

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 649 473**

51 Int. Cl.:

C07D 403/04 (2006.01)
A61K 31/4155 (2006.01)
A61K 31/4178 (2006.01)
A01N 43/56 (2006.01)
A01N 43/50 (2006.01)
A61P 33/00 (2006.01)
A61P 33/14 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **27.02.2014 PCT/EP2014/053838**
- 87 Fecha y número de publicación internacional: **12.09.2014 WO14135439**
- 96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **27.02.2014 E 14706854 (8)**
- 97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **30.08.2017 EP 2964631**

54 Título: **Derivados de N-[3-(1H-pirazol-4-il)fenilmetil]-sulfonamida sustituidos con halógeno y compuestos relacionados como pesticidas para uso en protección vegetal, medicina veterinaria y protección de materiales**

30 Prioridad:

04.03.2013 EP 13157618

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
12.01.2018

73 Titular/es:

**BAYER ANIMAL HEALTH GMBH (100.0%)
51368 Leverkusen, DE**

72 Inventor/es:

**MAUE, MICHAEL;
DÉCOR, ANNE;
BRETSCHNEIDER, THOMAS;
HAHN, JULIA JOHANNA;
HALLENBACH, WERNER;
FISCHER, REINER;
SCHWARZ, HANS-GEORG;
GÖRGENS, ULRICH;
ILG, KERSTIN;
RAMING, KLAUS;
KÖBBERLING, JOHANNES;
HÜBSCH, WALTER y
TÜRBERG, ANDREAS**

74 Agente/Representante:

CARPINTERO LÓPEZ, Mario

ES 2 649 473 T3

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

DESCRIPCIÓN

Derivados de N-[3-(1H-pirazol-4-il)fenilmetil]-sulfonamida sustituidos con halógeno y compuestos relacionados como pesticidas para uso en protección vegetal, medicina veterinaria y protección de materiales

5 La presente solicitud se refiere a nuevos compuestos sustituidos con halógenos, a procedimientos para su preparación y a su uso para controlar plagas parasitarias de plantas, plagas en almacenes o plagas que destruyen materiales industriales, especialmente artrópodos y en particular insectos, arácnidos y nematodos.

Se sabe que ciertos compuestos sustituidos con halógeno son activos como herbicidas (ver J. Org. Chem. 1997, 62 (17), 5908-5919 J. Heterocicl Chem. 1998, 35 (6), 1493-1499, WO 2004/035545, WO 2004/106324, US 2006/069132, WO 2008/029084).

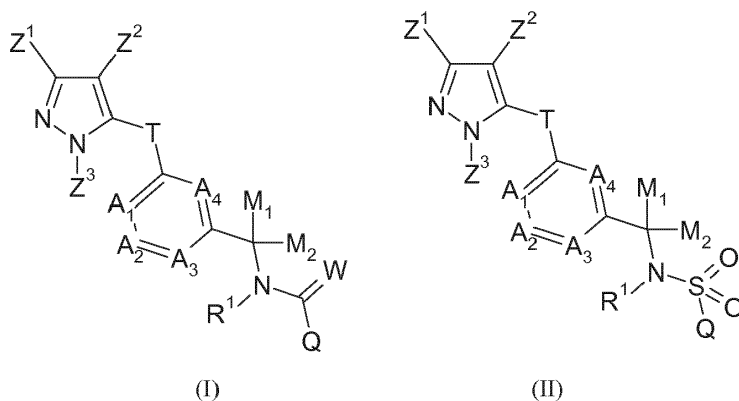
10 Además, se sabe que ciertos compuestos sustituidos con halógeno son activos como insecticidas (EP1911751, WO2012-069366, WO2012-080376 y WO2012-107434).

También se sabe que ciertos compuestos sustituidos con halógenos tienen actividades inhibitoras de FAAH (WO 2009/151991).

15 Los productos de protección vegetal modernos deben cumplir con una amplia gama de requisitos, por ejemplo, en relación con la altura, la duración y la amplitud de su efecto y su posible uso. Los problemas de toxicidad, capacidad de combinación con otros ingredientes activos o ayudas de formulación son importantes, así como la cuestión del esfuerzo que debe realizarse para la síntesis de una sustancia activa. También puede presentarse resistencia. Por todas estas razones, la búsqueda de nuevos productos fitosanitarios nunca se puede considerar concluida, y existe una necesidad constante de nuevos compuestos con propiedades mejoradas en comparación con compuestos conocidos. Fue un objeto de la presente invención proporcionar compuestos que amplían el espectro de los plaguicidas en diversos aspectos y/o mejoran su actividad.

Sorprendentemente, se ha descubierto ahora que ciertos compuestos sustituidos con halógeno, así como sus N-óxidos y sales, tienen propiedades biológicas y son particularmente adecuados para controlar plagas animales y, por lo tanto, pueden usarse particularmente bien en el campo agroquímico y en el campo de la salud animal.

25 Los compuestos sustituidos con halógeno de la presente invención están representados por las fórmulas generales (I) y (II)



en las que

30 R¹ representa hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alqueno C₁-C₆, alquino C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₇, alquilcarbonilo C₁-C₆, alcocarbonilo C₁-C₆, aril-(C₁-C₃)alquilo, heteroaril-(C₁-C₃)alquilo, dado el caso sustituidos,

M¹ y M², cada uno independientemente uno del otro, representan hidrógeno, ciano o representan alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₁-C₆, alcocarbonilo C₁-C₆ dado el caso mono- o polisustituidos o

35 M¹ y M² con el átomo de carbono al que están unidos forman un anillo de 3, 4, 5 o 6 miembros dado el caso sustituido que dado el caso contiene 0, 1 o 2 átomos de nitrógeno y/o 0, 1 o 2 átomos de oxígeno y/o 0, 1 o 2 átomos de azufre,

los grupos químicos

A₁ representa CR² o nitrógeno,

A₂ representa CR³ o nitrógeno,

A₃ representa CR⁴ o nitrógeno y

A₄ representa CR⁵ o nitrógeno

pero donde no más de tres de los grupos químicos A₁ a A₄ representan simultáneamente nitrógeno;

5 R², R³, R⁴ y R⁵ independientemente uno de otro representan hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-imino- Alquilo C₁-C₃, alquilsulfanilo C₁-C₆, alquilsulfínilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, N-alquilamino C₁-C₆ o NN-di-alquilamino C₁-C₆, dado el caso sustituidos; si ninguno de los grupos A₂ y A₃ representa nitrógeno, R³ y R⁴ junto con el átomo de carbono al que están unidos pueden formar un anillo de 5 o 6 miembros que contiene 0, 1 o 2 átomos de nitrógeno y/o 0 o 1 átomos de oxígeno y/o 0 o 1 átomo de azufre, o

10 si ninguno de los grupos A₁ y A₂ representa nitrógeno, R² y R³ junto con el átomo de carbono al que están unidos pueden formar un anillo de 6 miembros que contiene 0, 1 o 2 átomos de nitrógeno;

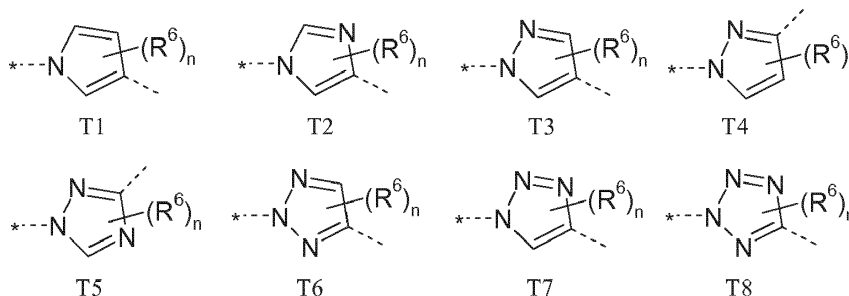
W representa oxígeno o azufre;

15 Q representa hidrógeno, hidroxilo, amino o uno de los grupos dado el caso sustituidos alquilo, alcoxi, alqueno, alquino, cicloalquilo, heterocicloalquilo, cicloalquilalquilo, arilalquilo, heteroarilalquilo o representa un agrupamiento de N-alquilamino, N-alquilcarbonilamino, N,N-dialquilamino; o

Q representa un carbocíclico de 6 miembros insaturado que está dado el caso mono- o polisustituido con V o un anillo heterocíclico de 5 o 6 miembros insaturado que está dado el caso mono- o polisustituido con V, en el que

V independientemente uno de otro representan halógeno, ciano, nitro, alquilo, alqueno, alquino, cicloalquilo, alcoxi, N-alcoxiiminoalquilo, alquilsulfanilo, alquilsulfínilo, alquilsulfonilo, N,N-dialquilamino, dado el caso sustituidos,

20 T representa uno de los heteroaromáticos de 5 miembros T1-T8 enumerados a continuación, donde el enlace al grupo de la cabeza de pirazol está marcado con un asterisco,



en el que

25 R⁶ independientemente uno del otro representan halógeno, ciano, nitro, amino o alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, alquilsulfanilo C₁-C₆, alquilsulfínilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, dado el caso sustituidos, y

n representa los valores 0-2;

Z¹ representa alquilo y cicloalquilo dado el caso sustituidos, y

30 Z² representa hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, amino o alquilo, alquilcarbonilo, alquilsulfanilo, alquilsulfínilo, alquilsulfonilo dado el caso sustituidos, y

Z³ representa hidrógeno o alquilo, cicloalquilo, alqueno, alquino, arilo o heteroarilo dado el caso sustituidos;

Además, los radicales R¹, M¹, M² Q, V y R⁶ tienen los siguientes significados alternativos:

R¹ representa hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alqueno C₁-C₆, alquino C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₇, alquilcarbonilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆, aril-(C₁-C₃), heteroaril-(C₁-C₃)-alquilo, dado el caso sustituidos,

35 M¹ y M², cada uno independientemente uno del otro, representan hidrógeno, ciano o representan alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₂-C₇, dado el caso mono- o polisustituidos, o

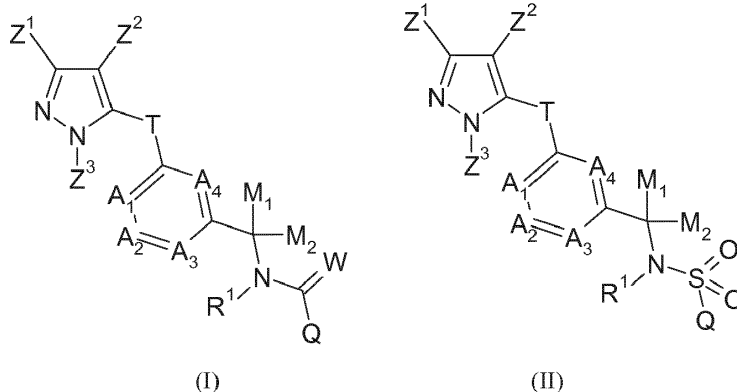
Q es un carbociclo de 6 miembros insaturado dado el caso mono- a polisustituido con V, o es un anillo heterocíclico insaturado de 5 miembros o 6 miembros que está dado el caso monosustituido a polisustituido con V, donde

40 V representa independientemente halógeno, ciano, nitro, alquilo dado el caso sustituido, alqueno, alquino, cicloalquilo, alcoxi, N-alcoxiiminoalquilo, alquilsulfanilo, alquilsulfínilo, alquilsulfonilo, N,N-dialquilamino

R⁶ es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, amino o un alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, alquilsulfanilo C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, dado el caso sustituidos, y

Generalmente preferidos para los fines de esta solicitud, los compuestos de fórmula general (II) son siempre independientes del grado de preferencia de las definiciones de radicales particulares.

5 Los compuestos de las fórmulas (I) y (II)



definidas, en las que

R¹ representa hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alqueno C₁-C₆, alquino C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₇, alquilcarbonilo C₁-C₆, alcoxicarbonilo C₁-C₆, aril(alquilo C₁-C₃), heteroaril-(C₁-C₃)-alquilo dado el caso sustituidos;

10 M¹ y M² son cada uno, independientemente uno del otro, hidrógeno, ciano o un alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₁-C₆, alcoxicarbonilo C₁-C₆, que están dado el caso mono- o polisustituidos; o

M¹ y M² con el átomo de carbono al que están unidos forman un anillo de 3, 4, 5 o 6 miembros dado el caso sustituido que dado el caso contiene 0, 1 o 2 átomos de nitrógeno y/o 0, 1 o 2 átomos de oxígeno y/o 0, 1 o 2 átomos de azufre,

15 los grupos químicos

A₁ es CR² o nitrógeno,

A₂ es CR³ o nitrógeno,

A₃ es CR⁴ o nitrógeno, y

A₄ es CR⁵ o nitrógeno,

20 pero no más de tres de los grupos químicos A₁ a A₄ son simultáneamente nitrógeno;

R², R³, R⁴ y R⁵ son independientemente hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₁-C₆, Alcoxi C₁-C₆, N-alcoxi-C₁-C₆-imino-alquilo C₁-C₃, alquilsulfanilo C₁-C₆, alquilo C₁-C₆-alquilsulfinilo, Alquilsulfonilo C₁-C₆, N-C₁-C₆-alquilamino, N,N-di-C₁-C₆-alquilamino, dado el caso sustituidos;

25 si ninguno de los grupos A₂ y A₃ es nitrógeno, pueden R³ y R⁴ junto con el átomo de carbono al que están unidos formar un anillo de 5 o 6 miembros que contiene 0, 1 o 2 átomos de nitrógeno y/o 0 o 1 átomo de oxígeno, y/o 0 o 1 átomo de azufre, o

si ninguno de los grupos A₁ y A₂ es nitrógeno, pueden R² y R³ formar un anillo de 6 miembros junto con el átomo de carbono al que están unidos que contiene 0, 1 o 2 átomos de nitrógeno;

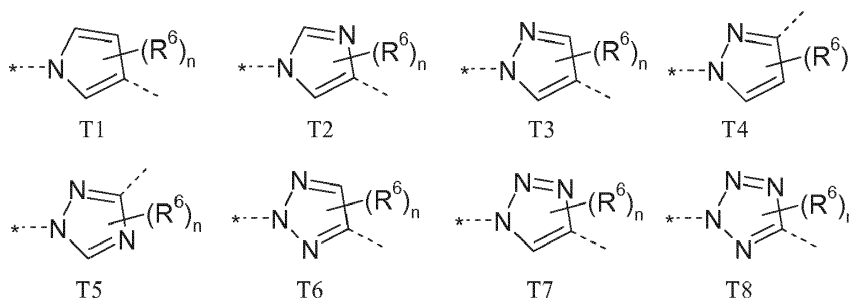
W es oxígeno o azufre;

30 Q representa hidrógeno, formilo, hidroxi, amino o uno de los grupos dado el caso sustituidos, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₁-C₆, heterocicloalquilo C₂-C₇, C₁-C₄-Alcoxi, cicloalquilo C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, arilo-(C₁-C₃)-alquilo, Heteroarilo-(C₁-C₃)-alquilo o un grupo N-C₁-C₄-alquilamino, N-C₁-C₄-alquilcarbonilamino, N,N-Di-C₁-C₄-alquilamino; o

Q representa un carbociclo de 6 miembros insaturado que está dado el caso monosustituido a polisustituido con V, o representa un anillo heterocíclico insaturado de 5 miembros o 6 miembros que está dado el caso monosustituido a polisustituido con V; en el que

- 5 V es, independientemente uno del otro, halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₆, Alquenilo C₂-C₄, Alquinilo C₂-C₄, Cicloalquilo C₁-C₆, Alcoxi C₁-C₆, N-C₁-C₆-Alcoxi-imino-C₁-C₃-alquilo, Alquilsulfanilo C₁-C₆, Alquilsulfino C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, N,N-di-(alquilo C₁-C₆)amino dado el caso monosustituido;

T es uno de los heteroaromáticos de 5 miembros T1-T8 que se enumeran a continuación, en el que el enlace al grupo de la cabeza de pirazol está indicado por un asterisco,



en el que

R⁶ es independientemente uno de otro halógeno, ciano, nitro, amino o alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, alquilsulfino C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆, Alquilsulfonilo, dado el caso sustituidos con halógeno, y

- 15 n representa los valores 0-1;

Z¹ un haloalquilo C₁-C₆, halocicloalquilo C₁-C₆, dado el caso sustituidos y

Z² es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, amino o un alquilo C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, alquilsulfanilo C₁-C₆, alquilsulfino C₁-C₆ y alquilsulfonilo C₁-C₆, dado el caso sustituidos, y

- 20 Z³ es hidrógeno o un alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₁-C₆, alquenilo C₁-C₆, alquinilo C₁-C₆, arilo o heteroarilo, dado el caso sustituidos;

También se da preferencia a los compuestos de las fórmulas (I) y (II), en los cuales los radicales mencionados a continuación se definen alternativamente como sigue:

R¹ es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₇, alquilcarbonilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆, arilo(C₁-C₃)-alquilo, heteroarilo(C₁-C₃)alquilo, dado el caso sustituidos;

- 25 M¹ y M² son cada uno independientemente hidrógeno, ciano o alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₇-carbonilo uno dado el caso mono- o polisustituidos, o

R², R³, R⁴ y R³ son independientemente uno de otro hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, N-alcoxi-C₁-C₆-imino-alquilo C₁-C₃, alquilsulfanilo C₁-C₆, alquilsulfino C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, N-C₁-C₆-alquilamino, N,N-di-C₁-C₆-alquilamino, dado el caso sustituidos;

- 30 Q es hidrógeno, formilo, hidroxilo, amino o uno de los grupos dado el caso sustituidos alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₁-C₆, heterocicloalquilo C₁-C₅, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₆-alquil-Cicloalquilo C₁-C₆-cicloalquilo, aril-(C₁-C₃)-alquilo, heteroarilo-(C₁-C₃)-alquilo, o un grupo N-C₁-C₄-alquilamino, N-C₁-C₄-alquilcarbonilamino, N,N-di-C₁-C₄-alquilamino; o

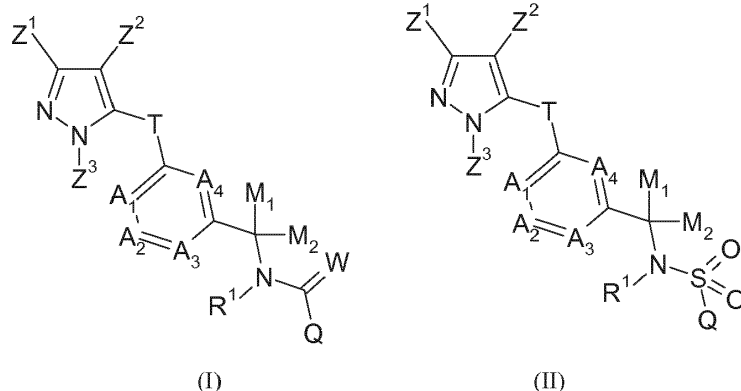
- 35 Q representa un carbociclo de 6 miembros insaturado que está dado el caso monosustituido a polisustituido con V, o representa un anillo heterocíclico insaturado de 5 miembros o 6 miembros que está dado el caso mono- a polisustituido con V;

V representa, independientemente uno de otro, halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₁-C₄, alquinilo C₁-C₄, cicloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alcoxi-N-C₁-C₆-imino-C₁-C₃-alquilo, alquilsulfanilo C₁-C₆, alquilsulfino C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, N,N-di-(alquil-C₁-C₆)amino, dado el caso sustituidos;

- 40 Z¹ representa haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₁-C₆, halocicloalquilo C₁-C₆, dado el caso sustituidos, y

Z³ representa hidrógeno o un alquilo, cicloalquilo, alquenilo, alquinilo, arilo o heteroarilo dado el caso sustituidos;

Se da preferencia particular a los compuestos de las fórmulas (I) y (II)



en las que

- 5 R¹ representa hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₁-C₆, alquinilo C₁-C₆, que no están sustituidos o están monosustituidos o disustituidos independientemente uno de otro con flúor, cloro, ciano, alcoxi C₁-C₆ y alcoxycarbonilo C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆, aril(alquilo C₁-C₃), heteroaril(alquilo C₁-C₃)

M¹ es hidrógeno,

M² es hidrógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, cicloalquilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₃ que no están sustituidos o están sustituidos con flúor, cloro, ciano o alcoxi C₁-C₆,

