mezcla el principio activo con los aditivos y se muele meticulosamente la mezcla en un molino adecuado. Esto proporciona polvos humectables que pueden diluirse con agua para proporcionar suspensiones de cualquier concentración deseada.

Ejemplo F6: Gránulos extrusores

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

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

Ejemplo F7: Gránulos recubiertos

Principio activo	3 %
Poliethylenglicol (PM 200)	3 %
Caolín	94 %

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

Ejemplo F8: Concentrado en suspensión

Principio activo	40 %
Etilenglicol	10 %
Éter nonilfenoxipolietilenglicólico (15 mol de OE)	6 %
Lignosulfonato de sodio	10 %
Carboximetilcelulosa	1 %
Disolución acuosa de formaldehído al 37%	0,2 %
Aceite de silicona (emulsión acuosa al 75%)	0,8 %
Agua	32 %

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

Ejemplo F9: Polvos para el tratamiento de semillas en seco

	a)	b)	c)
Principio activo	25 %	50 %	75 %
Aceite mineral ligero	5 %	5 %	5 %
Ácido silícico muy dispersado	5 %	5 %	-
Caolín	65 %	40 %	-
Talco	-	-	20 %

Se mezcla la combinación exhaustivamente con los adyuvantes y se muele la mezcla exhaustivamente en un molino adecuado, lo que proporciona polvos que se pueden utilizar directamente para el tratamiento de las semillas.

Ejemplo F10: Concentrado emulsionable

Principio activo	10 %
Éter polietilenglicólico del octilfenol (4-5 mol de óxido de etileno)	3 %
Dodecibencenosulfonato de calcio	3 %
Éter poliglicólico de aceite de ricino (35 mol de óxido de etileno)	4 %
Ciclohexanona	30 %

Mezcla de xilenos

50 %

Se pueden obtener emulsiones con cualquier dilución requerida, que se pueden utilizar para proteger plantas, a partir de este concentrado diluyendo con agua.

Ejemplo F11: Concentrado fluido para el tratamiento de semillas

Principios activos	40 %
Propilenglicol	5 %
Copolímero de butanol OP/OE	2 %
Triestirefenol con 10-20 moles de OE	2 %
1,2-bencisotiazolin-3-ona (en forma de una disolución al 20% en agua)	0,5 %
Sal cálcica de pigmento monoazo	5 %
Aceite de silicona (en forma de una emulsión al 75% en agua)	0,2 %
Agua	45,3 %

5 Se mezcla íntimamente la combinación finamente molida con los adyuvantes, lo que genera un concentrado en suspensión a partir del cual se pueden obtener suspensiones con cualquier dilución deseada diluyendo con agua. Utilizando tales diluciones se pueden tratar y proteger tanto plantas vivas como el material de propagación vegetal contra la infestación por parte de microorganismos mediante pulverización, vertido o inmersión.

10 La actividad de las composiciones de acuerdo con la invención puede ampliarse considerablemente y adaptarse a las circunstancias predominantes mediante la adición de otros principios activos como insecticidas, acaricidas y/o fungicidas. Las mezclas de los compuestos de fórmula I con otros principios activos como insecticidas, acaricidas y/o fungicidas también pueden presentar otras ventajas sorprendentes, las cuales también pueden describirse, en un sentido más amplio, como actividad sinérgica. Por ejemplo, una mejor tolerancia por parte de las plantas, una menor fitotoxicidad, la posibilidad de controlar los insectos en las diferentes etapas de su desarrollo, o un mejor comportamiento durante su producción, por ejemplo, durante la molienda o la mezcla, durante su almacenamiento o durante su uso.

15 Las adiciones adecuadas a los principios activos de la presente son, por ejemplo, representantes de las siguientes clases de principios activos: compuestos orgánicos de fósforo, derivados de nitrofenol, tioureas, hormonas juveniles, formamidinas, derivados de benzofenona, ureas, derivados de pirrol, carbamatos, piretroides, hidrocarburos clorados, acilureas, derivados de piridilmetilenoamino, macrólidos, neonicotinoides y preparados de *Bacillus thuringiensis*.

20 Se prefieren las siguientes mezclas de los compuestos de fórmula I con principios activos (la abreviatura "TX" significa "un compuesto seleccionado a partir del grupo constituido por los compuestos descritos en las Tablas 1-12 y P1 de la presente invención"):

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

30 un acaricida seleccionado del grupo de sustancias constituido por 1,1-bis(4-clorofenil)-2-etoxietanol (nombre según la IUPAC) (910) + TX, benenosulfonato de 2,4-diclorofenilo (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1059) + TX, 2-fluoro-N-metil-N-1-naftilacetamida (nombre según la IUPAC) (1295) + TX, sulfona 4-clorofenil fenilica (nombre según la IUPAC) (981) + TX, abamectina (1) + TX, acequinocilo (3) + TX, acetoprol [CCN] + TX, acrinatrina (9) + TX, aldicarb (16) + TX, aldoxicarb (863) + TX, alfa-cipermetrina (202) + TX, amiditió (870) + TX, amidoflumet [CCN] + TX, amidotioato (872) + TX, amitón (875) + TX, hidrogenooxalato de amitón (875) + TX, amitraz (24) + TX, aramita (881) + TX, óxido arsenioso (882) + TX, AVI 382 (código de compuesto) + TX, AZ 60541 (código de compuesto) + TX, azinfós-etilo (44) + TX, azinfós-metilo (45) + TX, azobenceno (nombre según la IUPAC) (888) + TX, azoclotina (46) + TX, azotoato (889) + TX, benomilo (62) + TX, benoxafós (nombre alternativo) [CCN] + TX, benzoximato (71) + TX, benzoato de bencilo (nombre según la IUPAC) [CCN] + TX, bifentrina (74) + TX, bifentrina (76) + TX, binapacril (907) + TX, brofenvalerato (nombre alternativo) + TX, bromocicleno (918) + TX, bromofós (920) + TX, bromofós-etilo (921) + TX, bromopropilato (94) + TX, buprofezina (99) + TX, butocarboxim (103) + TX, butoxicarboxim (104) + TX, butilpiridabeno (nombre alternativo) + TX, polisulfuro de calcio (nombre según la IUPAC) (111) + TX, camfeclor (941) + TX, carbanolato (943) + TX, carbarilo (115) + TX, carbofurano (118) + TX, carbofenotión (947) + TX, CGA 50'439 (código de desarrollo) (125) + TX, quinometionato (126) + TX, clorbensida (959) + TX, clordimeform (964) + TX, clorhidrato de clordimeform (964) + TX, clorfenapir (130) + TX, clorfenetol (968) + TX, clorfensón (970) + TX, clorfensulfuro (971) + TX, clorfenvinfós (131) + TX, clorobencilato (975) + TX, cloromebuform (977) + TX, clorometiurón (978) + TX, cloropropilato (983) + TX, clorpirifós (145) + TX, clorpirifós-metilo (146) + TX, clortiofós (994) + TX, cinerina I (696) + TX, cinerina II (696) + TX, cinerinas (696) + TX, clofentezina (158) + TX, closantel (nombre alternativo) [CCN] + TX, coumafós (174) + TX, crotamitón (nombre alternativo) [CCN] + TX, crotoxfós (1010) + TX, cufraneb (1013) + TX, ciantoato (1020) + TX, ciflumetofeno (n.º de Reg. CAS: 400882-07-7) + TX, cihalotrina (196) + TX, cihexatina (199) + TX, cipermetrina (201) + TX, DCPM (1032) + TX, DDT (219) + TX, demefión (1037) + TX, demefión-O (1037) + TX, demefión-S (1037) + TX, demetón (1038) + TX, demetón-metilo (224) + TX, demetón-O (1038) + TX, demetón-O-metilo (224) + TX, demetón-S (1038) + TX, demetón-S-metilo (224) + TX, demetón-S-metilsulfón (1039) + TX, diafentiurón (226) + TX, dialifós (1042) + TX, diazinona (227) + TX, diclofluanida (230) + TX, diclorfós (236) + TX, diclifós (nombre alternativo) + TX, dicofol (242)

