

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 638 504**

51 Int. Cl.:

**C07D 471/04** (2006.01)

**A01N 43/90** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **07.11.2014 PCT/EP2014/073996**

87 Fecha y número de publicación internacional: **21.05.2015 WO15071180**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **07.11.2014 E 14796055 (3)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **14.06.2017 EP 3068780**

54 Título: **Heterociclos bicíclicos activos como pesticidas con sustituyentes que contienen azufre**

30 Prioridad:

**13.11.2013 EP 13192625**

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

**23.10.2017**

73 Titular/es:

**SYNGENTA PARTICIPATIONS AG (100.0%)**

**Schwarzwaldallee 215**

**4058 Basel, CH**

72 Inventor/es:

**MUEHLEBACH, MICHEL;**

**EDMUNDS, ANDREW y**

**STOLLER, ANDRÉ**

74 Agente/Representante:

**LEHMANN NOVO, María Isabel**

ES 2 638 504 T3

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

## DESCRIPCIÓN

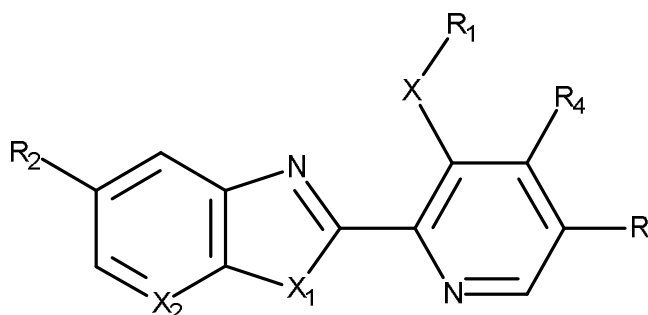
Heterociclos bicíclicos activos como pesticidas con sustituyentes que contienen azufre

5 La presente invención se refiere a derivados heterocíclicos que contienen azufre activos como insecticidas, a procesos para su preparación, a composiciones que comprenden dichos 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 heterocíclicos con acción pesticida y se describen, por ejemplo, en los documentos WO 2009/131237, WO 2011/043404, WO 2011/040629, WO 2010/125985, WO 2012/086848 y WO 2013/018928.

Se acaban de descubrir derivados heterocíclicos novedosos con propiedades pesticidas.

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



(I),

20 donde X es S=N-R<sub>10</sub> o S(O)=N-R<sub>10</sub>, donde R<sub>10</sub> es hidrógeno, nitro, ciano, C(O)R<sub>26</sub>, C(O)OR<sub>27</sub>, CONR<sub>28</sub>R<sub>29</sub>, SO<sub>2</sub>R<sub>30</sub>, CONH<sub>2</sub>, C(S)NH<sub>2</sub>; o R<sub>10</sub> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> o (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>);

R es hidrógeno, halógeno, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, OR<sub>31</sub> o S(O)<sub>n</sub>R<sub>32</sub>;

X<sub>1</sub> es O, S o N-R<sub>3</sub>, donde R<sub>3</sub> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), o X<sub>1</sub> es N-(4-metoxibencilo) o N-(propargilo);

25 X<sub>2</sub> es N, CH, C-halógeno, C-CN, C-O-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), C-S-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), C-SO<sub>2</sub>-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), C-S-fenilo, C-SO<sub>2</sub>-fenilo o C-SO<sub>2</sub>-(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>);

R<sub>1</sub> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</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>;

R<sub>2</sub> es halógeno, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, OR<sub>31</sub>, S(O)<sub>n</sub>R<sub>32</sub> o SF<sub>5</sub>;

R<sub>4</sub> es hidrógeno o halógeno;

30 R<sub>26</sub> es hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> o (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>);

R<sub>27</sub>, R<sub>28</sub>, R<sub>29</sub> y R<sub>30</sub>, independientemente unos de otros, son alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> o (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>);

R<sub>31</sub> y R<sub>32</sub>, independientemente el uno del otro, son alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

35 n es 0, 1 o 2; y

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

40 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 y hexilo. Los radicales alcoxi, alqueno y alquino derivan de los radicales alquilo mencionados. Los grupos alqueno y alquino pueden ser mono- o poliinsaturados.

45 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 halofenilo.

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, en particular trifluorometilo.

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 los radicales pentiloxi y hexiloxi isoméricos; preferentemente metoxi y etoxi.

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

10 Los grupos cicloalquilo tienen preferentemente de 3 a 6 átomos de carbono anulares, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo. El fenilo, también como parte de un sustituyente tal como fenoxi, bencilo, benciloxi, benzoilo, feniltio, fenilalquilo, fenoxialquilo, puede estar sustituido. En este caso, los sustituyentes pueden estar en la posición *orto*, *meta* y/o *para*. Las posiciones preferidas de los sustituyentes son las posiciones *orto* y *para* respecto al punto de unión del anillo.

15 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, un ácido fosforoso o un ácido halhídrico, con ácidos carboxílicos orgánicos fuertes, tales como ácidos (alcano C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carboxílicos que no están sustituidos o están 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 no están sustituidos o están 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 amoniaco 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.

20 Las sales de los compuestos de fórmula I pueden prepararse de un modo conocido *per se*. Por lo tanto, por ejemplo, se obtienen sales de adición de 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.

25 Las sales de los compuestos de fórmula I pueden convertirse de la manera habitual en compuestos I libres, 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.

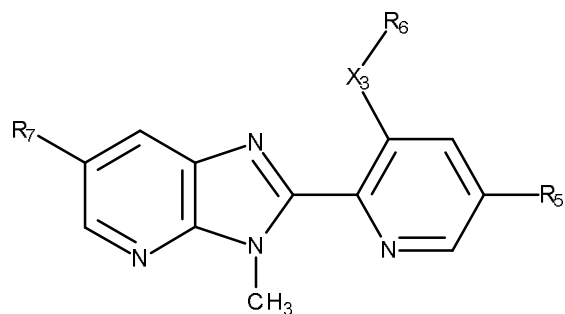
30 Las sales de los compuestos de fórmula I se pueden convertir de una forma conocida *per se* en otras sales de los compuestos de fórmula I, sales de adición de ácido, por ejemplo, en otras sales de adición de ácido, por ejemplo, mediante el tratamiento de una sal de ácido inorgánico, tal como clorhidrato, 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 mezcla de reacción.

35 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.

40 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.

45 Se prefieren compuestos de fórmula I donde X es S=N-R<sub>10</sub> o S(O)=N-R<sub>10</sub>, donde R<sub>10</sub> es hidrógeno, nitro, ciano, C(O)R<sub>26</sub>, C(O)OR<sub>27</sub>, CONR<sub>28</sub>R<sub>29</sub>, SO<sub>2</sub>R<sub>30</sub>; o R<sub>10</sub> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> o (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>); y sales y N-óxidos agroquímicamente aceptables de estos compuestos.

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



(I-1),

donde  $X_3$  es  $S=N-R_{10}$  o  $S(O)=N-R_{10}$  y  $R_{10}$  es preferentemente hidrógeno, ciano o  $C(O)CF_3$ ;

$R_5$  es hidrógeno, halógeno o haloalquilo  $C_1-C_4$ ;  $R_6$  es metilo, etilo, *n*-propilo o *i*-propilo; y  $R_7$  es halógeno o haloalquilo  $C_1-C_4$ ; y sales, estereoisómeros, enantiómeros, tautómeros y *N*-óxidos agroquímicamente aceptables de estos compuestos.

En compuestos preferidos de fórmula I-1,

$X_3$  es como se ha definido anteriormente y  $R_5$  es hidrógeno.

Otros compuestos preferidos de fórmula I-1 son aquellos donde

$X_3$  es como se ha definido anteriormente y  $R_5$  es trifluorometilo.

En compuestos especialmente preferidos de fórmula I-1,

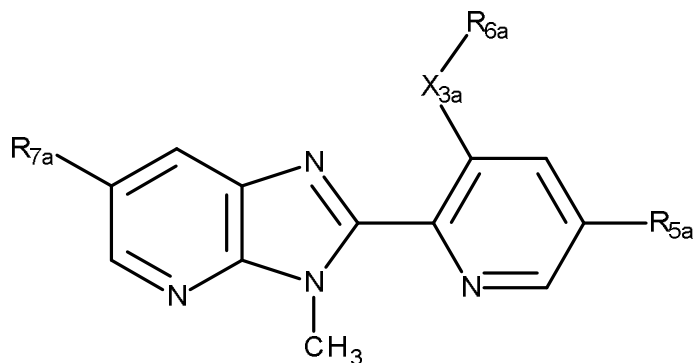
$X_3$  es  $S=NH$ ,  $S=N-CN$  o  $S=N-C(O)CF_3$ ,  $R_5$  es hidrógeno,  $R_6$  es etilo y  $R_7$  es trifluorometilo; o  $X_3$  es  $S=NH$ ,  $S=N-CN$  o  $S=N-C(O)CF_3$ ,  $R_5$  es trifluorometilo,  $R_6$  es etilo y  $R_7$  es trifluorometilo.

Otra realización de la presente invención agrupa compuestos de fórmula I-1 donde

$X_3$  es  $S(O)=NH$ ,  $S(O)=N-CN$  o  $S(O)=N-C(O)CF_3$ ,  $R_5$  es hidrógeno,  $R_6$  es etilo y  $R_7$  es trifluorometilo; o

$X_3$  es  $S(O)=NH$ ,  $S(O)=N-CN$  o  $S(O)=N-C(O)CF_3$ ,  $R_5$  es trifluorometilo,  $R_6$  es etilo y  $R_7$  es trifluorometilo.

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



(I-1a),

donde  $X_{3a}$  es  $S(O)=N-R_{10}$  y  $R_{10}$  es preferentemente alquilo  $C_1-C_6$ ,  $C(O)R_{26}$ ,  $C(O)OR_{27}$ ,  $CONR_{28}R_{29}$ ,  $SO_2R_{30}$ ,  $CONH_2$  o  $C(S)NH_2$  y donde  $R_{26}$  es preferentemente hidrógeno, alquilo  $C_1-C_6$  o haloalquilo  $C_1-C_6$ , y  $R_{27}$ ,  $R_{28}$ ,  $R_{29}$ ,  $R_{30}$ , independientemente unos de otros, son preferentemente alquilo  $C_1-C_6$ ;  $R_{5a}$  es hidrógeno, halógeno o haloalquilo  $C_1-C_4$ ;  $R_{6a}$  es metilo, etilo, *n*-propilo o *i*-propilo; y  $R_{7a}$  es halógeno o haloalquilo  $C_1-C_4$ ; y sales, estereoisómeros, enantiómeros, tautómeros y *N*-óxidos agroquímicamente aceptables de estos compuestos.

En compuestos preferidos de fórmula I-1a,

$X_{3a}$  es como se ha definido en la fórmula I-1a anterior y  $R_{5a}$  es hidrógeno.

Otros compuestos preferidos de fórmula I-1a son aquellos donde

$X_{3a}$  es como se ha definido en la fórmula I-1a anterior y  $R_{5a}$  es trifluorometilo.

En compuestos especialmente preferidos de fórmula I-1a,

$X_{3a}$  es  $S(O)=N-CH_3$ ,  $S(O)=N-C(O)H$ ,  $S(O)=N-C(O)CH_2CH_3$ ,  $S(O)=N-C(O)OCH_3$ ,  $S(O)=N-C(O)N(CH_3)_2$ ,  $S(O)=N-C(O)NH_2$  o  $S(O)=N-SO_2CH_3$ ;  $R_{5a}$  es hidrógeno,  $R_{6a}$  es etilo y  $R_{7a}$  es trifluorometilo;

o  $X_{3a}$  es  $S(O)=N-CH_3$ ,  $S(O)=N-C(O)H$ ,  $S(O)=N-C(O)CH_2CH_3$ ,  $S(O)=N-C(O)OCH_3$ ,

$S(O)=N-C(O)N(CH_3)_2$ ,  $S(O)=N-C(O)NH_2$  o  $S(O)=N-SO_2CH_3$ ;  $R_{5a}$  es trifluorometilo,  $R_{6a}$  es etilo y  $R_{7a}$  es trifluorometilo.

En compuestos preferidos particulares de fórmula I,

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

R<sub>1</sub> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>;

R<sub>2</sub> es haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

X<sub>1</sub> es N-R<sub>3</sub>, donde R<sub>3</sub> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

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

R<sub>4</sub> es hidrógeno; y

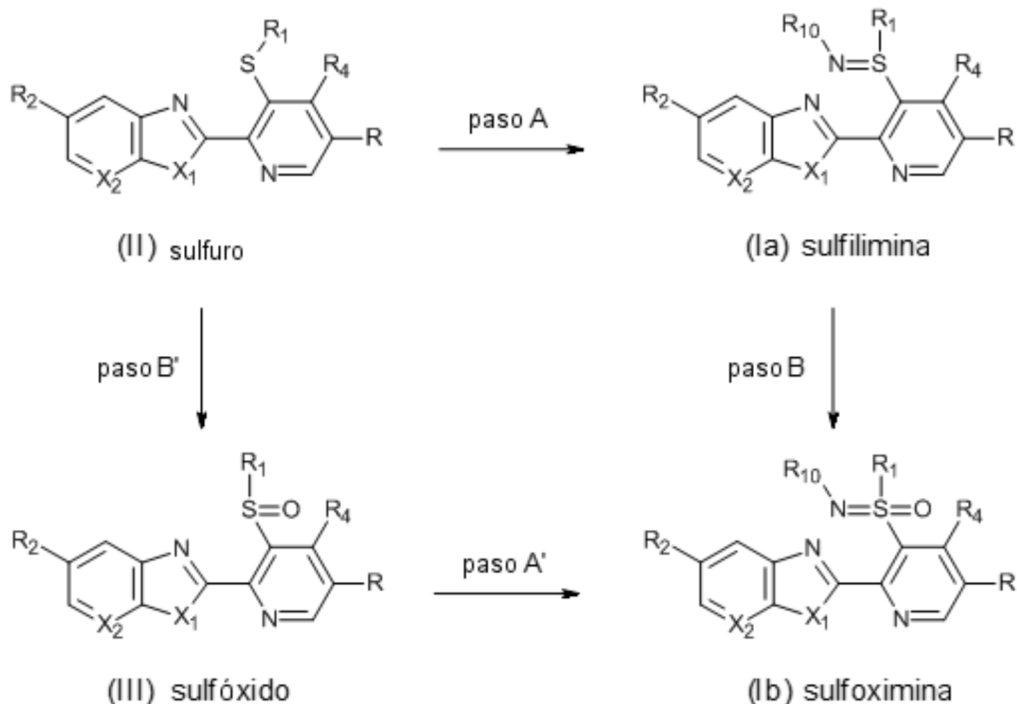
X es S=N-R<sub>10</sub> o S(O)=N-R<sub>10</sub>, donde R<sub>10</sub> es hidrógeno, ciano, (haloalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo, aminocarbonilo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>,

(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>,

-C(O)H o di(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)aminocarbonilo.

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. El subgrupo de compuestos de fórmula I donde X es S=N-R<sub>10</sub> definidos como la sulfilimina Ia, donde R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, R<sub>10</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se han definido anteriormente, se pueden preparar haciendo reaccionar el sulfuro correspondiente de fórmula II, donde R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se han definido anteriormente, en condiciones de una reacción de iminación (paso A, Esquema 1). El subgrupo particular de compuestos de fórmula I donde X es S(O)=N-R<sub>10</sub> definidos como la sulfoximina Ib, donde R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, R<sub>10</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se han definido anteriormente, se pueden obtener mediante la oxidación de los compuestos de tipo sulfilimina de fórmula Ia, donde R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, R<sub>10</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se han definido anteriormente (paso B).

Esquema 1



Por otro lado, el orden de los dos pasos se puede invertir con lo que los compuestos de tipo sulfoximina de fórmula Ib, donde R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, R<sub>10</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se han definido anteriormente, se pueden preparar a partir de los sulfóxidos de fórmula III, donde R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se han definido anteriormente, en condiciones adecuadas de una reacción de iminación (paso A').

Las condiciones de reacción y los métodos de preparación típicos para acceder a los compuestos de fórmula I, ya sea a través de las sulfiliminas Ia (paso A) o las sulfoximinas Ib (paso A'), se pueden consultar, por ejemplo, en H. Okamura, C. Bolm, *Org. Lett.* 2004, 6, 1305-1307; H. Okamura, C. Bolm, *Chem. Lett.* 2004, 33, 482-487; D. Leca, K. Song, M. Amatore, L. Fensterbank, E. Lacôte, M. Malacria, *Chem. Eur. J.* 2004, 10, 906-916; o M. Reggelin, C. Zur, *Synthesis*, 2000, 1-64. Las condiciones/reactivos de iminación típicos se pueden definir como Na<sub>2</sub>/H<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>, O-mesitileno-sulfonilo-hidroxi-aminina (MSH), o métodos catalizados con metales [remítase a O.G. Mancheno, C. Bolm, *Chem. Eur. J.* 2007, 13, 6674-6681] tales como R<sub>10</sub>-N<sub>3</sub>/FeCl<sub>2</sub>, R<sub>10</sub>-NH<sub>2</sub>/Fe(acac)<sub>3</sub>/PhI=O, PhI=N-R<sub>10</sub>/Fe(OTf)<sub>2</sub>, PhI=N-R<sub>10</sub>/CuOTf, PhI=N-R<sub>10</sub>/Cu(OTf)<sub>2</sub>, PhI=N-R<sub>10</sub>/CuPF<sub>6</sub>, PhI(OAc)<sub>2</sub>/R<sub>10</sub>-NH<sub>2</sub>/MgO/Rh<sub>2</sub>(OAc)<sub>4</sub> u oxaziridinas (p. ej., éster *tert*-butílico del ácido 3-(4-cianofenil)oxaziridin-2-carboxílico).

Son de interés particular los métodos de iminación exentos de metales de sulfuros de fórmula II y/o sulfóxidos de fórmula III para preparar sulfiliminas de fórmula Ia (paso A) y/o sulfoximinas de fórmula Ib (paso A'). En tales reacciones de iminación participa R<sub>10</sub>-NH<sub>2</sub> y un oxidante, por ejemplo, PhI(OAc)<sub>2</sub>/R<sub>10</sub>-NH<sub>2</sub> según se describe en G.Y. Cho, C. Bolm, *Tetrahedron Lett.* 2005, 46, 8007-8008; o N-bromosuccinimida (NBS)/R<sub>10</sub>-NH<sub>2</sub> y una base tal como *tert*-butóxido de sodio o potasio según se describe en C. Bolm *et al.*, *Synthesis* 2010, N.º 17, 2922-2925. De forma alternativa, también se pueden utilizar oxidantes tales como N-yodosuccinimida (NIS) o yodo según se describe, por ejemplo, en O.G.