- 10 M¹ y M² con el átomo de carbono al que están unidos forman un anillo de 3 miembros dado el caso sustituido,

los grupos químicos

A₁ es CR² o nitrógeno,

A₂ es CR³ o nitrógeno,

A₃ es CR⁴ o nitrógeno, y

- 15 A₄ es CR⁵ o nitrógeno,

en los que pero no más de tres de los grupos químicos A₁ a A₄ son simultáneamente nitrógeno;

- 20 R², R³, R⁴ y R⁵, independientemente uno de otro, son hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, dado el caso monosustituido a pentasustituido con flúor, cloro, ciano, hidroxycarbonilo, alcoxycarbonilo C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆ o alquilo C₁-C₆ sustituido con fenilo, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-imino-C₁-C₃, alquilC₁-C₆-sulfanilo, C₁-C₆-alquilsulfonilo, N-alquilamino C₁-C₆ o N, N-di-alquilamino C₁-C₆;

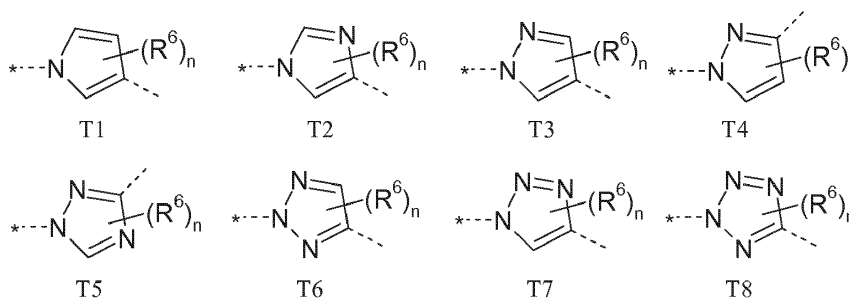
W es oxígeno o azufre;

- 25 Q es hidrógeno, amino o uno de los radicales que están dado el caso sustituidos, independientemente uno de otro, hasta cinco veces por hidroxilo, nitro, amino, flúor, cloro, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, ciano, hidroxycarbonilo, alcoxycarbonilo C₁-C₄, alquilo C₁-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₁-C₆, heterocicloalquilo de 2 a 5 átomos de carbono, alcoxi C₁-C₄, alquinilo C₁-C₆, alcoxycarboniloC₁-C₄, heteroaril (C₁-C₃)-alquilo, N-C₁-C₄-alquilamino, N-C₁-C₄-alquilcarbonilamino o N,N-di-alquilamino C₁-C₄; o

Q es un arilo que está sustituido con 0-4 sustituyentes V o representa un compuesto heteroaromático de 5 o 6 miembros sustituido con 0-4 sustituyentes V, donde

- 30 V es independientemente uno del otro halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, N-C₁-C₆-alcoxi-imino-C₁-C₃-alquilo, alquilsulfonilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, N,N-di-(alquil C₁-C₆)amino, dado el caso sustituidos;

T es uno de los heteroaromáticos de 5 miembros T1-T8 que se enumeran a continuación, en el que el enlace al grupo de la cabeza de pirazol está indicado por un asterisco,



en el que

5 R^6 es independientemente uno de otro, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, amino o un alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , alquilcarbonilo C_1-C_6 , alquilsulfanilo C_1-C_6 , alquilsulfino C_1-C_6 , alquilsulfonilo C_1-C_6 , que está sustituido de una a cinco veces dado el caso con flúor y/o cloro, y

n tiene los valores 0-1;

Z^1 es haloalquilo C_1-C_6 , halocicloalquilo C_1-C_6 , dado el caso sustituido, y

10 Z^2 representa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, amino o un alquilo C_1-C_6 , alquilcarbonilo C_1-C_6 , alquilsulfanilo C_1-C_6 , alquilsulfino C_1-C_6 , alquilsulfonilo C_1-C_6 , que está sustituido de una a cinco veces dado el caso con flúor y/o cloro, y

Z^3 representa hidrógeno o alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_1-C_6 , alqueno C_3-C_4 , alquino C_3-C_4 , arilo y heteroarilo, dado el caso sustituido;

15 También se da preferencia particular a los compuestos de las fórmulas (I) y (II), en los cuales los radicales mencionados a continuación se definen alternativamente como sigue:

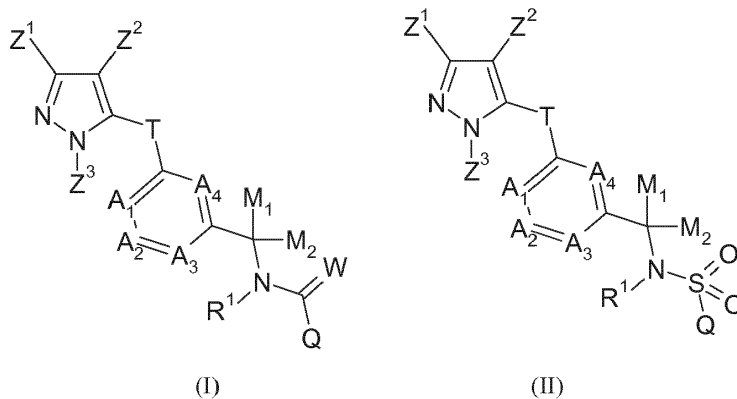
R^6 es independientemente uno del otro, halógeno, ciano, nitro, amino o un alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , alquilcarbonilo C_1-C_6 , alquilcarbonilo C_1-C_6 , alquilsulfonilo C_1-C_6 , alquilsulfino C_1-C_6 , alquilsulfonilo, dado el caso sustituido con halógeno de una a cinco veces, y

Z^1 es un alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_1-C_6 , dado el caso sustituido y

20 Z^2 es hidrogeno, halógeno, ciano, nitro, amino o un alquilo C_1-C_6 , alquilcarbonilo C_1-C_6 , alquilsulfanilo C_1-C_6 , alquilsulfino C_1-C_6 , alquilsulfonilo C_1-C_6 , dado el caso sustituido con flúor y/o cloro, y

Z^3 es hidrógeno o un alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_1-C_6 , alqueno C_1-C_4 , alquino C_1-C_4 , arilo y heteroarilo dado el caso sustituido;

Se da preferencia muy particular a los compuestos de las fórmulas (I) y (II)



25 en las que R^1 es hidrógeno, alquilo C_1-C_4 , alqueno C_3-C_4 , alquino C_3-C_4 , alquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_4 y alcoxycarbonilo C_1-C_4 , alquilcarbonilo C_1-C_4 , alcoxycarbonilo C_1-C_4 , arilo(alquilo C_1-C_2), heteroarilo(alquilo C_1-C_2), que está dado el caso sustituido una o dos veces con flúor, cloro, ciano,

M¹ es hidrógeno,

M² es hidrógeno, alquilo C₁-C₃, alqueno C₂-C₆, cicloalquilo C₁-C₆, alcoxicarbonilo C₁-C₃, que está dado el caso sustituido con halógeno, ciano, alcoxi y alcoxicarbonilo,

M¹ y M² con el átomo de carbono al que están unidos forman un anillo de 3 miembros dado el caso sustituido,

5 los grupos químicos

A₁ es CR² o nitrógeno,

A₂ es CR³ o nitrógeno,

A₃ es CR⁴ o nitrógeno, y

A₄ es CR⁵ o nitrógeno,

10 pero no más de tres de los grupos químicos A₁ a A₄ son simultáneamente nitrógeno;

R², R³, R⁴ y R⁵ son independientemente uno de otro hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano o nitro, sustituidos de una a cinco veces con hidroxilo, nitro, amino, flúor, cloro, alcoxi C₁-C₄, ciano o hidroxicarbonilo. Alcoxicarbonilo C₁-C₄, alquilcarbamoilo C₁-C₄, cicloalquilcarbamoilo C₃-C₇, alquilo C₁-C₄ sustituido con fenilo, C₂-alquilo, C₁-C₄-alquilsulfanilo, C₁-C₄-alquilsulfinilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, N-C₁-C₄-alquilamino o N,N-C₁-C₄-alquilamino;

15 W es oxígeno o azufre;

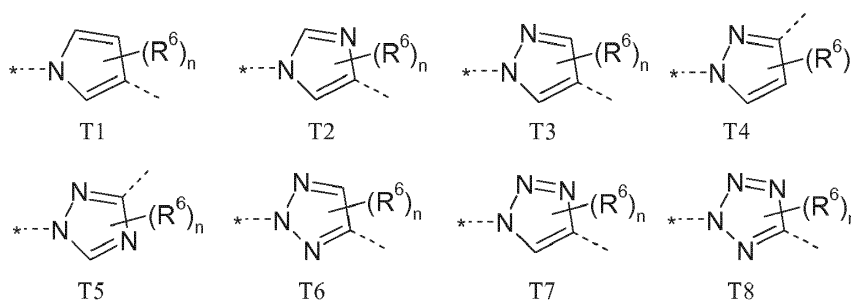
Q es hidrógeno, amino o uno de los radicales independientemente uno de otro que está dado el caso mono- a pentasustituido con hidroxilo, nitro, amino, halógeno, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, ciano, hidroxicarbonilo. Alcoxicarbonilo C₁-C₄, alcoxicarbonilo C₁-C₄, alcoxicarbonilo C₁-C₄, alcoxicarbonilo C₁-C₄, alcoxicarbonilo C₁-C₄, cicloalquilcarbamoilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, arilo (C₁-C₃)alquilo, heteroarilo (C₁-C₃)alquilo, N-C₁-C₄-alquilamino, N-C₁-C₄ alquilcarbonilamino o N, N-di-alquil CC₁-C₄-amino; o

20 Q es un arilo que está sustituido con 0, 1, 2, 3 o 4 sustituyentes V, o es un compuesto heteroaromático de 5 o 6 miembros sustituido con 0, 1, 2, 3 o 4 sustituyentes V, en el que

V es, independientemente uno de otro, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano o nitro, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, ciano, hidroxicarbonilo. Alcoxi C₁-C₄, alcoxicarbonilo C₁-C₄, alquilcarbamoilo C₁-C₄, cicloalquilcarbamoilo C₁-C₆, N-C₁-C₆-alcoxi-imino-C₁-C₃-alquilo, C₁-C₆-alquilsulfanilo, C₁-C₆-alquilsulfinilo, C₁-C₆-alquilsulfonilo, N,N-di-(alquil C₁-C₆)amino, dado el caso mono- a pentasustituido con hidroxilo, nitro, amino, flúor, cloro, bromo, yodo;

25

T es uno de los heteroaromáticos de 5 miembros T1-T8 que se enumeran a continuación, en el que el enlace al grupo de la cabeza de pirazol está indicado por un asterisco,



30

en el que

R⁶ es independientemente uno de otro flúor, cloro, ciano, nitro, amino o un alquilo C₁-C₆ que está dado el caso monosustituido a pentasustituido con flúor y/o cloro, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, alquilsulfanilo C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, y

35 n tiene los valores 0-1;

Z¹ es haloalquilo C₁-C₄, halogencicloalquilo C₃-C₆, que está dado el caso mono- o disustituido con alcoxi C₁-C₄, ciano, hidroxicarbonilo. Alcoxicarbonilo C₁-C₄, alquilcarbamoilo C₁-C₄, cicloalquilcarbamoilo C₃-C₆, fenilo, y

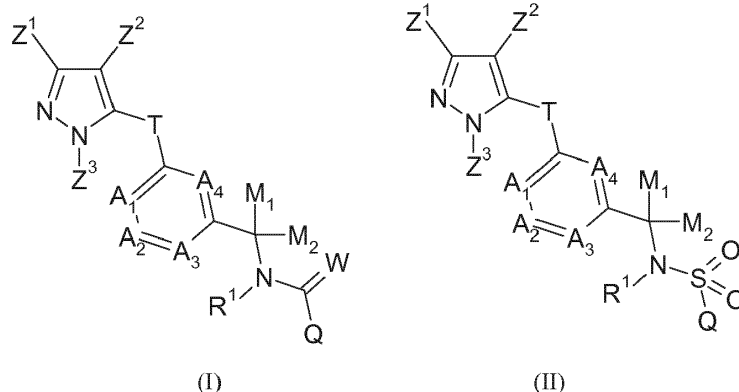
Z² es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, amino o alcoxicarbonilo C₁-C₄, alquilcarbamoilo C₁-C₄, cicloalquilcarbamoilo C₁-C₆, alquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄, alquilsulfanilo C₁-C₄, alquilsulfinilo C₁-C₄,

alquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, sustituidos con fenilo, dado el caso mono- a trisustituido cada uno independientemente de otro por hidroxilo, nitro, amino, flúor, cloro, alcoxi C₁-C₄, ciano o hidroxicarbonilo, y

Z³ es hidrógeno o, en caso dado, independientemente uno del otro, con hidroxilo, nitro, amino, alcoxi C₁-C₄, ciano, flúor, cloro, hidroxicarbonilo. Alcoxicarbonilo C₁-C₄, alquilcarbamoilo C₁-C₄, cicloalquilcarbamoilo C₃-C₆, alquilo C₁-C₄ o, cicloalquilo C₁-C₆, alquenilo C₃-C₄, sustituidos con fenilo;

5

Se da preferencia particular a los compuestos de las fórmulas (I) y (II)



definidas, en las que

10 R¹ es hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilcarbonilo, isopropilcarbonilo, n-butilcarbonilo, isobutilcarbonilo, isopropilcarbonilo, n-butilcarbonilo, isopropilcarbonilo, n-butilcarbonilo, iso-butilcarbonilo, t-butilcarbonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n-propoxicarbonilo, isopropoxicarbonilo, n-butoxicarbonilo, i-butoxicarbonilo, iso-butoxicarbonilo, t-butoxicarbonilo, cianometilo, 2-cianoetilo, bencilo, 4-metoxibencilo, pirid-2 ilmetilo, pirid-3-ilmetilo, pirid-4-ilmetilo, 6-cloropirid-3-il-metilo;

M¹ es hidrógeno,

15 M² Hidrógeno, metilo, etilo, difluorometilo, triclorometilo, diclorofluorometilo, trifluorometilo, ciclopropilo, ciclobutilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo,

M¹ y M² con el átomo de carbono al que están unidos, forman un carbociclo de 3 miembros,

los grupos químicos

A₁ es CR² o nitrógeno,

20 A₂ es CR³ o nitrógeno,

A₃ es CR⁴ o nitrógeno, y

A₄ es CR⁵ o nitrógeno,

pero no más de tres de los grupos químicos A₁ a A₄ son simultáneamente nitrógeno;

R² y R⁵, independientemente uno del otro, son hidrógeno, metilo, flúor y cloro, y

25 R³ y R⁴ son independientemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, metilo, etilo, fluorometilo, difluorometilo, clorodifluorometilo, trifluorometilo, 2,2,2trifluoroetilo, metoxilo, etoxilo, metiletoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, clorodifluorometoxi, diclorofluorometoxi, trifluorometoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, pentafluoroetoxi, N-metoxiiminometilo, 1-(N-metoxiimino)1-metilsulfanilo, trifluorometilsulfanilo, metilsulfonilo, metilsulfino, trifluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfino;

30 W es oxígeno o azufre;

Q es hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, t-butilo, 1-metilpropilo, n-butilo, 2-metilpropilo, 2-metilbutilo, hidroximetilo, 2-hidroxietilo, 2-hidroxipropilo, cianometilo, 2-cianoetilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 1-trifluorometiletilo, 2,2-difluoropropilo, 3,3,3-trifluoropropilo, 2,2-dimetil-3-fluoropropilo, ciclopropilo, 1-ciano-ciclopropilo, ciclopropil-metilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, 1-ciclopropiletilo, bis(ciclopropil)metilo, 2,2-dimetilciclopropilo-metilo, 2-fenilciclopropilo, 2,2-diclorociclopropilo, trans-2-clorociclopropilo, cis-2-clorociclopropilo, 2,2-difluorociclopropilo, trans-2-fluorociclopropilo, cis-2-fluorociclopropilo, trans-4-hidroxiciclohexilo, 4-trifluorometilciclohexil-etenilo, 1-metil-etenilo, prop-1-enilo, 2-metil-prop-1-enilo, 3-metilbut-

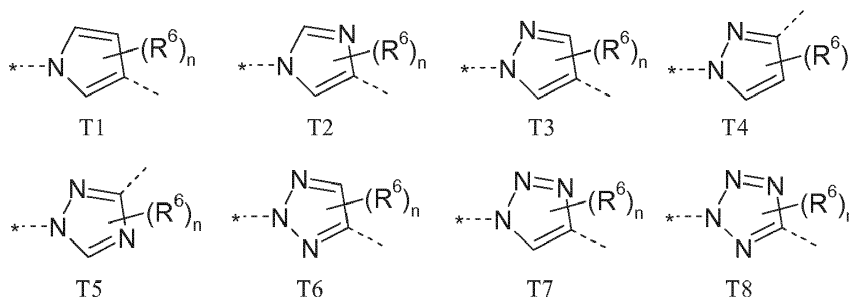
35

1-enilo, 3,3,3-trifluoroprop-1-enilo, 1-etil-etenido, 1-metil-prop-1-enilo, prop-2-inilo, 3- fluoro-prop-2-enilo, oxetan-3-ilo, tietano-3-ilo, 1-óxido-tietan-3-ilo, 1,1-dióxido-tietan-3-ilo, tetrahidrofuran-3-ilo, 1,1-dióxido-tetrahidrotiofen-3-ilo, isoxazol-3-ilmetilo, 1,2,4-triazol-3-ilmetilo, 3-metil-oxetan-3- ilmetilo, bencilo, 2,6-difluorofenilmetilo, 3- fluorofenilmetilo, 2-fluorofenilmetilo, 2,5-difluorofenilmetilo, 1-feniletilo, 4-Chloifeniletirilo, 2-Trifluorometilfeniletilo, 1- piridin-2-iletilo, piridin-2-ilmetilo, 5-fluoropiridin-2-ilmetilo, (6-cloro-piridin-3-il)metilo, pirimidin-2-ilmetilo, tiofen-2- ilmetilo, 2-etoxietilo, 2-metoxietilo, 1-(metilsulfanil)etilo, 2-(metilsulfanil)etilo, 1-metil-2-(etilsulfanil)etilo, 2-metil-1- (metilsulfanil)propan-2-ilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, metoxicarbonilmetilo, NH₂, N-etilamino, N-alilamino, N,N- dimetilamino, N,N-dietilamino, metoxi, etoxi, propoxi, iso-propoxi, tert-butoxi; o

Q es fenilo, naftilo, piridazina, pirazina, pirimidina, triazina, piridina, pirazol, tiazol, isotiazol, oxazol, isoxazol, triazol, imidazol, furano, tiofeno, pirrol, oxadiazol, tiadiazol, sustituido con 0, 1, 2 o 3 sustituyentes V, donde

V es independientemente flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, metilo, etilo, difluorometilo, triclorometilo, clorodifluorometilo, diclorofluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 1-cloro-1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 1,1-difluoroetilo, pentafluoroetilo heptafluoro-n-propilo, heptafluoro-isopropilo, nonafluoro-n-butilo, ciclopropilo, ciclobutilo, metoxi, etoxi, n-propoxi, 1-metiletoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, cloro-difluorometoxi, dicloro-fluorometoxi, trifluorometoxi, 2,2, 2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, pentafluoroetoxi, N-metoxiiminometilo, 1-(N-metoxiimino)etilo, metilsulfanilo, metilsulfonilo, metilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfinilo, trifluorometilsulfanilo, N,N- dimetilamino;

T es uno de los heteroaromáticos de 5 miembros T1-T8 que se enumeran a continuación, en el que el enlace al grupo de la cabeza de pirazol está indicado por un asterisco,



en los que

R⁶ es independientemente flúor, cloro, ciano, nitro, amino, metilo, metilo, propilo, 1-metiletilo, tert-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, etoxi, trifluorometoxi, 2,2-difluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, metilcarbonilo, etilcarbonilo, trifluorometilcarbonilo, metilsulfanilo, metilsulfinilo, metilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfanilo, trifluorometilsulfinilo, y

n tiene los valores 0-1;