+ TX, dicotofós (243) + TX, dienoclor (1071) + TX, dimefox (1081) + TX, dimetoato (262) + TX, dinactina (nombre alternativo) (653) + TX, dinex (1089) + TX, dinex-diclexina (1089) + TX, dinobutón (269) + TX, dinocap (270) + TX, dinocap-4 [CCN] + TX, dinocap-6 [CCN] + TX, dinoción (1090) + TX, dinopentón (1092) + TX, dinosulfón (1097) + TX, dinoterbón (1098) + TX, dioxatión (1102) + TX, difenilsulfona (nombre según la IUPAC) (1103) + TX, disulfiram (nombre alternativo) [CCN] + TX, disulfotón (278) + TX, DNOC (282) + TX, dofenapina (1113) + TX, doramectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, endosulfano (294) + TX, endotión (1121) + TX, EPN (297) + TX, eprinomectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, etión (309) + TX, etoato-metilo (1134) + TX, etoxazol (320) + TX, etrimfós (1142) + TX, fenazaflor (1147) + TX, fenazaquina (328) + TX, óxido de fenbutatina (330) + TX, fenotiocarb (337) + TX, fenpropatrina (342) + TX, fenpirad (nombre alternativo) + TX, fenpiroximato (345) + TX, fensón (1157) + TX, fentrifanilo (1161) + TX, fenvalerato (349) + TX, fipronilo (354) + TX, fluacipirim (360) + TX, fluazurón (1166) + TX, flubencimina (1167) + TX, flucicloخور (366) + TX, flucitrinato (367) + TX, fluenitilo (1169) + TX, flufenoxurón (370) + TX, flumetrina (372) + TX, fluorbensida (1174) + TX, fluvalinato (1184) + TX, FMC 1137 (código de desarrollo) (1185) + TX, formetanato (405) + TX, clorhidrato de formetanato (405) + TX, formotión (1192) + TX, formparanato (1193) + TX, gamma-HCH (430) + TX, gliodina (1205) + TX, halfenprox (424) + TX, heptenofós (432) + TX, ciclopropanocarboxilato de hexadecilo (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1216) + TX, hexitiazox (441) + TX, yodometano (nombre según la IUPAC) (542) + TX, isocarbofós (nombre alternativo) (473) + TX, O-(metoxiaminotiofosforil)salicilato de isopropilo (nombre según la IUPAC) (473) + TX, ivermectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, jasmolina I (696) + TX, jasmolina II (696) + TX, jodfenfós (1248) + TX, lindano (430) + TX, lufenurón (490) + TX, malatión (492) + TX, malonobeno (1254) + TX, mecarbam (502) + TX, mefosfolano (1261) + TX, mesulfeno (nombre alternativo) [CCN] + TX, metacrifós (1266) + TX, metamidofós (527) + TX, metidatión (529) + TX, metiocarb (530) + TX, metomilo (531) + TX, bromuro de metilo (537) + TX, metolcarb (550) + TX, mevinfós (556) + TX, mexacarbato (1290) + TX, milbectina (557) + TX, oxima de milbemicina (nombre alternativo) [CCN] + TX, mipafox (1293) + TX, monocrotofós (561) + TX, morfotión (1300) + TX, moxidectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, naled (567) + TX, NC-184 (código de compuesto) + TX, NC-512 (código de compuesto) + TX, nifluridida (1309) + TX, nikkomicinas (nombre alternativo) [CCN] + TX, nitrilcarb (1313) + TX, complejo de nitrilcarb y cloruro de zinc 1:1 (1313) + TX, NNI-0101 (código de compuesto) + TX, NNI-0250 (código de compuesto) + TX, ometoato (594) + TX, oxamilo (602) + TX, oxideprofós (1324) + TX, oxidisulfotón (1325) + TX, pp'-DDT (219) + TX, paratión (615) + TX, permetrina (626) + TX, aceites del petróleo (nombre alternativo) (628) + TX, fenkaptón (1330) + TX, fentoato (631) + TX, forato (636) + TX, fosalona (637) + TX, fosfolán (1338) + TX, fosmet (638) + TX, fosfamidón (639) + TX, foxim (642) + TX, pirimifós-metilo (652) + TX, policloroterpenos (nombre tradicional) (1347) + TX, polinactinas (nombre alternativo) (653) + TX, proclonol (1350) + TX, profenofós (662) + TX, promacilo (1354) + TX, propargita (671) + TX, propetamfós (673) + TX, propoxur (678) + TX, protidatión (1360) + TX, protoato (1362) + TX, piretrina I (696) + TX, piretrina II (696) + TX, piretrinas (696) + TX, piridabeno (699) + TX, piridafentión (701) + TX, pirimidifeno (706) + TX, pirimitato (1370) + TX, quinalfós (711) + TX, quintiofós (1381) + TX, R-1492 (código de desarrollo) (1382) + TX, RA-17 (código de desarrollo) (1383) + TX, rotenona (722) + TX, escradán (1389) + TX, sebufós (nombre alternativo) + TX, selamectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, SI-0009 (código de compuesto) + TX, sofamida (1402) + TX, espiroclorfenol (738) + TX, espiromesifeno (739) + TX, SSI-121 (código de desarrollo) (1404) + TX, sulfiram (nombre alternativo) [CCN] + TX, sulfluramida (750) + TX, sulfotep (753) + TX, azufre (754) + TX, SZI-121 (código de desarrollo) (757) + TX, tau-fluvalinato (398) + TX, tebufenpirad (763) + TX, TEPP (1417) + TX, terbam (nombre alternativo) + TX, tetraclorvinfós (777) + TX, tetradifón (786) + TX, tetranactina (nombre alternativo) (653) + TX, tetrasul (1425) + TX, tiafenox (nombre alternativo) + TX, tiocarboxima (1431) + TX, tiofanox (800) + TX, tiometón (801) + TX, tioquinox (1436) + TX, turingiensina (nombre alternativo) [CCN] + TX, triamifós (1441) + TX, triaratenol (1443) + TX, triazofós (820) + TX, triazurón (nombre alternativo) + TX, triclorfón (824) + TX, trifenofós (1455) + TX, trinactina (nombre alternativo) (653) + TX, vamidotión (847) + TX, vaniliprol [CCN] e YI-5302 (código de compuesto) + TX,

un algicida seleccionado del grupo de sustancias constituido por betoxazina [CCN] + TX, dioctanoato de cobre (nombre según la IUPAC) (170) + TX, sulfato de cobre (172) + TX, cibutrina [CCN] + TX, diclona (1052) + TX, diclorofeno (232) + TX, endotal (295) + TX, fentina (347) + TX, cal hidratada [CCN] + TX, nabam (566) + TX, quinoclamina (714) + TX, quinonamida (1379) + TX, simazina (730) + TX, acetato de trifenilestaño (nombre según la IUPAC) (347) e hidróxido de trifenilestaño (nombre según la IUPAC) (347) + TX,

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

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

un bactericida seleccionado del grupo de sustancias constituido por en 1-hidroxi-1*H*-piridin-2-tiona (nombre según la IUPAC) (1222) + TX, 4-(quinoxalin-2-ilamino)benzenosulfonamida (nombre según la IUPAC) (748) + TX, sulfato de 8-hidroxiquinolina (446) + TX, bronopol (97) + TX, dioctanoato de cobre (nombre según la IUPAC) (170) + TX, hidróxido de cobre (nombre según la IUPAC) (169) + TX, cresol [CCN] + TX, diclorofeno (232) + TX, dipiritiona (1105) + TX, dodicina (1112) + TX, fenaminosulf (1144) + TX, formaldehído (404) + TX, hidrargafeno (nombre



alternativo) [CCN] + TX, kasugamicina (483) + TX, clorhidrato de kasugamicina hidratado (483) + TX, bis(dimetilditiocarbamato) de níquel (nombre según la IUPAC) (1308) + TX, nitrapirina (580) + TX, octilina (590) + TX, ácido oxolínico (606) + TX, oxitetraciclina (611) + TX, hidroxiquinolinsulfato de potasio (446) + TX, probenazol (658) + TX, estreptomina (744) + TX, sesquisulfato de estreptomina (744) + TX, tecloftalam (766) + TX y tiomersal (nombre alternativo) [CCN] + TX,

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

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

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

una feromona de insecto seleccionada del grupo de sustancias constituido por acetato de (*E*)-dec-5-en-1-ilo con (*E*)-dec-5-en-1-ol (nombre según la IUPAC) (222) + TX, acetato de (*E*)-tridec-4-en-1-ilo (nombre según la IUPAC) (829) + TX, (*E*)-6-metilhept-2-en-4-ol (nombre según la IUPAC) (541) + TX, acetato de (*E,Z*)-tetradeca-4,10-dien-1-ilo (nombre según la IUPAC) (779) + TX, acetato de (*Z*)-dodec-7-en-1-ilo (nombre según la IUPAC) (285) + TX, (*Z*)-hexadec-11-enal (nombre según la IUPAC) (436) + TX, acetato de (*Z*)-hexadec-11-en-1-ilo (nombre según la IUPAC) (437) + TX, acetato de (*Z*)-hexadec-13-en-11-en-1-ilo (nombre según la IUPAC) (438) + TX, (*Z*)-icos-13-en-10-ona (nombre según la IUPAC) (448) + TX, (*Z*)-tetradec-7-en-1-ol (nombre según la IUPAC) (782) + TX, (*Z*)-tetradec-9-en-1-ol (nombre según la IUPAC) (783) + TX, acetato de (*Z*)-tetradec-9-en-1-ilo (nombre según la IUPAC) (784) + TX, acetato de (*7E,9Z*)-dodeca-7,9-dien-1-ilo (nombre según la IUPAC) (283) + TX, acetato de (*9Z,11E*)-tetradeca-9,11-dien-1-ilo (nombre según la IUPAC) (780) + TX, acetato de (*9Z,12E*)-tetradeca-9,12-dien-1-ilo (nombre según la IUPAC) (781) + TX, 14-metiloctadec-1-eno (nombre según la IUPAC) (545) + TX, 4-metilnonan-5-ol con 4-metilnonan-5-ona (nombre según la IUPAC) (544) + TX, alfa-multistriatina (nombre alternativo) [CCN] + TX, brevicomina (nombre alternativo) [CCN] + TX, codlure (nombre alternativo) [CCN] + TX, codlemona (nombre alternativo) (167) + TX, cuelure (nombre alternativo) (179) + TX, disparlure (277) + TX, acetato de dodec-8-en-1-ilo (nombre según la IUPAC) (286) + TX, acetato de dodec-9-en-1-ilo (nombre según la IUPAC) (287) + TX, dodeca-8 + TX, acetato de 10-dien-1-ilo (nombre según la IUPAC) (284) + TX, dominicalure (nombre alternativo) [CCN] + TX, 4-metiloctanoato de etilo (nombre según la IUPAC) (317) + TX, eugenol (nombre alternativo) [CCN] + TX, frontalina (nombre alternativo) [CCN] + TX, gosiplure (nombre alternativo) (420) + TX, grandlure (421) + TX, grandlure I (nombre alternativo) (421) + TX, grandlure II (nombre alternativo) (421) + TX, grandlure III (nombre alternativo) (421) + TX, grandlure IV (nombre alternativo) (421) + TX, hexalure [CCN] + TX, ipsdienol (nombre alternativo) [CCN] + TX, ipsenol (nombre alternativo) [CCN] + TX, japonilure (nombre alternativo) (481) + TX, lineatina (nombre alternativo)

[CCN] + TX, litlure (nombre alternativo) [CCN] + TX, looplure (nombre alternativo) [CCN] + TX, medlure [CCN] + TX, ácido megatomoico (nombre alternativo) [CCN] + TX, eugenol metílico (nombre alternativo) (540) + TX, muscalure (563) + TX, acetato de octadeca-2,13-dien-1-ilo (nombre según la IUPAC) (588) + TX, acetato de octadeca-3,13-dien-1-ilo (nombre según la IUPAC) (589) + TX, orfralure (nombre alternativo) [CCN] + TX, orictalure (nombre alternativo) (317) + TX, ostramona (nombre alternativo) [CCN] + TX, siglure [CCN] + TX, sordidina (nombre alternativo) (736) + TX, sulcatol (nombre alternativo) [CCN] + TX, acetato de tetradec-11-en-1-ilo (nombre según la IUPAC) (785) + TX, trimedlure (839) + TX, trimedlure A (nombre alternativo) (839) + TX, trimedlure B<sub>1</sub> (nombre alternativo) (839) + TX, trimedlure B<sub>2</sub> (nombre alternativo) (839) + TX, trimedlure C (nombre alternativo) (839) y trunc-call (nombre alternativo) [CCN] + TX,