Manchero, C. Bolm, *Org. Lett.* 2007, 9, 3809-3811. En el documento WO2008/1060, se ha descrito un ejemplo de sales de tipo hipoclorito que se utilizan como oxidante, tales como hipoclorito de sodio NaOCl o hipoclorito de calcio Ca(OCl)<sub>2</sub>.

5 En la transformación de una sulfilimina Ia en una sulfoximina Ib (paso B), pueden participar reactivos clásicos de oxidación, por ejemplo, KMnO<sub>4</sub>, NaMnO<sub>4</sub>, mCPBA, NaIO<sub>4</sub>/RuO<sub>2</sub>, NaIO<sub>4</sub>/RuCl<sub>3</sub>, H<sub>2</sub>O<sub>2</sub>, oxone. En particular, el uso de sales de rutenio combinadas con peryodatos de metales alcalinos y, como alternativa, el uso de permanganatos de metales alcalinos se ha descrito en los documentos WO2008/097235 y WO2008/106006.

10 Las condiciones de preparación detalladas útiles para la síntesis de tales compuestos de tipo sulfilimina y/o sulfoximina de fórmula Ia y Ib, respectivamente, también se proporcionan, por ejemplo, en el documento WO2006/061200 o WO 2007/080131.

15 Los compuestos de tipo sulfuro de fórmula II y los compuestos de tipo sulfóxido de fórmula III, donde R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se han definido anteriormente, se pueden preparar de acuerdo con los métodos descritos en el documento WO 2013/018928.

20 Un compuesto de fórmula I, donde R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se han definido anteriormente y donde R<sub>10</sub> es CN, se puede transformar en un compuesto de fórmula I, donde R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se han definido anteriormente y donde R<sub>10</sub> es C(O)CF<sub>3</sub>, mediante el tratamiento con anhídrido trifluoroacético en un disolvente tal como diclorometano según se describe, por ejemplo, en O.G. Manchero, C. Bolm, *Org. Lett.* 2007, 9, 3809-3811.

25 Un compuesto de fórmula I, donde R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se han definido anteriormente y donde R<sub>10</sub> es C(O)CF<sub>3</sub>, se puede transformar en un compuesto de fórmula I, donde R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se han definido anteriormente y donde R<sub>10</sub> es hidrógeno, mediante el tratamiento con una base tal como carbonato de sodio o potasio en un disolvente polar prótico tal como metanol o etanol según se describe, por ejemplo, en H. Okamura, C. Bolm, *Org. Lett.* 2004, 6, 1305-1307.

30 Un compuesto de fórmula I, donde R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se han definido anteriormente y donde X es S(O)=N-R<sub>10</sub> donde R<sub>10</sub> es C(O)NH<sub>2</sub>, se puede preparar a partir de un compuesto de fórmula I, donde R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se han definido anteriormente y donde X es S(O)=N-R<sub>10</sub> donde R<sub>10</sub> es CN, mediante el tratamiento con un ácido fuerte tal como ácido sulfúrico concentrado en un disolvente orgánico tal como acetonitrilo según se describe, por ejemplo, en el documento WO09/111309.

35 Un compuesto de fórmula I, donde R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se han definido anteriormente y donde X es S(O)=N-R<sub>10</sub> donde R<sub>10</sub> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, se puede preparar a partir de un compuesto de fórmula I, donde R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se han definido anteriormente y donde X es S(O)=N-R<sub>10</sub> donde R<sub>10</sub> es hidrógeno, mediante el tratamiento con un agente alquilante de fórmula LG-R<sub>10</sub>, 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 dimetilsulfato), 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 tetrahydrofurano, éter dimetilico del etilenglicol (1,2-dimetoxietano), 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.

40 Un compuesto de fórmula I, donde R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se han definido anteriormente y donde X es S(O)=N-R<sub>10</sub> donde R<sub>10</sub> es C(O)R<sub>26</sub> y R<sub>26</sub> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, se puede preparar a partir de un compuesto de fórmula I, donde R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se han definido anteriormente y donde X es S(O)=N-R<sub>10</sub> donde R<sub>10</sub> es hidrógeno, mediante el tratamiento con un reactivo de fórmula LG<sub>1</sub>-C(O)R<sub>26</sub> o un reactivo de tipo anhídrido de fórmula R<sub>26</sub>C(O)-O-C(O)R<sub>26</sub>, donde R<sub>26</sub> es como se ha definido anteriormente y 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 tetrahydrofurano, éter dimetilico 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. La reacción se puede llevar a cabo en presencia de un exceso de base, que también puede actuar entonces como disolvente o diluyente.

50 Un compuesto de fórmula I, donde R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se han definido anteriormente y donde X es S(O)=N-R<sub>10</sub> donde R<sub>10</sub> es C(O)OR<sub>27</sub> y R<sub>27</sub> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, se puede preparar a partir de un compuesto de fórmula I, donde R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se han definido anteriormente y donde X es S(O)=N-R<sub>10</sub> donde R<sub>10</sub> es hidrógeno, mediante el tratamiento con un reactivo de fórmula LG<sub>2</sub>-C(O)OR<sub>27</sub>, donde R<sub>27</sub> es como se ha definido anteriormente y LG<sub>2</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. La reacción se puede llevar a cabo en presencia de un exceso de base, que también puede actuar entonces como disolvente o diluyente.

Un compuesto de fórmula I, donde R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se han definido anteriormente y donde X es S(O)=N-R<sub>10</sub> donde R<sub>10</sub> es CONR<sub>28</sub>R<sub>29</sub> y R<sub>28</sub>, R<sub>29</sub>, independientemente el uno del otro, son alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, se puede preparar a partir de un compuesto de fórmula I, donde R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se han definido anteriormente y donde X es S(O)=N-R<sub>10</sub> donde R<sub>10</sub> es hidrógeno, mediante el tratamiento con un reactivo de fórmula LG<sub>3</sub>-C(O)NR<sub>28</sub>R<sub>29</sub>, donde R<sub>28</sub> y R<sub>29</sub> son como se han definido anteriormente y LG<sub>3</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. La reacción se puede llevar a cabo en presencia de un exceso de base, que también puede actuar entonces como disolvente o diluyente.

Un compuesto de fórmula I, donde R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se han definido anteriormente y donde X es S(O)=N-R<sub>10</sub> donde R<sub>10</sub> es SO<sub>2</sub>R<sub>30</sub> y R<sub>30</sub> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, se puede preparar a partir de un compuesto de fórmula I, donde R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se han definido anteriormente y donde X es S(O)=N-R<sub>10</sub> donde R<sub>10</sub> es hidrógeno, mediante el tratamiento con un reactivo de fórmula LG<sub>4</sub>-SO<sub>2</sub>R<sub>30</sub>, donde R<sub>30</sub> es como se ha definido anteriormente y LG<sub>4</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. La reacción se puede llevar a cabo en presencia de un exceso de base, que también puede actuar entonces como disolvente o diluyente.

Un compuesto de fórmula I, donde R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se han definido anteriormente y donde X es S(O)=N-R<sub>10</sub> donde R<sub>10</sub> es C(O)R<sub>26</sub> y R<sub>26</sub> es hidrógeno, se puede preparar a partir de un compuesto de fórmula I, donde R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se han definido anteriormente y donde X es S(O)=N-R<sub>10</sub> donde R<sub>10</sub> es hidrógeno, mediante el tratamiento con un ortoformiato de trialquilo tal como ortoformiato de trimetilo, opcionalmente en presencia de un activador ácido tal como el ácido *para*-toluenosulfónico, opcionalmente en presencia de un disolvente orgánico inerte y a temperaturas comprendidas entre 0 y 180 °C. La reacción se puede llevar a cabo en presencia de un exceso de ortoformiato de trialquilo, que también puede actuar entonces como disolvente o diluyente. Un proceso de este tipo se ilustra, por ejemplo, en el documento WO 2006/037945.

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, amido de sodio, metóxido de sodio, acetato de sodio, carbonato de sodio, *tert*-butóxido de potasio, hidróxido de potasio, carbonato de potasio, hidruro de potasio, diisopropilamido de litio, bis(trimetilsilil)amido 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*. Por lo tanto, 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 I libres, 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 mezcla de  
25 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  
35 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.

40 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.

45 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  
50 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 proporcionar los diastereómeros, de donde puede liberarse  
55 el enantiómero deseado por acción de agentes adecuados, por ejemplo, agentes básicos.

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  
60 materiales de partida que tengan una estereoquímica adecuada.

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.* **1989**, 32, 2561 o el documento WO  
65 2000/15615.

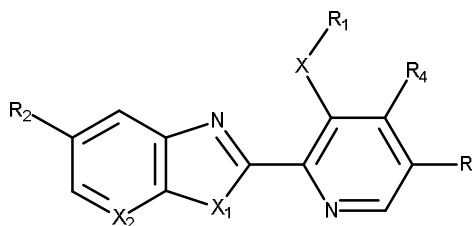


Es conveniente aislar o sintetizar en cada caso el isómero más eficaz biológicamente, por ejemplo, el enantiómero o diastereómero, o mezcla de isómeros, por ejemplo, mezcla de enantiómeros o mezcla de diastereómeros, si los componentes individuales tienen una actividad biológica diferente.

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 1-19 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.

Tabla 1: Esta tabla expone los 60 compuestos de 1.001 a 1.060 de fórmula I:



(I),

donde X es S=N-CN y R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se definen a continuación:

15 Tabla 1:

Comp. N.º	R	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>4</sub>	X <sub>1</sub>	X <sub>2</sub>
1.001	H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	N-CH <sub>3</sub>	N
1.002	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	N-CH <sub>3</sub>	N
1.003	H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	N-CH <sub>3</sub>	N
1.004	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	N-CH <sub>3</sub>	N
1.005	H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	OCF <sub>3</sub>	H	N-CH <sub>3</sub>	N
1.006	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	OCF <sub>3</sub>	H	N-CH <sub>3</sub>	N
1.007	H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	SCF <sub>3</sub>	H	N-CH <sub>3</sub>	N
1.008	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	SCF <sub>3</sub>	H	N-CH <sub>3</sub>	N
1.009	H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	S(O) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	N-CH <sub>3</sub>	N
1.010	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	S(O) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	N-CH <sub>3</sub>	N
1.011	H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	S	N
1.012	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	S	N
1.013	H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	S	N
1.014	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	S	N
1.015	H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	OCF <sub>3</sub>	H	S	N
1.016	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	OCF <sub>3</sub>	H	S	N
1.017	H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	SCF <sub>3</sub>	H	S	N
1.018	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	SCF <sub>3</sub>	H	S	N
1.019	H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	S(O) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	S	N
1.020	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	S(O) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	S	N
1.021	H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	O	N
1.022	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	O	N
1.023	H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	O	N
1.024	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	O	N
1.025	H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	OCF <sub>3</sub>	H	O	N
1.026	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	OCF <sub>3</sub>	H	O	N
1.027	H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	SCF <sub>3</sub>	H	O	N
1.028	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	SCF <sub>3</sub>	H	O	N
1.029	H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	S(O) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	O	N
1.030	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	S(O) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	O	N
1.031	H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	N-CH <sub>3</sub>	CH
1.032	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	N-CH <sub>3</sub>	CH
1.033	H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	N-CH <sub>3</sub>	CH
1.034	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	N-CH <sub>3</sub>	CH
1.035	H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	OCF <sub>3</sub>	H	N-CH <sub>3</sub>	CH
1.036	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	OCF <sub>3</sub>	H	N-CH <sub>3</sub>	CH
1.037	H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	SCF <sub>3</sub>	H	N-CH <sub>3</sub>	CH
1.038	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	SCF <sub>3</sub>	H	N-CH <sub>3</sub>	CH

Comp. N.º	R	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>4</sub>	X <sub>1</sub>	X <sub>2</sub>
1.039	H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	S(O) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	N-CH <sub>3</sub>	CH
1.040	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	S(O) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	N-CH <sub>3</sub>	CH
1.041	H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	S	CH
1.042	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	S	CH
1.043	H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	S	CH
1.044	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	S	CH
1.045	H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	OCF <sub>3</sub>	H	S	CH
1.046	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	OCF <sub>3</sub>	H	S	CH
1.047	H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	SCF <sub>3</sub>	H	S	CH
1.048	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	SCF <sub>3</sub>	H	S	CH
1.049	H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	S(O) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	S	CH
1.050	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	S(O) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	S	CH
1.051	H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	O	CH
1.052	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	O	CH
1.053	H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	O	CH
1.054	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	O	CH
1.055	H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	OCF <sub>3</sub>	H	O	CH
1.056	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	OCF <sub>3</sub>	H	O	CH
1.057	H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	SCF <sub>3</sub>	H	O	CH
1.058	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	SCF <sub>3</sub>	H	O	CH
1.059	H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	S(O) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	O	CH
1.060	CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	S(O) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	O	CH

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

- 5 Tabla 2: Esta tabla expone los 60 compuestos de 2.001 a 2.060 de fórmula I, donde X es S=N-C(O)CF<sub>3</sub> y R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se definen en la Tabla 1.
- Tabla 3: Esta tabla expone los 60 compuestos de 3.001 a 3.060 de fórmula I, donde X es S=N-H y R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se definen en la Tabla 1.
- 10 Tabla 4: Esta tabla expone los 60 compuestos de 4.001 a 4.060 de fórmula I, donde X es S(O)=N-CN y R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se definen en la Tabla 1.
- Tabla 5: Esta tabla expone los 60 compuestos de 5.001 a 5.060 de fórmula I, donde X es S(O)=N-C(O)CF<sub>3</sub> y R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se definen en la Tabla 1.
- 15 Tabla 6: Esta tabla expone los 60 compuestos de 6.001 a 6.060 de fórmula I, donde X es S(O)=N-H y R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se definen en la Tabla 1.
- Tabla 7: Esta tabla expone los 60 compuestos de 7.001 a 7.060 de fórmula I, donde X es S(O)=N-C(O)NH<sub>2</sub> y R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se definen en la Tabla 1.
- 20 Tabla 8: Esta tabla expone los 60 compuestos de 8.001 a 8.060 de fórmula I, donde X es S(O)=N-C(O)NHCH<sub>3</sub> y R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se definen en la Tabla 1.
- Tabla 9: Esta tabla expone los 60 compuestos de 9.001 a 9.060 de fórmula I, donde X es S(O)=N-C(O)N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> y R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se definen en la Tabla 1.
- 25 Tabla 10: Esta tabla expone los 60 compuestos de 10.001 a 10.060 de fórmula I, donde X es S(O)=N-CH<sub>3</sub> y R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se definen en la Tabla 1.
- 30 Tabla 11: Esta tabla expone los 60 compuestos de 11.001 a 11.060 de fórmula I, donde X es S(O)=N-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> y R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se definen en la Tabla 1.