Z¹ es difluorometilo, triclorometilo, clorodifluorometilo, diclorofluorometilo, trifluorometilo, bromodiclorometilo, 1- fluoroetilo, 1-fluoro-1-metiletilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 1,2,2,2 tetrafluoroetilo, 1-cloro- 1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 1,1-difluoroetilo, pentafluoroetilo heptafluoro-n- propilo, heptafluoro isopropilo, nonafluoro-n-butilo, ciclopropilo, 1-clorociclopropilo, 1-fluorociclopropilo, 1- Bromciclopropilo, 1-ciano-ciclopropilo, 1-Trifluormehtil-ciclopropilo, ciclobutilo, y 2,2-difluoro-1-metil-ciclopropilo, y

Z² es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, amino, metilo, etilo, 1,1-t-butilo, difluorometilo, triclorometilo, clorodifluorometilo, diclorofluorometilo, trifluorometilo, bromodiclorometilo, 1-fluoroetilo, 1-fluoro- 1-metiletilo, 2- fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 1-cloro-1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 2,2, 2-tricloroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 1,1-difluoroetilo, pentafluoroetilo heptafluoro-n-propilo, heptafluoro-isopropilo, nonafluoro-n-butilo, metilsulfanilo, metilsulfinilo, metilsulfonilo, etiltio, etilsulfinilo, etilsulfonilo, trifluorometilsulfanilo, trifluorometilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, cloro-difluorometilsulfanilo, cloro-difluorometilsulfinilo, cloro- difluorometilsulfonilo, dicloro-fluorometilsulfanilo, dicloro-fluorometilsulfinilo, dicloro-fluorometilsulfonilo, y

Z³ es hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, s-butilo, t-butilo, 1-propenilo, 1-propinilo, 1- butinilo, difluorometilo, triclorometilo, clorodifluorometilo, diclorofluorometilo, trifluorometilo, 1 fluoroetilo, 1-fluoro-1- metiletilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, fenilo, 2-clorofenilo, 3-clorofenilo. 4-clorofenilo, 2,4- Dicloropenilo, 2,5-diclorofenilo, 3,4-diclorofenilo, 2,6-diclorofenil son 2,6-dicloro-4-trifluormehtilfenilo, 3-cloro-5- trifluorometil-piridin-2-ilo;

Además, se prefieren especialmente los compuestos de las fórmulas (I) y (II), en los cuales los radicales mencionados a continuación se definen de manera alternativa como sigue:

R¹ es hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, metoximetilo, etoximetilo, propoximetilo, metilcarbonilo, etilcarbonilo, n-propilcarbonilo, isopropilcarbonilo, s-butilcarbonilo, t-butilcarbonilo, y similares, Metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n-propoxicarbonilo, isopropoxicarbonilo, iso-butoxicarbonilo, t-butoxicarbonilo, cianometilo, 2-cianoetilo, bencilo, 4-metoxibencilo, pirid-2-ilmetilo, pirid-3-ilmetilo, pirid-4-il-metilo, 6-cloropirid-3-il-metilo;

5 M² es hidrógeno, alquilo C₁-C₃, alqueno C₂-C₃, cicloalquilo C₁-C₆, alcoxicarbonilo C₁-C₃, ciano o ciano-alquilo C₁-C₂,

Q es hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, 1-metiletilo, 1,1-dimetiletilo, 1-metilpropilo, n-butilo, 2-metilpropilo, 2-metilbutilo, hidroximetilo, 2-hidroxiopropilo, cianometilo, 2-cianoetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 1-trifluorometiletilo, 2,2-difluoropropilo, 3,3,3-Trifluoropropilo, 2,2-dimetil-3-fluoropropilo, ciclopropilo, 1-ciano-ciclopropilo, 1-metoxicarbonil-ciclopropilo, 1-(N-metilcarbamoil)ciclopropilo, 1-(N-ciclopropilcarbamoil)ciclopropilo, 10 ciclopropil-metilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, 1-ciclopropiletilo, 2-bis(ciclopropil)metilo, 2-metil-dimetilciclopropilo, 2-fenilciclopropilo, 2,2-diclorociclopropilo, trans-2-clorociclopropilo, cis-2-clorociclopropilo, 2,2-difluorociclopropilo, trans-2-fluorociclopropilo, cis-2-fluorociclopropilo, trans-4-hidroxiciclohexilo, 4-trifluorometilciclohexilo, prop-2-enilo, 2-metil-prop-2-enilo, prop-2-inilo, 1,1-dimetilbut-2-inilo, 3-cloro-prop-2-enilo, 3,3-Dicloro-prop-2-enilo, 3,3-dicloro-1,1-dimetilprop-2-enilo, fenilo, 2-Clorofenilo, 3-clorofenilo, 4-clorofenilo, oxetano-3-ilo, 15 tietano-3-ilo, 1-óxido-tietan-3-ilo, 1,1-dióxido-tietan-3-ilo, isoxazol-3-ilmetilo, 1,2,4-triazol-3-ilmetilo, 3-metil-oxetan-3-ilmetilo, bencilo, 2,6-difluorofenilmetilo, 3-fluorofenilmetilo, 2-fluorofenilmetilo, 2,5-difluorofenilmetilo, 1-feniletilo, 4-clorofeniletilo, 2-trifluorometilfeniletilo, 1-piridin-2-iletilo, piridin-2-ilmetilo, 5-fluoropiridin-2-ilmetilo, (6-cloro-piridin-3-il)metilo, pirimidin-2-ilmetilo, metoxi, 2- etoxietilo, 2-(metilsulfanil)etilo, 1-metil-2-(etilsulfanil)etilo, 2-metil-1-(metilsulfanil)propan-2-ilo, metoxicarbonilo, metoxicarbonilmetilo, NH₂, N-etilamino, N-alilamino, N,N-dimetilamina, N,N-dietilamino; o

Q que está sustituido 4 sustituyentes V es fenilo, naftilo, piridazina, pirazina, pirimidina, triazina, piridina, pirazol, tiazol, isotiazol, oxazol, isoxazol, triazol, imidazol, furano, tiofeno, pirrol, oxadiazol, tiadiazol, en el que

V es independientemente flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, metilo, etilo, difluorometilo, triclorometilo, 25 clorodifluorometilo, diclorofluorometilo, trifluorometilo, clorometilo, bromometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 1-cloro-1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 1,1-difluoretilo, pentafluoroetilo pentafluoro-tert-butilo, heptafluoro-n-propilo, heptafluoro-isopropilo, nonafluoro-n-butilo, ciclopropilo, ciclobutilo, metoxi, etoxi, n-propoxi, 1-metiletoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, cloro-difluorometoxi, dicloro-fluorometoxi, trifluorometoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, pentafluoroetoxi, N-metoxiiminometilo, 1-(N-metoxiimino)etilo, metilsulfanilo, metilsulfonilo, metilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, 30 trifluorometilsulfinilo, trifluorometilsulfanilo, N,N-dimetilamino;

R⁶ representa independientemente halógeno, ciano, nitro, amino, metilo, etilo, 1-metiletilo, tert-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, etoxi, trifluorometoxi, 2,2-difluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, metilcarbonilo, etilcarbonilo, trifluorometilcarbonilo, metilsulfanilo, metilsulfinilo, metilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo, Trifluorometilsulfanilo, 35 trifluorometilsulfinilo, y

n tiene los valores 0-1;

Z¹ es metilo, etilo, 1,1-dimetiletilo, difluorometilo, triclorometilo, clorodifluorometilo, diclorofluorometilo, trifluorometilo, bromodiclorometilo, clorometilo, bromometilo, 1-fluoroetilo, 1-fluoro-1-metiletilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 1-cloro-1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 1,1-difluoretilo, pentafluoroetilo pentafluoro-t-butilo, heptafluoro-n-propilo, heptafluoro-isopropilo, nonafluoro-n-butilo, 40 ciclopropilo, 1-clorociclopropilo, 1-fluorociclopropilo, 1-Bromociclopropilo, 1-ciano-ciclopropilo, 1-trifluorometil-ciclopropilo, ciclobutilo, y 2,2-difluoro-1-metil-ciclopropilo, y

Z² es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro amino, metilo, etilo, 1,1-dimetiletilo, difluorometilo, triclorometilo, clorodifluorometilo, diclorofluorometilo, trifluorometilo, bromodiclorometilo, clorometilo, bromometilo, 1-fluoroetilo, 1-fluoro-1-metiletilo, 2 1-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 1-cloro-1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, 2 cloro-2,2-difluoroetilo, 1,1-difluoretilo, pentafluoroetilo pentafluoro-t-butilo, 45 heptafluoro-n-propilo, heptafluoro-isopropilo, nonafluoro-n-butilo, metilsulfanilo, metilsulfinilo, metilsulfonilo, etiltio, etilsulfinilo, etilsulfonilo, trifluorometilsulfanilo, trifluorometilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, cloro-difluorometilsulfanilo, cloro-difluorometilsulfinilo, cloro-difluorometilsulfonilo, dicloro-fluorometilsulfanilo, dicloro-fluorometilsulfinilo, dicloro-fluorometilsulfonilo y

Z³ es hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, s-butilo, t-butilo, etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-propinilo, 1-butinilo, difluorometilo, triclorometilo, clorodifluorometilo, diclorofluorometilo, trifluorometilo, clorometilo, bromometilo, 1-fluoroetilo, 1-fluoro-1-metiletilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, fenilo, 2-clorofenilo, 3-clorofenilo, 3-cloro-5-trifluorometil-piridin-2-il 4-clorofenilo, 2,5-diclorofenilo, 3,4-diclorofenilo, 2,6-diclorofenilo, 2,6-dicloro-4-trifluorometilfenilo, 3-cloro-5-trifluorometilpiridin-2-ilo;

55 Compuestos particularmente preferidos en el contexto de la invención son los de las fórmulas generales (I) y (II)

en los que

Z¹ es trifluorometilo, 1-clorociclopropilo, 1-fluorociclopropilo o pentafluoroetilo,

Z² es trifluorometilo, nitro, metilsulfanilo, metilsulfonilo, metilsulfonilo, flúor, cloro, bromo, ciano o yodo,

Z³ es metilo, etilo, n-propilo o hidrógeno,

5 R¹ es hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, isobutilo, t-butilo, metoximetilo, etoximetilo, propoximetilo, metilcarbonilo, etilcarbonilo, n-propilcarbonilo, isopropilcarbonilo, n-butilcarbonilo, N-butoxicarbonilo, isobutoxicarbonilo, iso-butoxicarbonilo, t-butoxicarbonilo, cianometilo, 2-cianoetilo, bencilo, 4-metoxibencilo, isobutilcarbonilo, s-butilcarbonilo, t-butilcarbonilo, -2-ilmetilo, pirid-3-ilmetilo, pirid-4-ilmetilo, 6-cloropirid-3-il-metilo,

M¹ es hidrógeno;

10 M² es hidrógeno o metilo;

M¹ y M² con el átomo de carbono al que están unidos, forman un carbociclo de 3 miembros,

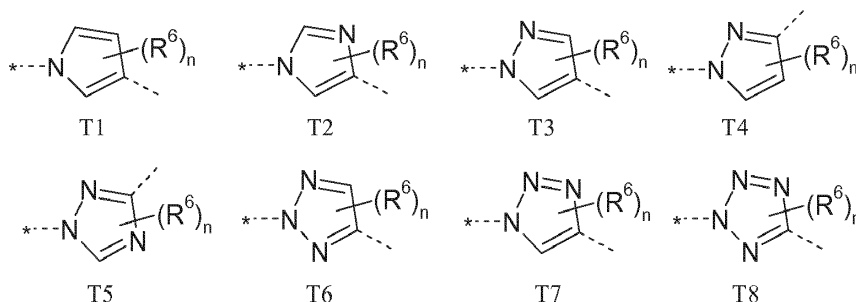
A₁ y A₄ son CH

A₂ es CH o N,

A₃ es CR⁴ y

15 R⁴ es metilo, etilo, flúor, cloro, bromo o yodo

T es uno de los heteroaromáticos de 5 miembros T1-T8 que se enumeran a continuación, en el que el enlace al grupo de la cabeza de pirazol está indicado por un asterisco,



20 en la que

R⁶ es hidrógeno, metilo, etilo, 2-metiletilo, 2,2-dimetiletilo, flúor, cloro, bromo, yodo, nitro, trifluorometilo, amino,

W es oxígeno y

25 Q es hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, 1-metiletilo, 1,1-dimetiletilo, n-butilo, 1-metilpropilo, 2-metilpropilo, 2-metilbutilo, Hydroximetil2-hidroxiopropilo, cianometilo, 2-cianoetilo, 2- fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 1-trifluorometiletilo, 2,2-difluoropropilo, 3,3,3-Trifluorpropilo, 2,2-dimetil-3-fluoropropilo, ciclopropilo, ciclopropil-metilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, 1-ciclopropiletilo, bis(ciclopropil)metilo, 2,2-dimetilciclopropilo-metilo, 2-fenilciclopropilo, 2,2-diclorociclopropilo, trans-2-clorociclopropilo, cis-2-clorociclopropilo, 2,2- difluorociclopropilo, trans-2-fluorociclopropilo, cis-2-fluorociclopropilo, trans-4-hidroxiciclohexilo, 4-trifluormetilciclohexilo, etenilo, 1-metil-etenilo, prop-1-enilo, 2-metil-prop-1-enilo, 3-metilbut-1- enilo, 3,3,3-trifluoroprop-1-enilo, 1-etil-etenilo, 1-metil-prop-1-enilo, prop-2-inilo, 3-fluoro-prop-2-enilo, oxetan-3-ilo, tietan-3-ilo, 1-óxido-tietan-3-ilo, 1,1-dióxido-tietan-3-ilo, isoxazol-3-ilmetilo, 1,2,4-triazol-3- ilmetilo, 3-metil-oxetan-3-ilmetilo, bencilo, 2,6-difluorofenilmetilo, 3-fluorofenilmetilo, 2-fluorofenilmetilo, 2,5-difluorofenilmetilo, 1-feniletilo, 4-clorofeniletilo, 2-Trifluormetilfeniletilo, 1-piridin-2- iletilo, piridin-2-ilmetilo, (6-cloro-piridin-3-il)metilo, 5-fluoro-piridin-2-ilmetilo, pirimidin-2-ilmetilo, metoxi, 2-etoxietilo, 2-(metilsulfanil)etilo, 1-metil-2-(etilsufanil)etilo, 2-metil-1-(metilsulfanil)propan-2-ilo, metoxicarbonilo, metoxicarbonilmetilo, NH₂, N-etilamino, N-alilamino, N,N-dimetilamino, N,N-dietilamino, metoxi, etoxi, propoxi, iso-propoxi, tert-butoxi; o

Q es 0, 1, 2, 3 sustituyentes V sustituidos con fenilo, naftilo, piridazina, pirazina, pirimidina, triazina, piridina, pirazol, tiazol, isotiazol, oxazol, isoxazol, triazol, imidazol, furano, tiofeno, pirrol, oxadiazol, tiadiazol, en el que

40 V es independientemente flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, metilo, etilo, difluorometilo, triclorometilo, clorodifluorometilo, diclorofluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo,

1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 1-cloro-1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 1,1-ifuoretilo, pentafluoroetilo, heptafluoro-n-propilo, heptafluoro-isopropilo, nonafluoro-n-butilo, ciclopropilo, ciclobutilo, metoxi, etoxi, n-propoxi, 1-metiletoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, cloro-difluorometoxi, dicloro-fluorometoxi, trifluorometoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, pentafluoroetoxi, N-metoxiiminometilo, 1-(N-metoxiimino)-etilo, 1, metilsulfanilo, metilsulfonilo, metilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfinilo, trifluorometilsulfanilo, N,N-dimetilamino;

Compuestos particularmente preferidos son también aquellos en los que los siguientes radicales se definen de manera alternativa como sigue:

R¹ es hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, i-butilo, s-butilo, t-butilo, metoximetilo, etoximetilo, propoximetilo, metilcarbonilo, etilcarbonilo, n-propilcarbonilo, isopropilcarbonilo, sec.-butilcarbonilo, t-butilcarbonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n-propoxicarbonilo, isopropoxicarbonilo, iso-butoxicarbonilo, t-butoxicarbonilo, cianometilo, 2-cianoetilo, bencilo, 4-metoxibencilo, pirid-2-il-metilo, pirid-3-il-metilo, pirid-4-ilmetilo, 6-cloropirid-3-il metilo,

A₁, A₂ y A₄ son CH,

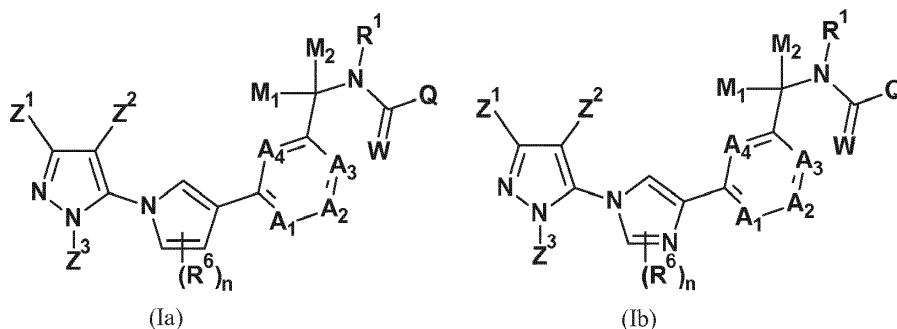
R⁴ es flúor, cloro, bromo o yodo

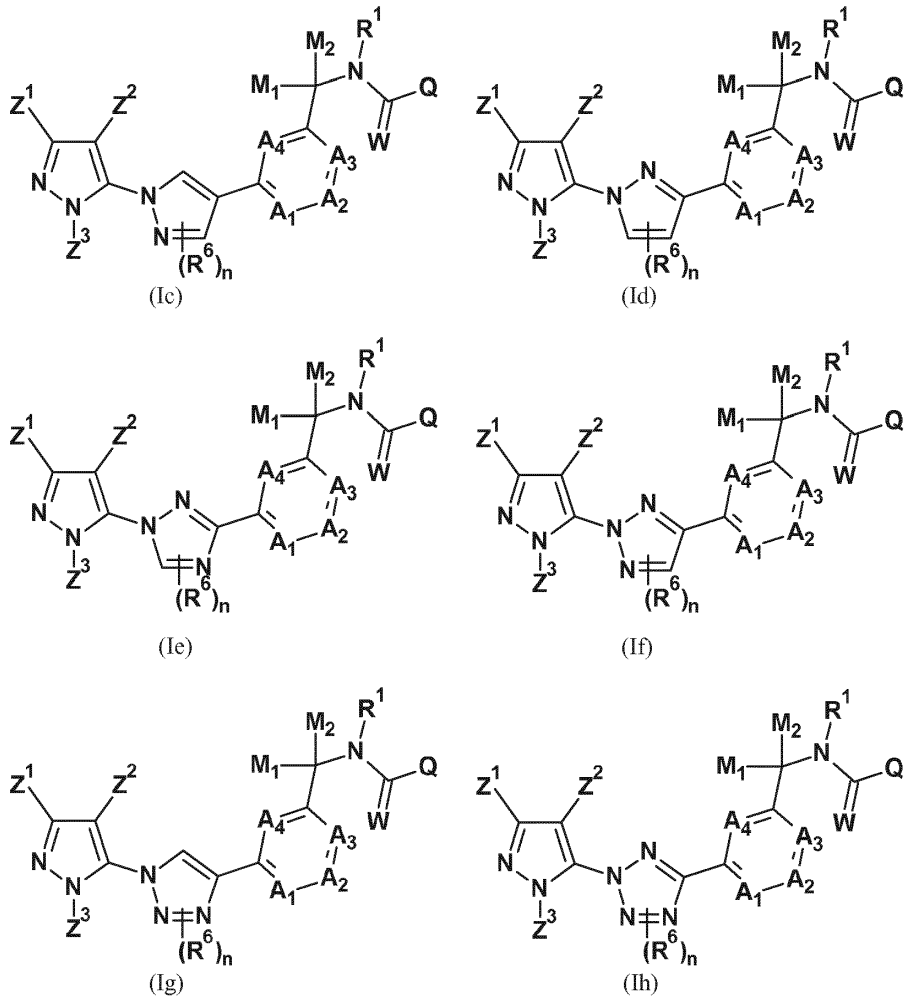
Q es hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, 1-metiletilo, 1,1-dimetiletilo, n-butilo, 1-metilpropilo, 2-metilpropilo, 2-metilbutilo, hidroximetilo, 2-hidroxiopropilo, cianometilo, 2-cianoetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 1-trifluorometiletilo, 2,2-difluoropropilo, 3,3,3-Trifluoropropilo, 2,2-dimetil-3-fluoropropilo, ciclopropilo, 1-ciano-ciclopropilo, 1-metoxicarbonil-ciclopropilo, 1-(N-metilcarbamoil)ciclopropilo, 1-(N-ciclopropilcarbamoil)ciclopropilo, ciclopropil-metilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, 1-ciclopropiletilo, bis(ciclopropil)metilo, 2,2-metil-dimetilciclopropilo, 2-fenilciclopropilo, 2,2-diclorociclopropilo, trans-2-clorociclopropilo, cis-2-clorociclopropilo, 2,2-difluorociclopropilo, trans-2-fluorociclopropilo, cis-2-fluorociclopropilo, trans-4-hidroxiciclohexilo, 4-trifluorometilciclohexilo, prop-2-enilo, 2-metil-prop-2-enilo, prop-2-inilo, 1,1-dimetilbut-2-inilo, 3-cloro-prop-2-enil "3,3-dicloro-prop-2-enilo, 3,3-dicloro-1,1-dimetilprop-2-enilo, fenilo, 2 Clorofenilo, 3-clorofenilo, 4-clorofenilo, oxetano-3-ilo, tietano-3-ilo, 1-óxido-tietan-3-ilo, 1,1-dióxido-tietan-3-ilo, isoxazol-3-ilmetil, 1,2,4-triazol-3-ilmetilo, 3-metil-oxetan-3-ilmetilo, bencilo, 2,6-difluorofenilmetilo, 3-fluorofenilmetilo, 2-fluorofenilmetilo, 2,5-difluorofenilmetilo, 1-feniletilo, 4-clorofeniletilo, 2-Trifluorometilfeniletilo, 1-piridin-2-iletilo, piridin-2-ilmetilo, (6-cloro-piridin-3-il)metilo, 5-fluoro-piridin-2-ilmetilo, pirimidin-2-ilmetilo, metoxi, 2- etoxietilo, 2-(metilsulfanil)etilo, 1-metil-2-(etilsulfanil)etilo, 2-metil-1-(metilsulfanil)propan-2-ilo, metoxicarbonilo, metoxicarbonilmetilo, NH₂, N-etilamino, N-alilamino, N, N-dimetilamino, N,N-dietilamino; o