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

un insecticida seleccionado del grupo de sustancias constituido por 1-dicloro-1-nitroetano (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1058) + TX, 1,1-dicloro-2,2-bis(4-etilfenil)etano (nombre según la IUPAC) (1056), + TX, 1,2-dicloropropano (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1062) + TX, 1,2-dicloropropano con 1,3-dicloropropeno (nombre según la IUPAC) (1063) + TX, 1-bromo-2-cloroetano (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (916) + TX, acetato de 2,2,2-tricloro-1-(3,4-diclorofenil)etilo (nombre según la IUPAC) (1451) + TX, metilfosfato de 2,2-diclorovinilo y 2-etilsulfinito (nombre según la IUPAC) (1066) + TX, dimetilcarbamato de 2-(1,3-ditiolan-2-il)fenilo (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1109) + TX, tiocianato de 2-(2-butoxi)etilo (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (935) + TX, metilcarbamato de 2-(4,5-dimetil-1,3-dioxolan-2-il)fenilo (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1084) + TX, 2-(4-cloro-3,5-xililoxi)etanol (nombre según la IUPAC) (986) + TX, fosfato dietílico de 2-clorovinilo (nombre según la IUPAC) (984) + TX, 2-imidazolidona (nombre según la IUPAC) (1225) + TX, 2-isovalerilindan-1,3-diona (nombre según la IUPAC) (1246) + TX, metilcarbamato de 2-metil(prop-2-inil)aminofenilo (nombre según la IUPAC) (1284) + TX, laurato de 2-tiocianatoetilo (nombre según la IUPAC) (1433) + TX, 3-bromo-1-cloroprop-1-eno (nombre según la IUPAC) (917) + TX, dimetilcarbamato de 3-metil-1-fenilpirazol-5-ilo (nombre según la IUPAC) (1283) + TX, metilcarbamato de 4-metil(prop-2-inil)amino-3,5-xililo (nombre según la IUPAC) (1285) + TX, dimetilcarbamato de 5,5-dimetil-3-oxociclohex-1-enilo (nombre según la IUPAC) (1085) + TX, abamectina (1) + TX, acefato (2) + TX, acetamiprid (4) + TX, acetión (nombre alternativo) [CCN] + TX, acetoprol [CCN] + TX, acrinatrina (9) + TX, acrilonitrilo (nombre según la IUPAC) (861) + TX, alanicarb (15) + TX, aldicarb (16) + TX, aldoxicarb (863) + TX, aldrina (864) + TX, aletrina (17) + TX, alosamidina (nombre alternativo) [CCN] + TX, alixicarb (866) + TX, alfa-cipermetrina (202) + TX, alfa-ecdisona (nombre alternativo) [CCN] + TX, fosfuro de aluminio (640) + TX, amiditió (870) + TX, amidotiato (872) + TX, aminocarb (873) + TX, amitón (875) + TX, hidrogenooxalato de amitón (875) + TX, amitraz (24) + TX, anabasina (877) + TX, atidatió (883) + TX, AVI 382 (código de compuesto) + TX, AZ 60541 (código de compuesto) + TX, azadiractina (nombre alternativo) (41) + TX, azametifós (42) + TX, azinfós-etilo (44) + TX, azinfós-metilo (45) + TX, azotoato (889) + TX, endotoxinas delta de *Bacillus thuringiensis* (nombre alternativo) (52) + TX, hexafluorosilicato de bario (nombre alternativo) [CCN] + TX, polisulfuro de bario (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (892) + TX, bartrina [CCN] + TX, Bayer 22/190 (código de desarrollo) (893) + TX, Bayer 22408 (código de desarrollo) (894) + TX, bendiocarb (58) + TX, benfuracarb (60) + TX, bensultap (66) + TX, beta-cliflutrina (194) + TX, beta-cipermetrina (203) + TX, bifentrina (76) + TX, bioaletrina (78) + TX, isómero S-ciclopentenílico de la bioaletrina (nombre alternativo) (79) + TX, bioetanometrina [CCN] + TX, biopermetrina (908) + TX, biorresmetrina (80) + TX, éter bis(2-cloroetilico) (nombre según la IUPAC) (909) + TX, bistriflurón (83) + TX, bórax (86) + TX, brofenvalerato (nombre alternativo) + TX, bromfenvinfós (914) + TX, bromociclono (918) + TX, bromo-DDT (nombre alternativo) [CCN] + TX, bromofós (920) + TX, bromofós-etilo (921) + TX, bufencarb (924) + TX, buprofezina (99) + TX, butacarb (926) + TX, butatiófós (927) + TX, butocarboxim (103) + TX, butonato (932) + TX, butoxicarboxim (104) + TX, butilpiridabeno (nombre alternativo) + TX, cadusafós (109) + TX, arseniato de calcio [CCN] + TX, cianuro de calcio (444) + TX, polisulfuro de calcio (nombre según la IUPAC) (111) + TX, camfeclor (941) + TX, carbanolato (943) + TX, carbarilo (115) + TX, carbofurano (118) + TX, disulfuro de carbono (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (945) + TX, tetracloruro de carbono (nombre según la IUPAC) (946) + TX, carbofenotió (947) + TX, carbosulfán (119) + TX, cartap (123) + TX, clorhidrato de cartap (123) + TX, cevadina (nombre alternativo) (725) + TX, clorbiciclono (960) + TX, clordano (128) + TX, clordecona (963) + TX, clordimeform (964) + TX, clorhidrato de clordimeform (964) + TX, cloretoxifós (129) + TX, clorfenapir (130) + TX, clorfenvinfós (131) + TX, clorfluazurón (132) + TX, clormefós (136) + TX, cloroforno [CCN] + TX, cloropicrina (141) + TX, clorfoxim (989) + TX, clorprazofós (990) + TX, clorpirifós (145) + TX, clorpirifós-metilo (146) + TX, clortiofós (994) + TX, cromafenoza (150) + TX, cinerina I (696) + TX, cinerina II (696) + TX, cinerinas (696) + TX, *cis*-resmetrina (nombre alternativo) + TX, cismetrina (80) + TX, clocitrina (nombre alternativo) + TX, cloetocarb (999) + TX, closantel (nombre alternativo) [CCN] + TX, clotianidina (165) + TX, acetoarsenito de cobre [CCN] + TX, arseniato de cobre [CCN] + TX, oleato de cobre [CCN] + TX, coumafós (174) + TX, coumitoato (1006) + TX, crotamitón (nombre alternativo) [CCN] + TX, crotoxiófós (1010) + TX, crufomato (1011) + TX, criolito (nombre alternativo) (177) + TX, CS 708 (código de desarrollo) (1012) + TX, cianofenós (1019) + TX, cianofós (184) + TX, ciantoato (1020) + TX, cicletrina [CCN] + TX, cicloprotrina (188) + TX, ciflutrina (193) + TX, cihalotrina (196) + TX, cipermetrina (201) + TX, cifenotrina (206) + TX, ciromazina (209) + TX, citioato (nombre alternativo) [CCN] + TX, *d*-