- Tabla 12: Esta tabla expone los 60 compuestos de 12.001 a 12.060 de fórmula I, donde X es S(O)=N-C(O)CH<sub>3</sub> y R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se definen en la Tabla 1.
- 5 Tabla 13: Esta tabla expone los 60 compuestos de 13.001 a 13.060 de fórmula I, donde X es S(O)=N-C(O)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> y R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se definen en la Tabla 1.
- Tabla 14: Esta tabla expone los 60 compuestos de 14.001 a 14.060 de fórmula I, donde X es S(O)=N-C(O)OCH<sub>3</sub> y R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se definen en la Tabla 1.
- 10 Tabla 15: Esta tabla expone los 60 compuestos de 15.001 a 15.060 de fórmula I, donde X es S(O)=N-C(O)OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> y R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se definen en la Tabla 1.
- Tabla 16: Esta tabla expone los 60 compuestos de 16.001 a 16.060 de fórmula I, donde X es S(O)=N-C(O)H y R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se definen en la Tabla 1.
- 15 Tabla 17: Esta tabla expone los 60 compuestos de 17.001 a 17.060 de fórmula I, donde X es S(O)=N-SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> y R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se definen en la Tabla 1.
- Tabla 18: Esta tabla expone los 60 compuestos de 18.001 a 18.060 de fórmula I, donde X es S(O)=N-SO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> y R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se definen en la Tabla 1.
- 20 Tabla 19: Esta tabla expone los 60 compuestos de 19.001 a 19.060 de fórmula I, donde X es S(O)=N-C(S)NH<sub>2</sub> y R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, X<sub>1</sub> y X<sub>2</sub> son como se definen en la Tabla 1.
- 25 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 ingredientes activos de acuerdo con la invención puede manifestarse directamente, es decir, en la destrucción de las plagas, la cual se produce inmediatamente o poco tiempo después, por ejemplo, durante la ecdisis, o indirectamente, por ejemplo, en una tasa reducida de oviposición y/o eclosión, correspondiendo una actividad satisfactoria a una tasa de destrucción (mortalidad) de al menos un 50%.
- 30
- 35 Los compuestos de fórmula I se pueden utilizar para combatir y controlar infestaciones de plagas de insectos tales como lepidópteros, dípteros, hemípteros, tisanópteros, ortópteros, dictiópteros, coleópteros, sifonápteros, himenópteros e isópteros, y también otras plagas de invertebrados, por ejemplo, plagas de acáridos, nematodos y moluscos. En lo sucesivo en el presente documento, se hace referencia de forma colectiva a insectos, acáridos, nematodos y moluscos como plagas. Las plagas que pueden combatirse y controlarse mediante el uso de los compuestos de la invención incluyen las plagas asociadas con la agricultura (dicho término incluye el cultivo de cosechas para productos alimenticios y de fibras), horticultura y cría de animales, animales de compañía, forestación y almacenamiento de productos de origen vegetal (tales como frutas, granos y madera); las plagas asociadas con los daños de las estructuras fabricadas por el hombre y la transmisión de enfermedades del hombre y los animales; y también plagas molestas (tales como moscas).
- 40
- 45 Los ejemplos de especies de plagas que se pueden controlar con los compuestos de fórmula I incluyen: *Myzus persicae* (áfido), *Aphis gossypii* (áfido), *Aphis fabae* (áfido), *Lygus* spp. (miridos), *Dysdercus* spp. (miridos), *Nilaparvata lugens* (fulgoromorfo), *Nephotettix incticeps* (cicadélido), *Nezara* spp. (pentatómidos), *Euschistus* spp. (pentatómidos), *Leptocorisa* spp. (pentatómidos), *Frankliniella occidentalis* (tisanóptero), *Thrips* spp. (tisanópteros), *Leptinotarsa decemlineata* (escarabajo de la patata de Colorado), *Anthonomus grandis* (gorgojo del algodón), *Aonidiella* spp. (cocoideos), *Trialeurodes* spp. (aleuródidos), *Bemisia tabaci* (aleuródido), *Ostrinia nubilalis* (gusano barrenador del maíz europeo), *Spodoptera littoralis* (oruga de la hoja del algodón), *Heliothis virescens* (gusano cogollero del tabaco), *Helicoverpa armigera* (isoca bolillera), *Helicoverpa zea* (isoca bolillera), *Sylepta derogata* (gusano enrollador de la hoja del algodón), *Pieris brassicae* (mariposa blanca), *Plutella xylostella* (polilla de las coles), *Agrotis* spp. (gusanos cortadores), *Chilo suppressalis* (barrenador del tallo del arroz), *Locusta migratoria* (acridido), *Chortiocetes terminifera* (acridido), *Diabrotica* spp. (gusanos de la raíz del maíz), *Panonychus ulmi* (arañuela roja europea), *Panonychus citri* (arañuela roja de los cítricos), *Tetranychus urticae* (arañuela de las dos manchas), *Tetranychus cinnabarinus* (arañuela roja común), *Phyllocoptruta oleivora* (ácaro del tostado de los cítricos), *Polyphagotarsonemus latus* (ácaro blanco), *Brevipalpus* spp. (falsas arañuelas rojas), *Boophilus microplus* (garrapata del ganado bovino), *Dermacentor variabilis* (garrapata canina americana), *Ctenocephalides felis* (pulga felina), *Liriomyza* spp. (minador), *Musca domestica* (mosca común), *Aedes aegypti* (mosquito), *Anopheles* spp. (mosquitos), *Culex* spp. (mosquitos), *Lucilia* spp. (moscas azules), *Blattella germanica* (cucaracha), *Periplaneta americana* (cucaracha), *Blatta orientalis* (cucaracha), termitas de la familia *Mastotermitidae* (por ejemplo, *Mastotermes* spp.), *Kalotermitidae* (por ejemplo, *Neotermes* spp.), *Rhinotermitidae* (por ejemplo, *Coptotermes formosanus*, *Reticulitermes flavipes*, *R. speratu*, *R. virginicus*, *R. hesperus* y *R. santonensis*) y *Termitidae* (por ejemplo, *Globitermes sulphureus*), *Solenopsis geminata* (hormiga roja), *Monomorium pharaonis* (hormiga faraón), *Damalinia* spp. y *Linognathus* spp. (piojos malófagos y hematófagos), *Meloidogyne* spp. (nematodos
- 60
- 65

inductores de anguilulosis), *Globodera* spp. y *Heterodera* spp. (nematodos inductores de quistes), *Pratylenchus* spp. (nematodos inductores de lesiones), *Rhodopholus* spp. (nematodos barrenadores del platanero), *Tylenchulus* spp. (nematodos de los cítricos), *Haemonchus contortus* (gusano alambre), *Caenorhabditis elegans* (anguilula del vinagre), *Trichostrongylus* spp. (nematodos gastrointestinales) y *Deroceas reticulatum* (babosa).

5

Otros ejemplos de las plagas mencionadas anteriormente 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., *Polyphagotarsonne latus*, *Panonychus* spp., *Phyllocoptruta oleivora*, *Phytonemus* spp, *Polyphagotarsonemus* spp, *Psoroptes* spp., *Rhipicephalus* spp., *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., *Steneotarsonemus* spp, *Tarsonemus* spp. y *Tetranychus* spp.;

10

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

15

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*, *Orycaephilus* spp., *Otiorhynchus* spp., *Phyllophaga* spp, *Phlyctinus* spp., *Popillia* spp., *Psylliodes* spp., *Rhysomatus aubtilis*, *Rhizopertha* spp., *Scarabeidae*, *Sitophilus* spp., *Sitotroga* spp., *Somaticus* spp, *Sphenophorus* spp, *Sternechus subsignatus*, *Tenebrio* spp., *Tribolium* spp. y *Trogoderma* spp.;

20

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.;

25

del orden de los hemípteros, por ejemplo, *Acanthocoris scabrorator*, *Acrosternum* spp, *Adelphocoris lineolatus*, *Amblypelta nitida*, *Bathycoelia thalassina*, *Blissus* spp, *Cimex* spp., *Clavigralla tomentosicollis*, *Creontiades* spp, *Distantiella theobroma*, *Dichelops furcatus*, *Dysdercus* spp., *Edessa* spp, *Euchistus* spp., *Eurydema pulchrum*, *Eurygaster* spp., *Halyomorpha halys*, *Horcias nobilellus*, *Leptocoris* spp., *Lygus* spp, *Margarodes* spp, *Murgantia histrionic*, *Neomegalotomus* spp, *Nesidiocoris tenuis*, *Nezara* spp., *Nysius simulans*, *Oebalus insularis*, *Piesma* spp., *Piezodorus* spp, *Rhodnius* spp., *Sahlbergella singularis*, *Scaptocoris castanea*, *Scotinophara* spp. , *Thyanta* spp , *Triatoma* spp., *Vatiga illudens*; *Acyrtosium pisum*, *Adalges* spp, *Agalliana ensigera*, *Agonoscena targionii*, *Aleurodicus* spp, *Aleurocanthus* spp, *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus floccosus*, *Aleyrodes brassicae*, *Amarasca biguttula*, *Amritodus atkinsoni*, *Aonidiella* spp., *Aphididae*, *Aphis* spp., *Aspidiotus* spp., *Aulacorthum solani*, *Bactericera cockerelli*, *Bemisia* spp, *Brachycaudus* spp, *Brevicoryne brassicae*, *Cacopsylla* spp, *Cavariella aegopodii Scop.*, *Ceroplaster* spp., *Chrysomphalus aonidium*, *Chrysomphalus dictyospermi*, *Cicadella* spp, *Cofana spectra*, *Cryptomyzus* spp, *Cicadulina* spp, *Coccus hesperidum*, *Dalbulus maidis*, *Dialeurodes* spp, *Diaphorina citri*, *Diuraphis noxia*, *Dysaphis* spp, *Empoasca* spp., *Eriosoma larigerum*, *Erythroneura* spp., *Gascardia* spp., *Glycaspis brimblecombei*, *Hyadaphis pseudobrassicae*, *Hyalopterus* spp, *Hyperomyzus pallidus*, *Idioscopus clypealis*, *Jacobiasca lybica*, *Laodelphax* spp., *Lecanium corni*, *Lepidosaphes* spp., *Lopaphis erysimi*, *Lyogenys maidis*, *Macrosiphum* spp., *Mahanarva* spp, *Metcalfa pruinosa*, *Metopolophium dirhodum*, *Myndus crudus*, *Myzus* spp., *Neotoxoptera* spp, *Nephotettix* spp., *Nilaparvata* spp.,

35

*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*, *Quadraspidiotus* spp., *Quesada gigas*, *Recilia dorsalis*, *Rhopalosiphum* spp., *Saissetia* spp., *Scaphoideus* spp., *Schizaphis* spp., *Sitobion* spp., *Sogatella furcifera*, *Spissistilus festinus*, *Tarophagus Proserpina*, *Toxoptera* spp, *Trialeurodes* spp, *Tridiscus sporoboli*, *Trionymus* spp, *Trioza erytrae* , *Unaspis citri*, *Zygina flammigera*, *Zyginidia scutellaris*;

45

del orden de los heterópteros, for example, *Cimex* spp., *Distantiella theobroma*, *Dysdercus* spp., *Euchistus* spp., *Eurygaster* spp., *Leptocoris* spp., *Nezara* spp., *Piesma* spp., *Rhodnius* spp., *Sahlbergella singularis*, *Scotinophara* spp. y *Triatoma* spp.;

55

del orden de los homópteros, por ejemplo, *Aleurothrixus floccosus*, *Aleyrodes brassicae*, *Aonidiella* spp., *Aphididae*, *Aphis* spp., *Aspidiotus* spp., *Bemisia tabaci*, *Ceroplaster* spp., *Chrysomphalus aonidium*, *Chrysomphalus dictyospermi*, *Coccus hesperidum*, *Empoasca* spp., *Eriosoma larigerum*, *Erythroneura* spp., *Gascardia* spp., *Laodelphax* spp., *Lecanium corni*, *Lepidosaphes* spp., *Macrosiphum* spp., *Myzus* spp., *Nephotettix* spp., *Nilaparvata* spp., *Parlatoria* spp., *Pemphigus* spp., *Planococcus* spp., *Pseudaulacaspis* spp., *Pseudococcus* spp., *Psylla* spp., *Pulvinaria aethiopica*, *Quadraspidiotus* spp., *Rhopalosiphum* spp., *Saissetia* spp., *Scaphoideus* spp., *Schizaphis* spp., *Sitobion* spp., *Trialeurodes vaporariorum*, *Trioza erytrae* y *Unaspis citri*;

60

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.;

65

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

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*, *Heliopsis* spp., *Hellula undalis*, *Herpetogramma* spp., *Hyphantria cunea*, *Keiferia lycopersicella*, *Lasmopalpus lignosellus*, *Leucoptera scitella*, *Lithocollethis* 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., *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*, y *Yponomeuta* spp.;

del orden de los malófagos, por ejemplo, *Damalinea* spp. y *Trichodectes* spp.;

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

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. y

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

Los principios 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.

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 mandarinas; 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.

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 afiliter, 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 *Paratrachodorus*; 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*); *Helicella* (*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. canaticulata*); *Vallonia* y *Zanitoides*.

Debe entenderse que el término "cultivos" incluye también cultivos que han sido modificados para que sean tolerantes a herbicidas como bromoxinilo o clases de herbicidas (tales como, por ejemplo, inhibidores de HPPD, inhibidores de ALS, por ejemplo primisulfurón, prosulfurón y trifloxisulfurón, inhibidores de EPSPS (5-enol-pirovil-shikimato-3-fosfo-sintasa), inhibidores de GS (glutamina-sintetasa)) como resultado de métodos convencionales de reproducción o ingeniería genética. Un ejemplo de un cultivo que ha sido modificado para que sea tolerante a imidazolinonas, p. ej., imazamox, mediante métodos convencionales de cultivo selectivo (mutagénesis) es la colza de verano Clearfield® (canola). Los ejemplos de cultivos que han sido modificados para que sean tolerantes a herbicidas o clases de herbicidas mediante métodos de ingeniería genética incluyen las variedades de maíz resistentes a glifosato y glufosinato que se pueden adquirir de proveedores comerciales con las marcas registradas RoundupReady® y Libertilink®.

También 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 estas 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, por ejemplo, CryIA(b), CryIA(c), CryIF, CryIF(a2), CryIIA(b), CryIIIA, CryIIIB(b1) o Cry9c, o proteínas insecticidas vegetativas (VIP), por ejemplo, VIP1, VIP2, VIP3 o VIP3A; o proteínas insecticidas de nematodos que colonizan bacterias, por ejemplo, *Photorhabdus* spp. o *Xenorhabdus* spp., tales como *Photorhabdus luminescens*, *Xenorhabdus nematophilus*; toxinas producidas por animales tales como toxinas de escorpiones, toxinas de arácnidos, toxinas de avispas y otras neurotoxinas específicas de insectos; toxinas producidas por hongos tales como toxinas de *Streptomyces*, lectinas de plantas tales como lectinas de guisante, lectinas de cebada o lectinas de la campanilla de invierno; aglutininas; inhibidores de proteinasas tales como inhibidores de tripsina, inhibidores de serín proteasa, inhibidores de patatina, cistatina, papaína; proteínas que desactivan ribosomas (RIP) tales como ricina, RIP del maíz, abrina, lufina, saporina o briodina; enzimas que participan en el metabolismo de esteroides tales como 3-hidroxiesteroide-oxidasa, ecdiesteroide-UDP-glicosil-transferasa, colesterol-oxidasa, inhibidores de ecdisona, HMG-COA-reductasa, bloqueadores de canales iónicos tales como bloqueadores de canales de sodio o calcio, esterasa de la hormona juvenil, receptores de hormonas diuréticas, estilbeno-sintasa, bibencil-sintasa, quitinasas y glucanasas.

En el contexto de la presente invención, por  $\delta$ -endotoxinas se entenderá, por ejemplo, CryIA(b), CryIA(c), CryIF, CryIF(a2), CryIIA(b), CryIIIA, CryIIIB(b1) o Cry9c, o proteínas insecticidas vegetativas (VIP), por ejemplo, VIP1, VIP2, VIP3 o VIP3A, también expresamente 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). Las toxinas truncadas, por ejemplo, una toxina CryIA(b) truncada, son conocidas. 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 CryIIIA055, en el que una secuencia de reconocimiento de catepsina-D se inserta en una toxina CryIIIA (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.

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 de forma habitual pertenecen especialmente al grupo de los escarabajos (coleópteros), insectos con dos alas (dípteros) y mariposas (lepidópteros).

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 CryIA(b)); YieldGard Rootworm® (variedad de maíz que expresa una toxina CryIIIB(b1)); YieldGard Plus® (variedad de maíz que expresa una toxina CryIA(b) y CryIIIB(b1)); Starlink® (variedad de maíz que expresa una toxina Cry9(c)); Herculex I® (variedad de maíz que expresa una toxina CryIF(a2) y la enzima fosfinotricina-N-acetiltransferasa (PAT) para lograr tolerancia al herbicida glufosinato

de amonio); NuCOTN 33B® (variedad de algodón que expresa una toxina CryIA(c)); Bollgard I® (variedad de algodón que expresa una toxina CryIA(c)); Bollgard II® (variedad de algodón que expresa una toxina CryIA(c) y una toxina CryIIA(b)); VIPCOT® (variedad de algodón que expresa una toxina VIP); NewLeaf® (variedad de patata que expresa una toxina CryIIIA); NatureGard® Agrisure® GT Advantage (rasgo tolerante al glifosato GA21), Agrisure® CB Advantage (rasgo de gusano barrenador del maíz (CB) Bt11) y Protecta®.

Otros ejemplos de tales cultivos transgénicos son:

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

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

20 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 genéticamente para que sea resistente a insectos mediante la expresión transgénica de una toxina CryIIIA modificada. Esta toxina es Cry3A055 modificada mediante la inserción de una secuencia de reconocimiento de la proteasa catepsina D. La preparación de estas plantas de maíz transgénicas se describe en el documento WO 03/018810.

4. Maíz MON 863 de Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Bruselas, Bélgica, número de registro C/DE/02/9. MON 863 expresa una toxina CryIIIB(b1) y presenta resistencia a ciertos insectos coleópteros.

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

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

40 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 CryIA(b) obtenida de *Bacillus thuringiensis subsp. Kurstaki*, la cual proporciona tolerancia a ciertos lepidópteros, incluido el gusano barrenador del maíz europeo.

45 También se describen cultivos transgénicos de plantas resistentes a los insectos en el Informe del BATS (Zentrum für Biosicherheit und Nachhaltigkeit, Zentrum BATS, Clarastrasse 13, 4058 Basilea, Suiza) de 2003.

50 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.

55 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).

Los cultivos también se pueden modificar para que tengan una resistencia mejorada a patógenos fúngicos (por ejemplo, *Fusarium*, *Anthraxnose* o *Phytophthora*), bacterianos (por ejemplo, *Pseudomonas*) o víricos (por ejemplo, virus del enrollamiento de la hoja de la patata, virus del marchitamiento con manchas del tomate, virus del mosaico del pepino).

5 Los cultivos también incluyen aquellos que presentan una resistencia mejorada frente a nematodos tales como el nematodo que induce quistes en la soja.

10 Los cultivos que son tolerantes al estrés abiótico incluyen aquellos que tienen tolerancia mejorada a la sequía, alto contenido de sal, alta temperatura, frío, helada o radiación de luz, por ejemplo, a través de la expresión de NF-YB u otras proteínas conocidas en la técnica.

15 Los cultivos que exhiben calidad o rendimiento mejorado incluyen aquellos con floración mejorada o propiedades de maduración del fruto mejoradas (tales como maduración ralentizada); contenido modificado de aceite, almidón, aminoácidos, ácidos grasos, vitaminas, componentes fenólicos u otro contenido (tal como la variedad de soja Vistive™); utilización de nutrientes mejorada (tal como asimilación de nitrógeno mejorada); y calidad del producto de la planta mejorada (tal como mejor calidad de la fibra de algodón).

20 Otras áreas de uso de los compuestos y 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
Buprestidos	<i>Agilus planipennis</i>	Fresno
Cerambíidos	<i>Anoploa 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 naturales importantes desde un punto de vista económico.



ES 2 638 504 T3

Familia	Especie	Hospedador o cultivo infestado
Bupréstidos	<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, 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, Sicamoro, Sauce, Álamo amarillo	
Cerambísidos	<i>Goes pulverulentus</i>	Haya, Olmo, Roble de Nuttall, Sauce, Roble negro, Roble de corteza de cerezo, Roble de agua, Sicamoro
	<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, 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, Sicamoro, 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 pruinosus</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, Albaricoque, Almendra, Cereza negra
	<i>Synanthedon pictipes</i>	Melocotón, Ciruela, Cereza, Haya, Cereza negra

Familia	Especie	Hospedador o cultivo infestado
	<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

En el sector de la higiene, los compuestos y las composiciones de acuerdo con la invención son activos 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.

5

Algunos ejemplos de dichos parásitos son:

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

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

15 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..

20 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..

25 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 Meso-stigmata, por ejemplo, *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., *Ixodes* spp., *Amblyomma* spp., *Boophilus* spp., *Dermacentor* spp., *Haemophysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Rhipicephalus* spp., *Dermanyssus* spp., *Railletia* spp., *Pneumonyssus* spp., *Sternostoma* spp. y *Varroa* spp..