Q es fenilo, naftilo, piridazina, pirazina, pirimidina, triazina, piridina, pirazol, tiazol, isotiazol, oxazol, isoxazol, triazol, imidazol, furano, tiofeno, pirrol, oxadiazol, tiadiazol, sustituido con 0-4 sustituyentes V, en los que

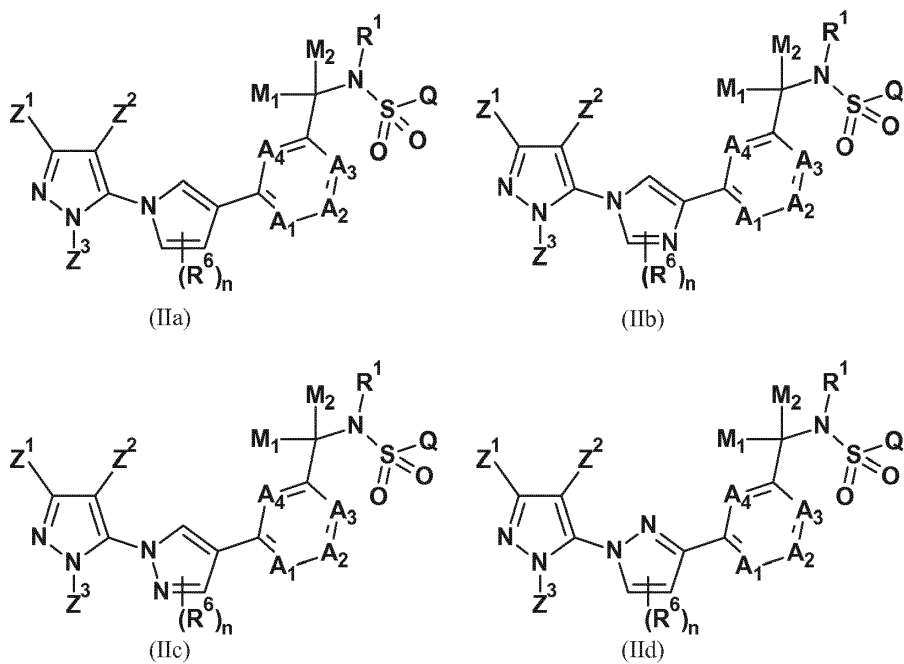
V es independientemente flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, metilo, etilo, difluorometilo, triclorometilo, clorodifluorometilo, diclorofluorometilo, trifluorometilo, clorometilo, bromometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 1-cloro-1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 1,1-difluoroetilo, pentafluoroetilo pentafluoro-tert-butilo, heptafluoro-n-propilo, heptafluoro-isopropilo, nonafluoro-n-butilo, ciclopropilo, ciclobutilo, metoxi, etoxi, n-propoxi, 1-metiletoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, cloro-difluorometoxi, dicloro-fluorometoxi, trifluorometoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, pentafluoroetoxi, N-metoxiiminometilo, 1-(N-metoxiimino) etilo, metilsulfanilo, metilsulfonilo, metilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfinilo, trifluorometilsulfanilo, N,N-dimetilamino;

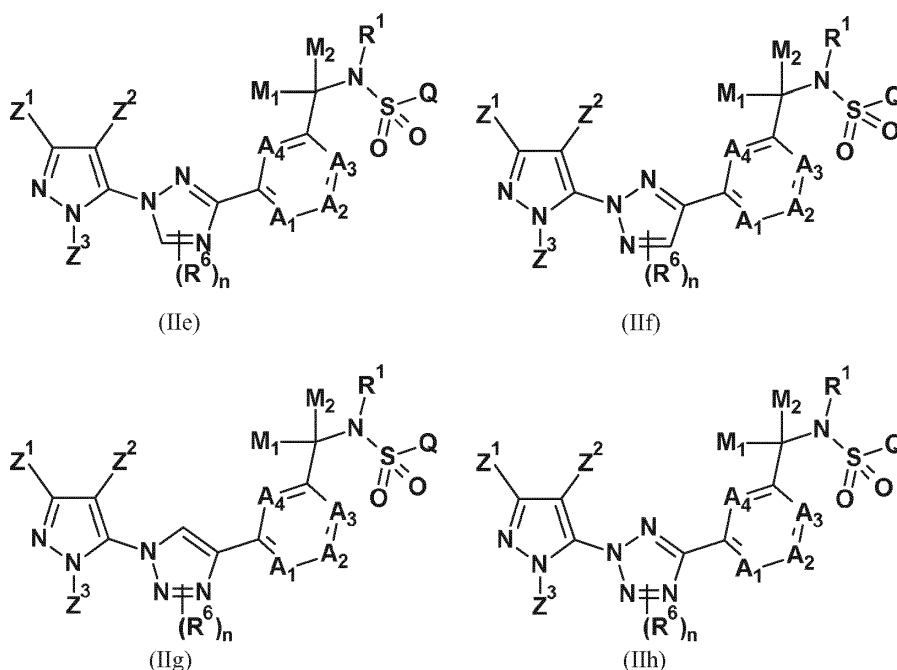
Compuestos particularmente preferidos para los fines de la invención son los de las fórmulas generales (Ia), (Ib), (Ic), (Id), (Ie), (If), (Ig), (Ih), en las cuales A₁-A₄, n, W, Q, R¹, R⁶, M¹, M² y R¹-R³ tienen los significados descritos anteriormente.,





5 Los compuestos especialmente acentuados según la invención son también los de las fórmulas generales (IIa), (IIb), (IIc), (IId), (IIe), (IIf), (IIg), (IIh) los radicales A₁-A₄, n, W, Q, R¹, R⁶, M¹, M² y Z¹-Z³ tienen los significados descritos anteriormente





De acuerdo con la invención, "alquilo", en el caso de ácidos carbónicos de cadena lineal o ramificada, preferiblemente de 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, t-butilo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 1,2-dimetilpropilo, 1,1-dimetilpropilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, hexilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,2-dimetilpropilo, 1,3-dimetilbutilo, 1,4-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 1,1-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etilbutilo y 2-etilbutilo. Más preferido para alquilos que tienen de 1 a 4 átomos de carbono, tales como, entre otros, metilo, etilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo o t-butilo. Los alquilos de acuerdo con la invención pueden estar sustituidos por uno o más radicales idénticos o diferentes.

Según la invención, "alqueno" es -solo o como parte de un grupo químico- un hidrocarburo de cadena lineal, preferiblemente de 2 a 6 átomos de carbono y al menos un doble enlace, tales como vinilo, 2-propenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 2-propilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1,2-dimetil-2-propenilo, 1-etil-2-propenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1-metil-2-pentenilo, 2-metil-2-pentenilo, 3-metil-2-pentenilo, 4-metil-2-pentenilo, 3-metil-3-pentenilo, 4-metil-3-pentenilo, 1-metil-4-pentenilo, 2-metil-1-dimetil-2-butenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, 1,2-dimetil-3-butenilo, 2-dimetil-3-butenilo, 2,3-dimetil-2-butenilo, 2,3-dimetil-1-etil-3-butenilo, 2-etil-2-butenilo, 2-etil-3-butenilo, 1,1,2-trimetil-2-propenilo, 1-etil-1-metil-2-propenilo y 1-etil-2-metil-2-propenilo. Más preferido es alquenos que tienen de 2 a 4 átomos de carbono, tales como, entre otros, 2-propenilo, 2-butenilo o 1-metil-2-propenilo. Los alquenos de acuerdo con la invención pueden estar sustituidos por uno o más radicales idénticos o diferentes.

Según la invención, "alquino" es -solo o como parte de un grupo químico- un hidrocarburo de cadena lineal, preferiblemente de 2 a 6 átomos de carbono y al menos un triple enlace tales como 2-propinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 1-metil-2-propinilo, 2-pentinilo, 3-pentinilo, 4-pentinilo, 1-metil-3-butinilo, 2-metil-3-butinilo, 1-metil-2-butinilo, 1,1-dimetil-2-propinilo, 1-etil-2-propinilo, 2-hexinilo, 3-hexinilo, 4-hexinilo, 5-hexinilo, 1-metil-2-pentinilo, 1-metil-3-pentinilo, 1-metil-4-pentinilo, 2-metil-3-pentinilo, 2-metil-4-pentinilo, 3-metil-4-pentinilo, 4-metil-2-pentinilo, 1,1-dimetil-3-butinilo, 1,2-dimetil-3-butinilo, 2,2-dimetil-3-butinilo, 1-etil-3-butinilo, 2-etil-3-butinilo, 1-etil-1-metil-2-propinilo, y 2,5-hexadiinilo. También se prefiere un alquino que tiene de 2 a 4 átomos de carbono tales como, etinilo, entre otras cosas, 2-propinilo o 2-butinilo-2-propenilo. Los alquinos según la invención pueden estar sustituidos por uno o más radicales idénticos o diferentes.

Según la invención, "cicloalquilo" es -solo o como parte de un grupo químico- un hidrocarburo mono-, bi- o tricíclico, que tiene preferiblemente 3 a 10 carbonos, tales como ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, ciclooctilo, biciclo[2.2.1]heptilo, biciclo[2.2.2]octilo o adamantilo. Además representa preferiblemente cicloalquilos que tienen 3, 4, 5, 6 o 7 átomos de carbono, tales como, entre otras cosas, ciclopropilo, o ciclobutilo. Los cicloalquilos según la invención pueden estar sustituidos por uno o más radicales idénticos o diferentes.

Según la invención, "alquilocicloalquilo" significa alquilocicloalquilo mono-, bi- o tricíclico, que tiene preferiblemente de 4 a 10 o de 4 a 7 átomos de carbono tales como, por ejemplo, etilociclopropilo, isopropilciclobutilo, 3-metilciclopentilo y 4-metil-ciclohexilo. También se prefiere un alquilocicloalquilo con 4, 5 o 7 átomos de carbono, tales como, entre otros,

etilciclopropilo o 4-metil-ciclohexilo. Los alquilocicloalquilos según la invención pueden estar sustituidos con uno o más radicales idénticos o diferentes.

5 Según la presente invención "cicloalquilalquilo" es cicloalquilalquilo mono-, bi- o tricíclico, preferiblemente de 4 a 10 o de 4 a 7 átomos de carbono, tales como ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo, ciclohexilmetilo y ciclopentiletilo. También se prefieren cicloalquilalquilos que tienen 4, 5 o 7 átomos de carbono, tales como, entre otros, ciclopropilmetilo o ciclobutilmetilo. Los cicloalquilalquilos de acuerdo con la invención pueden estar sustituidos por uno o más radicales idénticos o diferentes.

Según la invención, "halógeno" es flúor, cloro, bromo o yodo, en particular flúor, cloro o bromo.

10 Los grupos químicos sustituidos con halógeno según la presente invención, tales como haloalquilo, halocicloalquilo, haloalcoxi, halogenoalquilsulfanilo, halogenoalquilsulfino o halogenoalquilsulfonilo son una o más veces hasta el número máximo posible de sustituyentes sustituidos con halógeno. En el caso de sustitución múltiple con halógeno, los átomos de halógeno pueden ser idénticos o diferentes y pueden unirse todos a uno o más átomos de carbono. El halógeno es, en particular, flúor, cloro, bromo o yodo, preferiblemente flúor, cloro o bromo y, de manera especialmente preferida, flúor.

15 Según la invención, "halocicloalquilo" significa halocicloalquilo mono-, bi- o tricíclico, preferiblemente con 3 a 10 átomos de carbono, tales como, entre otros, 1-fluoro-ciclopropilo, 2-fluoro-ciclopropilo o 1-fluoro-ciclobutilo. También se prefiere el halocicloalquilo que tiene 3, 5 o 7 átomos de carbono. Los halocicloalquilos de acuerdo con la invención pueden estar sustituidos por uno o más radicales idénticos o diferentes.

20 De acuerdo con la invención "haloalquilo", "haloalquenilo" o "haloalquinilo" están sustituidos con alquilos de halógeno, alquilenilos o alquinilos que tienen preferiblemente 1 a 9 átomos de halógeno iguales o diferentes, tales como monohaloalquilo (= monohaloalquilo) como $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$, CHClCH_3 , CHFCH_3 , CH_2Cl , CH_2F ; perhaloalquilo tal como CCl_3 o CF_3 o CF_2CF_3 ; polihaloalquilo como CHF_2 , CH_2F , CH_2CHFCl , CHCl_2 , $\text{CF}_2\text{CF}_2\text{H}$, CH_2CF_3 . Lo mismo se aplica a haloalquenilo y otros radicales sustituidos con halógeno. El haloalcoxi es, por ejemplo, OCF_3 , OCHF_2 , OCH_2F , OCF_2CF_3 , OCH_2CF_3 y $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$;

25 Otros ejemplos de haloalquilos son triclorometilo, clorodifluorometilo, diclorofluorometilo, clorometilo, bromometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, pentafluoroetilo y pentafluoro-tert-butilo. Se prefieren haloalquilos que tienen de 1 a 4 átomos de carbono y 1 a 9, preferiblemente de 1 a 5 átomos de halógeno iguales o diferentes seleccionados entre flúor, cloro o bromo. Especialmente preferidos son los haloalquilos que tienen 1 o 2 átomos de carbono y 1 a 5 átomos de halógeno iguales o diferentes seleccionados entre flúor y cloro, tales como, entre otros, difluorometilo, trifluorometilo o 2,2-difluoroetilo.

30 Según la invención, "hidroxialquilo" significa alcohol de cadena lineal o ramificada, que tiene preferiblemente 1 a 6 átomos de carbono, tales como metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol, isobutanol, s-butanol y t-butanol. También se prefiere para grupos hidroxialquilo que tienen 1 a 4 átomos de carbono. Los grupos hidroxialquilo de acuerdo con la invención pueden estar sustituidos por uno o más radicales idénticos o diferentes

35 De acuerdo con la invención "alcoxi" representa O-alquilo de cadena lineal o ramificada, preferiblemente tiene de 1 a 6 átomos de carbono, tales como metoxi, etoxi, n-propoxi, isopropoxi, n-butoxi, isobutoxi, iso-butoxi y t-butoxi. También se prefiere para grupos alcoxi que tienen de 1 a 4 átomos de carbono. Los grupos alcoxi de acuerdo con la invención pueden estar sustituidos por uno o más radicales idénticos o diferentes.

40 Según la invención es "haloalcoxi" se sustituye con cadena de halógeno o ramificado O-alquilo, preferiblemente que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, tales como, entre otras cosas, difluorometoxi, trifluorometoxi, 2,2-difluoroetoxi, 1,1,2,2-tetrafluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi y 2-cloro-1,1,2-trifluoroetoxi. También se prefiere para grupos haloalcoxi que tienen de 1 a 4 átomos de carbono. Los grupos haloalcoxi de acuerdo con la invención pueden estar sustituidos por uno o más radicales idénticos o diferentes.

45 Según la invención "alquilsulfanilo" se refiere a S-alquilo de cadena lineal o ramificada, preferiblemente que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, tales como metiltio, etiltio, n-propiltio, isopropiltio, n-butiltio, isobutiltio, s-butiltio y t-butiltio. También se prefiere para alquilsulfanilo tiene $\text{C}_1\text{-C}_4$. La invención alquilsulfanilo puede estar sustituido con uno o más radicales idénticos o diferentes.

50 Ejemplos de grupos halogenoalquilsulfanilo, es decir, alquilsulfanilo sustituido con halógeno, incluyen difluorometiltio, trifluorometiltio, triclorometiltio, clorodifluormetiltio, 1-fluoroetiltio, 2-fluoroetiltio, 2,2-difluoroetiltio, 1,1,2,2-tetrafluoroetiltio, 2,2,2-trifluoroetiltio o 2-cloro-1,1,2-trifluoroetiltio.

Según la invención "alquilsulfino" representa alquilsulfino de cadena lineal o ramificada que tiene preferiblemente de 1 a 6 átomos de carbono, tales como metilsulfino, etilsulfino, n-propilsulfino, isopropsulfino, n-butilsulfino,

isobutilsulfinilo, s-butilsulfinilo y t-butilsulfinilo. Más preferiblemente, grupos alquilsulfinilo que tienen 1 a 4 átomos de carbono. El alquilsulfinilo según la invención puede estar sustituido con uno o más radicales idénticos o diferentes.

Ejemplos de grupos "halogenoalquilsulfinilo", es decir, grupos alquilsulfinilo sustituidos con halógeno incluyen difluorometilsulfinilo, trifluorometilsulfinilo, triclorometilsulfinilo, clorodifluorometilsulfinilo, 1-fluoroetilsulfinilo, 2-fluoroetilsulfinilo, 2,2-difluoroetilsulfinilo, 1,1,2,2-tetrafluoroetilsulfinilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfinilo y 2-cloro-1,1,2-trifluoroetilsulfinilo.

Según la invención "alquilsulfonylo" representa alquilsulfonylo de cadena lineal o ramificada que tiene preferiblemente de 1 a 6 átomos de carbono, tal como metilsulfonylo, etilsulfonylo, n-propilsulfonylo, isopropilsulfonylo, n-butilsulfonylo, isobutilsulfonylo, s-butilsulfonylo y t-butilsulfonylo. Más preferiblemente grupos alquilsulfonylo que tienen 1 a 4 átomos de carbono. La invención alquilsulfonylo puede estar sustituido con uno o más radicales idénticos o diferentes.

Ejemplos de grupos halogenoalquilsulfonylo, es decir, sustituido con halógeno alquilsulfonylo grupos son, entre otras cosas, difluorometilsulfonylo, trifluorometilsulfonylo, triclorometilsulfonylo, clorodifluorometilsulfonylo, 1-fluoroetilsulfonylo, 2-fluoroetilsulfonylo, 2,2-Difluoroetilsulfonylo, 1,1,2,2-tetrafluoroetilsulfonylo, 2,2,2-trifluoroetilsulfonylo y 2-cloro-1,1,2-trifluoroetilsulfonylo.