limoneno (nombre alternativo) [CCN] + TX, *d*-tetrametrina (nombre alternativo) (788) + TX, DAEP (1031) + TX, dazomet (216) + TX, DDT (219) + TX, decarbofurano (1034) + TX, deltametrina (223) + TX, demefión (1037) + TX, demefión-O (1037) + TX, demefión-S (1037) + TX, demetón (1038) + TX, demetón-metilo (224) + TX, demetón-O (1038) + TX, demetón-O-metilo (224) + TX, demetón-S (1038) + TX, demetón-S-metilo (224) + TX, demetón-S-metilsulfona (1039) + TX, diafentiurón (226) + TX, dialifós (1042) + TX, diamidafós (1044) + TX, diazinona (227) + TX, dicaptón (1050) + TX, diclofentión (1051) + TX, diclorvós (236) + TX, diclifós (nombre alternativo) + TX, dicresilo (nombre alternativo) [CCN] + TX, dicrotofós (243) + TX, diciclanilo (244) + TX, dieldrina (1070) + TX, fosfato dietílico de 5-metilpirazol-3-ilo (nombre según la IUPAC) (1076) + TX, diflubenzurón (250) + TX, dilor (nombre alternativo) [CCN] + TX, dimeflutrina [CCN] + TX, dimefox (1081) + TX, dimetán (1085) + TX, dimetoato (262) + TX, dimetrina (1083) + TX, dimetilvinfós (265) + TX, dimetilán (1086) + TX, dinex (1089) + TX, dinex-diclexina (1089) + TX, dinoprop (1093) + TX, dinosam (1094) + TX, dinoseb (1095) + TX, dinotefurano (271) + TX, diofenolán (1099) + TX, dioxabenzofós (1100) + TX, dioxacarb (1101) + TX, dioxatión (1102) + TX, disulfotón (278) + TX, diticrofós (1108) + TX, DNOC (282) + TX, doramectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, DSP (1115) + TX, ecdisterona (nombre alternativo) [CCN] + TX, El 1642 (código de desarrollo) (1118) + TX, emamectina (291) + TX, benzoato de emamectina (291) + TX, EMPC (1120) + TX, empenrina (292) + TX, endosulfano (294) + TX, endotión (1121) + TX, endrina (1122) + TX, EPBP (1123) + TX, EPN (297) + TX, epofenonano (1124) + TX, eprinomectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, esfenvalerato (302) + TX, etafós (nombre alternativo) [CCN] + TX, etiofencarb (308) + TX, etiól (309) + TX, etiprol (310) + TX, etoato-metilo (1134) + TX, etoprofós (312) + TX, formiato de etilo (nombre según la IUPAC) [CCN] + TX, etil-DDD (nombre alternativo) (1056) + TX, dibromuro de etileno (316) + TX, dicloruro de etileno (nombre químico) (1136) + TX, óxido de etileno [CCN] + TX, etofenprox (319) + TX, etrimfós (1142) + TX, EXD (1143) + TX, famfur (323) + TX, fenamifós (326) + TX, fenazaflor (1147) + TX, fenclorfós (1148) + TX, fenetacarb (1149) + TX, fenflutrina (1150) + TX, fenitrotión (335) + TX, fenobucarb (336) + TX, fenoxacrim (1153) + TX, fenoxicarb (340) + TX, fenpiritrina (1155) + TX, fenpropatrina (342) + TX, fenpirad (nombre alternativo) + TX, fensulfotión (1158) + TX, fentiól (346) + TX, fentiól-etilo [CCN] + TX, fenvalerato (349) + TX, fipronilo (354) + TX, flonicamida (358) + TX, flubendiamida (N.º de Reg. CAS.: 272451-65-7) + TX, flucufurón (1168) + TX, flucicloxurón (366) + TX, flucitrinato (367) + TX, fluenetilo (1169) + TX, flufenerim [CCN] + TX, flufenoxurón (370) + TX, flufenprox (1171) + TX, flumetrina (372) + TX, fluvalinato (1184) + TX, FMC 1137 (código de desarrollo) (1185) + TX, fonofós (1191) + TX, formatanato (405) + TX, clorhidrato de formatanato (405) + TX, formotión (1192) + TX, formparanato (1193) + TX, fosmetilán (1194) + TX, fospirato (1195) + TX, fostiazato (408) + TX, fostietán (1196) + TX, furatiocarb (412) + TX, furetrina (1200) + TX, gamma-cihalotrina (197) + TX, gamma-HCH (430) + TX, guazatina (422) + TX, acetatos de guazatina (422) + TX, GY-81 (código de desarrollo) (423) + TX, halfenprox (424) + TX, halofenozida (425) + TX, HCH (430) + TX, HEOD (1070) + TX, heptaclor (1211) + TX, heptenofós (432) + TX, heterofós [CCN] + TX, hexaflumurón (439) + TX, HHDN (864) + TX, hidrametilnona (443) + TX, cianuro de hidrógeno (444) + TX, hidropreno (445) + TX, hiquincarb (1223) + TX, imidacloprid (458) + TX, imiprotrina (460) + TX, indoxacarb (465) + TX, yodometano (nombre según la IUPAC) (542) + TX, IPSP (1229) + TX, isazofós (1231) + TX, isobenzán (1232) + TX, isocarbofós (nombre alternativo) (473) + TX, isodrina (1235) + TX, isofenfós (1236) + TX, isolano (1237) + TX, isoprocab (472) + TX, *O*-(metoxiaminotiofosforil)salicilato de isopropilo (nombre según la IUPAC) (473) + TX, isoprotiolano (474) + TX, isotioato (1244) + TX, isoxatión (480) + TX, ivermectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, jasmolina I (696) + TX, jasmolina II (696) + TX, jodfenfós (1248) + TX, hormona juvenil I (nombre alternativo) [CCN] + TX, hormona juvenil II (nombre alternativo) [CCN] + TX, hormona juvenil III (nombre alternativo) [CCN] + TX, keleván (1249) + TX, kinopreno (484) + TX, lambda-cihalotrina (198) + TX, arseniato de plomo [CCN] + TX, lepimectina (CCN) + TX, leptofós (1250) + TX, lindano (430) + TX, lirimfós (1251) + TX, lufenurón (490) + TX, litidatión (1253) + TX, metilcarbamato de *m*-cumenilo (nombre según la IUPAC) (1014) + TX, fosfuro de magnesio (nombre según la IUPAC) (640) + TX, malatión (492) + TX, malonobeno (1254) + TX, mazidox (1255) + TX, mecarbam (502) + TX, mecarfón (1258) + TX, menazón (1260) + TX, mefosfolano (1261) + TX, cloruro mercurioso (513) + TX, mesulfenfós (1263) + TX, metaflumizona (CCN) + TX, metam (519) + TX, metam-potasio (nombre alternativo) (519) + TX, metam-sodio (519) + TX, metacrifós (1266) + TX, metamidofós (527) + TX, fluoruro de metanosulfonilo (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1268) + TX, metidatión (529) + TX, metiocarb (530) + TX, metocrotofós (1273) + TX, metomiil (531) + TX, metopreno (532) + TX, metoquina-butilo (1276) + TX, metotrina (nombre alternativo) (533) + TX, metoxiclor (534) + TX, metoxifenozida (535) + TX, bromuro de metilo (537) + TX, isotiocianato de metilo (543) + TX, metilcloroformo (nombre alternativo) [CCN] + TX, cloruro de metileno [CCN] + TX, metoflutrina [CCN] + TX, metolcarb (550) + TX, metoxadiazona (1288) + TX, mevinfós (556) + TX, mexacarbato (1290) + TX, milbemectina (557) + TX, oxima de milbemicina (nombre alternativo) [CCN] + TX, mipafox (1293) + TX, mirex (1294) + TX, monocrotofós (561) + TX, morfotión (1300) + TX, moxidectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, naftalofós (nombre alternativo) [CCN] + TX, naled (567) + TX, naftaleno (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1303) + TX, NC-170 (código de desarrollo) (1306) + TX, NC-184 (código de compuesto) + TX, nicotina (578) + TX, sulfato de nicotina (578) + TX, nifluridida (1309) + TX, nitenpiram (579) + TX, nitiazina (1311) + TX, nitrilacarb (1313) + TX, complejo de nitrilacarb y cloruro de zinc 1:1 (1313) + TX, NNI-0101 (código de compuesto) + TX, NNI-0250 (código de compuesto) + TX, nornicotina (nombre tradicional) (1319) + TX, novalurón (585) + TX, noviflumurón (586) + TX, etilfosfonotioato de *O*-5-dicloro-4-yodofenilo y *O*-etilo (nombre según la IUPAC) (1057) + TX, fosforotioato de *O*,*O*-dietilo y *O*-4-metil-2-oxo-2*H*-cromen-7-ilo (nombre según la IUPAC) (1074) + TX, fosforotioato de *O*,*O*-dietilo y *O*-6-metil-2-propilpirimidin-4-ilo (nombre según la IUPAC) (1075) + TX, ditiopirofosfato de *O*,*O*,*O*',*O*'-tetrapropilo (nombre según la IUPAC) (1424) + TX, ácido oleico (nombre según la IUPAC) (593) + TX, ometoato (594) + TX, oxamilo (602) + TX, oxidemetón-metilo (609) + TX, oxideprofós (1324) + TX, oxidisulfotón (1325) + TX, pp'-DDT (219) + TX, para-diclorobenceno [CCN] + TX, paratión (615) + TX, paratión-metilo (616) + TX, penflurón (nombre alternativo) [CCN] + TX, pentaclorofenol (623) + TX, laurato de pentaclorofenilo (nombre según la IUPAC) (623) + TX,

- 5 permetrina (626) + TX, aceites del petróleo (nombre alternativo) (628) + TX, PH 60-38 (código de desarrollo) (1328) + TX, fenkaptón (1330) + TX, fenotrina (630) + TX, fentoato (631) + TX, forato (636) + TX, fosalona (637) + TX, fosfolán (1338) + TX, fosmet (638) + TX, fosniclor (1339) + TX, fosfamidón (639) + TX, fosfina (nombre según la IUPAC) (640) + TX, foxim (642) + TX, foxim-metilo (1340) + TX, pirimetafós (1344) + TX, pirimicarb (651) + TX,
- 10 pirimifós-etilo (1345) + TX, pirimifós-metilo (652) + TX, isómeros de policlorodidiclopentadieno (nombre según la IUPAC) (1346) + TX, policloroterpenos (nombre tradicional) (1347) + TX, arsenito de potasio [CCN] + TX, tiocianato de potasio [CCN] + TX, praletrina (655) + TX, precoceno I (nombre alternativo) [CCN] + TX, precoceno II (nombre alternativo) [CCN] + TX, precoceno III (nombre alternativo) [CCN] + TX, primidofós (1349) + TX, profenofós (662) + TX,
- 15 proflutrina [CCN] + TX, promacilo (1354) + TX, promecarb (1355) + TX, propafós (1356) + TX, propetamfós (673) + TX, propoxur (678) + TX, protidación (1360) + TX, protiofós (686) + TX, protoato (1362) + TX, protrifenbuto [CCN] + TX, pimetrozina (688) + TX, piraclorofós (689) + TX, pirazofós (693) + TX, piresmetrina (1367) + TX, piretrina I (696) + TX,
- 20 piretrina II (696) + TX, piretrinas (696) + TX, piridabeno (699) + TX, piridalilo (700) + TX, piridafentión (701) + TX, pirimidifeno (706) + TX, pirimitato (1370) + TX, piriproxifeno (708) + TX, cuasia (nombre alternativo) [CCN] + TX, quinalfós (711) + TX, quinalfós-metilo (1376) + TX, quinotión (1380) + TX, quintiofós (1381) + TX, R-1492 (código de desarrollo) (1382) + TX, rafoxanida (nombre alternativo) [CCN] + TX, resmetrina (719) + TX, rotenona (722) + TX,
- 25 RU 15525 (código de desarrollo) (723) + TX, RU 25475 (código de desarrollo) (1386) + TX, riania (nombre alternativo) (1387) + TX, rianodina (nombre tradicional) (1387) + TX, sabadilla (nombre alternativo) (725) + TX, escradán (1389) + TX, sebufós (nombre alternativo) + TX, selamectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, SI-0009 (código de compuesto) + TX, SI-0205 (código de compuesto) + TX, SI-0404 (código de compuesto) + TX, SI-0405 (código de compuesto) + TX,
- 30 silafluofeno (728) + TX, SN 72129 (código de desarrollo) (1397) + TX, arsenito de sodio [CCN] + TX, cianuro de sodio (444) + TX, fluoruro de sodio (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1399) + TX, hexafluorosilicato de sodio (1400) + TX, pentaclorofenóxido de sodio (623) + TX, seleniato de sodio (nombre según la IUPAC) (1401) + TX, tiocianato de sodio [CCN] + TX, sofamida (1402) + TX, espinosad (737) + TX,
- 35 espiromesifeno (739) + TX, espirotetramat (CCN) + TX, sulcofurón (746) + TX, sulcofurón-sodio (746) + TX, sulfuramida (750) + TX, sulfotep (753) + TX, fluoruro de sulfurilo (756) + TX, sulprofós (1408) + TX, aceites de alquitrán (nombre alternativo) (758) + TX, tau-fluvalinato (398) + TX, tazimcarb (1412) + TX, TDE (1414) + TX,
- 40 tebufenozida (762) + TX, tebufenpirad (763) + TX, tebupirimfós (764) + TX, teflubenzurón (768) + TX, teflutrina (769) + TX, temefós (770) + TX, TEPP (1417) + TX, teraletrina (1418) + TX, terbam (nombre alternativo) + TX, terbufós (773) + TX, tetracloroetano [CCN] + TX, tetraclorvinfós (777) + TX, tetrametrina (787) + TX, theta-cipermetrina (204) + TX,
- 45 tiacloprid (791) + TX, tiafenox (nombre alternativo) + TX, tiametoxam (792) + TX, ticofós (1428) + TX, tiocarboxima (1431) + TX, tiociclam (798) + TX, hidrogenooxalato de tiociclam (798) + TX, tiodicarb (799) + TX, tiofanox (800) + TX, tiometón (801) + TX, tionazina (1434) + TX, tiosultap (803) + TX, tiosultap-sodio (803) + TX, turingiensina (nombre alternativo) [CCN] + TX, tolfenpirad (809) + TX, tralometrina (812) + TX, transflutrina (813) + TX,
- 50 transpermetrina (1440) + TX, triamifós (1441) + TX, triazamato (818) + TX, triazofós (820) + TX, triazurón (nombre alternativo) + TX, triclorfón (824) + TX, triclorometafós-3 (nombre alternativo) [CCN] + TX, tricloronat (1452) + TX, trifenofós (1455) + TX, triflumurón (835) + TX, trimetacarb (840) + TX, tripreno (1459) + TX, vamidotión (847) + TX,
- 55 vaniliprol [CCN] + TX, veratridina (nombre alternativo) (725) + TX, veratrina (nombre alternativo) (725) + TX, XMC (853) + TX, xililcarb (854) + TX, YI-5302 (código de compuesto) + TX, zeta-cipermetrina (205) + TX, zetametrina (nombre alternativo) + TX, fosfuro de zinc (640) + TX, zolaprofós (1469) y ZXI 8901 (código de desarrollo) (858) + TX,
- 60 ciantraniliprol [736994-63-19] + TX, clorantraniliprol [500008-45-7] + TX, cienopirafeno [560121-52-0] + TX, ciflumetofeno [400882-07-7] + TX, pirifluquinazón [337458-27-2] + TX, espinetoram [187166-40-1 + 187166-15-0] + TX, espirotetramat [203313-25-1] + TX, sulfoxaflor [946578-00-3] + TX, flupirrol [704886-18-0] + TX, meperflutrina [915288-13-0] + TX, tetrametilflutrina [84937-88-2] + TX, triflumezopirim (dado a conocer en el documento WO 2012/092115) + TX, fluxametamida (WO 2007/026965) + TX,
- un moluscicida seleccionado del grupo de sustancias constituido por óxido de bis(tributilestaño) (nombre según la IUPAC) (913) + TX, bromoacetamida [CCN] + TX, arseniato de calcio [CCN] + TX, cloetocarb (999) + TX,
- 50 acetoarsenito de cobre [CCN] + TX, sulfato de cobre (172) + TX, fentina (347) + TX, fosfato férrico (nombre según la IUPAC) (352) + TX, metaldehído (518) + TX, metiocarb (530) + TX, niclosamida (576) + TX, niclosamida-olamina (576) + TX, pentaclorofenol (623) + TX, pentaclorofenóxido de sodio (623) + TX, tazimcarb (1412) + TX, tiodicarb (799) + TX, óxido de tributilestaño (913) + TX, trifenmorf (1454) + TX, trimetacarb (840) + TX, acetato de trifenilestaño (nombre según la IUPAC) (347) e hidróxido de trifenilestaño (nombre según la IUPAC) (347) + TX,
- 55 piriprol [394730-71-3] + TX,
- un nematocida seleccionado del grupo de sustancias constituido por AKD-3088 (código de compuesto) + TX, 1,2-dibromo-3-cloropropano (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1062) + TX, 1,2-dicloropropano (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1063) + TX, 1,3-dicloropropano (nombre según la IUPAC) (1063) + TX, 1,3-dicloropropeno (233) + TX, 1,1-dióxido de 3,4-diclorotetrahidrotiofeno (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1065) + TX,
- 60 3-(4-clorofenil)-5-metilrodanina (nombre según la IUPAC) (980) + TX, ácido 5-metil-6-tioxo-1,3,5-tiadiazinan-3-ilacético (nombre según la IUPAC) (1286) + TX, 6-isopentenilaminopurina (nombre alternativo) (210) + TX, abamectina (1) + TX, acetoprol [CCN] + TX, alanicarb (15) + TX, aldicarb (16) + TX, aldoxicarb (863) + TX, AZ 60541 (código de compuesto) + TX, benclotiaz [CCN] + TX, benomilo (62) + TX,
- 65 butilpiridabeno (nombre alternativo) + TX, cadusafós (109) + TX, carbofurano (118) + TX, disulfuro de carbono (945) + TX, carbosulfán (119) + TX, cloropicrina (141) + TX, clorpirifós (145) + TX, cloetocarb (999) + TX, citocininas (nombre alternativo) (210) + TX, dazomet (216) + TX, DBCP (1045) + TX, DCIP (218) + TX, diamidafós (1044) + TX, diclofentión (1051) + TX, diclifós (nombre alternativo) + TX, dimetoato (262) + TX, doramectina (nombre alternativo)