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

35 Los compuestos y las composiciones de acuerdo con la invención son también adecuados para la protección contra la infestación de insectos en el caso de materiales tales como madera, textiles, plásticos, adhesivos, pegamentos, pinturas, papel y cartulina, cuero, revestimientos de pisos y edificios.

40 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., *Apato monachus*, *Bostrychus capucins*, *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*, *Cryptotermes brevis*, *Heterotermes indicola*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes santonensis*, *Reticulitermes lucifugus*, *Mastotermes darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis* y *Coptotermes formosanus* y tisanuros tales como *Lepisma saccharina*.

50 La presente invención, por lo tanto, proporciona una composición insecticida, acaricida, nematocida o molusquicida, preferentemente una composición insecticida o acaricida, que comprende una cantidad eficaz como insecticida, acaricida, nematocida o molusquicida de un compuesto de fórmula I y un portador o diluyente adecuado para este.

55 En un aspecto adicional, la invención proporciona un método para combatir y controlar plagas que comprende aplicar una cantidad eficaz como insecticida, acaricida, nematocida o molusquicida, preferentemente una cantidad eficaz como insecticida y acaricida de un compuesto de fórmula I o una composición que comprende un compuesto de fórmula I, a una plaga, un emplazamiento de una plaga o a una planta susceptible de ser atacada por una plaga, con excepción de

un método para el tratamiento del cuerpo humano o animal mediante cirugía o terapia y métodos de diagnóstico realizados en el cuerpo humano o animal.

Los compuestos de fórmula I se utilizan preferentemente contra insectos o acáridos.

El término "planta", tal como se utiliza en la presente, incluye plántulas, arbustos y árboles.

La invención también se refiere a una composición pesticida que, además de comprender el compuesto de fórmula I, comprende adyuvantes de formulación.

Por lo tanto, la invención también se refiere a composiciones pesticidas tales como concentrados emulsionables, concentrados en suspensión, 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.

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).

Algunos ejemplos de disolventes adecuados son: hidrocarburos aromáticos no hidrogenados o parcialmente hidrogenados, preferentemente las fracciones de C8 a C12 de alquilbencenos, tales como mezclas de xileno, naftalenos alquilados o tetrahidronaftaleno, hidrocarburos alifáticos o cicloalifáticos, tales como parafinas o ciclohexano, alcoholes tales como etanol, propanol o butanol, glicoles y sus éteres y ésteres tales como propilenglicol, éter dipropilenglicólico, etilenglicol o éter 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.

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 particulados adecuados para gránulos son de tipo poroso, tal como pumita, ladrillo roto, sepiolita o bentonita, y los materiales portadores no absorbentes adecuados son calcita o arena. Además, pueden utilizarse un gran número de materiales granulados de naturaleza orgánica o inorgánica, en particular dolomita o residuos vegetales pulverizados.

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.

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. Los ejemplos de alquilarilsulfonatos son las sales sódicas, cálcicas o trietanolamónicas del ácido decilbencenosulfónico, ácido dibutilnaftalenosulfónico, o de un condensado de ácido naftalenosulfónico y 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. Otros fosfatos adecuados son tris-ésteres de ácido fosfórico con alcoholes alifáticos o aromáticos y/o bis-ésteres de ácidos fosfónicos de alquilo con alcoholes alifáticos o aromáticos, que son un adyuvante de tipo oleoso de alto rendimiento. Estos tris-ésteres se han descrito, por ejemplo, en el documento WO 01/47356, WO 00/56146, EP-A-0579052 o EP-A-1018299 o se pueden adquirir de proveedores comerciales con su nombre químico. Los tris-ésteres de ácido fosfórico preferidos para su uso en las nuevas composiciones son fosfato de tris(2-etilhexilo), fosfato de tris(*n*-octilo) y fosfato de tris(butoxietilo), donde el fosfato de tris(2-etilhexilo) es el más preferido. Algunos bis-ésteres de ácidos alquilfosfónicos adecuados son 2-etilhexilfosfonato de bis(2-etilhexilo), *n*-octilfosfonato de bis(2-etilhexilo), butilfosfonato de dibutilo, y tripropilfosfonato de bis(2-etilhexilo), donde el *n*-octilfosfonato de bis(2-etilhexilo) se prefiere de forma particular.

Las composiciones de acuerdo con la invención pueden incluir además preferentemente un aditivo que comprenda un aceite de origen animal o vegetal, un aceite mineral, ésteres alquílicos de tales aceites o mezclas de tales aceites y derivados oleosos. La cantidad de aditivo oleoso utilizada en la composición de acuerdo con la invención está comprendida generalmente entre un 0.01 y un 10%, respecto a la mezcla de pulverización. Por ejemplo, el aditivo oleoso se puede añadir a un tanque de pulverización con la concentración deseada después de haber preparado la mezcla de pulverización. Los aditivos oleosos preferidos comprenden aceites minerales o un aceite de origen vegetal, por ejemplo, aceite de colza tal como ADIGOR® y MERO®, aceite de oliva o aceite de girasol, aceite vegetal emulsionado tal como AMIGO® (Rhône-Poulenc Canada Inc.), ésteres alquílicos de aceites de origen vegetal, por ejemplo, derivados metílicos, o un aceite de origen animal tal como aceite de pescado o sebo bovino. Un aditivo preferido contiene, por ejemplo, como componentes activos esencialmente un 80% en peso de ésteres alquílicos de aceites de pescado y un 15% en peso de aceite de colza metilado, y también un 5% en peso de emulsionantes y modificadores del pH habituales. Los aditivos oleosos especialmente preferidos comprenden ésteres alquílicos de ácidos grasos C<sub>8</sub>-C<sub>22</sub>, siendo especialmente importantes los derivados metílicos de ácidos grasos C<sub>12</sub>-C<sub>18</sub>, por ejemplo, los ésteres metílicos del ácido láurico, ácido palmítico y ácido oleico. Estos ésteres se conocen como laurato de metilo (CAS-111-82-0), palmitato de metilo (CAS-112-39-0) y oleato de metilo (CAS-112-62-9). Un derivado de tipo éster metílico de ácido graso preferido es Emery® 2230 y 2231 (Cognis GmbH). Estos y otros derivados oleosos también se describen en el *Compendium of Herbicide Adjuvants*, 5.<sup>a</sup> edición, Universidad del Sur de Illinois, 2000. Además, los ácidos grasos alcoxilados se pueden utilizar como aditivos en las composiciones de la invención así como aditivos basados en polimetilsiloxano, que se han descrito en el documento WO 2008/037373.

La aplicación y acción de los aditivos oleosos se pueden mejorar adicionalmente combinándolos con sustancias tensioactivas tales como surfactantes no iónicos, aniónicos o catiónicos. En las páginas 7 y 8 del documento WO 97/34485 se enumeran ejemplos de surfactantes aniónicos, no iónicos y catiónicos adecuados. Las sustancias tensioactivas preferidas son surfactantes aniónicos del tipo dodecilsulfonato, especialmente sus sales de calcio, y también surfactantes no iónicos del tipo alcohol graso etoxilado. Se prefieren especialmente los alcoholes grasos C<sub>12</sub>-C<sub>22</sub> etoxilados con un grado de etoxilación comprendido entre 5 y 40. Algunos ejemplos de surfactantes que se pueden adquirir de proveedores comerciales son los de tipo Genapol (Clariant AG). También se prefieren los surfactantes de silicona, especialmente heptametiltrisiloxanos modificados con óxido de polialquilo, los cuales se pueden adquirir de proveedores comerciales, p. ej., como Silwet L-77®, y también surfactantes perfluorados. La concentración de sustancias tensioactivas en relación con el aditivo total está comprendida generalmente entre un 1 y un 30% en peso. Algunos ejemplos de aditivos oleosos constituidos por mezclas de aceites o aceites minerales o derivados de estos con surfactantes son Edenor ME SU®, Turbocharge® (Syngenta AG, CH) y Actipron® (BP Oil UK Limited, RU).

Dichas sustancias tensioactivas también se pueden emplear en las formulaciones solas, es decir, sin aditivos oleosos.

Además, la adición de un disolvente orgánico a la mezcla de aditivo oleoso/surfactante puede contribuir a una mejora adicional de la acción. Algunos disolventes adecuados son, por ejemplo, Solvesso® (ESSO) y Aromatic Solvent® (Exxon Corporation). La concentración de tales disolventes puede estar comprendida entre un 10 y un 80% en peso del peso total. Tales aditivos oleosos, que pueden estar mezclados con disolventes, se describen, por ejemplo, en el documento US-A-4 834 908. Un aditivo oleoso que se puede adquirir de proveedores comerciales descrito en el citado

documento se conoce con el nombre de MERGE® (BASF Corporation). Otro aditivo oleoso que se prefiere de acuerdo con la invención es SCORE® (Syngenta Crop Protection Canada).

Además de los aditivos oleosos enumerados anteriormente, para mejorar la actividad de las composiciones de acuerdo con la invención también es posible añadir formulaciones de alquilpirrolidonas (p. ej., Agrimax®) a la mezcla de pulverización. También se pueden utilizar formulaciones de estructuras sintéticas tales como, por ejemplo, poliacrilamida, compuestos de polivinilo o poli-1-p-menteno (p. ej., Bond®, Courier® o Emerald®). También se pueden mezclar soluciones que contienen ácido propiónico, por ejemplo, Eurogkem Pen-e-trate®, en la mezcla de pulverización como agentes potenciadores de la actividad.

La expresión "principio activo" se refiere a uno de los compuestos de fórmula I, especialmente los compuestos de fórmula I expuestos específicamente en las tablas. También se refiere a las mezclas del compuesto de fórmula I, en particular un compuesto seleccionado a partir de dicha Tabla 1, con otros insecticidas, fungicidas, herbicidas, protectores, adyuvantes y similares, cuyas mezclas se exponen específicamente más adelante.

Las composiciones pueden comprender también otros auxiliares sólidos o líquidos, tales como estabilizantes, por ejemplo, aceites vegetales epoxidados o no epoxidados (por ejemplo, aceite de coco, de canola o de soja epoxidado), antiespumantes, por ejemplo, aceite de silicona, conservantes, reguladores de la viscosidad, aglutinantes y/o espesantes; fertilizantes, en particular fertilizantes que contengan nitrógeno tales como nitratos de amonio y urea según se describe en el documento WO 2008/017388, que puede mejorar la eficacia de los compuestos de la invención; u otros principios activos para lograr efectos específicos, por ejemplo, sales de amonio o fosfonio, en particular haluros, (hidrogeno)sulfatos, nitratos, (hidrogeno)carbonatos, citratos, tartratos, formiatos y acetatos, según se describe en los documentos WO 2007/068427 y WO 2007/068428, que pueden también mejorar la eficacia de los compuestos de la invención y que pueden utilizarse combinados con potenciadores de la penetración tales como ácidos grasos alcoxilados; bactericidas, fungicidas, nematocidas, activadores de plantas, molusquicidas o herbicidas.

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).

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.

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.

Las composiciones de acuerdo con la invención también son adecuadas para proteger el material de propagación vegetal, por ejemplo, semillas tales como frutos, tubérculos o granos, o plantas de vivero, contra las plagas del tipo mencionado anteriormente. El material de propagación se puede tratar con las composiciones antes de plantarlo, por ejemplo, se pueden tratar las semillas antes de sembrarlas. Como alternativa, las composiciones se pueden aplicar a los granos de las semillas (recubrimiento), ya sea empapando los granos en una composición líquida o aplicando una capa de una composición sólida. También es posible aplicar las composiciones cuando el material de propagación se planta en el sitio de aplicación, por ejemplo, en el surco para la semilla durante la perforación. Estos métodos de tratamiento para material de propagación vegetal y el material de propagación vegetal que comprende un compuesto de fórmula (I) según se ha definido anteriormente son otros objetos de la invención.

Otros métodos de aplicación de las composiciones de acuerdo con la invención comprenden la aplicación por goteo al suelo, la inmersión de partes de plantas tales como bulbos de raíz o tubérculos, el empapado del suelo, así como la inyección al suelo. Estos métodos son conocidos en la técnica.

Para aplicar un compuesto de fórmula I como insecticida, acaricida, nematocida o molusquicida a una plaga, a un emplazamiento de una plaga o a una planta susceptible de ser atacada por una plaga, el compuesto de fórmula I generalmente se formula en una composición que incluye, además del compuesto de fórmula I, un diluyente o portador inerte adecuado y, opcionalmente, un adyuvante de formulación en forma de agente tensioactivo (AT), según se describe en la presente o, por ejemplo, en el documento EP-B-1062217. Los AT son compuestos químicos capaces de modificar las propiedades de una interfase (por ejemplo, interfases de líquido/sólido, líquido/aire o líquido/líquido)

reduciendo la tensión interfacial y, de este modo, provocan cambios en otras propiedades (por ejemplo, dispersión, emulsificación y humectación).

5 Por regla general, las composiciones comprenden de un 0.1 a un 99%, especialmente de un 0.1 a un 95%, del principio activo de fórmula 1 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.

10 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.

15 Cuando se utiliza en un revestimiento de semillas, un compuesto de fórmula I se utiliza con una tasa de 0.0001 g a 10 g (por ejemplo, 0.001 g o 0.05 g), preferentemente de 0.005 g a 10 g, más preferentemente de 0.005 g a 4 g, por kilogramo de semillas.

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

25 Las composiciones se pueden seleccionar entre varios tipos de formulaciones, que incluyen polvos espolvoreables (PE), polvos solubles (PS), gránulos solubles en agua (GS), gránulos dispersables en agua (GD), polvos humectables (PH), gránulos (GR) (de liberación lenta o rápida), concentrados solubles (SL), líquidos miscibles en aceite (LAc), líquidos de volumen ultrabajo (LU), concentrados emulsionables (CE), concentrados dispersables (CD), emulsiones (tanto de aceite en agua (EAg) como de agua en aceite (EAc)), microemulsiones (ME), concentrados en suspensión (CS), concentrados en suspensión basados en aceites (SA), aerosoles, formulaciones en forma de humo/niebla, suspensiones de cápsulas (SC) y formulaciones para el tratamiento de semillas. El tipo de formulación elegido en cualquier caso dependerá del objetivo específico previsto y de las propiedades físicas, químicas y biológicas del compuesto de fórmula I.

30 Los polvos espolvoreables (PE) se pueden preparar mezclando un compuesto de fórmula I con uno o más diluyentes sólidos (por ejemplo, arcillas naturales, caolín, pirofilita, bentonita, alúmina, montmorilonita, diatomita, creta, tierras diatomáceas, fosfatos de calcio, carbonatos de calcio y magnesio, azufre, cal, harinas, talco y otros portadores sólidos orgánicos e inorgánicos) y moliendo mecánicamente la mezcla hasta obtener un polvo fino.

35 Los polvos solubles (PS) se pueden preparar mezclando un compuesto de fórmula I con una o más sales inorgánicas hidrosolubles (tales como bicarbonato de sodio, carbonato de sodio o sulfato de magnesio) o uno o más sólidos orgánicos hidrosolubles (tales como un polisacárido) y, opcionalmente, uno o más agentes humectantes, uno o más agentes dispersantes o una mezcla de dichos agentes, para mejorar su dispersabilidad/solubilidad en agua. A continuación, la mezcla se muele hasta obtener un polvo fino. También se pueden granular composiciones similares para formar gránulos solubles en agua (GS).

40 Los polvos humectables (PH) se pueden preparar mezclando un compuesto de fórmula I con uno o más portadores o diluyentes sólidos, uno o más agentes humectantes y, preferentemente, uno o más agentes dispersantes y, opcionalmente, uno o más agentes de suspensión, para facilitar la dispersión en líquidos. A continuación, la mezcla se muele hasta obtener un polvo fino. También se pueden granular composiciones similares para formar gránulos dispersables en agua (GD).

45 Los gránulos (GR) se pueden formar tanto granulando una mezcla de un compuesto de fórmula I y uno o más portadores o diluyentes sólidos en polvo, como a partir de gránulos preformados que no contengan el compuesto de fórmula I absorbiendo dicho compuesto de fórmula I (o una solución de este en un agente adecuado) en un material granular poroso (tal como pumita, arcillas de atapulgita, tierra de fuller, kieselguhr, diatomita o marlos de maíz molidos) o adsorbiendo un compuesto de fórmula I (o una solución de este en un agente adecuado) en un material de núcleo duro (tal como arenas, silicatos, carbonatos minerales, sulfatos o fosfatos) y secando cuando sea necesario. Los agentes que se emplean habitualmente para facilitar la absorción o adsorción incluyen disolventes (tales como alcoholes, éteres, cetonas, ésteres y disolventes del petróleo aromáticos y alifáticos) y agentes aglutinantes (tales como acetatos de polivinilo, alcoholes polivinílicos, dextrinas, azúcares y aceites vegetales). También se pueden incluir uno o más aditivos diferentes en los gránulos (por ejemplo, un agente emulsionante, agente humectante o agente dispersante).

65

Los concentrados dispersables (CD) se pueden preparar disolviendo un compuesto de fórmula I en agua o un disolvente orgánico tal como una cetona, alcohol o éter glicólico. Estas soluciones pueden contener un agente tensioactivo (por ejemplo, para mejorar la dilución en agua o evitar la cristalización en un tanque de pulverización).

5 Los concentrados emulsionables (CE) o las emulsiones de aceite en agua (EAg) se pueden preparar disolviendo un compuesto de fórmula I en un disolvente orgánico (que contenga opcionalmente uno o más agentes humectantes, uno o más agentes emulsionantes o una mezcla de dichos agentes). Los disolventes orgánicos adecuados para emplear en CE incluyen hidrocarburos aromáticos (tales como alquilbencenos o alquilnaftalenos, por ejemplo, SOLVESSO 100, SOLVESSO 150 y SOLVESSO 200; SOLVESSO es una marca comercial registrada), cetonas (tales como ciclohexanona o metilciclohexanona) y alcoholes (tales como alcohol bencílico, alcohol furfúrico o butanol),

15 *N*-alquilpirrolidonas (tales como *N*-metilpirrolidona o *N*-octilpirrolidona), dimetilamidas de ácidos grasos (tales como la dimetilamida de un ácido graso C<sub>8</sub>-C<sub>10</sub>) e hidrocarburos clorados. Un producto de tipo CE puede emulsionar espontáneamente al añadir agua, para producir una emulsión con una estabilidad suficiente para permitir la aplicación por pulverización con un equipo adecuado. La preparación de una EAg implica obtener un compuesto de fórmula I, ya sea como un líquido (si no es un líquido a temperatura ambiente, se puede fundir a una temperatura razonable, normalmente inferior a 70 °C) o en solución (disolviéndolo en un disolvente adecuado), y a continuación emulsionar el líquido o la solución resultante en agua que contenga uno o más AT, con un cizallamiento elevado, para producir una emulsión. Los disolventes adecuados para emplear en EAg incluyen aceites vegetales, hidrocarburos clorados (tales como clorobencenos), disolventes aromáticos (tales como alquilbencenos o alquilnaftalenos) y otros disolventes orgánicos adecuados que presenten una solubilidad baja en agua.