Según la invención "alquilcarbonilo" representa alquilo-C(=O) de cadena lineal o ramificada de, preferiblemente con 2 a 7 átomos de carbono, tal como metilcarbonilo, etilcarbonilo, n-propilcarbonilo, isopropilcarbonilo, s-butilcarbonilo y t-butilcarbonilo. También se prefieren alquilcarbonilos que tienen de 1 a 4 átomos de carbono. El alquilcarbonilo de la invención puede estar sustituido con uno o más radicales idénticos o diferentes.

Según la invención "cicloalquilcarbonilo" representa un grupo cicloalquilcarbonilo de cadena lineal o ramificada, preferiblemente tiene de 3 a 10 átomos de carbono en el grupo cicloalquilo, tales como ciclopropilcarbonilo, ciclobutilcarbonilo, ciclopentilcarbonilo, ciclohexil-carbonilo, cicloheptilcarbonilo, ciclooctilcarbonilo, biciclo[2.2.1]heptilo, biciclo[2.2.0.2]octilcarbonilo y adamantilcarbonilo. Además, es preferiblemente, cicloalquilcarbonilo que tiene de 3, 5 o 7 átomos de carbono en el grupo cicloalquilo. El cicloalquilcarbonilo de la invención puede estar sustituido con uno o más radicales idénticos o diferentes.

Según la invención "alcoxycarbonilo" -solo o como parte de un grupo químico- representa alcoxycarbonilo de cadena lineal o ramificada que tiene preferiblemente 1 a 6 átomos de carbono, o 1 a 4 átomos de carbono en el grupo alcoxi, tales como metoxycarbonilo, etoxycarbonilo, n-propoxycarbonilo, isopropoxycarbonilo, iso-butoxycarbonilo y t-butoxycarbonilo. Los grupos alcoxycarbonilo de la invención pueden estar sustituidos por uno o más radicales idénticos o diferentes.

Según la invención, "alquilaminocarbonilo" se refiere a un grupo alquilaminocarbonilo lineal o ramificado que tiene preferiblemente de 1 a 6 átomos de carbono, o 1 a 4 átomos de carbono en el grupo alquilo, tal como metilaminocarbonilo, etilaminocarbonilo, n-proilaminocarbonilo, isopropilaminocarbonilo, sec-butilaminocarbonilo y tert-butilaminocarbonilo. La invención alquilaminocarbonilo puede estar sustituido con uno o más radicales idénticos o diferentes.

Según la invención es "N,N-dialquilaminocarbonilo" representan de cadena lineal o ramificada N,N-dialquilaminocarbonilo que tiene preferiblemente de 1 a 6 átomos de carbono, o 1 a 4 átomos de carbono en la parte alquilo, tales como N,N-dimetilamino-carbonilo, N,N-dietilamino carbonilo, N,N-di(n-propilamino)carbonilo, N,N-di(isopropilamino)carbonilo y N,N-di(iss-butilamino)carbonilo. El grupo carbonilo N,N-dialquilamino de la invención puede estar sustituido con uno o más radicales idénticos o diferentes.

Según la invención, "arilo" significa un sistema aromático mono-, bi- o policíclico que tiene preferiblemente de 6 a 14, en particular 6 a 10 átomos de carbono en el anillo, tales como fenilo, naftilo, antrilo, fenantrenilo, preferiblemente fenilo. Además arilo representa también sistemas policíclicos, tales como tetrahidronaftilo, indenilo, indanilo, fluorenilo, bifenilo, en el que el sitio de unión en el sistema aromático. Los grupos arilo de la invención pueden estar sustituidos por uno o más radicales idénticos o diferentes.

Ejemplos de arilos sustituidos son los arilalquilos, que también pueden estar sustituidos con uno o más radicales idénticos o diferentes en el grupo alquilo y/o arilo. Ejemplos de tales arilalquilos son, entre otros, bencilo y 1-feniletilo.

De acuerdo con la presente invención "heterociclo", "anillo heterocíclico" o "sistema de anillo heterocíclico" es un sistema de anillo carbocíclico con al menos un anillo, en el que al menos un átomo de carbono reemplazado por un heteroátomo, preferiblemente por un heteroátomo del grupo N, O, S, P, B, Si, Se, y que es saturado, insaturado o heteroaromático y por lo tanto no sustituido o sustituido con un sustituyente Z puede estar sustituido, en el que el sitio de unión se encuentra en un átomo de anillo. A menos que se defina otra cosa, el anillo heterocíclico contiene preferiblemente de 3 a 9 átomos de anillo, en particular de 3 a 6 átomos de anillo, y uno o más, preferiblemente 1 a 4

átomos, en particular de 1, 2 o 3 heteroátomos en el anillo heterocíclico, preferiblemente del grupo N, O, y S, pero dos átomos de oxígeno no deben estar directamente adyacentes. Los anillos heterocíclicos generalmente no contienen más de 4 átomos de nitrógeno, y/o no más de 2 átomos de oxígeno y/o no más de 2 átomos de azufre. Si el radical heterocíclico o el anillo heterocíclico está dado el caso sustituido, se puede fusionar con otros anillos carbocíclicos o heterocíclicos. En el caso de heterocíclico dado el caso sustituido, los sistemas policíclicos se incluyen en la invención, tal como 8-aza-biciclo [3.2.1] octanilo o 1-aza-biciclo[2.2.1]heptilo. En el caso de heterocíclico dado el caso sustituido, de acuerdo con la invención, también se incluyen sistemas espirocíclicos, por ejemplo 1-oxa-5-aza-spiro[2.3] hexilo.

Los grupos heterocíclico de la invención son, por ejemplo, piperidinilo, piperazinilo, morfolinilo, tiomorfolinilo, dihidropirranilo, tetrahidropirranilo, dioxanilo, pirrolinilo, pirrolidinilo, imidazolinilo, imidazolidinilo, tiazolidinilo, oxazolidinilo, dioxolanilo, dioxolilo, pirazolidinilo, tetrahidrofuranilo, dihidrofuranilo, oxetanilo, oxiranilo, azetidino, aziridinilo, oxazetidino, oxaziridinilo, oxazepanilo, oxazinanilo, azepanilo, oxopirrolidinilo, dioxopirrolidinilo, oxomorfolinilo, oxopiperazinilo y oxepanilo.

Los heteroarilos, es decir, sistemas heteroaromáticos son de particular importancia. De acuerdo con la invención, el término heteroarilo representa compuestos heteroaromáticos, es decir compuestos heterocíclicos aromáticos completamente insaturados que se encuentran bajo la definición anterior de heterociclos. Preferiblemente son anillos de 5 a 7 miembros que tienen de 1 a 3, preferiblemente 1 o 2, heteroátomos idénticos o diferentes del grupo mencionado anteriormente. Los heteroarilos de acuerdo con la invención son, por ejemplo, furilo, tienilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-y 1,2,4-triazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-, 1,3,4-, 1,2,4-, y 1,2,5-oxadiazolilo, azepinilo, pirrolilo, piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, 1,3,5-, 1,2,4- y 1,2,3-triazinilo, 1,2,4, 1,3,2, 1,3,6 y 1,2,6-oxazinilo, oxepinilo, tiepinilo, 1,2,4-triazolonil y 1,2,4-diazepinilo. Los grupos heteroarilo de la invención pueden además estar sustituidos con uno o más radicales idénticos o diferentes.

Grupos sustituidos tales como alquilo sustituido, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, arilo, fenilo, bencilo, heterocíclico y heteroarilo, por ejemplo, significan un radical derivado de la estructura no sustituido radical sustituido, siendo los sustituyentes por ejemplo uno o más, preferiblemente 1, 2 o 3 radicales del grupo halógeno, alcoxi, alquilsulfanilo, hidroxilo, amino, nitro, carboxi o un grupo carboxi del grupo equivalente, ciano, isociano, azido, alcoxycarbonilo, alquilcarbonilo, formilo, carbamoilo, N,N-mono- y dialquilaminocarbonilo, amino sustituido tal como acilamino, N,N-mono- y dialquilamino, trialquilsililo y cicloalquilo dado el caso sustituido, arilo dado el caso sustituido, heterocíclico dado el caso sustituido, donde cada uno de los grupos cíclicos mencionados en último lugar también pueden contener heteroátomos o grupos funcionales divalentes como en el y alquilsulfino, donde se incluyen ambos enantiómeros de los grupos alquilsulfonilo, alquilsulfonilo, alquilsulfonilo, alquilsulfonilo, y, en el caso de radicales cíclicos (= "cuerpo básico cíclico"), también alquilo, haloalquilo, alquilsulfanilalquilo alcoxi-alquilo, N,N-mono- y dialquil-aminoalquilo y hidroxialquilo dado el caso sustituidos.

En el contexto del término "grupos sustituidos", tales como alquilo sustituido, etc., los sustituyentes insaturados adecuados, además de los radicales saturados que contienen hidrocarburo anteriormente mencionados, están incluidos radicales alifáticos y aromáticos insaturados, tales como alquenilo, alquinilo, alqueniloxi, alquiniloxi, alquenililo, alquinililo, alqueniloxycarbonilo, alquiniloxycarbonilo, alquenilcarbonilo, alquinilcarbonilo, N,N-mono- y dialquenilamino-carbonilo, mono- y dialquinilaminocarbonilo, N,N-mono- y dialquenilamino, N,N-mono- y dialquiniamino, trialquilsililo, trialquilsililo, cicloalqueno dado el caso sustituido, cicloalqueno dado el caso sustituido, fenilo, fenoxi dado el caso sustituidos correspondientes, etc. En el caso de radicales cíclicos sustituidos con grupos alifáticos en el anillo también incluyen sistemas cíclicos que tienen sustituyentes que están unidos con un enlace doble en el anillo, por ejemplo, por un grupo alquilideno tal como metilideno o etilideno o un grupo oxo, un grupo imino y un grupo imino sustituido.

Cuando dos o más residuos forman uno o más anillos, pueden ser carbocíclico, heterocíclico, saturado, parcialmente saturado, insaturado, por ejemplo, aromáticos, y sustituidos adicionalmente.

Los sustituyentes ejemplificados anteriormente ("sustituyente de primer nivel ") pueden, si contienen grupos que contienen hidrocarburos, estar sustituidos dado el caso adicionalmente allí ("sustituyente de segundo nivel "), por ejemplo por uno de los sustituyentes como se define para el sustituyente de primer nivel. Son posibles otros planos sustituyentes adicionales. Preferiblemente, solo uno o dos planos de sustitución están incluidos en el término "radical sustituido".

Los sustituyentes preferidos para los planos sustituyentes son, por ejemplo,

amino, hidroxilo, halógeno, nitro, ciano, isociano, mercapto, isotiocianato, carboxi, carbonamida, SF₅, aminosulfonilo, alquilo, cicloalquilo, alquenilo, cicloalquenilo, alquinilo, N-mono-alquil-amino, N,N-dialquilamino, N-alcanoilamino, alcoxi, alqueniloxi, alquiniloxi, cicloalcoxi, cicloalqueniloxi, alcoxycarbonilo, alqueniloxycarbonilo, alquiniloxycarbonilo, ariloxycarbonilo, alcanoilo, alquenilcarbonilo, alquinilcarbonilo, arilcarbonilo, alquilsulfanilo, cicloalquilsulfanilo,

alqueniltio, cicloalqueniltio, alquiniiltio, alquilsulfenilo, y alquilsulfino, ambos enantiómeros del grupo alquilsulfino están incluidos, alquilsulfonilo, N-mono-alquil-aminosulfonilo, N,N-dialquil-aminosulfonilo, alquilsulfonilo, alquilsulfonilo, en la que ambos enantiómeros están compuestos de alquilsulfonilo y alquilsulfonilo, N-alquil-aminocarbonilo, N,N-dialquil-amino-carbonilo, N-alcanoilamino-carbonilo, N-alcanoil-N-alquil-aminocarbonilo, arilo, ariloxi, bencilo, benciloxi, benciltio, ariltio, arilamino, bencilamino, heterocíclico y trialkilsililo.

Los sustituyentes que están compuestos de varios niveles sustituyentes son preferiblemente alcoxialquilo, alquilsulfanilalquilo, alquilsulfanilalcoxi, alcoxialcoxi, fenetilo, benciloxi, haloalquilo, halocicloalquilo, haloalcoxi, halogenalquilsulfanilo, haloalquilsulfino, haloalquilsulfonilo, haloalcanoilo, haloalquilcarbonilo, haloalcoxycarbonilo, halogenalcoxialcoxi, halogenalcoxialquilsulfanilo, halogenalcoxialkanoilo, haloalcoxialquilo.

En el caso de radicales que tienen átomos de carbono, los que tienen de 1 a 6 átomos de carbono, preferiblemente 1 a 4 átomos de carbono, especialmente preferido 1 o 2 átomos de C. por regla general, los sustituyentes preferidos se seleccionan de entre el grupo halógeno, por ejemplo, flúor y cloro, alquilo(C₁-C₄), preferiblemente metilo o etilo, alquilo(C₁-C₄)haloalquilo, preferiblemente trifluorometilo, alquilo(C₁-C₄)alcoxi, preferiblemente metoxi o etoxi, alquilo(C₁-C₄)haloalcoxi, nitro y ciano. Aquí se da preferencia particular a los sustituyentes metilo, metoxi, flúor y cloro.

Amino sustituido, tal como amino mono- o disustituido es un radical del grupo de los radicales amino sustituidos, que son N-sustituidos con ejemplo por uno o dos radicales idénticos o diferentes del grupo que comprende alquilo, hidroxilo, amino, alcoxi, acilo y arilo; preferiblemente N-mono y N,N-dialquilamino, (por ejemplo, metilamino, etilamino, N,N-dimetilamino, N,N-dietilamino, N,N-di-n-propilamino, N,N-diisopropilamino, o N,N-dibutilamino), grupos N- o N,N-mono- o dialcoxialquilamino (por ejemplo, N-metoximetilamino, N-metoxietilamino, N,N-di(metoximetil)amino o N,N-di(metoxietil)amino), N-mono-y N,N-diarilamino, tal como anilina, acilamino, N,N-diacilamino, N-alquil-N-arilamino, N-alquil-N-acilamino y N-heterociclos saturados dado el caso sustituidos; siendo preferidos los radicales alquilo que tienen de 1 a 4 átomos de carbono; arilo es preferiblemente fenilo o fenilo sustituido; para acilo, se aplica la definición mencionada más adelante, preferiblemente alquilo(C₁-C₄)alcanoilo. Lo mismo se aplica a hidroxilamino o hidrazino sustituido.

Según la invención, el término "grupos amino cíclicos" incluye sistemas de anillo heteroaromáticos o alifáticos con uno o más átomos de nitrógeno. Los heterociclos están saturados o insaturados, compuestos por uno o más, sistemas de anillos dado el caso condensados, y contienen dado el caso otros heteroátomos, tales como uno o dos átomos de nitrógeno, oxígeno y/o átomos de azufre. El término también incluye aquellos grupos que tienen un sistema de anillo con espirales o puentes. El número de átomos que constituyen el grupo amino cíclico es arbitrario y puede ser, por ejemplo, en el caso de un sistema de un anillo de 3 a 8 átomos en el anillo y en el caso de un sistema de dos anillos de 7 a 11 átomos.

Ejemplos de grupos amino cíclicos con grupos monocíclicos saturados e insaturados con un átomo de nitrógeno como heteroátomo son 1-azetidino, pirrolidino, 2-pirrolidin-1-ilo, 1-pirrolilo, piperidino, 1,4-dihidropirazina-1-ilo, 1 llamado, 2,5,6-tetrahidropirazina-1-ilo, 1,4-dihidropiridin-1-ilo, 1,2,5,6-tetrahidropiridin-1-ilo, homopiperidinilo; ejemplos de grupos amino cíclico que tiene y grupos monocíclicos saturados e insaturados que tienen dos o más átomos de nitrógeno como heteroátomos son 1-imidazolidinilo, 1-imidazolilo, 1-pirazolilo, 1-triazolilo, 1-tetrazolilo, 1-piperazinilo, 1-homopiperazinilo, 1,2-dihidro-piperazin-1-il 1,2-dihidro-pirimidin-1-il perhidropirimidin-1-ilo, 1,4-diazacicloheptan-1-ilo; pueden mencionarse como ejemplos de grupos amino cíclico que tienen grupos monocíclicos saturados e insaturados con uno o dos átomos de oxígeno y de uno a tres átomos de nitrógeno como heteroátomos, tales como oxazolidin-3-ilo, 2,3-dihidroisoxazol-2-ilo, isoxazol-2-ilo, 1,2, 3-oxadiazina-2-ilo, morfolino, ejemplos de grupos amino cíclicos de grupos monocíclicos saturados e insaturados que tienen de uno a tres átomos de nitrógeno y uno o dos átomos de azufre como heteroátomos son tiazolidin-3-ilo, isotiazolin-2-ilo, tiomorfolino o dioxotiomorfolino; ejemplos de grupos amino cíclicos que tiene grupos cíclicos condensados saturados e insaturados son indol-1-ilo, 1,2-dihidrobencimidazol-1-ilo, perhidropirrol[1,2-a]pirazin-2-ilo; por ejemplo, entre los grupos amino cíclicos con grupos espirocíclicos, se menciona el 2-azaspiro[4,5]decan-2-ilo; ejemplos de grupos amino cíclicos puenteados son grupos heterocíclicos como el 2-azabicyclo[2,2,1] heptan-7-ilo.

Amino sustituido también incluye compuestos de amonio cuaternario (sales) que tienen cuatro sustituyentes orgánicos en el átomo de nitrógeno.

Fenilo dado el caso sustituido es preferiblemente fenilo que está sin sustituir o sustituido una vez o múltiples veces, preferiblemente hasta tres veces, con radicales idénticos o diferentes del grupo halógeno, alquilo(C₁-C₄), alquilo(C₁-C₄), alcoxi(C₁-C₄)alcoxi(C₁-C₄), alcoxi(C₁-C₄)-alquilo(C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄), alquilo(C₁-C₄), haloalcoxi(C₁-C₄) alquilsulfanilo, alquilo(C₁-C₄) haloalquilsulfanilo, ciano, isociano y nitro, por ejemplo o-, m- y p-tolilo, dimetilfenilo, 2-, 3- y 4-clorofenilo, 2-, 3- y 4-fluorofenilo, 2-, 3- y 4-trifluorometilo y -triclorometilfenilo, 2,4-, 3,5-, 2,5- y 2,3-diclorofenilo, o-, m- y p-metoxifenilo.

Cicloalquilo dado el caso sustituido es preferiblemente cicloalquilo que está sin sustituir o sustituido una vez o múltiples veces, preferiblemente hasta tres veces, con radicales idénticos o diferentes del grupo halógeno, ciano, alquilo(C₁-C₄), alcoxi(C₁-C₄), alcoxi(C₁-C₄)alcoxi(C₁-C₄), alcoxi(C₁-C₄)alquilo(C₁-C₄), halogenoalquilo(C₁-C₄), alquilo(C₁-C₄)haloalcoxi, en particular por uno o dos radicales alquilo(C₁-C₄).

- 5 Heterociclilo dado el caso sustituido es preferiblemente heterociclilo es no sustituido o sustituido una o varias veces, preferiblemente hasta tres veces, con radicales idénticos o diferentes del grupo halógeno, ciano, alquilo(C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄), alcoxi(C₁-C₄)alcoxi(C₁-C₄), alcoxi(C₁-C₄)alquilo(C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄), alquilo(C₁-C₄), haloalcoxi, nitro y oxo, en particular sustituido una o varias veces, con radicales del grupo halógeno, alcoxi alquilo(C₁-C₄), alcoxi(C₁-C₄), haloalquilo(C₁-C₄) y oxo, está sustituido sobre todo por uno o dos radicales alquilo(C₁-C₄).
- 10 Ejemplos de heteroarilos sustituidos con alquilo son furilmetilo, tienilmetilo, pirazolilmetilo, imidazolilmetilo, 1,2,3- y 1,2,4-triazolilmetilo, isoxazolilmetilo, tiazolilmetilo, isotiazolilmetilo, 1,2,3-, 1,3,4-, 1,2,4- y 1,2,5-oxadiazolilmetilo, azepinilmetilo, pirrolilmetilo, piridilmetilo, piridazinilmetilo, pirimidinilmetilo, pirazinilmetilo, 1,3,5-, 1,2,4- y 1,2,3-triazinilmetilo, 1,2,4, 1,3,2, 1,3,6 y 1,2,6-oxazinilmetilo, oxepinilmetilo, tiepinilmetilo y 1,2,4-diazepinilmetilo.