- [CCN] + TX, emamectina (291) + TX, benzoato de emamectina (291) + TX, eprinomectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, etoprofós (312) + TX, dibromuro de etileno (316) + TX, fenamifós (326) + TX, fempirad (nombre alternativo) + TX, fensulfotión (1158) + TX, fostiazato (408) + TX, fostietán (1196) + TX, furfural (nombre alternativo) [CCN] + TX, GY-81 (código de desarrollo) (423) + TX, heterofós [CCN] + TX, yodometano (nombre según la IUPAC) (542) + TX, isamidofós (1230) + TX, isazofós (1231) + TX, ivermectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, kinetina (nombre alternativo) (210) + TX, mecarfón (1258) + TX, metam (519) + TX, metam-potasio (nombre alternativo) (519) + TX, metam-sodio (519) + TX, bromuro de metilo (537) + TX, isotiocianato de metilo (543) + TX, oxima de milbemicina (nombre alternativo) [CCN] + TX, moxidectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, composición de *Myrothecium verrucaria* (nombre alternativo) (565) + TX, NC-184 (código de compuesto) + TX, oxamilo (602) + TX, forato (636) + TX, fosfamidón (639) + TX, fosfocarb [CCN] + TX, sebufós (nombre alternativo) + TX, selamectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, espinosad (737) + TX, terbam (nombre alternativo) + TX, terbufós (773) + TX, tetraclorotiofeno (nombre según la IUPAC/ Chemical Abstracts) (1422) + TX, tiafenox (nombre alternativo) + TX, tionazina (1434) + TX, triazofós (820) + TX, triazurón (nombre alternativo) + TX, xilenoles [CCN] + TX, YI-5302 (código de compuesto) y zeatina (nombre alternativo) (210) + TX, fluensulfona [318290-98-1] + TX,
- 5 un inhibidor de la nitrificación seleccionado del grupo de sustancias constituido por etilxantato potásico [CCN] y nitrapirina (580) + TX,
- 10 un activador vegetal seleccionado del grupo de sustancias constituido por acibenzolar (6) + TX, acibenzolar-S-metilo (6) + TX, probenazol (658) y extracto de *Reynoutria sachalinensis* (nombre alternativo) (720) + TX,
- 15 un rodenticida seleccionado del grupo de sustancias constituido por 2-isovalerilindan-1,3-diona (nombre según la IUPAC) (1246) + TX, 4-(quinoxalin-2-ilamino)benzenosulfonamida (nombre según la IUPAC) (748) + TX, alfa-clorohidrina [CCN] + TX, fosfuro de aluminio (640) + TX, antu (880) + TX, óxido arsenioso (882) + TX, carbonato de bario (891) + TX, bistiosemi (912) + TX, brodifacoum (89) + TX, bromadiolona (91) + TX, brometalina (92) + TX, cianuro de calcio (444) + TX, cloralosa (127) + TX, clorofacinona (140) + TX, colecalciferol (nombre alternativo) (850) + TX, coumaclor (1004) + TX, coumafurilo (1005) + TX, coumatetralilo (175) + TX, crimidina (1009) + TX, difenacoum (246) + TX, difetialona (249) + TX, difacinona (273) + TX, ergocalciferol (301) + TX, flocoumafeno (357) + TX, fluoroacetamida (379) + TX, flupropadina (1183) + TX, clorhidrato de flupropadina (1183) + TX, gamma-HCH (430) + TX, HCH (430) + TX, cianuro de hidrógeno (444) + TX, yodometano (nombre según la IUPAC) (542) + TX, lindano (430) + TX, fosfuro de magnesio (nombre según la IUPAC) (640) + TX, bromuro de metilo (537) + TX, norbormida (1318) + TX, fosacetim (1336) + TX, fosfina (nombre según la IUPAC) (640) + TX, fósforo [CCN] + TX, pindona (1341) + TX, arsenito de potasio [CCN] + TX, pirinurón (1371) + TX, esclirrosida (1390) + TX, arsenito de sodio [CCN] + TX, cianuro de sodio (444) + TX, fluoroacetato de sodio (735) + TX, estricnina (745) + TX, sulfato de talio [CCN] + TX, warfarina (851) y fosfuro de zinc (640) + TX,
- 20 un compuesto sinérgico seleccionado del grupo de sustancias constituido por piperonilato de 2-(2-butoxi)etilo (nombre según la IUPAC) (934) + TX, 5-(1,3-benzodioxol-5-il)-3-hexilciclohex-2-enona (nombre según la IUPAC) (903) + TX, farnesol con nerolidol (nombre alternativo) (324) + TX, MB-599 (código de desarrollo) (498) + TX, MGK 264 (código de desarrollo) (296) + TX, butóxido de piperonilo (649) + TX, piprotal (1343) + TX, isómero de propilo (1358) + TX, S421 (código de desarrollo) (724) + TX, sesamex (1393) + TX, sesasmolina (1394) y sulfóxido (1406) + TX,
- 25 un repelente de animales seleccionado del grupo de sustancias constituido por antraquinona (32) + TX, cloralosa (127) + TX, naftenato de cobre [CCN] + TX, oxiclورو de cobre (171) + TX, diazinona (227) + TX, dicitopentadieno (nombre químico) (1069) + TX, guazatina (422) + TX, acetatos de guazatina (422) + TX, metiocarb (530) + TX, piridin-4-amina (nombre según la IUPAC) (23) + TX, tiram (804) + TX, trimetacarb (840) + TX, naftenato de zinc [CCN] y ziram (856) + TX,
- 30 un virucida seleccionado del grupo de sustancias constituido por imanina (nombre alternativo) [CCN] y ribavirina (nombre alternativo) [CCN] + TX,
- 35 un protector de lesiones seleccionado del grupo de sustancias constituido por óxido de mercurio (512) + TX, octilina (590) y tiofanato-metilo (802) + TX,
- 40 y compuestos biológicamente activos seleccionados del grupo constituido por azaconazol (60207-31-0) + TX, bitertanol [70585-36-3] + TX, bromuconazol [116255-48-2] + TX, ciproconazol [94361-06-5] + TX, difenoconazol [119446-68-3] + TX, diniconazol [83657-24-3] + TX, epoxiconazol [106325-08-0] + TX, fenbuconazol [114369-43-6] + TX, fluquinconazol [136426-54-5] + TX, flusilazol [85509-19-9] + TX, flutriafol [76674-21-0] + TX, hexaconazol [79983-71-4] + TX, imazalilo [35554-44-0] + TX, imibenconazol [86598-92-7] + TX, ipconazol [125225-28-7] + TX, metconazol [125116-23-6] + TX, miclobutanilo [88671-89-0] + TX, pefurazoato [101903-30-4] + TX, penconazol [66246-88-6] + TX, protioconazol [178928-70-6] + TX, pirifenox [88283-41-4] + TX, procloraz [67747-09-5] + TX, propiconazol [60207-90-1] + TX, simeconazol [149508-90-7] + TX, tebuconazol [107534-96-3] + TX, tetraconazol [112281-77-3] + TX, triadimefón [43121-43-3] + TX, triadimenol [55219-65-3] + TX, triflumizol [99387-89-0] + TX, triticonazol [131983-72-7] + TX, ancimidol [12771-68-5] + TX, fenarimol [60168-88-9] + TX, nuarimol [63284-71-9] + TX, bupirimato [41483-43-6] + TX, dimetirimol [5221-53-4] + TX, etirimol [23947-60-6] + TX, dodemorf [1593-77-7] + TX,
- 45
- 50
- 55
- 60
- 65