25 Las microemulsiones (ME) pueden prepararse mezclando agua con una combinación de uno o más disolventes con uno o más AT para producir espontáneamente una formulación líquida isotrópica termodinámicamente estable. Hay un compuesto de fórmula I presente inicialmente en el agua o en la mezcla de disolventes/AT. Los disolventes adecuados para emplear en las ME incluyen los descritos previamente en la presente para emplear en CE o en EAg. Una ME puede ser un sistema de aceite en agua o de agua en aceite (se puede determinar qué sistema está presente mediante medidas de conductividad) y puede ser adecuada para mezclar pesticidas solubles en agua y solubles en aceite en la misma formulación. Una ME es adecuada para diluirla en agua, en cuyo caso se puede mantener como una microemulsión o puede formar una emulsión de aceite en agua convencional.

35 Los concentrados en suspensión (CS) pueden comprender suspensiones acuosas o no acuosas de partículas sólidas insolubles finamente divididas de un compuesto de fórmula I. Los CS se pueden preparar moliendo con bolas o microesferas el compuesto sólido de fórmula I en un medio adecuado, opcionalmente con uno o más agentes dispersantes, para producir una suspensión de partículas finas del compuesto. Se pueden incluir uno o más agentes humectantes en la composición y se puede incluir un agente de suspensión para reducir la velocidad a la cual sedimentan las partículas. Como alternativa, se puede moler un compuesto de fórmula I en seco y añadirlo a agua, la cual contiene los agentes descritos previamente en la presente, para producir el producto final deseado.

40 Un concentrado en suspensión basado en aceites (SA) se puede preparar de forma similar suspendiendo partículas sólidas insolubles finamente divididas de un compuesto de fórmula I en un fluido orgánico (por ejemplo, al menos un aceite mineral o aceite vegetal). Los SA pueden comprender además al menos un potenciador de la penetración (por ejemplo, un alcohol etoxilado o un compuesto relacionado), al menos un surfactante no iónico y/o al menos un surfactante aniónico, y opcionalmente al menos un aditivo del grupo de los emulsionantes, agentes inhibidores de espuma, conservantes, antioxidantes, tintes y/o materiales de relleno inertes. Un SA está diseñado y es adecuado para diluirlo con agua antes de su uso con el fin de proporcionar una solución de pulverización con estabilidad suficiente para permitir la aplicación por pulverización con un equipo adecuado.

50 Las formulaciones de aerosoles comprenden un compuesto de fórmula I y un propelente adecuado (por ejemplo, *n*-butano). Un compuesto de fórmula I también se puede disolver o dispersar en un medio adecuado (por ejemplo, agua o un líquido miscible en agua, tal como *n*-propanol) para proporcionar composiciones para su uso en bombas de pulverización accionadas manualmente no presurizadas.

55 Un compuesto de fórmula I se puede mezclar en estado seco con una mezcla pirotécnica con el fin de formar una composición adecuada para generar, en un espacio cerrado, un humo que contenga dicho compuesto.

60 Las suspensiones de cápsulas (SC) se pueden preparar de una manera similar a la preparación de formulaciones de EAg, pero con una etapa de polimerización adicional de modo que se obtiene una dispersión acuosa de gotículas de aceite, en la que cada una de las gotículas de aceite está encapsulada por una cubierta polimérica y contiene un compuesto de fórmula I y, opcionalmente, un soporte o diluyente para este. La cubierta polimérica se puede producir tanto mediante una reacción de policondensación interfacial como mediante un procedimiento de coacervación. Las composiciones pueden permitir la liberación controlada del compuesto de fórmula I y pueden emplearse para el tratamiento de semillas. Un compuesto de fórmula I también se puede formular en una matriz polimérica biodegradable para proporcionar una liberación controlada lenta del compuesto.

65

5 Un compuesto de fórmula I también se puede formular para su uso como un tratamiento de semillas, por ejemplo, como una composición en polvo, que incluye un polvo para el tratamiento de semillas en seco (SS), un polvo hidrosoluble (HS) o un polvo dispersable en agua para un tratamiento en suspensión (DS), o como una composición líquida, que incluye un concentrado líquido (CL), una solución (LS) o una suspensión de cápsulas (SC). Las preparaciones de las composiciones de tipo SS, HS, DS, CL y LS son muy similares a las de las composiciones de tipo PE, PS, PH, CS, SA y CD, respectivamente, descritas anteriormente. Las composiciones para tratar semillas pueden incluir un agente para fomentar la adhesión de la composición a la semilla (por ejemplo, un aceite mineral o una barrera peliculígena).

10 Una composición de la presente invención puede incluir uno o más aditivos para mejorar el rendimiento biológico de la composición (por ejemplo, mejorando la humectación, retención o distribución sobre superficies; resistencia a la lluvia en superficies tratadas; o captación o movilidad de un compuesto de fórmula I). Estos aditivos incluyen agentes tensioactivos (AT), aditivos de pulverización basados en aceites, por ejemplo, ciertos aceites minerales, aceites vegetales o aceites de plantas naturales (tales como el aceite de soja o de colza) y mezclas de estos con otros adyuvantes biopotenciadores (ingredientes que pueden potenciar o modificar la acción de un compuesto de fórmula I).  
15 Se puede conseguir un incremento del efecto de un compuesto de fórmula I, por ejemplo, añadiendo sales de amonio y/o de fosfonio, y/u opcionalmente al menos un potenciador de la penetración tal como alcoxilatos de alcoholes grasos (por ejemplo, éster metílico de aceite de ricino) o ésteres de aceites vegetales.

20 Los agentes humectantes, agentes dispersantes y agentes emulsionantes pueden ser agentes tensioactivos (AT) de tipo catiónico, aniónico, anfótero o no iónico.

Los AT de tipo catiónico adecuados incluyen compuestos de amonio cuaternario (por ejemplo, bromuro de cetiltrimetilamonio), imidazolinas y sales de aminas.

25 Los AT aniónicos adecuados incluyen sales de metales alcalinos y ácidos grasos, sales de monoésteres alifáticos y ácido sulfúrico (por ejemplo, laurilsulfato de sodio), sales de compuestos aromáticos sulfonados (por ejemplo, dodecilmecenosulfonato de sodio, dodecilmecenosulfonato de calcio, butilnaftalenosulfonato y mezclas de diisopropil- y triisopropilnaftalenosulfonatos de sodio), sulfatos de éteres, sulfatos de éteres de alcoholes (por ejemplo, lauret-3-sulfato de sodio), carboxilatos de éteres (por ejemplo, lauret-3-carboxilato de sodio), ésteres de tipo fosfato (productos de la  
30 reacción entre uno o más alcoholes grasos y ácido fosfórico (principalmente monoésteres) o pentóxido de fósforo (principalmente diésteres), por ejemplo, la reacción entre alcohol laurílico y ácido tetrafosfórico; además, estos productos se pueden etoxilar), sulfosuccinamatos, parafina o sulfonatos, tauratos y lignosulfonatos de olefinas.

35 Los AT adecuados de tipo anfótero incluyen betaínas, propionatos y glicinatos.

Los AT de tipo no iónico adecuados incluyen productos de condensación de óxidos de alquileno, tales como óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de estos, con alcoholes grasos (tales como alcohol oleílico o alcohol cetílico) o con alquifenoles (tales como octilfenol, nonilfenol u octilcresol); ésteres parciales obtenidos a partir de ácidos grasos de cadena larga o anhídridos de hexitol; productos de condensación de dichos ésteres parciales con  
40 óxido de etileno; polímeros en bloque (que comprenden óxido de etileno y óxido de propileno); alcanolamidas; ésteres simples (por ejemplo, ésteres polietilenglicólicos de ácidos grasos); óxidos de aminas (por ejemplo, óxido de laurildimetilamina); y lecitinas.

45 Los agentes de suspensión adecuados incluyen coloides hidrófilos (tales como polisacáridos, polivinilpirrolidona o carboximetilcelulosa de sodio) y arcillas esponjosas (tales como bentonita o atapulgita).

Un compuesto de fórmula I puede aplicarse mediante cualquiera de los medios conocidos para la aplicación de compuestos pesticidas. Por ejemplo, se puede aplicar, formulado o sin formular, a las plagas o al emplazamiento de las plagas (tal como el hábitat de las plagas o una planta en desarrollo expuesta a la infestación por parte de las plagas) o a cualquier parte de la planta, incluidos el follaje, los tallos, las ramas o raíces, a la semilla antes de plantarla o a otro medio en el cual las plantas se estén desarrollando o en el cual se vayan a plantar (tal como el suelo que rodea las raíces, el suelo en general, el agua de arrozales o sistemas de cultivo hidropónico), se puede aplicar directamente o se puede pulverizar, espolvorear, aplicar por inmersión, aplicar como una formulación de crema o pasta, aplicar como un vapor o aplicar mediante la distribución o incorporación de una composición (tal como una composición granular o una  
50 composición empaquetada en una bolsa hidrosoluble) en el suelo o un entorno acuoso.

Un compuesto de fórmula I también se puede inyectar en plantas o pulverizar sobre vegetación empleando técnicas de pulverización electrodinámicas u otros métodos de volumen reducido, o se puede aplicar mediante sistemas de irrigación terrestres o aéreos.

60 Las composiciones para emplear como preparados acuosos (soluciones o dispersiones acuosas) se suministran generalmente en forma de un concentrado que contiene una proporción elevada del principio activo y el concentrado se añade al agua antes de su uso. A menudo se requiere que estos concentrados, los cuales pueden incluir CD, CS, SA, CE, EAg, ME, GS, PS, PH, GD y SC, puedan soportar periodos prolongados de almacenamiento y que, después de dicho almacenamiento, se puedan añadir al agua para formar preparados acuosos que permanezcan homogéneos durante un tiempo suficiente para que sea posible aplicarlos con equipos de pulverización convencionales. Estos  
65



preparados acuosos pueden contener diferentes cantidades de un compuesto de fórmula I (por ejemplo, de un 0.0001 a un 10% en peso), dependiendo del fin para el cual se vayan a emplear.

5 Un compuesto de fórmula I se puede emplear en mezclas con fertilizantes (por ejemplo, fertilizantes que contengan nitrógeno, potasio o fósforo, y más particularmente fertilizantes de nitrato de amonio y/o urea). Los tipos de formulación adecuados incluyen gránulos de fertilizante. Las mezclas contienen adecuadamente hasta un 25% en peso del compuesto de fórmula I.

10 Las composiciones preferidas se componen en particular según se indica a continuación ( % = porcentaje en peso):

10 Concentrados emulsionables:

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%

15 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%

20 Concentrados en suspensión:

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

25 Polvos humectables:

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

30 Granulados:

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%

35 Ejemplos de preparación:

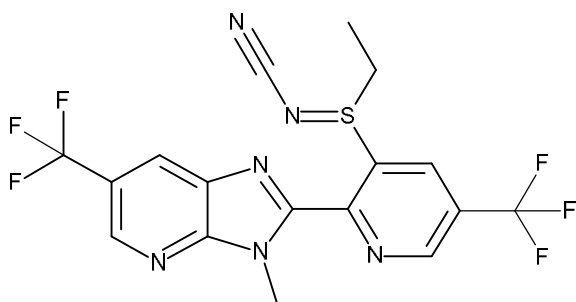
"Pf" significa punto de fusión en °C. Los radicales libres representan grupos metilo. Las medidas de <sup>1</sup>H RMN se registraron en un espectrómetro Bruker de 400 MHz, los desplazamientos químicos se proporcionan en ppm con respecto a un patrón de TMS. Los espectros se midieron en disolventes deuterados tal como se indica.

40 Métodos de LCMS:

Método 1 (ZCQ 13):

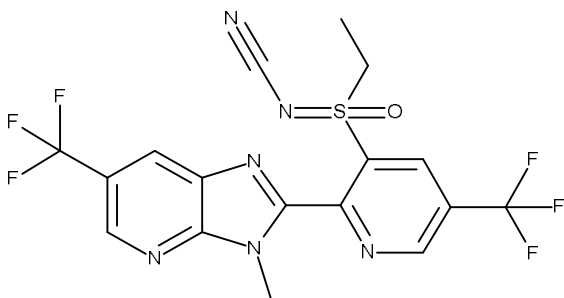
45 Los espectros se registraron en un espectrómetro de masas de Waters (espectrómetro de masas de cuadrupolo único ZQ) dotado de una fuente de electronebulización (polaridad: iones positivos o negativos, capilaridad: 3.00 kV, intervalo del cono: 30-60 V, extractor: 2.00 V, temperatura de la fuente: 150 °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.

55 EJEMPLO 1: Preparación de [etil-[2-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-b]piridin-2-il]-5-(trifluorometil)-3-piridil] -λ<sup>4</sup>-sulfanilidenocianamida (compuesto P1.1):



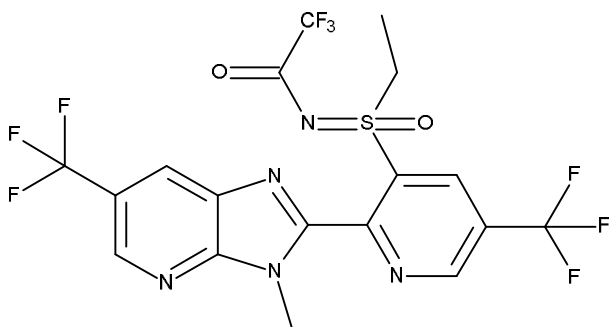
5 A una solución de 2-[3-etilsulfanil-5-(trifluorometil)-2-piridil]-3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-*b*]piridina (400 mg, 0.984 mmol) y cianamida (71 mg, 1.673 mmol) en acetonitrilo (1.5 ml) a 5-10 °C, se añadió diacetato de yodobenceno (539 mg, 1.673 mmol). La reacción se agitó a temperatura ambiente durante 18 horas. Se añadió adicionalmente un total de 0.6 eq. de cianamida y 0.6 eq. de diacetato de yodobenceno a la mezcla en dos porciones y se continuó agitando a 40 °C durante 7 horas. La mezcla de reacción se diluyó con diclorometano, se vertió sobre agua y el sistema bifásico se trató con NaHSO<sub>3</sub> acuoso al 10%. Después de agitar durante 30 minutos, la fase orgánica se separó, la fase acuosa se extrajo con diclorometano, las fases orgánicas combinadas se secaron con sulfato de magnesio, se filtraron y se concentraron. El residuo se purificó mediante cromatografía flash en columna (heptano/acetato de etilo) para proporcionar el producto del título como un sólido blanco (303 mg), pf: 187 °C. <sup>1</sup>H-RMN (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 1.71 (t, *J*=7.3 Hz, 3 H), 3.30 (dt, *J*=12.3, 7.3 Hz, 1 H), 3.88 (dt, *J*=12.3, 7.3 Hz, 1 H), 4.43 (s, 3 H), 8.39 (d, *J*=1.4 Hz, 1 H), 8.87 (d, *J*=1.4 Hz, 1 H), 9.06 (d, *J*=1.5 Hz, 1 H), 9.20 (d, *J*=1.5 Hz, 1 H). LCMS (método ZCQ13): 447 (MH<sup>+</sup>), tiempo de retención 1.72 min.

15 **EJEMPLO 2:** Preparación de [etil-2-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-*b*]piridin-2-il]-5-(trifluorometil)-3-piridil]-oxo-λ<sup>6</sup>-sulfanilideno]cianamida (compuesto P1.2):



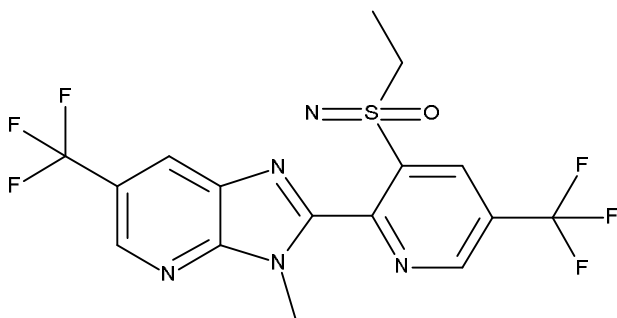
20 Una solución de [etil-2-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-*b*]piridin-2-il]-5-(trifluorometil)-3-piridil]-λ<sup>4</sup>-sulfanilideno]cianamida (280 mg, 0.627 mmol) disuelta en acetonitrilo (1.5 ml) y diclorometano (1.8 ml) se añadió a una solución de peryodato de sodio (271 mg, 1.254 mmol) en agua (3.0 ml) a temperatura ambiente. Se añadió cloruro de rutenio (III) hidratado (1.45 mg, 0.007 mmol) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 3.5 horas. Tras diluir con acetonitrilo (6.0 ml), diclorometano (2.0 ml) y agua (3.0 ml), se añadió más peryodato de sodio (135 mg, 0.625 mmol) y se continuó agitando durante toda la noche. La fase orgánica se separó, la fase acuosa se extrajo con diclorometano, las fases orgánicas combinadas se lavaron con NaHSO<sub>3</sub> acuoso al 10%, se secaron con sulfato de magnesio, se filtraron y se concentraron para proporcionar el producto del título como un sólido blanco (253 mg), pf: 153 °C. <sup>1</sup>H-RMN (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 1.56 (t, *J*=7.3 Hz, 3 H), 4.12 (s, 3 H), 4.30 (dt, *J*=14.0, 7.3 Hz, 1 H), 4.64 (dt, *J*=14.0, 7.3 Hz, 1 H), 8.35 (d, *J*=1.5 Hz, 1 H), 8.82 (d, *J*=1.5 Hz, 1 H), 8.85 (d, *J*=1.2 Hz, 1 H), 9.34 (d, *J*=1.2 Hz, 1 H). LCMS (método ZCQ13): 463 (MH<sup>+</sup>), tiempo de retención 1.67 min.