15 Según la invención, las sales adecuadas de los compuestos de la invención, por ejemplo, sales con bases o sales de adición de ácido, son todas las sales no tóxicas convencionales, preferiblemente sales agrícolamente y/o fisiológicamente aceptables de los mismos. Por ejemplo, sales con bases o sales de adición de ácido. Se da preferencia a sales con bases inorgánicas tales como sales de metal alcalino (por ejemplo sodio, potasio o sales de cesio), metal alcalinotérreo (por ejemplo sales de calcio o magnesio), sales de amonio o sales con bases orgánicas, especialmente con aminas orgánicas, tales como trietil amonio, dicitclohexilamonio, N,N'-dibencilileno-diamonio, piridinio, picolinio o de amonio etanol, sales con ácidos inorgánicos (por ejemplo hidroclouros, hidrobromuros, dihidrosulfatos, trihidrosulfato, o fosfatos), sales con ácidos carboxílicos orgánicos o ácidos sulfónicos orgánicos (por ejemplo, formiatos, acetatos, trifluoroacetatos, maleato, tartrato, metanosulfonato, bencenosulfonato o 4-toluenosulfonato). Como es sabido, las t-aminas, tales como, por ejemplo, algunos de los compuestos de la invención, pueden formar N-óxidos, que representan sales también de acuerdo con la invención.

20 Los compuestos de la invención pueden existir como isómeros geométricos y/o como ópticamente activos o mezclas de isómeros de composición variable dependiendo de la clase de los sustituyentes correspondientes. Estos estereoisómeros son, por ejemplo, enantiómeros, diastereómeros, atropisómeros o isómeros geométricos. La invención comprende así estereoisómeros puros así como también cualquier mezcla deseada de estos isómeros.

25 Los compuestos de acuerdo con la invención pueden, si se desea, estar presentes en diversas formas polimórficas o como una mezcla de diferentes formas polimórficas. Tanto los polimorfos puros como las mezclas de polimorfos son el objeto de la invención y se pueden usar de acuerdo con la invención.

30 Los compuestos de la fórmula general (I) se pueden mezclar con otras sustancias activas insecticidas, nematocidas o antimicrobianas o usarse juntos. En estas mezclas o aplicaciones comunes se producen efectos sinérgicos, es decir, el efecto observado de estas mezclas o aplicaciones comunes es mayor que la suma de los efectos de los ingredientes activos individuales dentro de estas aplicaciones. Ejemplos de dichos asociados de mezcla o combinación son:

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

35 Carbamatos, por ejemplo, alanicarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbarilo, carbofuran, carbosulfan, etiofencarb, fenobucarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, triazamato, trimetacarb, XMC y xililcarb; o

40 organofosfatos, por ejemplo, acefato, azametifos, azinfos-etilo, azinfos-metilo, cadusafos, cloretoxifos, clorfenvinfos, cloromefos, clorpirifos, clorpirifos-metilo, cumafos, cianofos, demeton-S-metilo, diazinon, diclorvos/DDVP, dicrotofos, dimetoato, dimetilvinfos, disulfotón, EPN, etión, etoprofos, famfur, fenamifos, fenitrotión, fentión, fostiazato, heptenofos, imiciafos, isofenfos, salicilato de O-(metoxiaminothio-fosforil)isopropilo isoxatió, malatió, mecarbam, metamidofos, metidatió, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemetón-metilo, paratió, paratió-metilo, f, forato, fosalón, fosmet, fosfamidón, foxim, pirimifos-metilo, profenofos, propetamfos, protiofos, piraclufos, piridafentión, quinalfos, sulfotep, tebupirimfos, temefos, terbufos, tetraclorvinfos, tiometón, triazofos, triclorfón y vamidotiona.

45 (2) Antagonistas del canal de cloruro GABA, tales como organoclorados de ciclodieno, por ejemplo clordano y endosulfán; o

fenilpirazoles (fiproles), por ejemplo etiprol y fipronil.

(3) Moduladores de los canales de sodio/bloqueadores de los canales de sodio dependientes de voltaje, tales como

- piretroides, por ejemplo acrinatrina, aletrina, d-cis-trans aletrina, d-trans aletrina, bifentrina, bioaletrina, bioaletrina isómero S-ciclopentenilo, biorresmetrina, cicloprotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, gamma-cihalotrina, cipermetrina, alfa cipermetrina, beta-cipermetrina, theta-Cipametrina, zeta-cipermetrina, cifenotrina [(1R)-trans-isómeros], deltametrina, empentrina [(E)- (1R) isómero), esfenvalerato, etofenprox,
- 5 fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flumetrina, tau-fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, kadetrina, permetrina, fenotrina [(1R)-trans-isómero), praletrina, piretrinas (piretro), resmetrina, silafluofeno, teflutrina, tetrametrina, tetrametrina [(1R)- isómeros)], tralometrina y transflutrina; o
- DDT; o metoxicloro.
- (4) Receptores nicotínicos de acetilcolina (nAChR) agonistas, tales como
- 10 neonicotinoides, por ejemplo, acetamiprid, clotianidina, dinotefurano, imidacloprid, nitenpiram, tiacloprid y tiametoxam; o
- nicotina; o
- sulfoxaflor.
- (5) Receptores de acetilcolina nicotínicos (nAChR) activadores alostéricos tales como, por ejemplo,
- 15 spinosinas, por ejemplo, spinetoram y spinosad.
- (6) Activadores de canales de cloruro, tales como, por ejemplo,
- avermectinas/milbemicinas, por ejemplo, abamectina, emamectina benzoato, lepimectina y milbemectina.
- (7) Imitadores de hormonas juveniles tales como, por ejemplo,análogos de la hormona juvenil, por ejemplo, hidropreno, kinopreno y methopreno; ofenoxicarb; o piriproxifeno.
- 20 (8) Ingredientes activos con mecanismos de acción desconocidos o no específicos, tales como, por ejemplo, haluros de alquilo, por ejemplo, bromuro de metilo y otros halogenuros de alquilo; o
- cloropicrina; o fluoruro de sulfurilo; o bórax; o tártaro.
- (9) Inhibidores selectivos de la alimentación, por ejemplo, pimetrozina; o flonicamida.
- (10) inhibidores del crecimiento de ácaros, por ejemplo, clofentezinas, hexitiazox y diflovidazina; o
- 25 etoxazol.
- (11) Disruptores microbianos de la membrana intestinal de insecto, por ejemplo, *Bacillus thuringiensis* subespecie israelensis, *Bacillus thuringiensis* subespecie aizawai, *Bacillus thuringiensis* subespecie kurstaki, *Bacillus thuringiensis* subespecie tenebrionis y B.t. Proteínas vegetales: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry1A.105, Cry2Ab, Vip3A, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34 Ab1/35Ab1; o
- 30 *Bacillus sphaericus*.
- (12) Inhibidores de la fosforilación oxidativa, disruptores de ATP tales como, por ejemplo, diafentiurón; o
- Compuestos de organoestaño, por ejemplo, azociclotina, cihexatina y fenbutatin óxido; o
- propargita; o tetradifona.
- (13) Desacopladores de la fosforilación oxidativa por interrupción del gradiente de protones H, tal como, por ejemplo,
- 35 clorfenapir, DNOC y sulfuramida.
- (14) Antagonistas nicotínicos del receptor de acetilcolina, tales como bensulap, cartaphidrocloruro, tiociclam y tiosulfato sódico.
- (15) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 0, como bistriflurón, clorfluazurón, diflubenzurón, flucicloxurón, flufenoxurón, hexaflumurón, lufenurón, Novalurón, Noviflumurón, teflubenzurón y triflumurón.
- 40 (16) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 1, como, por ejemplo, buprofezina.
- (17) Ingredientes activos que inhiben la renovación en dípteros, como, por ejemplo, ciromazina.
- (18) Agonistas del receptor de ecdisona tales como, por ejemplo, cromafenozida, halofenocida, metoxifenocida y tebufenozida.
- (19) Agonistas octopaminérgicos, tales como, por ejemplo, amitraz.

(20) Inhibidores de transporte de electrones del complejo III tales como, por ejemplo, hidrametilona; o acequinocilo; o fluacirpirim.

(21) Inhibidores del transporte de electrones de complejo I, por ejemplo

acaricidas METI, por ejemplo, fenazaquin, fenpiroximato, pirimidifeno, piridabeno, tebufenpirad y tolfenpirad; o

5 Rotenona (Derris).

(22) Bloqueadores de los canales de sodio dependientes del voltaje, por ejemplo, indoxacarb; o metaflumizona.

(23) Inhibidores de la acetil-CoA carboxilasa, tales como, por ejemplo,

Tetron y derivados del ácido tetrámico, por ejemplo, espirodiclofen, espiromesifeno y espirotetramato.

(24) Inhibidores de transporte de electrones de complejo IV, tales como, por ejemplo,

10 fosfinas, por ejemplo, fosfuro de aluminio, fosfuro de calcio, fosfina y fosfuro de zinc; o cianuro.

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

ciopopirafen y ciflumofeneno.

(28) Efectores del receptor de Rianodina, tales como, por ejemplo,

15 diamidas, clorantraniliprol, ciantraniliprol y flubendiamida.

Otros ingredientes activos con un mecanismo de acción desconocido, como amidofluor, azadiractina, benclotiaz, benzoximato, bifenazato, bromopropilato, quinometionato, criolita, dicofol, diflovidazina, fluensulfona, flufenimer, flufiprol, fluopiram, fufenozida, imidaclotiz, iprodiona, meperflutrina, piridalilo, pirifluquinazona, tetrametilflutrina y yodometano; además, preparaciones basadas en Bacillus firmus (en particular cepa CNCM I-1582, por ejemplo VOTIVO™, BioNem), así como los siguientes compuestos activos conocidos:

3-Bromo-N-{2-bromo-4-cloro-6-[(1-ciclopropyletil)carbamoil]fenil}-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido a partir de WO2005/077934), 4-[[6-bromopirid-3-il)metil](2-fluoroetil)amino}furan-2(5H)-ona (conocido por el documento WO2007/115644), 4-[[6-fluoropirid-3-il)metil](2,2-difluoroetil)amino}furan-2(5H)-ona (conocido por el documento WO2007/115644), 4-[[2-cloro-1,3-tiazol-5-il)metil](2-fluoroetil)amino}furan-2(5H)-ona (conocido por el documento WO2007/115644), 4-[[6-cloro-pirid-3-il)metil](2-fluoroetil)amino}furan-2(5H)-ona (conocido por el documento WO2007/115644), flupiradifurona, 4-[[6-cloro-5-fluoropirid-3-il)metil](metil)amino}furan-2(5H)-ona (conocido por el documento WO2007/115643), 4-[[5,6-dicloro-3-il)metil](2-fluoroetil)amino}furan-2(5H)-ona (conocido por el documento WO2007/115646), 4-[[6-cloro-5-fluoropirid-3-il)metil](ciclopropil)amino}furan-2(5H)-ona (conocido por el documento WO2007/115643), 4-[[6-cloro-pirid-3-il)metil](ciclopropil)amino}furan-2(5H)-ona (conocido por el documento EP-A-0.539.588), 4-[[6-cloro-pirid-3-il)metil](metil)amino}furan-2(5H)-ona (conocido por el documento EP-A-0539588), [[1-(6-cloropiridin-3-il)etil]metil]óxido-λ4-sulfaniliden}cianamida (conocido por el documento WO2007/149134) y sus diastereómeros [[(1 R)-1-(6-cloropiridin-3-il)etil](metil)óxido-λ4-sulfaniliden}cianamida (A) y [[(1S)-1-(6-cloropiridin-3-il)etil](metil)óxido-λ4-sulfaniliden}cianamida (B) (también conocido desde el documento WO2007/149134), así como diastereómeros [(R)metil(óxido){(1R)-1-[6-(trifluorometil)piridin-3-il]etil]-λ4-sulfaniliden}cianamida (A₁) y [(S)-metil(óxido){(1S)-1-[6-(trifluorometil)piridin-3-il]etil]-λ4-sulfaniliden}cianamida (A₂) al que se hace referencia grupos diastereómeros A (conocidos por el documento WO 2010/074747, WO 2010/074751), [(R)metil(óxido){(1S)-1-[6-(trifluorometil)piridin-3-il]etil]-λ4-sulfaniliden}cianamida (B₁) y [(S)-metil(óxido){(1R)-1-[6-(trifluorometil)piridin-3-il]etil]-λ4-sulfaniliden}cianamida (B₂), que se refieren como grupo de diastereómeros B (también conocidos por el documento WO 2010/074747, WO 2010/074751) y 11-(4-cloro-2,6-dimetil-fenil)-12-hidroxi-1,4-dioxo-9-a zadispiro[4.2.4.2]tetradec-11-en-10-ona (conocido de WO2006/089633), 3-(4'-fluoro-2,4-dimetilbifenil-3-il)1-azaspiro[4.5]dec-3-en-2-ona (conocido de WO2008/067911), 1-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfonil]-3-(trifluorometil)-1H-1,2,4-triazol-5-amina (conocido del documento WO2006/043635), 2-ciano-3-(difluorometoxi)-N-metilbencenosulfonamida (conocido por el documento WO2006/100288), 2-ciano-3-(difluorometoxi)-N-bencenosulfonamida (conocido por el documento WO2005/035486), 4-(difluorometoxi)-N-etil-N-metil-1,2-benzotiazol-3-amina-1,1-dióxido (conocido por el documento WO2007/057407), N-[1-(2,3-dimetilfenil)-2-(3,5-dimetilfenil)etil]-4,5-dihidro-1,3-tiazol-2-amina(1,4-clorofenil)prop-2-en-1-il]-5-fluorospiro[indol-3,4'-piperidina]-1(2H)-il](2-cloropiridin-4-il)metanona (descrito en WO2003/106457), 3-(2,5-dimetilfenil)-4-hidroxi-8-metoxi-1,8-diaza-espiro[4,5]dec-3-en-2-ona (conocido por el documento WO2009/049851), 3-(2,5-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1,8-diaza-espiro[4,5]dec-3-en-4(3,5-dimetilpiperidin-1-il)-5-fluoropirimidina (conocida del documento WO2004/099160), (2,2,3,3,4,4,5,5-octafluoropentil)(3,3, 3-trifluoropropil)malononitrilo (conocido por el documento WO2005/063094), (2,2,3,3,4,4,5,5-octafluoropentil)(3,3,4,4,4-pentafluorobutil)malonitrilo conocido (de WO2005/063094), 8-[(2-

(ciclopropilmetoxi)-4-trifluorometil)fenoxi]-3-[6-(trifluorometil)-il piridazin-3]-3-azabicyclo [3.2.1]octano (conocido por el documento WO2007/040280) flometoquina, PF1364 (CAS Reg. 1204776-60-2) (conocido por JP2010/018586), 5-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-2-(¹H-1,2,4-triazol-1-il)benzocarbonitrilo (conocido por el documento WO2007/075459), 5-[5-(2-cloropiridin-4-il)-5-(trifluorometil)-4,5 dihidro-1,2-oxazol-3-il]-2- benzocarbonitrilo (conocido por el documento WO2007/075459), 4-[5-(3,5-(¹H-1,2,4-triazol-1-il)diclorofenil)-5-(trifluorometil)-1,2-oxazol-3-il-4,5-dihidro]-2-metil-N-{2-oxo-2-[(2,2,2-trifluoroetil)amino] etil}benzamida (conocido a partir del documento WO2005/085216), 4-[[[(6-cloropiridin-3-il)metil](ciclopropil)amino]-1,3-oxazol-2(5H)-ona, 4-[[(6-cloropiridin-3-il)metil](2,2-difluoroetil)amino]-2 -1,3-oxazol (5H)-ona, 4-[[[(6-cloropiridin-3-il)metil](etil)amino]-1,3-oxazol-2(5H)-ona, 4-[[[(6-cloropiridin-ona (todos descritos en WO2010/005692), piflubumida (conocido por el documento WO2002/096882), 2-[2-[[[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-¹H-pirazol-5 il]carbonil]amino]-5-cloro-3-metilbenzoil]hidrazinacarboxilato-2-metilo (conocido por el documento WO2005/085.216), metil-2-[2-{¹H-pirazol-5-il]carbonil}[[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il-amino)-5-ciano-3-metilbenzoil]]]hidrazinacarboxilato-2-etil (conocido por el documento WO2005/085216), 2-[2 -{[[[(3-cloropiridin-2-il)-¹H-pirazol-5-il-1-3-bromo]carbonil]amino]-5-ciano-3-metilbenzoil]hidrazinacarboxilato-2-metilo (conocido por el documento WO2005/085216), 2-[3,5-dibromo-2 -{[[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2 -il)-¹H-pirazol-5-il]carbonil]amino} benzoil]-1,2-dietilhidrazinacarboxilato (conocido por el documento WO2005/085216), 2-[3,5-dibromo-2-{[[3- bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-¹H-pirazol-5-il]carbonil]amino} hidrazinacarboxilato benzoil]-2-etilo (conocido por el documento WO2005/085216), (5RS, 7RS, 5RS, 7SR)-1-(6-cloro-3-piridilmetil)-1,2,3,5,6,7-hexahidro-7-metil-8-nitro-5-propoximidazo [1,2-a]piridina (conocido por el documento WO2007/101 369), 2-{6-[2-(5-fluoropiridin-3-il)-1,3-tiazol-5-il]piridin-2-il]pirimidina (conocido por el documento WO2010/006713), 2-{6-[2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-il]piridin-2-il]pirimidina (conocido por el documento WO2010/006713), 1-(2-il-3-cloropiridin)-N-[(metilcarbamoil)fenil]-2-metil-6-4-ciano]-3-[[5-(trifluorometil)-¹H-tetrazol-1-il]metil]-¹H-pirazol-5-carboxamida (conocido por el documento WO2010/069502), 1-(3-cloropiridin-2-il)-N-[4-ciano-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-3-[[5-(trifluorometil)-2H-tetrazol-2-il]metil]-¹H-pirazol-5-carboxamida (conocido por el documento WO2010/069502), N-[2-(tert-butilcarbamoil)-4-ciano-6-metilfenil]-1-(3-cloropiridin-2-il)-3-[[5-(trifluorometil)-¹H-tetrazol-1-il]metil]-¹H-pirazol-5-carboxamida (conocido por el documento WO2010/069502), N-[2-(tert-butilcarbamoil)-4-ciano-6-metilfenil]-1-(3-cloropiridin-2-il)-3-[[5-(trifluorometil)-2H-tetrazol-2-il]metil]-¹H-pirazol-5-carboxamida (conocido por el documento WO2010/069502), (1E)-N-[(6-cloropiridin-3-il)metil]-N'-ciano-N-(2,2-difluoretil)etanimidamida (conocido por el documento WO2008/009360), N-[2-(5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-il)-4-cloro-6-metilfenil]-3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-¹H-pirazol-5-carboxamida (conocido a partir de CN102057925), 2-[3,5-dibromo-2 -{[[3-bromo-1-(3-cloropiridin 2-il)-¹H-pirazol-5-il]carbonil]amino} benzoil]-2-etil-1-metilhidrazinocarboxilato (conocido por el documento WO2011/049233), Heptafluthrin, Piriminostrobin, Flufenoxistrobin y 3-cloro-N2-(2-cyano)propan-2-il)N1-[4-(1,1,1,2,3,3,3-heptafluoropropano-2-il)-2-metilfenil]ftalimida (conocido por el documento WO2012/034472).