TX, fenpropidina [67306-00-7] + TX, fenpropimorf [67564-91-4] + TX, espiroxamina [118134-30-8] + TX, tridemorf [81412-43-3] + TX, ciprodinilo [121552-61-2] + TX, mepanipirim [110235-47-7] + TX, pirimetanilo [53112-28-0] + TX, fencpiclonilo [74738-17-3] + TX, fludioxonilo [131341-86-1] + TX, benalaxilo [71626-11-4] + TX, furalaxilo [57646-30-7] + TX, metalaxilo [57837-19-1] + TX, *R*-metalaxilo [70630-17-0] + TX, ofurace [58810-48-3] + TX, oxadixilo [77732-09-3] + TX, benomilo [17804-35-2] + TX, carbendazim [10605-21-7] + TX, debacarb [62732-91-6] + TX, fuberidazol [3878-19-1] + TX, tiabendazol [148-79-8] + TX, clozolinato [84332-86-5] + TX, diclozolina [24201-58-9] + TX, iprodiona [36734-19-7] + TX, miclozolina [54864-61-8] + TX, procimidona [32809-16-8] + TX, vinclozolina [50471-44-8] + TX, boscalida [188425-85-6] + TX, carboxina [5234-68-4] + TX, fenfuram [24691-80-3] + TX, flutolanilo [66332-96-5] + TX, mepronilo [55814-41-0] + TX, oxicarboxina [5259-88-1] + TX, pentiopirad [183675-82-3] + TX, tifluzamida [130000-40-7] + TX, guazatina [108173-90-6] + TX, dodina [2439-10-3] [112-65-2] (base libre) + TX, iminoctadina [13516-27-3] + TX, azoxistrobina [131860-33-8] + TX, dimoxistrobina [149961-52-4] + TX, enestroburina {Proc. BCPC, Congr. Int., Glasgow, 2003, 1, 93} + TX, fluoxastrobina [361377-29-9] + TX, kresoxim-metilo [143390-89-0] + TX, metominostrobin [133408-50-1] + TX, trifloxistrobina [141517-21-7] + TX, orisastrobina [248593-16-0] + TX, picoxistrobina [117428-22-5] + TX, piraclostrobina [175013-18-0] + TX, ferbam [14484-64-1] + TX, mancozeb [8018-01-7] + TX, maneb [12427-38-2] + TX, metiram [9006-42-2] + TX, propineb [12071-83-9] + TX, tiram [137-26-8] + TX, zineb [12122-67-7] + TX, ziram [137-30-4] + TX, captafol [2425-06-1] + TX, captán [133-06-2] + TX, diclofluanid [1085-98-9] + TX, fluoroimida [41205-21-4] + TX, folpet [133-07-3] + TX, toliifluanid [731-27-1] + TX, caldo bordelés [8011-63-0] + TX, hidróxido de cobre [20427-59-2] + TX, oxiclورو de cobre [1332-40-7] + TX, sulfato de cobre [7758-98-7] + TX, óxido de cobre [1317-39-1] + TX, mancozeb [53988-93-5] + TX, oxina-cobre [10380-28-6] + TX, dinocap [131-72-6] + TX, nitroal-isopropilo [10552-74-6] + TX, edifenfós [17109-49-8] + TX, iprobenfós [26087-47-8] + TX, isoprotiolo [50512-35-1] + TX, fosdifeno [36519-00-3] + TX, pirazofós [13457-18-6] + TX, tolclofós-metilo [57018-04-9] + TX, acibenzolar-S-metilo [135158-54-2] + TX, anilazina [101-05-3] + TX, bentiavalicarb [413615-35-7] + TX, blasticidina-S [2079-00-7] + TX, quinometionato [2439-01-2] + TX, cloroneb [2675-77-6] + TX, clorotalonilo [1897-45-6] + TX, ciflufenamida [180409-60-3] + TX, cimoxanilo [57966-95-7] + TX, diclona [117-80-6] + TX, diclocimet [139920-32-4] + TX, diclomezina [62865-36-5] + TX, diclorán [99-30-9] + TX, dietofencarb [87130-20-9] + TX, dimetomorf [110488-70-5] + TX, SYP-LI90 (Flumorf) [211867-47-9] + TX, ditianón [3347-22-6] + TX, etaboxam [162650-77-3] + TX, etridiazol [2593-15-9] + TX, famoxadona [131807-57-3] + TX, fenamidona [161326-34-7] + TX, fenoxanilo [115852-48-7] + TX, fentina [668-34-8] + TX, ferimzona [89269-64-7] + TX, fluzinam [79622-59-6] + TX, fluopicolida [239110-15-7] + TX, flusulfamida [106917-52-6] + TX, fenhexamida [126833-17-8] + TX, fosetil-aluminio [39148-24-8] + TX, himexazol [10004-44-1] + TX, iprovalicarb [140923-17-7] + TX, IKF-916 (Ciazofamid) [120116-88-3] + TX, kasugamicina [6980-18-3] + TX, metasulfocarb [66952-49-6] + TX, metrafenona [220899-03-6] + TX, pencicurón [66063-05-6] + TX, ftalida [27355-22-2] + TX, polioxinas [11113-80-7] + TX, probenazol [27605-76-1] + TX, propamocarb [25606-41-1] + TX, proquinazid [189278-12-4] + TX, piroquilon [57369-32-1] + TX, quinoxifeno [124495-18-7] + TX, quintozeno [82-68-8] + TX, azufre [7704-34-9] + TX, tiadinilo [223580-51-6] + TX, triazóxido [72459-58-6] + TX, triciclazol [41814-78-2] + TX, triforina [26644-46-2] + TX, validamicina [37248-47-8] + TX, zoxamida (RH7281) [156052-68-5] + TX, mandipropamida [374726-62-2] + TX, isopirazam [881685-58-1] + TX, sedaxano [874967-67-6] + TX, (9-diclorometileno-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il)amida del ácido 3-difluorometil-1-metil-1*H*-pirazol-4-carboxílico (dada a conocer en el documento WO 2007/048556) + TX, (3',4',5'-trifluorobifenil-2-il)amida del ácido 3-difluorometil-1-metil-1*H*-pirazol-4-carboxílico (dada a conocer en el documento WO 2006/087343) + TX, [(3*S*,4*R*,4*aR*,6*S*,6*aS*,12*R*,12*aS*,12*bS*)-3-[(ciclopropilcarbonil)oxi]-1,3,4,4*a*,5,6,6*a*,12,12*a*,12*b*-decahidro-6,12-dihidroxi-4,6*a*,12*b*-trimetil-11-oxo-9-(3-piridinil)-2*H*,11*H*nafto[2,1-*b*]pirano[3,4-*e*]piran-4-il]metil-ciclopropanocarboxilato [915972-17-7] + TX y 1,3,5-trimetil-*N*-(2-metil-1-oxopropil)-*N*-[3-(2-metilpropil)-4-[2,2,2-trifluoro-1-metoxi-1-(trifluorometil)etil]fenil]-1*H*-pirazol-4-carboxamida [926914-55-8] + TX.

Las referencias entre corchetes tras los principios activos, p. ej. [3878-19-1], se refieren al número de registro del Chemical Abstracts. Los componentes de las mezclas descritos anteriormente son conocidos. Cuando los principios activos están incluidos en "The Pesticide Manual" [The Pesticide Manual - A World Compendium; decimotercera edición; Editor: C. D. S. Tomlin; Consejo Británico de Protección de los Cultivos], se describen en el mismo con el número de entrada facilitado entre paréntesis anteriormente en la presente para el compuesto particular, por ejemplo, el compuesto "abamectina" se describe con el número de entrada (1). Cuando se añade "[CCN]" anteriormente en la presente a un compuesto particular, el compuesto en cuestión está incluido en el "Compendium of Pesticide Common Names", que puede consultarse en Internet [A. Wood; Compendium of Pesticide Common Names, Copyright © 1995-2004], por ejemplo, el compuesto "acetoprol" se describe en la dirección de Internet <http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html>.

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

La mezcla de principios activos de los compuestos de fórmula I seleccionados a partir de las Tablas 1-12 y P1 con los principios activos descritos previamente comprende un compuesto seleccionado a partir de las Tablas 1-12 y P1,