35 **EJEMPLO 3:** Preparación de *N*-[etil-2-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-*b*]piridin-2-il]-5-(trifluorometil)-3-piridil]-oxo-λ<sup>6</sup>-sulfanilideno]-2,2,2-trifluoroacetamida (compuesto P1.3):



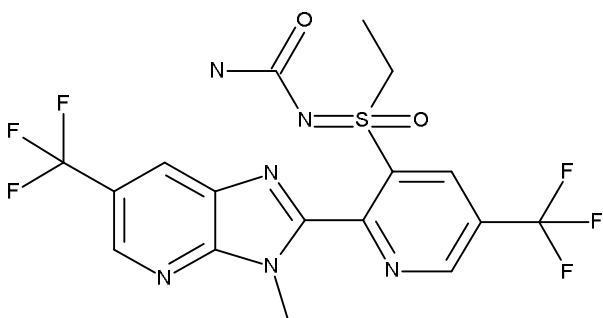
5 A una solución de [etil-[2-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-b]piridin-2-il]-5-(trifluorometil)-3-piridil]-oxo-λ<sup>6</sup>-sulfanilideno]cianamida (218 mg, 0.472 mmol) en diclorometano (21 ml) a 0 °C, se añadió anhídrido del ácido trifluoroacético (0.197 ml, 1.414 mmol). La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 18 horas. La mezcla de reacción se vertió sobre agua y la fase acuosa se extrajo con diclorometano (3x 10 ml). Las fases orgánicas combinadas se secaron con sulfato de magnesio anhidro, se filtraron y se evaporaron. El residuo se purificó mediante cromatografía flash en columna (heptano/acetato de etilo) para obtener el producto del título como un sólido blanco (178 mg), pf: 121 °C. <sup>1</sup>H-RMN (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 1.55 (t, *J*=7.3 Hz, 3 H), 3.92 (s, 3 H), 4.43 (dt, *J*=14.3, 7.3 Hz, 1 H), 4.73 (dt, *J*=14.3, 7.3 Hz, 1 H), 8.34 (d, *J*=1.2 Hz, 1 H), 8.82 (d, *J*=1.2 Hz, 1 H), 8.84 (d, *J*=1.2 Hz, 1 H), 9.30 (d, *J*=1.2 Hz, 1 H). LCMS (método ZCQ13): 534 (MH<sup>+</sup>), tiempo de retención 1.97 min.

15 EJEMPLO 4: Preparación de etilimino-[2-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-b]piridin-2-il]-5-(trifluorometil)-3-piridil]-oxo-λ<sup>6</sup>-sulfano (compuesto P1.4):



20 A una solución de *N*-[etil-[2-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-b]piridin-2-il]-5-(trifluorometil)-3-piridil]-oxo-λ<sup>6</sup>-sulfanilideno]-2,2,2-trifluoroacetamida (149 mg, 0.279 mmol) en metanol (25 ml), se añadió carbonato de potasio (193 mg, 1.397 mmol) a temperatura ambiente y la mezcla se agitó durante 15 minutos. Después de eliminar el disolvente a presión reducida, el residuo se diluyó con acetato de etilo y se filtró. El filtrado se concentró y el residuo se purificó mediante cromatografía en columna (heptano/acetato de etilo) para proporcionar el producto del título como un sólido blanco (109 mg), pf 102 °C. <sup>1</sup>H-RMN (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 1.40 (t, *J*=7.5 Hz, 3 H), 2.76 (s, 1 H), 3.83 (dt, *J*=14.2, 7.3 Hz, 1 H), 3.90 (s, 3 H), 3.95 (dt, *J*=14.2, 7.3 Hz, 1 H), 8.33 (d, *J*=1.5 Hz, 1 H), 8.78 (d, *J*=1.5 Hz, 1 H), 8.83 (d, *J*=1.5 Hz, 1 H), 9.20 (d, *J*=1.5 Hz, 1 H). LCMS (método ZCQ13): 438 (MH<sup>+</sup>), tiempo de retención 1.50 min.

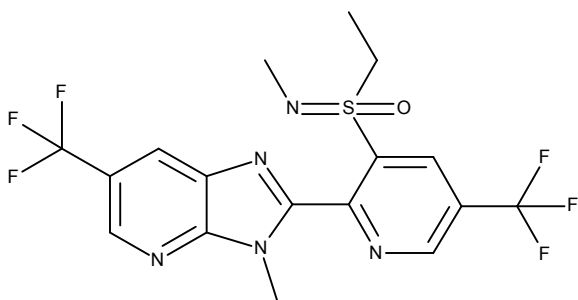
25 EJEMPLO 5: Preparación de [etil-[2-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-b]piridin-2-il]-5-(trifluorometil)-3-piridil]-oxo-λ<sup>6</sup>sulfanilideno]urea (compuesto P1.5):



30

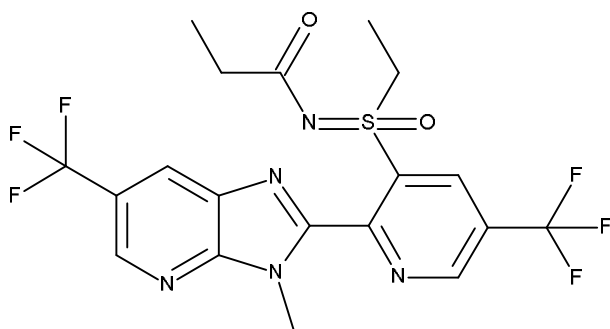
A una solución de [etil-2-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-*b*]piridin-2-il]-5-(trifluorometil)-3-piridil]-oxo- $\lambda^6$ -sulfanilideno]cianamida (213 mg, 0.461 mmol) en acetonitrilo (2 ml), se añadió ácido sulfúrico concentrado (33  $\mu$ l) y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante una hora. La mezcla se enfrió hasta 5 °C, se neutralizó mediante la adición de hidróxido de sodio acuoso al 20%, se diluyó con acetato de etilo y se separaron las fases. La fase orgánica se lavó con cloruro de sodio acuoso saturado, se secó con sulfato de sodio anhidro, se filtró y se evaporó. El residuo se lavó disgregándolo con hexano/éter dietílico 4:1, se filtró y el sólido se secó para proporcionar el producto del título como un sólido blanco (112 mg), pf: 206-208 °C.

10 EJEMPLO 6: Preparación de etilmetilimino-[2-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-*b*]piridin-2-il]-5-(trifluorometil)-3-piridil]-oxo- $\lambda^6$ -sulfano (compuesto P1.6):



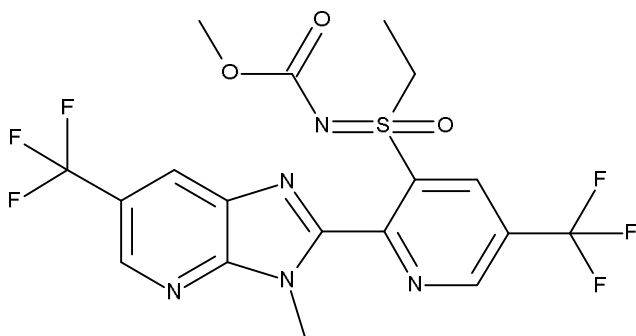
15 A una suspensión de hidruro de sodio al 60% (31.6 mg, 0.789 mmol) en 1,2-dimetoxietano (4 ml) a temperatura ambiente, se añadió etilimino-[2-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-*b*]piridin-2-il]-5-(trifluorometil)-3-piridil]-oxo- $\lambda^6$ -sulfano (150 mg, 0.343 mmol) y la mezcla se agitó 15 minutos hasta que se detuvo la formación de gas. A continuación, se añadió el yoduro de metilo (32.2  $\mu$ l, 0.514 mmol) a la solución transparente y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 1.5 horas. La mezcla se concentró a presión reducida y el residuo se purificó mediante cromatografía en columna de sílice (gradiente de 0-28% de acetato de etilo en heptano) para obtener el producto del título como un sólido blanco (90 mg), pf: 172-173 °C.

25 EJEMPLO 7: Preparación de N-[etil-2-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-*b*]piridin-2-il]-5-(trifluorometil)-3-piridil]-oxo- $\lambda^6$ -sulfanilideno]propanamida (compuesto P1.7):



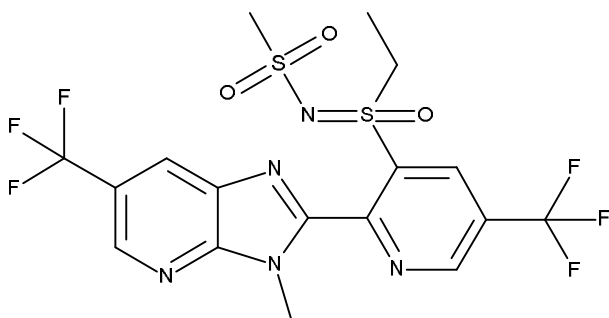
30 A una solución de etilimino-[2-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-*b*]piridin-2-il]-5-(trifluorometil)-3-piridil]oxo- $\lambda^6$ -sulfano (150 mg, 0.343 mmol) y trietilamina (61.8  $\mu$ l, 0.446 mmol) en diclorometano (2 ml) a 0-5 °C, se añadió cloruro de propanoilo (30  $\mu$ l, 0.343 mmol) gota a gota. La mezcla de reacción se agitó durante 1 hora a temperatura ambiente. Tras la adición de cloruro de propanoilo adicional (3  $\mu$ l) para conseguir que la reacción se completara, la mezcla se vertió sobre agua y se separaron las fases. La fase orgánica se lavó dos veces con agua, se secó con sulfato de sodio anhidro, se filtró y se evaporó. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de sílice (gradiente de 0-30% de acetato de etilo en heptano) para obtener el producto del título como un sólido (125 mg). LCMS (método 1): 494 (MH<sup>+</sup>), tiempo de retención 1.80 min.

35 EJEMPLO 8: Preparación análoga de N-[etil-2-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-*b*]piridin-2-il]-5-(trifluorometil)-3-piridil]-oxo- $\lambda^6$ -sulfanilideno]carbamato de metilo (compuesto P1.8):



5 Se obtuvo a partir de etilimino-[2-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-*b*]piridin-2-il]-5-(trifluorometil)-3-piridil]-oxo- $\lambda^6$ -sulfano y cloroforniato de metilo de acuerdo con el procedimiento descrito en el Ejemplo 7. El compuesto P1.8 se obtuvo como una goma. LCMS (método 1): 496 (MH<sup>+</sup>), tiempo de retención 1.68 min.

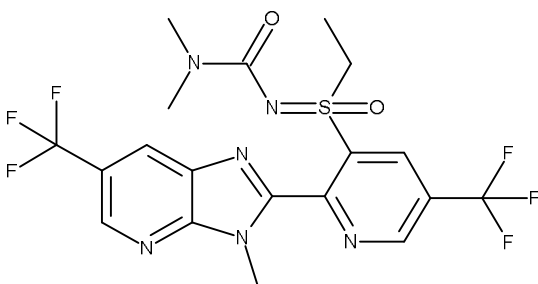
EJEMPLO 9: Preparación de *N*-[etil-2-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-*b*]piridin-2-il]-5-(trifluorometil)-3-piridil]-oxo- $\lambda^6$ sulfanilideno]metanosulfonamida (compuesto P1.9):



10

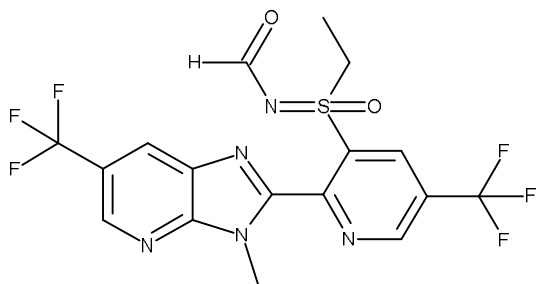
15 A una solución de etilimino-[2-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-*b*]piridin-2-il]-5-(trifluorometil)-3-piridil]oxo- $\lambda^6$ -sulfano (150 mg, 0.343 mmol) en piridina (2 ml) a 0-5 °C, se añadió cloruro de metanosulfonilo (34.5  $\mu$ l, 0.446 mmol). La mezcla de reacción se agitó durante 1 hora a temperatura ambiente. Después de añadir cloruro de metanosulfonilo adicional (10  $\mu$ l) para conseguir que se completara la reacción, la mezcla se agitó durante 30 minutos a temperatura ambiente y se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de sílice (gradiente de 0-25% de acetato de etilo en heptano) para obtener el producto del título como una goma (102 mg). LCMS (método 1): 516 (MH<sup>+</sup>), tiempo de retención 1.66 min.

20 EJEMPLO 10: Preparación análoga de 3-[etil-2-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-*b*]piridin-2-il]-5-(trifluorometil)-3-piridil]-oxo- $\lambda^6$ sulfanilideno]-1,1-dimetilurea (compuesto P1.11):



25 Se obtuvo a partir de etilimino-[2-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-*b*]piridin-2-il]-5-(trifluorometil)-3-piridil]-oxo- $\lambda^6$ -sulfano y cloruro de *N,N*-dimetilcarbamoilo de acuerdo con el procedimiento descrito en el Ejemplo 9. El compuesto P1.11 se obtuvo como un sólido, pf: 195-197 °C.

30 EJEMPLO 11: Preparación de *N*-[etil-2-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-*b*]piridin-2-il]-5-(trifluorometil)-3-piridil]-oxo- $\lambda^6$ sulfanilideno]formamida (compuesto P1.10):



5 Una solución de etilimino-[2-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-*b*]piridin-2-il]-5-(trifluorometil)-3-piridil]-oxo- $\lambda^6$ -sulfano (150 mg, 0.343 mmol) en ortoformiato de trimetilo (1 ml) se calentó a 90 °C durante toda la noche. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y el residuo se purificó mediante cromatografía en columna de sílice (gradiente de 0-20% de acetato de etilo en heptano). Las fracciones que contenían el producto se combinaron y se concentraron. El producto se purificó de nuevo mediante cromatografía en columna de fase inversa C18 (gradiente de 30-100% de acetonitrilo en agua) para proporcionar el compuesto del título (22 mg) como un sólido, pf: 154-156 °C.

10 Tabla P1: Ejemplos de compuestos de fórmula (I)

Compuesto N.º	Estructuras	Punto de fusión	de MS/RMN
P1.1		187°C	LCMS (método 1): 447 (M+H) <sup>+</sup> t <sub>R</sub> = 1.72 min
P1.2		153°C	LCMS (método 1): 463 (M+H) <sup>+</sup> t <sub>R</sub> = 1.67 min
P1.3		121°C	LCMS (método 1): 534 (M+H) <sup>+</sup> t <sub>R</sub> = 1.97 min
P1.4		102°C	LCMS (método 1): 438 (M+H) <sup>+</sup> t <sub>R</sub> = 1.50 min
P1.5		206-208°C	
P1.6		172-173°C	

Compuesto N.º	Estructuras	Punto de fusión	de	MS/RMN
P1.7		sólido		LCMS (método 1): 494 (M+H) <sup>+</sup> t <sub>R</sub> = 1.80 min
P1.8		goma		LCMS (método 1): 496 (M+H) <sup>+</sup> t <sub>R</sub> = 1.68 min
P1.9		goma		LCMS (método 1): 516 (M+H) <sup>+</sup> t <sub>R</sub> = 1.66 min
P1.10		154-156°C		
P1.11		195-197°C		

En las Tablas 1-19 anteriores se ilustran otros ejemplos específicos de compuestos de fórmula (I).

Ejemplos de formulación ( % = porcentaje en peso)

5	Ejemplo F1: Concentrados en emulsión	a)	b)	c)
	Principio activo	25 %	40 %	50 %
	Dodecilsulfonato de calcio	5 %	8 %	6 %
10	Éter polietilenglicólico de aceite de ricino (36 mol de OE)	5 %	-	-
	Éter tributilfenoxipolietilenglicólico (30 mol de OE)	-	12 %	4 %
	Ciclohexanona	-	15 %	20 %
15	Mezcla de xilenos	65 %	25 %	20 %

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

20	Ejemplo F2: Soluciones	a)	b)	c)	d)
	Principio activo	80 %	10 %	5 %	95 %
	Éter monometílico del etilenglicol	20 %	-	-	-
25	Polietilenglicol PM 400	-	70 %	-	-
	N-Metilpirrolid-2-ona	-	20 %	-	-
	Aceite de coco epoxidado	-	-	1 %	5 %
30	Éter de petróleo (intervalo de ebullición: 160-190 °C)	-	-	94 %	-

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

Ejemplo F3: Gránulos

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

10 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)
15 Principio activo	2 %	5 %
Sílice altamente dispersada	1 %	5 %
Talco	97 %	-
Caolín	-	90 %

20 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 %
25 Diisobutilnaftalenosulfonato de sodio	-	6 %	10 %
Éter octilfenoxipolietilenglicólico (7-8 mol de OE)	-	2 %	-
Sílice altamente dispersada	5 %	10 %	10 %
30 Caolín	62 %	27 %	-

35 Se mezcla el principio activo con los aditivos y se muele exhaustivamente 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 %
40 Caolín	87 %

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

Ejemplo F7: Gránulos recubiertos

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

50 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 %
55 Etilenglicol	10 %
Éter nonilfenoxipolietilenglicólico (15 mol de OE)	6 %
Lignosulfonato de sodio	10 %
Carboximetilcelulosa	1 %
Solución acuosa de formaldehído al 37%	0.2 %
60 Aceite de silicona (emulsión acuosa al 75%)	0.8 %
Agua	32 %

65 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 altamente 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 %

5 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 %

10 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.

15 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.

25 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 piridilmetileno, macrólidos, neonicotinoides y preparados de *Bacillus thuringiensis*.