Compuestos de acción antimicrobiana:

35 1. (1) Inhibidores de la biosíntesis de ergosterol, por ejemplo aldimorf, azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, diclobutrazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M, dodemorf, acetato de dodemorf, epoxiconazol, etaconazol, fenarimol, fenbuconazol, fenhexamida, fenpropidin, fenpropimorf, fluquinconazol, flurprimidol, flusilazol, flutriafol, furconazol, furconazol-cis, hexaconazol, imazalilo, sulfato de imazalilo, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanilo, naftifina, nuarimol, oxpoconazol, paclobutrazol, pefurazoato, penconazol, piperalina, procloraz, propiconazol, protioconazol, piributicarb, pirifenox, Quinconazol, simeconazol, espiroxamina, tebuconazol, terbinafina, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, tridemorf, triflumizol, triforina, triticonazol, uniconazol, uniconazol-p, viniconazol, voriconazol, 1-(4-clorofenil)-2-(¹H-1,2,4-triazol-1-il)cicloheptanol, 1-(2,2-dimetil-2,3-dihidro-¹H-inden-1-il)-¹H-imidazol-5-carboxilato de etilo, N'-[5-(difluorometil)-2-metil- l-4-[3-(trimetilsilil)propoxi] fenil]-N-etil-N-metilimidofornamida, N-etil-N-metil-N -[2-metil-5-(trifluorometil)-4-[3-(trimetilsilil)propoxi] fenil]imidofornamid y O-[1-(4-metoxifenoxi)-3,3-dimetil-butan-2-il]-¹H-imidazol-1-carbotioato.

50 2. (2) Inhibidores de la respiración (inhibidores de la cadena respiratoria), tales como bixafen, boscalid, carboxin, diflumetorim, fenfuram, fluopiram, flutolanilo, fluxaproxad, furametpir, furemeciclox, mezcla de isopirazam de racemato syn-epimérico, 1RS 4SR, 9RS y anti- racemato empimérico 1RS, 4SR, 9SR, isopirazam (racemato anti-epimérico), isopirazam (enantiómero anti-epimérico 1R, 4S, 9S), isopirazam (enantiómero anti-epimérico 1S, 4R, 9R), isopirazam (racemato syn-epimérico 1RS, 4SR, 9RS), isopirazam (enantiómero syn-epimérico 1 R, 4S, 9R), isopirazam (enantiómero syn-epimérico 1S, 4R, 9S), mepronilo, oxicarboxin, penflufen, pentiopirad, sedaxene, tifuluzamida, 1-metil-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi) fenil]-3-(trifluorometil)-¹H-pirazol-4-carboxamida, 3-(difluorometil)-1-metil-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi) fenil]-¹H-pirazol-4-carboxamida, 3-(difluorometil)-N-[4-fluoro-2-(1,1,2,3,3,3-hexafluoropropoxi)fenil]-1-metil-¹H-pirazol-4-carboxamida y N-[1-(2,4-diclorofenil)-1-metoxipropano-2-il]-3-(difluorometil)-1-metil-¹H-pirazol-4-carboxamida.

55 3. (3) Inhibidores de la respiración (inhibidores de la cadena respiratoria) en el complejo III de la cadena rrespiratoria como ametocradina, amisulbrom, azoxistrobina, ciazofamid, dimoxistrobina, enestrobirina, famoxadona, fenamidona, fluoxastrobina, cresoxim-metilo, metominostrobin, orisastrobina, picoxistrobina, piraclostrobina, pirametostrobin, piraxistrobin, piribencarb, trifloxistrobina, (2E)-2-(2-[[6-(3-cloro-2-metilfenoxi)-5-fluoropirimidin-4-

il]oxi]fenil)-2-(metoxiimino)-N-metil-etanamida, (2E)-2-(metoxiimino)-N-metil-2-(2-[etilideno ((1E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]amino)oxi]{metil}fenil)etanamida, (2E)-2-(metoxiimino)-N-metil-2-2-[(e)-({1-[3-(trifluorometil)fenil]etoxi]imino)metil]fenil]etanamida, (2E)-2-2-[[[(1E)-1-(3-[(e)-1-fluoro-2-feniletetil]oxi)fenil]etilideno]amino]oxi]metil]fenil)-2-(metoxiimino)-N-metil-etanoamida, (2E)-2-2-[[[(2E,3E)-4-(2,6-diclorofenil)peroxo-3-en-2-ilideno]amino]oxi]metil]fenil)-2-(metoxiimino)-N-metiletanamida, 2-cloro-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)piridina-3-carboxamida, 5-metoxi-2-metil-4-(2-[[[(1E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etilideno] amino]oxi]metil]fenil)-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-ona, (2E)-2-12-[[[ciclopopil[(4-metoxifenil)imino]metil]sulfanil]metil]fenil]-3-metoxi-prop-2-enoato de etilo, N-(3-etil-3,5,5-trimetilciclohexil)-3-(formilamino)-2-hidroxi-benzamida, 2-2-[(2,5-dimetilfenoxi)metil]fenil)-2-metoxi-N-metilacetamida y (2R)-2-2-[(2,5-dimetilfenoxi)metil]fenil)-2-metoxi-N-metilacetamida.

4. (4) Inhibidores de la mitosis y la división celular, por ejemplo benomilo, carbendazim, clorfenazol, dietofencarb, etaboxam, fluopicolide, fuberidazol, pencicurón, tiabendazol, tiofanato-metilo, tiofanato, zoxamida, 5-cloro-7-(4-metilpiperidina 1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a] pirimidina y 3-cloro-5-(6-cloropiridin-3-il)-6 metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)piridazina.

5. (5) Compuestos que tienen actividad en múltiples sitios, tales como mezcla de Burdeos, captafol, captan, clorotalonilo, preparaciones de cobre tales como hidróxido de cobre, naftenato de cobre, óxido de cobre, oxicloruro de cobre, sulfato de cobre, diclofluanid, ditianón, Dodine, Dodine base libre, ferbam, fluorofolpet, folpet, guazatrina, acetato de guazatina, iminoctadina, besilato de Iminoctadinal, triacetato de iminoctadina, mankuper, mancozeb, maneb, metiram, zinkmetiram, oxina-cobre, propamidina, propineb, azufre y preparaciones de azufre tales como, por ejemplo, polisulfuro de calcio, tiram, tolifluanida, zineb y ziram.

6. (6) Inductores de resistencia, tales como acibenzolar-S-metilo, isotianilo, probenazol, y tiadinilo.

7. (7) Inhibidores de la biosíntesis de aminoácidos y proteínas, por ejemplo andoprim, blasticidina-S, ciprodinilo, kasugamicina, kasugamicina clorhidrato hidratado, mepanipirim y pirimetanil.

8. (8) Inhibidores de la producción de ATP, por ejemplo, acetato de fentina, cloruro de fentina, hidróxido de fentina, y siltiofam.

9. (9) Inhibidores de la síntesis de la pared celular, por ejemplo bentiavalicarb, dimetomorf, flumorf, iprovalicarbo, mandipropamid, polioxinas, polioxorim, validamicina A y valifenalato.

10. (10) Inhibidores de la síntesis de lípidos y membrana, por ejemplo bifenilo, cloroneb, dicloran, edifenfos, etridiazol, iodocarb, iprobenfos, isoprotilano, propamocarb, clorhidrato de propamocarb, protiocarb, pirazofos, quintoceno, tecnaceno y tolclofos-metilo.

11. (11) Inhibidores de la biosíntesis de melanina, por ejemplo carpropamid, diclocimet, fenoxanilo, ftalida, piroquilon y triciclazol.

12. (12) Inhibidores de la síntesis de ácidos nucleicos, por ejemplo benalaxilo, benalaxil-M (kiralaxil), bupirimato, Clozilacon, dimetirimol, etirimol, furalaxilo, himexazol, metalaxilo, metalaxil-M (mefenoxam), ofurace, oxadixilo, ácido oxolínico.

13. (13) Inhibidores de transducción de señales, tales como clozolinato, fenciclonilo, fludioxonilo, iprodiona, procimidona, quinoxifeno y vinclozolina.

14. (14) Desacopladores, tales como dinocap, ferimzona, fluazinam y meptildinocap.

15. (15) Otros compuestos, tales como Bentiazol, betoxazina, capsimicina, carvona, quinometionato, chlazafenon, cufraneb, ciflufenamida, cimoxanilo, ciprosulfamida, dazomet, debacarb, diclorofeno, diclomezina, difenzoquat, difenzoquat metilsulfato, difenilamina, ecomat, fenpirazamina, flumetover, fluoromida, flusulfamida, flutianilo, fosetil-aluminio, fosetil-calcio, fosetil-sodio, hexaclorobenceno, irumamicina, metasulfocarb, isotiocianato de metilo, metrafenona, mildiomicina, natamicina, dimetilditiocarbamato de níquel, nitrotal-isopropilo, octilina, oxamocarb, oxifenthiin, pentaclorofenol y sus sales, fenotrina, ácido fosfórico y sus sales, propamocarb fosetilato, propanosin-sodio, proquinazid, pirrolnitrina, tebufloquin, tecloftalam, tolnifanid, triazóxido, trichlamid, zarilamid, 1-(4-{4-[(5R)-5-2,6-difluorofenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, 1-(4-{4-[(5R)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, 1-(4-{4-[(5S)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, 1-(4-{4-[(5R)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, 2-butoxi-6-yodo-3-propil-4H-cromen-4-ona, 2-cloro-5-[2-cloro-1-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-4-metil-1-imidazol-5-il]piridina, 2-fenilfenol y sus sales, 3,4,5-tricloropiridina-2,6-dicarbonitrilo, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetil-1,2-oxazolidin-3-il]piridina, 3-cloro-5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-metilpiridazina, 4-(4-clorofenil)-5-(2,6-

- difluorofenil)-3,6-dimetilpiridazina, 5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-tiol, 5-cloro-N'-fenil-N'-(prop-2-en-1-il)tiofeno-2-sulfonohidrazida, 5-metil-6-octil[1,2,4] triazol[1,5-a]pirimidin-7-amina, acetato de (2Z)-3-amino-2-ciano-3-fenilprop-2-enoato de metilo, N-(4-clorobencil)-3-[3-metoxi-4-(prop-2-en-1-iloxi)fenil]propanamida, N-[(4-clorofenil)(ciano)metil]-3-[3-metoxi-4-(prop-2-en-1-iloxi)fenil]propanamida, N-[(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)metil]-2,4-dicloropiridina-3-carboxamida, N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloropiridina-3-carboxamida, N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2-fluoro-4-iodopiridin-3-carboxamida, N-[(e)-[(ciclopropilmetoxi)imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-fenilacetamida, N-[(Z)-[(ciclopropilmetoxi)imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-fenilacetamida, N-metil-2-(1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-N-(1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il)-1,3-tiazol-4-carboxamida, N-metil-2-(1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il]-1,3-tiazol-4-carboxamida, N-metil-2-(1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-N-[(1S)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il]-1,3-tiazol-4-carboxamida, carbamato de pentil-6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilideno]amino]oxi]metil]piridin-2-ilo], ácido fenazina-1-carboxílico, quinolina-8-ol y quinolina-8-olsulfato (2:1).
16. (16) Otros compuestos de acción antimicrobiana: (15.1) bentiazol, (15.2) betoxazina, (15.3) capsimicina, (15.4) carvona, (15.5) quinometionato, (15.6) pirofenona (chlazafenona), (15.7) cufraneb, (15.8) ciflufenamida, (15.9) cimoxanilo, (15:10) ciprosulfamida, (15:11) dazomet, (15:12) debacarb, diclorofeno (15:13), (15:14), diclomezina, difenzoquat (15,15), difenilamina (15:16)metilsulfato difenzoquat, (15:17) difenilamina, (15:18) ecomato, (15:19) fenpirazamina, (15:20) flumetover, (15:21) fluoroimida, (15:22) flusulfamida, (15:23) flutianilo, (15:24) fosetil-aluminio, (15:25) fosetil-calcio, (15:26) fosetil-sodio, (15:27) hexaclorobenceno (15:28) irumamicina, (15:29)metasulfocarb, (15:30)metil isotiocianato, metrafenona (15:31), (15:32) mildiomicina, (15:33) natamicina (15:34) dimetiliditiocarbamato de níquel, (15:35), nitrotal-isopropilo, (15:37) oxamocarb, (15:38) oxifenthiin, (15:39) pentaclorofenol y sales, (15:40) fenotrina, (15:41) ácido fosforoso y sus sales, (15:42) pr opamocarb fositilato, (15,43) propanosina-sodio, (15,44) pirimorph, (15,45) (2E)-3-(4-tert-butilfenil)-3-(2-cloropiridina-4-il)-1-(morfolina 4-il)prop-2-en-1-ona, (15:46) (2Z)-3-(4-tert-butilfenil)-3-(2-cloropiridina-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona, (15:47) pirrolnitrina, (15:48) tebufloquin, (15:49) tecloftalam, (15:50) tolnifanida, (15:51) triazóxido, (15:52) triclameda, (15:53) zarilamid, (15:54) (3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[[[3-[(isobutiriloxi)metoxi]-4-metoxi-piridin-2-il]carbonil]amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-ilo 2-metilpropanoato, (15,55) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, (15:56) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, (15:57) 1-(4-{4-[5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5 metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, (15,58) 1-(4-metoxifenoxi)-3,3-dimetil-butan-2-ilo-¹H-imidazol-1-carboxilato, (15:59) 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)piridina, (15,60) 2,3-dibutil-6-clorotieno[2,3-d](3H)-ona pirimidin-4(3H)-ona, (15.61) 2,6-dimetil-1H, 5H-[1,4] ditiino [2,3-c: 5,6-c 'd]dipirrol-1,3,5,7 (2H, 6H)-tetrona, (15.62) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(5R)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona, (15.63) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(5S)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-ilo(5S)]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona, (15.64) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-{4-[4-(5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il}etanona (15,65) 2-butoxi-6-yodo-3-propil-4H-cromen-4-ona, (15.66) 2-cloro-5-[2-cloro-1-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-1H-imidazol-5-il-4-metil]piridina, (15.67) 2-fenilfenol y sus sales, (15.68) 3-(4,4,5-trifluoro-3, 3-dimetil-3,4-dihidroisquinolina-1-il)quinolina (15,69) 3,4,5-tricloropiridina-2,6-dicarbonitrilo, (15.70) 3-cloro-5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-metilpiridazina, (15.71) 4-(4-clorofenil)-5-(2,6-difluorofenil)-3,6-dimetilpiridazina, (15.72) 5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-tiol (15,73) 5-cloro-N'-fenil-N'-(prop-2-in-1-il)tiofeno-2-sulfonohidrazida, (15.74) 5-fluoro-2-[(4-fluorobencil)oxi]pirimidin-4-amina, (15.75) 5-fluoro-2-[(4-metilbencil)oxi] pirimidin-4-amina, (15.76) 5-metil-6-octil [1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, (15.77) (2Z)-3-amino-2-ciano-3-fenilacrilato de etilo, (15,78) N'-(4-[[3-(4-clorobencil)-1,2,4-tiadiazol-5-il]oxi]-2,5-dimetil-fenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (15,79) N-(4-clorobencil)-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]propanamida, (15.80) N-[(4-clorofenil)(ciano)metil]-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]propanamida, (15,81) N-[(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)metil]-2,4-dicloronicotinamida, (15,82) N-[1-(5-bromo-3-cloropiridina-2-il)etil]-2,4-dicloronicotinamida, (15,83) N-[1-(5-bromo-3-cloropiridina-2-il)etil]-2-fluoro-4-iodonicotinamida, (15,84) N-[(e)-[imino(ciclopropilmetoxi)][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-fenilacetamida (15,85) N-[(Z)-[(ciclopropilmetoxi)imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-fenilacetamida (15,86) N'-4-[(3-tert-butil-4-ciano-1,2-tiazol-5-il)oxi]-2-cloro-5-metilfenil)- N-etil-N-metilimidofornamida, (15,87) N-metil-2-(1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-N-(1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il)-1,3-tiazol-4-carboxamida (15,88) N-metil-2-(1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-N-[(1R)1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il]-1,3-tiazol-4-carboxamida (15.89) N-metil-2-(1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-N-[(1S)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il]-1,3-tiazol-4-carboxamida (15,90) pentil{6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metil]amino]oxi]metil]piridin-2-ilo]carbamato, (15,91) ácido fenazina-1-carboxílico, (15,92) quinolin-8-ol, (15,93) quinolin-8-ol sulfato (2:1), (15,94) {6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metil]amino]oxi]metil]piridin-2-ilo]carbamato de tert-butilo (15,95) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[2'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida (15,96) N-(4'-clorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida (15,97), N-(2',4'-diclorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15. 98) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[4'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida (15,99) N-(2',5'-difluorobifenil-(2-il)-1-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.100) 3-difluorometil)-1-metil-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.101) 5-fluoro-1,3-

dimetil-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.102) 2-cloro-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]nicotinamida, (15.103) 3-(difluorometil)-N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.104) N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.105) 3-(difluorometil)-N-(4'-etinilbifenil-2-il)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.106) N-(4'-etinilbifenil-2-il)-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.107) 2-cloro-N-(4'-etinilbifenil-2-il)nicotinamida (15.108) 2-cloro-N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]nicotinamida, (15.109) 4-(difluorometil)-2-metil-N-[4'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1,3-tiazol-5-carboxamida, (15.110) 5-fluoro-N-[4'-(3-hidroxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.111) 2-cloro-N-[4'-(3-hidroxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]nicotinamida, (15.112) 3-(difluorometil)-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.113) 5-fluoro-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.114) 2-cloro-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]nicotinamida, (5-bromo-2-metoxi-4-metilpiridin-3-il)(2,3,4-trimetoxi-6-metilfenil)metanona, (15.115) (5-bromo-2-metoxi-4-metilpiridin-3-il)(2,3,4-trimetoxi-6-metilfenil)metanona, (15.116) N-[2-(4-[[3-(4-clorofenil)prop-2-in-1-il]oxi]-3-metoxifenil)etil]-N2-(metilsulfonil)valinamida, (15.117) ácido 4-oxo-4-[(2-feniletil)amino] butanoico, (15.118) but-3-in-1-il{6-[[[(Z)-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metil]amino]oxi]metil]piridin-2-il}carbamato, (15.119) 4-amino-5-fluoropirimidina-2-ol (forma mesómero: 4-amino-5-fluoropirimidina-2(1H)-ona), (15.120) 3,4,5-trihidroxibenzoato de propilo (15.121) 1,3-dimetil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.122) 1,3-dimetil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.123) 1,3-dimetil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.124) [3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)](piridin-3-il)metanol, (15.125) (S)-il-1,2-oxazol-4-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (15.126) (R)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (15.127) 2-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxirano-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.128) 1-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-ilo tiocianato (15.129) 5-(alilsulfanil)-1-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxirano-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol (15.130) 2-[1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptano-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.131) 2-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.132) 2-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.133) 1-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-ilo tiocianato, (15.134) 1-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1 tiocianato de 1,2,4-triazol-5-ilo (15.135) 5-(alilsulfanil)-1-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxirano-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (15.136) 5-(alilsulfanil)-1-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (15.137) 2-[(2S,4S,SS)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptano-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.138) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptano-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.139) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptano-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.140) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetil-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.141) 2-[(2S,4S,SR)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptano-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.142) 2-[(2R,4S,SR)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptano-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.143) 2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptano-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.144) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptano-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.145) 2-fluoro-6-(trifluorometil)-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)benzamida, (15.146) 2-(6-bencilpiridina-2-il)quinazolina, (15.147) 2-[6-(3-fluoro-4-metoxifenil)-5-metilpiridin-2-il]quinazolina (15.148) 3-(4,4-difluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolina-1-il)quinolina, (15.149) ácido abscísico.

Además, los compuestos activos según la invención pueden combinarse con microorganismos.