- y un principio activo como los descritos previamente preferentemente con una relación de mezcla comprendida entre 100:1 y 1:6000, especialmente entre 50:1 y 1:50, más especialmente con una relación comprendida entre 20:1 y 1:20, incluso más especialmente entre 10:1 y 1:10, muy especialmente entre 5:1 y 1:5, con especial preferencia por una relación comprendida entre 2:1 y 1:2, y siendo igualmente preferida una relación comprendida entre 4:1 y 2:1, sobre todo una relación de 1:1, o 5:1, o 5:2, o 5:3, o 5:4, o 4:1, o 4:2, o 4:3, o 3:1, o 3:2, o 2:1, o 1:5, o 2:5, o 3:5, o 4:5, o 1:4, o 2:4, o 3:4, o 1:3, o 2:3, o 1:2, o 1:600, o 1:300, o 1:150, o 1:35, o 2:35, o 4:35, o 1:75, o 2:75, o 4:75, o 1:6000, o 1:3000, o 1:1500, o 1:350, o 2:350, o 4:350, o 1:750, o 2:750, o 4:750. Estas relaciones de mezcla están en peso.
- 5
- 10 Las mezclas descritas anteriormente pueden emplearse en un método para controlar plagas, que comprende aplicar una composición que comprende una mezcla tal como se ha descrito anteriormente a las plagas o a su entorno, con la excepción de un método para tratar el cuerpo humano o animal mediante cirugía o terapia y métodos de diagnóstico practicados en el cuerpo humano o animal.
- 15 Las mezclas que comprenden un compuesto de fórmula I seleccionado a partir de las Tablas 1-12 y P1 y uno o más principios activos como los descritos anteriormente pueden aplicarse, por ejemplo, en una única forma "premezclada", en una mezcla de pulverización combinada compuesta por formulaciones diferentes de cada uno de los componentes que son principios activos, tal como una "mezcla de tanque", y en un uso combinado de cada principio activo cuando estos se aplican de manera secuencial, es decir, uno después del otro en un periodo relativamente corto tal como unas pocas horas o días. El orden de aplicación de los compuestos de fórmula I seleccionados a partir de las Tablas 1-12 y P1 y los principios activos como los descritos anteriormente no es esencial para llevar a la práctica la presente invención.
- 20
- 25 Las composiciones de acuerdo con la invención también pueden comprender otros auxiliares sólidos o líquidos tales como estabilizantes, por ejemplo, aceites vegetales epoxidados o no epoxidados (por ejemplo, aceite de coco, aceite de colza o aceite de soja epoxidados), antiespumantes, por ejemplo, aceite de silicona, conservantes, reguladores de la viscosidad, aglutinantes y/o adherentes, fertilizantes u otros principios activos para obtener efectos específicos, por ejemplo, bactericidas, fungicidas, nematocidas, activadores de plantas, molusquicidas o herbicidas.
- 30 Las composiciones de acuerdo con la invención se preparan de forma conocida *per se*, en ausencia de auxiliares, por ejemplo, moliendo, tamizando y/o comprimiendo un principio activo sólido y, en presencia de al menos un auxiliar, por ejemplo, mezclando íntimamente y/o moliendo el principio activo con el auxiliar (o los auxiliares). Estos procesos para preparar las composiciones y el uso de los compuestos I para preparar estas composiciones son también un objeto de la invención.
- 35
- 40 Los métodos de aplicación para las composiciones, es decir, los métodos para controlar las plagas del tipo mencionado anteriormente, por ejemplo, mediante pulverización, atomización, espolvoreación, con cepillo, revestimiento, dispersión o vertido, que deben seleccionarse para adecuarse a los fines deseados de las circunstancias predominantes, y el uso de las composiciones para controlar las plagas del tipo mencionado anteriormente son otros objetos de la invención. Las tasas habituales de concentración se encuentran entre 0.1 y 1000 ppm, preferentemente entre 0.1 y 500 ppm, de principio activo. La tasa de aplicación por hectárea es generalmente de 1 a 2000 g de principio activo por hectárea, en particular de 10 a 1000 g/ha, preferentemente de 10 a 600 g/ha.
- 45 Un método de aplicación preferido en el campo de la protección de cultivos es la aplicación al follaje de las plantas (aplicación foliar), siendo posible seleccionar la frecuencia y tasa de aplicación para que coincida con el peligro de infestación de la plaga en cuestión. Como alternativa, el principio activo puede llegar a las plantas mediante el sistema radicular (acción sistémica), empapando la ubicación de las plantas con una composición líquida o incorporando el principio activo en forma sólida en el emplazamiento de las plantas, por ejemplo, en el suelo, por ejemplo, en forma de gránulos (aplicación al suelo). En el caso de los cultivos de arrozales, dichos gránulos pueden introducirse en forma dosificada en el arrozal anegado.
- 50
- 55 Los compuestos de la invención y sus composiciones también son adecuados para la protección del material de propagación vegetal, por ejemplo, semillas, tales como frutos, tubérculos o granos, o plantas de vivero, contra plagas del tipo mencionado anteriormente. El material de propagación puede tratarse con el compuesto antes de plantarlo, por ejemplo, pueden tratarse las semillas antes de sembrarlas. Como alternativa, el compuesto también puede aplicarse a los granos de las semillas (recubrimiento), ya sea empapando los granos en una composición líquida o aplicando una capa de una composición sólida. También es posible aplicar las composiciones cuando el material de propagación se planta en el sitio de aplicación, por ejemplo, en el surco para la semilla durante la perforación. Estos métodos de tratamiento para el material de propagación vegetal y el material de propagación vegetal tratado de este modo son otros objetos de la invención. Las tasas de tratamiento típicas dependerán de la planta y la plaga/hongos que se deseen controlar y generalmente están comprendidas entre 1 y 200 gramos por 100 kg de semillas, preferentemente entre 5 y 150 gramos por 100 kg de semillas, tal como entre 10 y 100 gramos por 100 kg de semillas.
- 60
- 65

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

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

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

#### 20 Ejemplos biológicos:

##### Ejemplo B1: Actividad contra *Spodoptera littoralis* (oruga de la hoja del algodón egipcio)

(larvicida, actividad de contacto residual/alimentación, prevención)

25 Se colocaron discos foliares de algodón en agar en una placa de microvaloración de 24 pocillos y se pulverizaron con soluciones de prueba. Tras secar, los discos foliares se infestaron con 5 larvas L1. Las muestras se inspeccionaron para determinar la mortalidad, el efecto de repelencia, el hábito alimenticio y la regulación del crecimiento 3 días después del tratamiento (DDT).

30 En esta prueba, los compuestos P1, P4 y P6 mostraron una actividad superior a un 80% con una concentración de 400 ppm.

##### Ejemplo B2: Actividad contra *Spodoptera littoralis* (oruga de la hoja del algodón egipcio)

35 (actividad sistémica)

Los compuestos de prueba se colocaron con una pipeta en placas de 24 pocillos y se mezclaron con agar. Se colocaron semillas de lechuga sobre el agar y la placa con múltiples pocillos se tapó con otra placa que también contenía agar. Después de 7 días, las raíces habían absorbido el compuesto y la lechuga había crecido hasta la placa que hacía de tapa. Las hojas de lechuga se cortaron en ese momento y colocaron en la placa que hacía de tapa. Se pipetearon huevos de *Spodoptera* a través de una plantilla de plástico sobre un papel absorbente de gel húmedo y la placa se tapó con este. Las muestras se inspeccionaron para comprobar la mortalidad, el efecto de repelencia, el hábito alimenticio y la regulación del crecimiento 5 días después de la infestación.

##### Ejemplo B3: Actividad contra *Plutella xylostella* (polilla de la col)

(larvicida, actividad de contacto residual/alimentación, prevención)

50 Una placa de microvaloración (PMV) de 24 pocillos con dieta artificial se trató con las soluciones de prueba que se aplicaron pipeteando. Tras secar, las PMV se infestaron con larvas L2 (10-15 por pocillo). Tras un periodo de incubación de 5 días, se inspeccionaron las muestras para determinar la mortalidad, la inhibición de la alimentación y la regulación del crecimiento de las larvas.

55 En esta prueba, los compuestos P4 y P6 mostraron una actividad superior a un 80% con una concentración de 400 ppm.

##### Ejemplo B4: Actividad contra *Diabrotica balteata* (gusano de la raíz del maíz)

60 (larvas L2 en brotes de maíz, alimentación/contacto, prevención)

Se trataron brotes de maíz, colocados sobre una capa de agar en placas de microvaloración de 24 pocillos, con las soluciones de prueba mediante pulverización. Tras secar, las PMV se infestaron con larvas L2 (6-10 por pocillo). Tras un periodo de incubación de 5 días, se inspeccionaron las muestras para determinar la mortalidad y la regulación del crecimiento de las larvas.



En esta prueba, los compuestos P1, P3, P4 y P6 mostraron una actividad superior a un 80% con una concentración de 400 ppm.

Ejemplo B5: Actividad contra *Myzus persicae* (áfido verde del melocotón)

5 (actividad de contacto residual/alimentación, prevención), población mixta

10 Se colocaron discos foliares de girasol en agar en placas de microvaloración de 24 pocillos y se pulverizaron con soluciones de prueba. Tras secar, los discos foliares se infestaron con una población de áfidos de edades mixtas. Tras un periodo de incubación de 6 días DDT, se inspeccionaron las muestras para determinar la mortalidad y efectos especiales (p. ej., fitotoxicidad).

15 En esta prueba, los compuestos P3, P5 y P9 mostraron una actividad superior a un 80% con una concentración de 400 ppm.

Ejemplo B6: Actividad contra *Myzus persicae* (áfido verde del melocotón)

(prueba de la actividad de alimentación con una bolsita), población mixta

20 Los compuestos de prueba se colocaron con una pipeta en placas de 24 pocillos y se mezclaron con una solución de sacarosa. Las placas se taparon con parafilm estirado. Se colocó una plantilla de plástico con 24 orificios sobre la placa y se colocaron plántulas de guisante infestadas directamente sobre el parafilm. La placa infestada se tapó con un papel absorbente de gel y otra plantilla de plástico, y a continuación se invirtió su posición. Se inspeccionaron las muestras 5 días después de la infestación para determinar la mortalidad. Tasa de aplicación: 12.5 ppm.

25 En esta prueba, los compuestos P3 y P8 mostraron una actividad de al menos un 80% en una concentración de 12.5 ppm.

Ejemplo B7: Actividad contra *Myzus persicae* (áfido verde del melocotón)

30 (actividad de alimentación/sistémica, curación), población mixta

35 Se colocaron raíces de plántulas de guisante, infestadas con una población de áfidos de edades mixtas, directamente en las soluciones de prueba. Se inspeccionaron las muestras 6 días después de la introducción para determinar la mortalidad y efectos especiales sobre la planta. En esta prueba, el compuesto P5 mostró una actividad de al menos un 80% con una concentración de 24 ppm.

Ejemplo B8: Actividad contra *Frankliniella occidentalis* (arañuelas de flores occidentales):

40 (población mixta, alimentación/contacto, prevención)

45 Se colocaron discos foliares de girasol en agar en una placa de microvaloración de 24 pocillos y se pulverizaron con soluciones de prueba. Tras secar, los discos foliares se infestaron con una población de *Frankliniella* de edades mixtas. Tras un periodo de incubación de 7 días DDT, se inspeccionan las muestras para determinar la mortalidad y efectos especiales (p. ej., fitotoxicidad).

En esta prueba, el compuesto P8 mostró una actividad superior a un 80% con una concentración de 400 ppm.

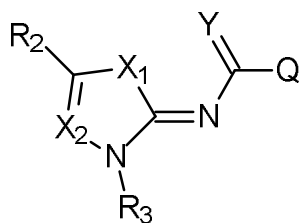
Ejemplo B9: Actividad contra *Aedes aegypti* (mosquito de la fiebre amarilla)

50 Se aplicaron las soluciones de prueba, con una tasa de aplicación de 200 ppm en etanol, en placas de cultivo tisular de 12 pocillos. Una vez secos los depósitos, se añadieron a cada pocillo cinco hembras adultas de *Aedes aegypti* con edades comprendidas entre dos y cinco días, y se alimentaron con una solución de sacarosa al 10% en un lecho de algodón. Se evaluó la paralización una hora después de la introducción, y se evaluó la mortalidad 24 y 48 horas después de la introducción.