30 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 1-19 y P1 de la presente invención"):

un adyuvante seleccionado del grupo de sustancias constituido por aceites de petróleo (nombre alternativo) (628) + TX, un acaricida seleccionado del grupo de sustancias constituido por acequinocilo ([57960-19-7] [CCN]) + TX, fenpiroximato [134098-61-6][CCN] + TX, flucitrinato [70124-77-5][ CCN] + TX, 1,1-bis(4-clorofenil)-2-etoxietanol (nombre según la IUPAC) (910) + TX, hexitiazox [78587-05-0][ CCN] + TX, bencenosulfonato 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, alfapipermetrina (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, azociclotina (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, bifenazato (74) + TX, bifentrina (76) + TX, binapacril (907) + TX, brofenvalerato (nombre alternativo) + TX, bromocicleno (918) + TX, bromofós (920) + TX, bromofós-etilo (921) + TX, bromopropilato (94) + TX, buprofezina (99) + TX, butocarboxim (103) + TX, butoxicarboxim (104) + TX, 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, clocantel (nombre alternativo) [CCN] + TX, coumafós (174) + TX, crotamitón (nombre alternativo) [CCN] + TX, crotoxfós (1010) + TX, cufraneb (1013) + TX, ciantoato (1020) + TX, ciflumetofeno [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, diclorvós (236) + TX, diclifós (nombre alternativo) + TX, dicofol (242) + TX, dicrotofós (243) + TX, dienoclor (1071) + TX, dimefox (1081) + TX, dimetoato (262) + TX, dinactina (nombre alternativo) (653) + TX, dinex (1089) + TX, dinex-diclexina (1089) + TX, dinobutón (269) + TX, dinocap (270) + TX, dinocap-4 [CCN] + TX, dinocap-6 [CCN] + TX, dinocetón (1090) + TX, dinopentón (1092) + TX, dinosulfón (1097) + TX, dinoterbón (1098) + TX, dioxatión (1102) + TX, 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, fenotiocarbo (337) + TX, fenpropatrina (342) + TX, fenpirad (nombre alternativo) + TX, fenpiroximato (345) + TX, fensón (1157) + TX, fentripanilo (1161) + TX, fenvalerato (349) + TX, fipronilo (354) + TX, fluacripirim (360) + TX, fluazurón (1166) + TX, flubencimina (1167) + TX, fluciclofurón (366) + TX, flucitrinato (367) + TX, fluenetilo (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, milbemectina (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, nitrilacarb (1313) + TX, complejo de nitrilacarb y cloruro de zinc 1:1 (1313) + TX, NNI-0101 (código de compuesto) + TX, NNI-0250 (código de compuesto) + TX, ometoato (594) + TX, oxamilo (602) + TX, oxideprofós (1324) + TX, oxidisulfotón (1325) + TX, pp'-DDT (219) + TX, paratión (615) + TX, permetrina (626) + TX, aceites del petróleo (nombre alternativo) (628) + TX, fenkaptón (1330) + TX, fentoato (631) + TX, forato (636) + TX, fosalona (637) + TX, fosfolán (1338) + TX, fosmet (638) + TX, fosfamidón (639) + TX, foxim (642) + TX, pirimifós-metilo (652) + TX, policicloterpenos (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, piridafentió (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, espiroclifeno (738) + TX, espiromesifeno (739) + TX, SSI-121 (código de desarrollo) (1404) + TX, sulfiram (nombre alternativo) [CCN] + TX, sulfuramida (750) + TX, sulfotep (753) + TX, azufre (754) + TX, SZI-121 (código de desarrollo) (757) + TX, tau-fluvalinato (398) + TX, tebufenpirad (763) + TX, TEPP (1417) + TX, terbam (nombre alternativo) + TX, tetraclorvinfós (777) + TX, tetradifón (786) + TX, tetranactina (nombre alternativo) (653) + TX, tetrasul (1425) + TX, tiafenox (nombre alternativo) + TX, tiocarboxima (1431) + TX, tiofanox (800) + TX, tiometón (801) + TX, tioquinox (1436) + TX, turingiensina (nombre alternativo) [CCN] + TX, triamifós (1441) + TX, triarateno (1443) + TX, triazofós (820) + TX, triazurón (nombre alternativo) + TX, triclofón (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, fentiión (346) + TX, piridin-4-amina (nombre según la IUPAC) (23) y estricnina (745) + TX,

5 un bactericida seleccionado del grupo de sustancias constituido por 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

10 alternativo) [CCN] + TX, kasugamicina (483) + TX, clorhidrato de kasugamicina hidratado (483) + TX, bis(dimetiliditiocarbamato) de níquel (nombre según la IUPAC) (1308) + TX, nitrapirina (580) + TX, octiliona (590) + TX, ácido oxolínico (606) + TX, oxtetraciclina (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,

15 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 riobravense* (nombre alternativo) (742) + TX, *Steinernema scapterisci* (nombre alternativo) (742) + TX, *Steinernema* spp. (nombre alternativo) (742) + TX,

40 *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,

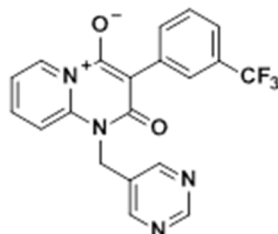
45 un quimioesterilizante seleccionado del grupo de sustancias constituido por afolato [CCN] + TX, bisazir (nombre alternativo) [CCN] + TX, busulfán (nombre alternativo) [CCN] + TX, diflubenzurón (250) + TX, dimatif (nombre alternativo) [CCN] + TX, hemel [CCN] + TX, hempa [CCN] + TX, metepa [CCN] + TX, 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,

50 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-in-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, disparture (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-(octiltio)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 momfluorotrina [609346-29-4] + TX, pirafuprol [315208-17-4] + TX, flometoquina [875775-74-9] + TX, flupiradifurón [951659-40-8] + TX, 1-dicloro-1-nitroetano (nombre de 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-etilsulfinitilo (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-ciflutrina (194) + TX, beta-cipermetrina (203) + TX, bifentrina (76) + TX, bioaletrina (78) + TX, isómero S-ciclopentenílico de la bioaletrina (nombre alternativo) (79) + TX, bioetanometrina [CCN] + TX, biopermetrina (908) + TX, biorresmetrina (80) + TX, éter bis(2-cloroetilico) (nombre según la IUPAC) (909) + TX, bistriflurón (83) + TX, bórax (86) + TX, brofenvalerato (nombre alternativo) + TX, bromfenvinfós (914) + TX, bromocicleno (918) + TX, bromo-DDT (nombre alternativo) [CCN] + TX, bromofós (920) + TX, bromofós-etilo (921) + TX, bufencarb (924) + TX, buprofezina (99) + TX, butacarb (926) + TX, butatofós (927) + TX, butocarboxim (103) + TX, butonato (932) + TX, butoxicarboxim (104) + TX, butilpiridabeno (nombre alternativo) + TX, cadusafós (109) + TX, arseniato de calcio [CCN] + TX, cianuro de calcio (444) + TX, polisulfuro de calcio (nombre 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, carbofenotión (947) + TX, carbosulfán (119) + TX, cartap (123) + TX, clorhidrato de cartap (123) + TX, cevadina (nombre alternativo) (725) + TX, clorbicicleno (960) + TX, clordano (128) + TX, clordecona (963) + TX, clordimeform (964) + TX, clorhidrato de clordimeform (964) + TX, cloretoxifós (129) + TX, clorfenapir (130) + TX, clorfenvinfós (131) + TX, clorfluazurón (132) + TX, clormefós (136) + TX, cloroformo [CCN] + TX, cloropicrina (141) + TX, clorfoxim (989) + TX, clorprazofós (990) + TX, clorpirifós (145) + TX, clorpirifós-metilo (146) + TX, clortiofós (994) + TX, cromafenozida (150) + TX, cinerina I (696) + TX, cinerina II (696) + TX, cinerinas (696) + TX, *cis*-resmetrina (nombre alternativo) + TX, cismetrina (80) + TX, cloctrina (nombre alternativo) + TX, cloetocarb (999) + TX, closantel (nombre alternativo) [CCN] + TX, clotianidina (165) + TX, acetoarsenito de cobre [CCN] + TX, arseniato de cobre [CCN] + TX, oleato de cobre [CCN] + TX, coumafós (174) + TX, coumitoato (1006) + TX, crotamitón (nombre alternativo) [CCN] + TX, crotoxifós (1010) + TX, crufomato (1011) + TX, criolito (nombre alternativo) (177) + TX, CS 708 (código de desarrollo) (1012) + TX, 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, empentrina (292) + TX, endosulfano (294) + TX, endotión (1121) + TX, endrina (1122) + TX, EPBP (1123) + TX, EPN (297) + TX, epofenonano (1124) + TX, eprinomectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, esfenvalerato (302) + TX, etafós (nombre alternativo) [CCN] + TX, etiofencarb (308) + TX, etiión (309) + TX, etiprol (310) + TX, etoato-metilo (1134) + TX, etopofós (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, fempirtrina (1155) + TX, fenpropatrina (342) + TX, fempirad (nombre alternativo) + TX, fensulfotión (1158) + TX, fentiión (346) + TX, fentiión-etilo [CCN] + TX, fenvalerato (349) + TX, fipronilo (354) + TX, flonicamida (358) + TX, flubendiamida (N.º de Reg. CAS.: 272451-65-7) + TX, flucofurón (1168) + TX, fluciclozurón (366) + TX, flucitrinato (367) + TX, fluenetilo (1169) + TX, flufenerim [CCN] + TX, flufenoxurón (370) + TX, flufenprox (1171) + TX, flumetrina (372) + TX, flualinato (1184) + TX, FMC 1137 (código de desarrollo) (1185) + TX, fonofós (1191) + TX, formetanato (405) + TX, clorhidrato de formetanato (405) + TX, formotión (1192) + TX, formparanato (1193) + TX, fosmetilán (1194) + TX, fospirato (1195) + TX, fostiazato (408) + TX, fostietán (1196) + TX, furatiocarb (412) + TX, furetrina (1200) + TX, gamma-cihalotrina (197) + TX, gamma-HCH (430) + TX, guazatina (422) + TX, acetatos de guazatina (422) + TX, GY-81 (código de desarrollo) (423) + TX, halfenprox (424) + TX, halofenozida (425) + TX, HCH (430) + TX, HEOD (1070) + TX, heptaclor (1211) + TX, heptenofós (432) + TX, heterofós [CCN] + TX, hexaflumurón (439) + TX, HHDN (864) + TX, hidrametilnona (443) + TX, cianuro de hidrógeno (444) + TX, hidropreno (445) + TX, hiquincarb (1223) + TX, imidacloprid (458) + TX, imiprotina (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, isoprocarb (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, metampotasio (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, metomilo (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, nor nicotina (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, permetrina (626) + TX, aceites del petróleo (nombre alternativo) (628) + TX, PH 6038 (código de desarrollo) (1328) + TX, fenkaptón (1330) + TX, fenotrina (630) + TX, fentoato (631) + TX, forato (636) + TX, fosadona (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, pirimifós-etilo (1345) + TX, pirimifós-metilo (652) + TX, isómeros de policlorodociclopentadieno (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, 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, pimetozina (688) + TX, piraclófós (689) + TX, pirazofós (693) + TX, piresmetrina (1367) + TX, piretrina I (696) + TX, piretrina II (696) + TX, piretrinas (696) + TX, piridabeno (699) + TX, piridallo (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, RU 15525 (código de desarrollo) (723) + TX, RU 25475 (código de desarrollo) (1386) + TX, riania (nombre alternativo) (1387) + TX, rianodina (nombre tradicional) (1387) + TX, sabadilla (nombre alternativo) (725) + TX, escradán (1389) + TX, sebufós (nombre alternativo) + TX, selamectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, SI-0009 (código de compuesto) + TX, SI-0205 (código de compuesto) + TX, SI-0404 (código de compuesto) + TX, SI-0405 (código de compuesto) + TX, silafluofeno (728) + TX, SN 72129 (código de desarrollo) (1397) + TX, arsenito de sodio [CCN] + TX, cianuro de sodio (444) + TX, fluoruro de sodio (nombre 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, espiromesifeno (739) + TX, espirotetramat (CCN) + TX, sulcofurón (746) + TX, sulcofurón-sodio (746) + TX, sulfluramida (750) + TX, sulfotep (753) + TX, fluoruro de sulfurilo (756) + TX, sulprofós (1408) + TX, aceites de alquitrán (nombre alternativo) (758) + TX, tau-fluvalinato (398) + TX, tazimcarb (1412) + TX, TDE (1414) + TX, tebufenozida (762) + TX, tebufenpirad (763) + TX, tebupirimfós (764) + TX, teflubenzurón (768) + TX, teflutrina (769) + TX, temefós (770) + TX, TEPP (1417) + TX, teraletrina (1418) + TX, terbam (nombre alternativo) + TX, terbufós (773) + TX, tetracloroetano [CCN] + TX, tetraclorvinfós (777) + TX, tetrametrina (787) + TX, theta-cipermetrina (204) + TX, tiacloprid (791) + TX, tiafenox (nombre alternativo) + TX, tiametoxam (792) + TX, ticrofós (1428) + TX, tiocarboxima (1431) + TX, tiociclám (798) + TX, hidrogenooxalato de tiociclám (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, translutrina (813) + TX, transpermetrina (1440) + TX, triamifós (1441) + TX, triazamato (818) + TX, triazofós (820) + TX, triazurón (nombre alternativo) + TX, triclorfón (824) + TX, triclormetafós-3 (nombre alternativo) [CCN] + TX, tricloronat (1452) + TX, trifenofós (1455) + TX, triflumurón (835) + TX, trimetacarb (840) + TX, tripreno (1459) + TX, vamidotión (847) + TX, vaniliprol [CCN] + TX, veratridina (nombre alternativo) (725) + TX, veratrina (nombre alternativo) (725) + TX, XMC (853) + TX, xililcarb (854) + TX, YI-5302 (código de compuesto) + TX, zeta-cipermetrina (205) + TX, zetametrina (nombre alternativo) + TX, fosfuro de zinc (640) + TX, zolapofós (1469) + TX, ZXI 8901 (código de desarrollo) (858) + TX, ciantraniliprol [736994-63-19] + TX, clorantraniliprol [500008-45-7] + TX, cienopirafeno [560121-52-0] + TX, ciflumetofeno [400882-07-7] + TX, pirifluquinazón [337458-27-2] + TX, espinetoram [187166-40-1 + 187166-15-0] + TX, espirotetramat [203313-25-1] + TX, sulfoxaflor [946578-00-3] + TX, flufiprol [704886-18-0] + TX, meperflutrina [915288-13-0] + TX, tetrametilflutrina [84937-88-2] + TX y un compuesto de fórmula B1



(B1)

con el nombre común triflumezopirim (descrito en el documento WO 2012/092115) + 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, 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, 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) (1045) + 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, 1,3-dicloropropeno (233) + TX, 1,1-dióxido de 3,4-diclorotetrahidrotiofeno (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1065) + TX, 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, 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, diclofentiól (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, etopofós (312) + TX, dibromuro de etileno (316) + TX, fenamifós (326) + TX, fenpirad (nombre alternativo) + TX, fensulfotiól (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, mearfón (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) + zeatina (nombre alternativo) (210) + TX, fluensulfona [318290-98-1] + TX, un inhibidor de la nitrificación seleccionado del grupo de sustancias constituido por etilxantato potásico [CCN] y nitrapirina (580) + TX,

un activador vegetal seleccionado del grupo de sustancias constituido por acibenzolar (6) + TX, acibenzolar-S-metilo (6) + TX, probenazol (658) y extracto de *Reynoutria sachalinensis* (nombre alternativo) (720) + TX,

un rodenticida seleccionado del grupo de sustancias constituido por 2-isovalerilindan-1,3-diona (nombre según la IUPAC) (1246) + TX, 4-(quinoxalin-2-ilamino)bencenosulfonamida (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, pirinuról (1371) + TX, esclirrosida (1390) + TX, arsenito de sodio [CCN] + TX, cianuro de sodio (444) + TX, fluoroacetato de sodio (735) + TX, estircinina (745) + TX, sulfato de talio [CCN] + TX, warfarina (851) y fosfuro de zinc (640) + TX,

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, sesamolina (1394) y sulfóxido (1406) + TX,

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, dicitlopentadieno (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,

un virucida seleccionado del grupo de sustancias constituido por imanina (nombre alternativo) [CCN] y ribavirina (nombre alternativo) [CCN] + TX,

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

y compuestos biológicamente activos seleccionados del grupo constituido por azaconazol (60207-31-0) + TX, bitertanol [70585-36-3] + TX, bromuconazol [116255-48-2] + TX, ciproconazol [94361-06-5] + TX, difenoconazol [119446-68-3] + TX, diniconazol [83657-24-3] + TX, epoxiconazol [106325-08-0] + TX, fenbuconazol [114369-43-6] + TX, fluquinconazol [136426-54-5] + TX, flusilazol [85509-19-9] + TX, flutriafol [76674-21-0] + TX, hexaconazol [79983-71-4] + TX, imazalilo [35554-44-0] + TX, imibenconazol [86598-92-7] + TX, ipconazol [125225-28-7] + TX, metconazol [125116-23-6] + TX, miclobutanilo [88671-89-0] + TX, pefurazoato [101903-30-4] + TX, penconazol [66246-88-6] + TX, protioconazol [178928-70-6] + TX, pirifenox [88283-41-4] + TX, procloraz [67747-09-5] + TX, propiconazol [60207-90-1] + TX, simeconazol [149508-90-7] + TX, tebuconazol [107534-96-3] + TX, tetraconazol [112281-77-3] +

TX, triadimefón [43121-43-3] + TX, triadimenol [55219-65-3] + TX, triflumizol [99387-89-0] + TX, triticonazol [131983-72-7] + TX, ancimidol [12771-68-5] + TX, fenarimol [60168-88-9] + TX, nuarimol [63284-71-9] + TX, bupirimato [41483-43-6] + TX, dimetirimol [5221-53-4] + TX, etirimol [23947-60-6] + TX, dodemorf [1593-77-7] + TX, fenpropidina [67306-00-7] + TX, fenpropimorf [67564-91-4] + TX, espiroxamina [118134-30-8] + TX, tridemorf [81412-43-3] + TX, ciprodinilo [121552-61-2] + TX, mepanipirim [110235-47-7] + TX, pirimetanilo [53112-28-0] + TX, fenpiclonilo [74738-17-3] + TX, fludioxonilo [131341-86-1] + TX, benalaxilo [71626-11-4] + TX, furalaxilo [57646-30-7] + TX, metalaxilo [57837-19-1] + TX, *R*-metalaxilo [70630-17-0] + TX, ofurace [58810-48-3] + TX, oxadixilo [77732-09-3] + TX, benomilo [17804-35-2] + TX, carbendazim [10605-21-7] + TX, debacarb [62732-91-6] + TX, fuberidazol [3878-19-1] + TX, tiabendazol [148-79-8] + TX, clozolinato [84332-86-5] + TX, diclozolina [24201-58-9] + TX, iprodiona [36734-19-7] + TX, miclozolina [54864-61-8] + TX, procimidona [32809-16-8] + TX, vinclozolina [50471-44-8] + TX, boscalida [188425-85-6] + TX, carboxina [5234-68-4] + TX, fenfuram [24691-80-3] + TX, flutolanilo [66332-96-5] + TX, mepronilo [55814-41-0] + TX, oxicarboxina [5259-88-1] + TX, pentiopirad [183675-82-3] + TX, tifuluzamida [130000-40-7] + TX, guazatina [108173-90-6] + TX, dodina [2439-10-3] [112-65-2] (base libre) + TX, iminocadina [13516-27-3] + TX, azoxistrobina [131860-33-8] + TX, mandestrobina [173662-97-0] + 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, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetil-3-isoxazolidinil]piridina (SYP-Z048), 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, tolifluand [731-27-1] + TX, caldo bordelés [8011-63-0] + TX, hidróxido de cobre [20427-59-2] + TX, oxiclóruo 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, nitrotal-isopropilo [10552-74-6] + TX, edifenfós [17109-49-8] + TX, iprobenfós [26087-47-8] + TX, isoprotiolano [50512-35-1] + TX, fosdifen [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, bentiavalcarb [413615-35-7] + TX, blastidina-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, fluazinam [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, mefenafena [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, piroquión [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,

e inhibidores de SDHI seleccionados del grupo constituido por

penflufén ([494793-67-8], US 7538073 (*N*-[2-(1,3-dimetilbutil)fenil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-carboxamida) + TX, furametpir ([123572-88-3] (5-cloro-*N*-(1,3-dihidro-1,1,3-trimetil-4-isobenzofuranil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-carboxamida) + TX, pentiopirad (US 5747518, [183675-82-3], (*N*-[2-(1,3-dimetilbutil)-3-tienil]-1-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-4-carboxamida) + TX, bixafén (US 7329633, [581809-46-3], (*N*-(3',4'-dicloro-5-fluoro[1,1'-bifenil]-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1*H*-pirazol-4-carboxamida) + TX, isopirazam (US 7598395, [881685-58-1] (mezcla de 2 isómeros *syn* 3-(difluorometil)-1-metil-*N*-[(1*RS*,4*SR*,9*RS*)-1,2,3,4-tetrahidro-9-isopropil-1,4-metanonaftalen-5-il]pirazol-4-carboxamida y 2 isómeros *anti* 3-(difluorometil)-1-metil-*N*-[(1*RS*,4*SR*,9*SR*)-1,2,3,4-tetrahidro-9-isopropil-1,4-metanonaftalen-5-il]pirazol-4-carboxamida) + TX, sedaxano (EP 1480955B1, [874967-67-6] (mezcla de 2 isómeros *cis* 2'-[(1*RS*,2*SR*)-1,1'-bicicloprop-2-il]-3-(difluorometil)-1-metilpirazol-4-carboxanilida y 2 isómeros *trans* 2'-[(1*RS*,2*SR*)-1,1'-bicicloprop-2-il]-3-(difluorometil)-1-metilpirazol-4-carboxanilida) + TX, fluxapiroxad (US 8008232, [907204-31-3] (3-(difluorometil)-1-metil-*N*-(3',4',5'-trifluoro[1,1'-bifenil]-2-il)-1*H*-pirazol-4-carboxamida) + TX, solatenol (WO 2007/048556 (9-diclorometilen-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il)amida del ácido 3-difluorometil-1-metil-1*H*-pirazol-4-carboxílico) + TX, el compuesto 3-(difluorometil)-*N*-metoxi-1-metil-*N*-[1-metil-2-(2,4,6-triclorofenil)etil]pirazol-4-carboxamida (descrita en el documento WO 2010/063700) + TX, tifuluzamida (US 5045554, [130000-40-7] (*N*-[2,6-dibromo-4-(trifluorometoxi)fenil]-2-metil-4-(trifluorometil)-5-tiazolcarboxamida) + TX, boscalida (US 5589493, [188425-85-6] (2-cloro-*N*-(4'-cloro[1,1'-bifenil]-2-il)-3-piridinacarboxamida) + TX, oxicarboxina ([5259-88-1] (4,4-dióxido de 5,6-dihidro-2-metil-*N*-fenil-1,4-oxatiin-3-carboxamida) + TX, carboxina ([5234-68-4] (5,6-dihidro-2-metil-*N*-fenil-1,4-oxatiin-3-carboxamida) + TX, fluopiram (US 7572818, [658066-35-4], (*N*-[2-[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridinil]etil]-2-(trifluorometil)benzamida) + TX, flutolanilo ([24691-80-3], (2-metil-*N*-fenil-3-furancarboxamida, fenfuram), US 4093743, N.º de Reg. CAS 66332-96-5 (*N*-[3-(1-metiletoxi)fenil]-2-(trifluorometil)benzamida) + TX, mepronilo ([55814-41-0], (2-metil-*N*-[3-(1-metiletoxi)fenil]benzamida) + TX y benodanilo ([15310-01-7], (2-yodo-*N*-fenilbenzamida) + TX;

y los compuestos ciclopropanocarboxilato de [(3*S*,4*R*,4*aR*,6*S*,6*aS*,12*R*,12*aS*,12*bS*)-3-[(ciclopropilcarbonil)oxil]-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]metilo [915972-17-7] + TX, 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, Ácido 4-oxo-4-[(2-feniletil)amino]butírico (descrito en el documento WO 2010137677) + TX, flufiprol [704886-18-0] + TX, ciclaniliprol [1031756-98-5] + TX, tetraniliprol [1229654-66-3]+ TX, guadirpir (descrito en el documento WO 2010/060231) + TX y ciclozaprid (descrito en el documento WO 2005/077934) + 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 para la Protección de los Cultivos], se describen en este 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 © 1995-2013], por ejemplo, el compuesto "acetoprol" se describe en la dirección de Internet <http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprol.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".

La mezcla de principios activos de los compuestos de fórmula I seleccionados a partir de las Tablas 1-19 y P1 con los principios activos descritos previamente comprende un compuesto seleccionado a partir de las Tablas 1-19 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. Se sobreentenderá que estas proporciones de mezcla incluyen, por un lado, proporciones en peso y además, por otro lado, proporciones molares.

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.

Las mezclas que comprenden un compuesto de fórmula I seleccionado a partir de las Tablas 1-19 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 1-19 y P1 y los principios activos como los descritos anteriormente no es esencial para llevar a la práctica la presente invención.

#### Ejemplos biológicos:

Ejemplo B1: Actividad contra *Spodoptera littoralis* (oruga de la hoja del algodón egipcio):  
(larvicida, actividad de contacto residual/alimentación, prevención)

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

En esta prueba, los compuestos P1.2, P1.3, P1.4, P1.6, P1.7, P1.8 y P1.10 mostraron una actividad superior a un 80% con una concentración de 400 ppm.

Ejemplo B2: Actividad contra *Diabrotica balteata* (gusano de la raíz del maíz):  
(larvicida, actividad de contacto residual/alimentación, prevención)

Se tratan brotes de maíz, colocados sobre una capa de agar en placas de microvaloración (PMV) de 24 pocillos, con las soluciones de prueba mediante pulverización. Tras secar, las PMV se infestan con larvas (L2, 6-10 por pocillo). Tras un

periodo de incubación de 5 días, se inspeccionan las muestras para determinar la mortalidad y la regulación del crecimiento de las larvas.

5 En esta prueba, los compuestos P1.1, P1.2, P1.3, P1.5 y P1.6 mostraron una actividad superior a un 80% con una concentración de 400 ppm.

Ejemplo B3: Actividad contra *Spodoptera littoralis* (oruga de la hoja del algodón egipcio)  
(actividad sistémica):

10 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 se 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 inspeccionan para comprobar la mortalidad, el efecto de repelencia, el hábito alimenticio y la regulación del crecimiento 5 días después de la infestación.

15 En esta prueba, los compuestos P1.3, P1.4, P1.6, P1.7, P1.8 y P1.10 mostraron una actividad de al menos un 80% con una concentración de 12.5 ppm.

20 Ejemplo B4: Actividad contra *Plutella xylostella* (polilla de la col):  
(larvicida, actividad de contacto residual/alimentación, prevención)

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.

25 En esta prueba, los compuestos P1.3, P1.4, P1.6, P1.7, P1.8 y P1.10 mostraron una actividad superior a un 80% con una concentración de 400 ppm.

30 Ejemplo B5: Actividad contra *Myzus persicae* (áfido verde del melocotón):  
(actividad de contacto residual/alimentación, prevención), población mixta

35 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).

En esta prueba, los compuestos P1.3, P1.4, P1.6, P1.7, P1.8 y P1.10 mostraron una actividad superior a un 80% con una concentración de 400 ppm.

40 Ejemplo B6: Actividad contra *Myzus persicae* (áfido verde del melocotón):  
(actividad de alimentación/sistémica, curación), población mixta

45 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, los compuestos P1.3, P1.4, P1.6, P1.8 y P1.10 mostraron una actividad de al menos un 80% con una concentración de 24 ppm.

50 Ejemplo B7: Actividad contra *Bemisia tabaci* (aleuródido del algodón):  
(actividad de contacto contra ejemplares adultos, prevención), adulto

55 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 aleuródidos adultos. Tras un periodo de incubación de 7 días DDT, se inspeccionaron las muestras para determinar la mortalidad y efectos especiales (p. ej., fitotoxicidad).

En esta prueba, los compuestos P1.4, P1.6, P1.7, P1.8 y P1.10 mostraron una actividad superior a un 80% con una concentración de 400 ppm.

60 Ejemplo B8: Actividad del tratamiento de semillas contra *Rhopalosiphum padi* (pulgón de los cereales) (actividad de alimentación/sistémica del tratamiento de semillas en cebada, prevención, actividad inicial y residual (infestación 2 y 4 semanas tras la siembra)), población mixta

65 Se siembra una semilla de cebada tratada en una maceta de 350 mL rellena de tierra. Dos semanas después de la siembra, se estima la fitotoxicidad y se expresa como un porcentaje en comparación con el control. Además, la plántula de cebada se infesta con una población del pulgón de estadios mixtos. Tras un periodo de incubación de siete días, se estima el grado de eficacia en comparación con el control y se expresa como un porcentaje. Los tratamientos en los que

todas las réplicas tienen un nivel de eficacia superior a un 90% se vuelven a infestar con los pulgones 28 días después de la siembra para determinar la actividad residual. Los procedimientos de evaluación siguen siendo los mismos que se han descrito anteriormente.

- 5 En esta prueba, por ejemplo, el compuesto P1.4 proporcionó al menos un 80% de control de *Rhopalosiphum padi* después de 28 días con una carga inicial de 0.3 mg de p.a. por semilla.

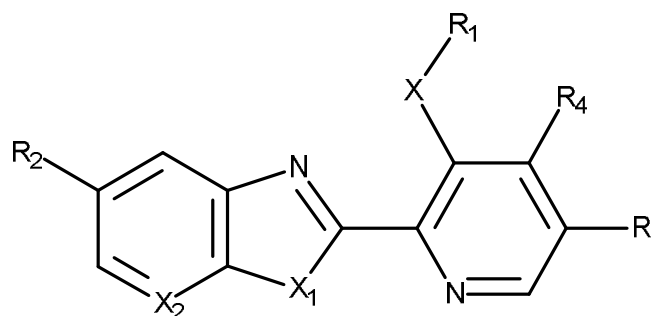
Ejemplo B9: Actividad contra *Aedes aegypti* (mosquito de la fiebre amarilla):

- 10 Se aplicaron las disoluciones 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.

- 15 Los siguientes compuestos proporcionaron al menos un 80% de control de *Aedes aegypti* después de 48 h: P1.3, P1.5, P1.6, P1.7 y P1.8.

## REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula I



(I),

5 donde

X es S=N-R<sub>10</sub> o S(O)=N-R<sub>10</sub>, donde R<sub>10</sub> es hidrógeno, nitro, ciano, C(O)R<sub>26</sub>, C(O)OR<sub>27</sub>, CONR<sub>28</sub>R<sub>29</sub>, SO<sub>2</sub>R<sub>30</sub>, CONH<sub>2</sub>, C(S)NH<sub>2</sub>; o R<sub>10</sub> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> o (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>);

R es hidrógeno, halógeno, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, OR<sub>31</sub> o S(O)<sub>n</sub>R<sub>32</sub>;

10 X<sub>1</sub> es O, S o N-R<sub>3</sub>, donde R<sub>3</sub> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), o X<sub>1</sub> es *N*-(4-metoxibencilo) o *N*-(propargilo);

X<sub>2</sub> es N, CH, C-halógeno, C-CN, C-O-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), C-S-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), C-SO<sub>2</sub>-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), C-S-fenilo, C-SO<sub>2</sub>-fenilo o C-SO<sub>2</sub>-(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>);

15 R<sub>1</sub> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</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>;

R<sub>2</sub> es halógeno, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, OR<sub>31</sub>, S(O)<sub>n</sub>R<sub>32</sub> o SF<sub>5</sub>;

R<sub>4</sub> es hidrógeno o halógeno;

R<sub>26</sub> es hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> o (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>);

20 R<sub>27</sub>, R<sub>28</sub>, R<sub>29</sub> y R<sub>30</sub>, independientemente unos de otros, son alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> o (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>);

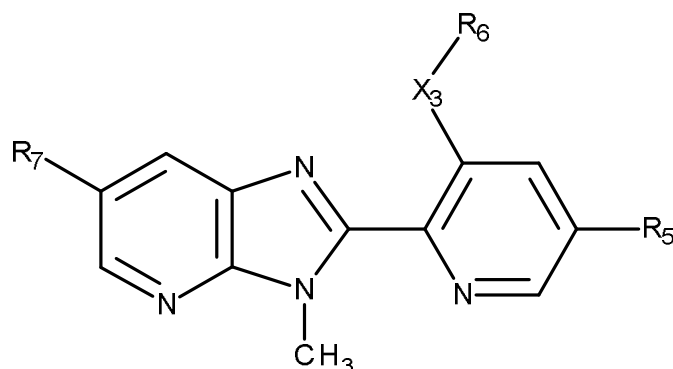
R<sub>31</sub> y R<sub>32</sub>, independientemente el uno del otro, son alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

n es 0, 1 o 2; y

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

25

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



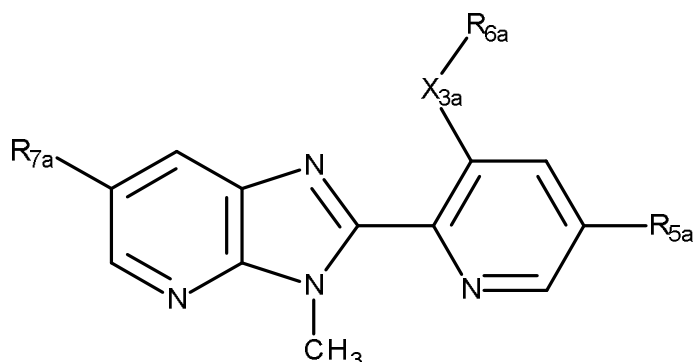
(I-1),

30 donde

X<sub>3</sub> es S=N-R<sub>10</sub> o S(O)=N-R<sub>10</sub> y R<sub>10</sub> es hidrógeno, ciano o C(O)CF<sub>3</sub>;

R<sub>5</sub> es hidrógeno, halógeno o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; R<sub>6</sub> es metilo, etilo, *n*-propilo o *i*-propilo; y R<sub>7</sub> es halógeno o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; y sales, estereoisómeros, enantiómeros, tautómeros y *N*-óxidos agroquímicamente aceptables de estos compuestos.

35 3. Un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, donde el compuesto de fórmula I está representado por los compuestos de fórmula I-1a



(I-1a),

donde

$X_{3a}$  es  $S(O)=N-R_{10}$  y  $R_{10}$  es alquilo  $C_1-C_6$ ,  $C(O)R_{26}$ ,  $C(O)OR_{27}$ ,  $CONR_{28}R_{29}$ ,  $SO_2R_{30}$ ,  $CONH_2$  o  $C(S)NH_2$ ; donde  $R_{26}$  es hidrógeno, alquilo  $C_1-C_6$  o haloalquilo  $C_1-C_6$ , y  $R_{27}$ ,  $R_{28}$ ,  $R_{29}$ ,  $R_{30}$  son, independientemente unos de otros, alquilo  $C_1-C_6$ ;

5

$R_5$  es hidrógeno, halógeno o haloalquilo  $C_1-C_4$ ;  $R_{6a}$  es metilo, etilo, *n*-propilo o *i*-propilo; y  $R_{7a}$  es halógeno o haloalquilo  $C_1-C_4$ ; y sales, estereoisómeros, enantiómeros, tautómeros y *N*-óxidos agroquímicamente aceptables de estos compuestos.

10

4. Una composición insecticida, acaricida, nematocida o molusquicida, que comprende una cantidad eficaz como insecticida, acaricida, nematocida o molusquicida de un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1 y un portador o diluyente adecuado para este.

15

5. Un método para combatir y controlar plagas que comprende aplicar una cantidad eficaz como pesticida de un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, o una composición que comprende un compuesto de este tipo, a una plaga, a un emplazamiento de una plaga o a una planta susceptible de ser atacada por una plaga, con la excepción de un método para el tratamiento del cuerpo humano o animal mediante cirugía o terapia y métodos de diagnóstico realizados en el cuerpo humano o animal.

20

6. Un método para combatir y controlar plagas que comprende aplicar a una plaga, a un emplazamiento de una plaga o a una planta susceptible de ser atacada por una plaga una composición pesticida de acuerdo con la reivindicación 4, con la excepción de un método para el tratamiento del cuerpo humano o animal mediante cirugía o terapia y métodos de diagnóstico realizados en el cuerpo humano o animal.