El siguiente compuesto proporcionó al menos un 80% de control de *Aedes aegypti* después de 48 horas: P3.

## REIVINDICACIONES

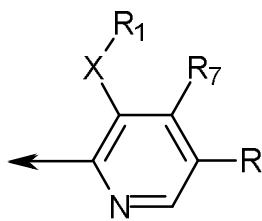
1. Un compuesto de fórmula I,



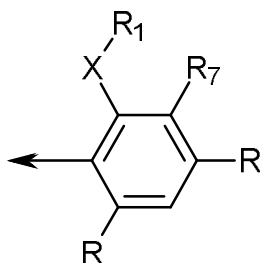
5 (I),

donde

- 10 X<sub>1</sub> es O, S o CR<sub>6</sub>=CH, donde R<sub>6</sub> es hidrógeno, halógeno, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> sustituido con uno o dos grupos hidroxilo, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> sustituido con uno o dos grupos metoxi, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> sustituido con uno o dos grupos ciano; o R<sub>6</sub> es haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, SF<sub>5</sub>, fenilcarboniltio, ciano, mercapto, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carbonilo, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carbonilo o -C(O)(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>);
- 15 o X<sub>1</sub> es N-R<sub>4</sub>, donde R<sub>4</sub> es hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;
- X<sub>2</sub> es N o C-R<sub>5</sub>, donde R<sub>5</sub> es hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno o ciano;
- 20 R<sub>2</sub> es hidrógeno, halógeno, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> sustituido con uno o dos grupos hidroxilo, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> sustituido con uno o dos grupos metoxi, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> sustituido con uno o dos grupos ciano; o R<sub>2</sub> es haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, SF<sub>5</sub>, fenilcarboniltio, ciano, mercapto, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carbonilo, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carbonilo o -C(O)(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>);
- R<sub>3</sub> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) o cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;
- Y es O o S;
- Q es un radical seleccionado del grupo constituido por la fórmula Q<sub>1</sub> y Q<sub>2</sub>:



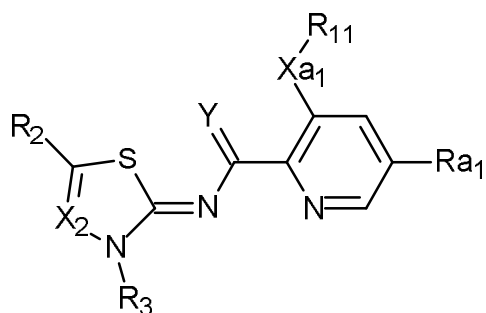
Q<sub>1</sub>



Q<sub>2</sub>

- 25 donde la flecha indica el punto de unión a la parte de la amida;
- y donde X es S, SO o SO<sub>2</sub>;
- cada R es, independientemente el uno del otro, hidrógeno, halógeno, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;
- 30 cada R<sub>1</sub> es, independientemente el uno del otro, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, (cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>; y
- cada R<sub>7</sub> es, independientemente el uno del otro, hidrógeno o halógeno;
- y sales, estereoisómeros, enantiómeros, tautómeros y *N*-óxidos agroquímicamente aceptables de dichos compuestos.

35 2. Un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, representado por los compuestos de fórmula I-1



(I-1),

donde

Y, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> y X<sub>2</sub> son como se definen en la fórmula I en la reivindicación 1;

5 Xa<sub>1</sub> es S, SO o SO<sub>2</sub>;

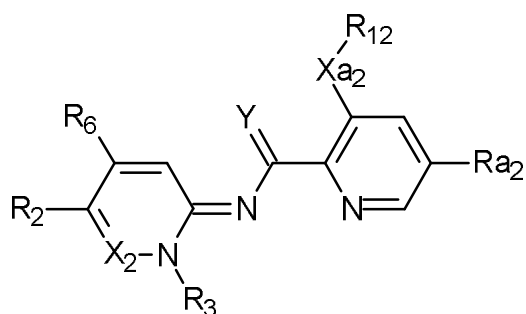
Ra<sub>1</sub> es hidrógeno, halógeno o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

R<sub>11</sub> es metilo, etilo, *n*-propilo, *i*-propilo o ciclopropilmetilo;

y sales, estereoisómeros, enantiómeros, tautómeros y *N*-óxidos agroquímicamente aceptables de dichos

10

3. Un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, representado por los compuestos de fórmula I-2



(I-2),

15 donde

Y, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>6</sub> y X<sub>2</sub> son como se definen en la fórmula I en la reivindicación 1;

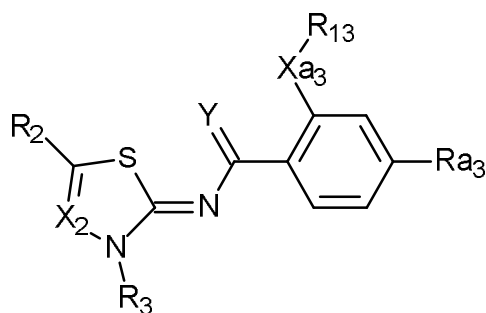
Xa<sub>2</sub> es S, SO o SO<sub>2</sub>;

Ra<sub>2</sub> es hidrógeno, halógeno o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

R<sub>12</sub> es metilo, etilo, *n*-propilo, *i*-propilo o ciclopropilmetilo;

20 y sales, estereoisómeros, enantiómeros, tautómeros y *N*-óxidos agroquímicamente aceptables de dichos compuestos.

4. Un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, representado por los compuestos de fórmula I-3



(I-3),

25

donde

Y, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> y X<sub>2</sub> son como se definen en la fórmula I en la reivindicación 1;

30 Xa<sub>3</sub> es S, SO o SO<sub>2</sub>;

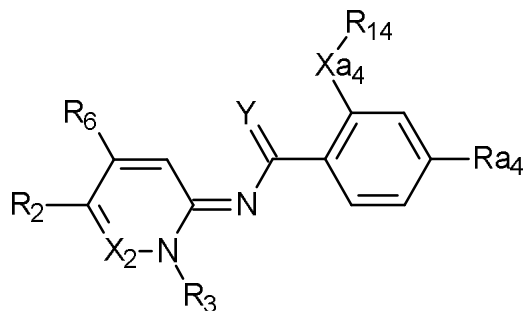
R<sub>3</sub> es hidrógeno, halógeno o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

R<sub>13</sub> es metilo, etilo, *n*-propilo, *i*-propilo o ciclopropilmetilo;

y sales, estereoisómeros, enantiómeros, tautómeros y *N*-óxidos agroquímicamente aceptables de dichos compuestos.

5

5. Un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, representado por los compuestos de fórmula I-4



(I-4),

10 donde

Y, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>6</sub> y X<sub>2</sub> son como se definen en la fórmula I en la reivindicación 1;

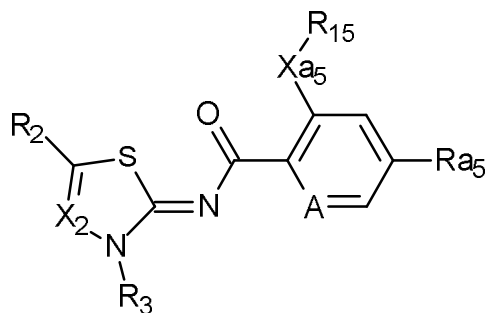
X<sub>a4</sub> es S, SO o SO<sub>2</sub>;

R<sub>a4</sub> es hidrógeno, halógeno o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

R<sub>14</sub> es metilo, etilo, *n*-propilo, *i*-propilo o ciclopropilmetilo;

15 y sales, estereoisómeros, enantiómeros, tautómeros y *N*-óxidos agroquímicamente aceptables de dichos compuestos.

6. Un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, representado por los compuestos de fórmula I-5



20

(I-5),

donde

A es N o CH;

X<sub>2</sub> es N, CH o C-(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>);

25 X<sub>a5</sub> es S, SO o SO<sub>2</sub>;

R<sub>a5</sub> es hidrógeno o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

R<sub>15</sub> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

R<sub>3</sub> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

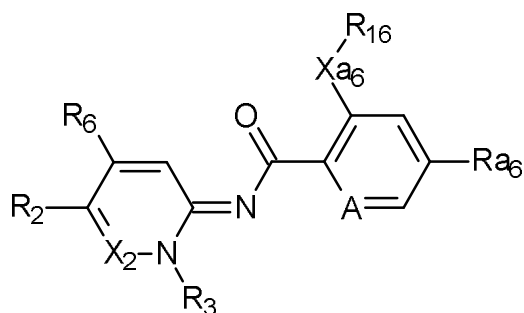
R<sub>2</sub> es haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cuando X<sub>2</sub> es N o CH; o

30 R<sub>2</sub> es hidrógeno cuando X<sub>2</sub> es C-(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>);

y sales, estereoisómeros, enantiómeros, tautómeros y *N*-óxidos agroquímicamente aceptables de dichos compuestos.

7. Un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, representado por los compuestos de fórmula I-6

35



(I-6),

donde

A es N o CH;

5 R<sub>6</sub> es hidrógeno o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

X<sub>2</sub> es N o CH;

X<sub>a6</sub> es S, SO o SO<sub>2</sub>;

Ra<sub>6</sub> es hidrógeno o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

R<sub>16</sub> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

10 R<sub>3</sub> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

R<sub>2</sub> es haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfanilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cuando a la vez X<sub>2</sub> es N o CH y R<sub>6</sub> es hidrógeno; o

R<sub>2</sub> es hidrógeno cuando a la vez X<sub>2</sub> es N o CH y R<sub>6</sub> es haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

15 y sales, estereoisómeros, enantiómeros, tautómeros y *N*-óxidos agroquímicamente aceptables de dichos compuestos.

8. Una composición pesticida, que comprende al menos un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1 o, cuando proceda, un tautómero de este, en cada caso en forma libre o en forma salina que se pueda utilizar agroquímicamente, como principio activo y al menos un auxiliar.

20 9. Un método para controlar plagas, que comprende aplicar una composición de acuerdo con la reivindicación 8 a las plagas o a su entorno, con la excepción de un método para tratar el cuerpo humano o animal mediante cirugía o terapia y métodos de diagnóstico practicados en el cuerpo humano o animal.

25 10. Un método para la protección de material de propagación vegetal frente al ataque de plagas, que comprende tratar el material de propagación o el sitio, donde el material de propagación está plantado, con una composición de acuerdo con la reivindicación 8.