Los microorganismos son adecuados para una buena tolerancia a las plantas, una toxicidad favorable al calor y una buena compatibilidad medioambiental para la protección de plantas y órganos, para aumentar los rendimientos de la cosecha, mejorar la calidad del cultivo y controlar plagas animales, en particular insectos, arácnidos, helmintos, nematodos y moluscos, en agricultura, horticultura, ganadería, silvicultura, jardines e instalaciones recreativas, almacenamiento y protección de materiales, así como en el sector de la higiene. Se pueden usar preferiblemente como agentes de protección de plantas. Son eficaces contra especies normalmente sensibles y resistentes, así como contra todas las etapas de desarrollo individuales. Los microorganismos mencionados anteriormente incluyen:

Microorganismos del grupo de las bacterias, por ejemplo, *Bacillus agri*, *Bacillus aizawai*, *Bacillus albolactis*, *Bacillus amiloliquefaciens*, especialmente la cepa *B. amiloliquefaciens* IN937a, o la cepa FZB42, *Bacillus cereus*, en particular, las esporas de *B. cereus* CNCM I-1562, *Bacillus coagulans*, *Bacillus endoparasiticus*, *Bacillus endorhythmos*, *Bacillus firmus*, en particular, las esporas de *B. firmus* CNCM I-1582, *Bacillus kurstaki*, *Bacillus lacticola*, *Bacillus lactimorbus*, *Bacillus lactis*, *Bacillus laterosporus*, *Bacillus lentimorbus*, *Bacillus licheniformis*, *Bacillus medusa*, *Bacillus megaterium*, *Bacillus metiens*, *Bacillus natto*, *Bacillus nigrificans*, *Bacillus popilliae*, *Bacillus pumilus*, especialmente la cepa *B. pumilus* Gb34, *Bacillus siamensis*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus subtilis*, especialmente la cepa *B. subtilis* GB03, o de la cepa *B. subtilis* var. FZB24 *amiloliquefaciens*, *Bacillus thuringiensis*, especialmente *B. thuringiensis* var. *israelensis* o *B. thuringiensis* ssp. cepa *aizawai* ABTS 1857 o, *B. thuringiensis* ssp. *kurstaki* cepa HD-1, *B. thuringiensis* var. *san diego*, *B. thuringiensis* var. *tenebrinos*, *Bacillus uniflagellatus*, *Delftia acidovorans*, en particular RAY209 tallo, *Lysobacter antibioticus*, en particular la cepa 13-*anisopliae* 1,

Metarhizium, Pseudomonas clorographis, en particular la cepa MA₃42, Proradix Pseudomonas, Streptomyces galbus, la cepa K61, en particular, Streptomyces griseoviridis;

- 5 Microorganismos del grupo de los hongos, por ejemplo Ampelomyces quisqualis, en particular la cepa AQ10, Aureobasidium pullulans, particularmente blastosporas de DSM¹4940 cepa o blastosporas de la cepa DSM¹4941 o mezclas de los mismos, Beauveria bassiana, en particular la cepa ATCC₇4040, Beauveria brongniartii, Candida oleophila, en particular O cepa, Coniothyrium minitans, en particular la cepa CON/M/91-8, Dilofospora alopecuri, Gliocladium catenulatum, en particular la cepa J1446; Hirsutella thompsonii, Lagenidium giganteum, Lecanicillium lecanii (anteriormente conocido como Verticillium lecanii) anisopliae, particularmente conidios de la cepa KV01, Metarhizium, en particular la cepa F52, Metschnikowia fructicola, en particular la cepa NRRL Y-30752, 10 Microsphaeropsis ochracea, Muscodor albus, en particular la cepa QST20799, Nomuraea rileyi, Paecilomyces lilacinus, en particular esporas de por ejemplo, la cepa lilacinus 251, Penicillium bilaii, en particular la cepa ATCC₂2348, Pichia anomala, en particular la cepa WRL-076, Pseudozyma flocculosa, en particular, la cepa PF-A₂2 UL, DV74 Pythium oligandrum, Trichoderma asperellum, en particular la cepa ICC012, Trichoderma harzianum, especialmente T. harzianum T39, Verticillium lecanii, en particular las cepas DAOM198499 y DAOM216596.
- 15 Microorganismos insecticidas del grupo de los protozoos, por ejemplo, Nosema locustae, Vairimorpha; microorganismos insecticidas del grupo de virus, por ejemplo, Polilla de gitana (Lymantria dispar) virus de poliedrosis nuclear (NPV), NPV de polilla de Tussock (Lymantriidae), NPV de Heliothis, NPV de mosca de sierra de pino (Neodiprion), virus de granulosis (GV) de polilla de codorniz (Cydia pomonella);

- 20 Microorganismos del grupo de nematodos entomopatógenos, por ejemplo, Steinernema scapterisci, Steinernema feltiae (Neoalectana carpocapsae), Heterorhabditis heliothidis, Xenorhabdus luminiscencia.

Los ingredientes activos mencionados aquí por su "nombre común" son conocidos y por ejemplo son descritos o se buscan en línea en Pesticide Manual ("The Pesticide Manual" 14a Ed., British Crop Protection Council 2006) (por ejemplo <http://www.alanwood.net/pesticides>).

- 25 Todos los asociados de mezcla mencionados de las clases (1) a (16), debido a sus grupos funcionales, son capaces de formar dado el caso sales de los ácidos con bases apropiadas.

- 30 Finalmente, se encontró que los nuevos compuestos de fórmula (I) exhiben buena tolerancia de las plantas y toxicidad favorable para los mamíferos y una buena compatibilidad ambiental, especialmente para controlar plagas animales, en particular artrópodos, insectos, arácnidos, helmintos, nematodos y moluscos, así como para agricultura, silvicultura, depósitos y materiales, así como para la higiene o la salud animal. Los compuestos de acuerdo con la invención también se pueden usar en el campo de la salud animal, por ejemplo para controlar endo y/o ectoparásitos.

Los compuestos de acuerdo con la invención se pueden usar como agentes para controlar plagas de animales, preferiblemente como agentes de protección de plantas. Son eficaces contra especies normalmente sensibles y resistentes, así como contra todas las etapas de desarrollo individuales.

- 35 Los compuestos de acuerdo con la invención se pueden convertir en formulaciones generalmente conocidas. Dichas formulaciones generalmente contienen de 0,01 a 98 % en peso de compuesto activo, preferiblemente de 0,5 a 90 % en peso.

- 40 Los compuestos según la invención pueden estar presentes en sus formulaciones comercialmente disponibles así como en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones mezclados con otros ingredientes activos o sinergistas. Los sinergistas son compuestos por los cuales se aumenta la acción de los ingredientes activos sin que el sinergista activo tenga que ser activo por sí mismo.

- 45 El contenido de sustancia activa de las formas de aplicación preparadas a partir de las formulaciones disponibles comercialmente puede variar dentro de límites amplios. La concentración de sustancia activa de las formas de aplicación puede ser de 0,0000001 a 95 % en peso de compuesto activo, preferiblemente de 0,00001 a 1 % en peso.

La aplicación se lleva a cabo de manera habitual adaptada a las formas de aplicación.

- 50 De acuerdo con la invención, todas las plantas y partes de plantas pueden ser tratadas. Se entiende por plantas todas las plantas y poblaciones de plantas, como las plantas silvestres deseadas o no deseadas o las plantas cultivadas (incluidas las plantas de cultivo de origen natural). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que pueden obtenerse mediante procedimientos de cultivo y optimización convencionales o mediante procedimientos biotecnológicos y de ingeniería genética o combinaciones de estos procedimientos, incluyendo las plantas transgénicas e incluyendo las protegidas por derechos de variedades vegetales o no protegibles por derechos de variedades vegetales. Las partes de la planta incluyen todas las partes por encima del suelo y por debajo del suelo,

y se incluyen los órganos de las plantas, tales como brote, hoja, flor y raíz, por ejemplo, hojas, agujas, tallos, troncos, flores, cuerpos fructíferos, frutos, semillas, raíces, tubérculos y rizomas. Las partes de la planta también incluyen material de cultivo, así como material de propagación vegetativo y generativo, por ejemplo, estacas, tubérculos, rizomas, retoños y semillas.

5 El tratamiento según la invención de las plantas y partes de plantas con los compuestos activos tiene lugar directamente o por exposición en su entorno, hábitat o espacio de almacenamiento mediante los procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo, mediante inmersión, pulverización, evaporación, nebulización, dispersión, aplicación a brocha, inyección y con material de propagación, especialmente en el caso de las semillas, también mediante la aplicación de una o más capas.

10 Como ya se mencionó anteriormente, todas las plantas y sus partes pueden tratarse de acuerdo con la invención. En una realización preferida, se tratan plantas silvestres o cultivares de plantas y cultivares de plantas obtenidos como resultado de procedimientos convencionales de cultivo biológico tales como cruzamiento o fusión de protoplastos, así como partes de los mismos. En una realización preferida adicional, se tratan plantas transgénicas y variedades de plantas obtenidas por procedimientos de ingeniería genética, en caso dado en combinación con procedimientos convencionales (Organismos Modificados Genéticamente) y partes de los mismos. Los términos o "partes de las plantas" o "partes de plantas" se han explicado anteriormente.

15 De acuerdo con la invención, se da preferencia particular al tratamiento de plantas, de cultivares de plantas que habitualmente están disponibles comercialmente o en uso. Se entiende por cultivares de plantas las plantas con características nuevas que han sido cultivadas tanto por cultivo convencional, por mutagénesis o por técnicas de ADN recombinante. Estas pueden ser variedades, bio- y genotipos.

20 En el campo de la salud animal, esto es, en el campo veterinario, las sustancias activas según la presente invención actúan contra parásitos animales, en particular ectoparásitos o endoparásitos. El término endoparásitos incluye, en particular, helmintos tales como cestodos, nematodos o trematodos, y protozoos tales como coccidios. Los ectoparásitos son normalmente y preferiblemente artrópodos, particularmente insectos tales como moscas (picadoras y lamedoras), larvas de moscas parásitas, piojos, flebotomos, plumas, pulgas y similares; o ácaros tales como garrapatas, por ejemplo, garrapatas de escudo o garrapatas de cuero, o ácaros tales como ácaros la sarna, ácaros del vello, piojos de plumas y similares.

25 Además, se descubrió que los compuestos según la invención muestran una alta acción insecticida contra insectos que destruyen materiales técnicos. En el presente contexto, los materiales técnicos deben entenderse como materiales no vivos, como plásticos, adhesivos, colas, papeles y cartón, cuero, madera, productos de procesamiento de madera y pinturas.

30 Además, los compuestos según la invención pueden usarse como agentes antiincrustantes solos o en combinación con otros compuestos activos.

35 Los ingredientes activos también son adecuadas para combatir plagas animales en el entorno doméstico, la higiene y la protección de productos almacenados, en particular insectos, arácnidos y ácaros, que se presentan en espacios cerrados, tales como pisos, salas de fábrica, oficinas, cabinas de vehículos. Pueden usarse para controlar estas plagas, ya sea solo o en combinación con otros ingredientes activos y auxiliares en productos insecticidas domésticos. Son eficaces contra las especies sensibles y resistentes, así como contra todas las etapas de desarrollo.

40 Todas las plantas, cultivares de plantas y poblaciones de plantas, tales como plantas silvestres deseadas o indeseables o plantas cultivadas, se entienden como plantas. Según la invención, los cultivos para ser tratados son plantas que son de origen natural u obtenidas mediante procedimientos de cultivo y optimización convencionales o mediante procedimientos biotecnológicos y de ingeniería genética o por combinaciones de los procedimientos anteriormente mencionados. El término planta de cultivo naturalmente también incluye plantas transgénicas.

45 Por variedades de plantas se entienden plantas con nuevas propiedades, los llamados rasgos que se han obtenido mediante cultivo convencional, mediante mutagénesis o mediante técnicas de ADN recombinante o una combinación de los mismos. Estas pueden ser variedades, razas, bio- y genotipos.

50 Se entiende por partes de la planta todas las partes y órganos de las plantas que se encuentran por encima del suelo y por debajo del suelo, tales como brote, hoja, flor y raíz, especialmente hojas, agujas, tallos, troncos, flores, cuerpos fructíferos, frutos, semillas, raíces, tubérculos y rizomas. El término partes de la planta comprende además material de cultivo así como material de propagación vegetativo y generativo, por ejemplo, esquejes, tubérculos, rizomas, yemas y semillas.

En una realización de acuerdo con la invención, se tratan los cultivares naturales o vegetales y los cultivares vegetales obtenidos como resultado de procedimientos convencionales de mejoramiento y optimización (por ejemplo, fusiones cruzadas o protoplastos) y partes de plantas de los mismos.

5 En una realización adicional de acuerdo con la invención, se tratan plantas transgénicas que se han obtenido mediante procedimientos de ingeniería genética, dado el caso en combinación con procedimientos convencionales, y sus partes.

El procedimiento de tratamiento de acuerdo con la invención se usa preferiblemente en plantas genéticamente modificadas o partes de plantas.

10 Las plantas genéticamente modificadas, llamadas plantas transgénicas, son plantas en las que un gen heterólogo se ha integrado de forma estable en el genoma.

15 El término "gen heterólogo" significa esencialmente un gen que se proporciona o se ensambla fuera de la planta y que, cuando se introduce en el genoma del núcleo celular, el genoma del cloroplasto o el genoma mitocondrial de la planta transformada, imparte propiedades agronómicas nuevas o mejoradas u otras propiedades, que expresa una proteína o polipéptido de interés o que contiene otro gen, presente en la planta (por ejemplo, mediante tecnología antisentido, tecnología de cosupresión o tecnología de ARNi [ARN de interferencia]). Un gen heterólogo presente en el genoma también se conoce como transgén. Un transgén, definido por su presencia específica en el genoma de la planta, se denomina transformación o evento transgénico.

20 Dependiendo de las especies de plantas o variedades de plantas, su ubicación y condiciones de crecimiento (suelos, clima, periodo de vegetación, dieta), el tratamiento de la invención puede también resultar en efectos sobreaditivos ("sinérgicos"). Por ejemplo, son posibles los siguientes efectos que van más allá de los efectos realmente esperados: tasas de aplicación reducidas y/o espectro de actividad extendida y/o mayor efectividad de los ingredientes activos y composiciones que pueden usarse de acuerdo con la invención, mejor crecimiento de plantas, mayor tolerancia contra altas o bajas temperaturas, mayor tolerancia a la sequedad o al contenido de agua o sal del suelo, mayor rendimiento de la floración, alivio de la cosecha, aceleración de la madurez, mayores rendimientos, frutos más grandes, mayor altura de planta, color verde intenso de la hoja, floración temprana, mayor calidad y/o mayor valor nutricional de los productos cosechados, una mejor vida útil y/o maniobrabilidad de los productos cosechados.

25 Las combinaciones de compuestos activos según la invención también pueden ejercer un efecto de refuerzo sobre las plantas en ciertas velocidades de aplicación. Por lo tanto, son adecuados para la movilización del sistema de defensa de la planta contra el ataque de hongos y/o microorganismos y/o virus fitopatógenos indeseados. Esta puede ser una de las razones de la mayor eficacia de las combinaciones de acuerdo con la invención, por ejemplo contra hongos. En el presente contexto, las sustancias que refuerzan las plantas (sustancias que inducen resistencia) también se refieren a sustancias o combinaciones de sustancias que son capaces de estimular el sistema de defensa de las plantas de manera tal que las plantas tratadas, cuando se inoculan posteriormente con hongos fitopatógenos y/o microorganismos y/o virus no deseados tendrá un grado considerable de resistencia a estos hongos y/o microorganismos y/o virus fitopatógenos indeseables. En el presente caso, se entienden hongos fitopatógenos, bacterias y virus como hongos y/o microorganismos y/o virus fitopatógenos indeseables. Por lo tanto, las sustancias según la invención pueden usarse para la protección de plantas contra el ataque de los patógenos mencionados dentro de un cierto periodo después del tratamiento. El periodo durante el cual se logra un efecto protector generalmente varía de 1 a 10 días, preferiblemente de 1 a 7 días, después del tratamiento de las plantas con las sustancias activas.

30 Las plantas que se tratan adicionalmente preferiblemente de acuerdo con la invención son resistentes a uno o más factores de estrés biótico, es decir, estas plantas tienen una mejor defensa contra plagas animales y microbianas, tales como los nematodos, insectos, ácaros, hongos fitopatógenos, bacterias, virus y/o viroides.

35 Además de las plantas y cultivares de plantas mencionados anteriormente, también es posible tratar aquellos de acuerdo con la invención que son resistentes a uno o más factores de estrés abiótico.

40 Las condiciones de estrés abiótico pueden incluir, por ejemplo, sequía, condiciones de frío y calor, estrés osmótico, inundaciones, aumento del contenido de sal del suelo, aumento de la exposición a minerales, condiciones de ozono, condiciones de luz elevada, disponibilidad limitada de nutrientes nitrogenados, disponibilidad limitada de nutrientes de fósforo o prevención de sombras.

50 Las plantas y los cultivares de plantas que también pueden tratarse de acuerdo con la invención son aquellas plantas que se caracterizan por propiedades de rendimiento incrementadas. Un mayor rendimiento en estas plantas, por ejemplo, con base en la mejora de la fisiología vegetal, la mejora de crecimiento de las plantas y la mejora de desarrollo de la planta, tales como la eficiencia del uso del agua, la eficiencia de retención de agua, la mejora de uso

del nitrógeno, la asimilación de carbono mejorada, la mejora de la fotosíntesis, el aumento de la eficiencia de germinación y maduración acelerada. El rendimiento puede verse influenciado aún más por la arquitectura mejorada de la planta (bajo condiciones de estrés y sin estrés), incluida la floración temprana, el control de la floración para la producción de semillas híbridas, el crecimiento de las plantas, el tamaño de la planta, los entrenudos y el espaciado, vainas, número de semillas por vaina o espiga, masa de semillas, aumento del llenado de las semillas, pérdida de semilla reducida, estallido de vainas reducido y estabilidad.

Otros rasgos de rendimiento incluyen la composición de la semilla, tales como el contenido de hidratos de carbono, contenido de proteínas, contenido en aceite y la composición, el valor nutritivo, la reducción de compuestos antinutricionales, procesabilidad mejorada y una mejor estabilidad al almacenamiento.

Las plantas que pueden tratarse de acuerdo con la invención son plantas híbridas que ya expresan las características de heterosis o vigor híbrido que resulta en general más alto rendimiento, vigor, salud y resistencia ante factores de estrés bióticos y abióticos. Dichas plantas se producen normalmente cruzando una línea progenitora propensa consanguínea (la pareja cruzada hembra) con otra línea consanguínea fértil (la pareja cruzada masculina). La semilla híbrida se cosecha normalmente de las plantas estériles de polen y se vende a los propagadores. Las plantas de polinización a veces pueden producirse (por ejemplo, maíz) mediante la eliminación (es decir, la eliminación mecánica de los órganos masculinos o flores masculinas); pero es más común que la esterilidad del polen se base en determinantes genéticos en el genoma de la planta. En este caso, especialmente cuando se desea obtener el producto deseado de las plantas híbridas, las semillas son generalmente favorables para asegurar que la fertilidad del polen en plantas híbridas que contienen los determinantes genéticos responsables de la esterilidad del polen está completamente restaurada. Esto puede lograrse asegurando que los asociados cruzados masculinos tengan genes restauradores de fertilidad correspondientes capaces de restaurar la fertilidad del polen en plantas híbridas que contienen los determinantes genéticos responsables de la esterilidad del polen. Los determinantes genéticos para la esterilidad del polen pueden localizarse en el citoplasma. Ejemplos de esterilidad de polen citoplásmico (CMS) se han descrito, por ejemplo, para especies de Brassica. Sin embargo, los determinantes genéticos para la esterilidad del polen también se pueden localizar en el núcleo celular. Las plantas de polinización también se pueden obtener mediante procedimientos de biotecnología vegetal, como la ingeniería genética. Un medio particularmente útil de la obtención de plantas masculinas estériles se describe en el documento WO 89/10396 en el que, por ejemplo, una ribonucleasa tal como barnasa se expresa selectivamente en las células tapete en los estambres. La fertilidad puede restaurarse mediante la expresión de un inhibidor de la ribonucleasa como Barstar en las células tapete.

Las plantas o cultivares de plantas (que se obtienen usando procedimientos de biotecnología vegetal, tales como ingeniería genética) que pueden tratarse de acuerdo con la invención son plantas tolerantes a herbicidas esto es, plantas que se han hecho tolerantes a uno o más herbicidas predeterminados. Dichas plantas pueden obtenerse mediante transformación genética o mediante selección de plantas que contienen una mutación que imparte dicha tolerancia a los herbicidas.

Las plantas tolerantes a herbicidas son, por ejemplo, plantas tolerantes a glifosato, esto es, plantas que se han hecho tolerantes al herbicida glifosato o sus sales. Por ejemplo, las plantas tolerantes a glifosato se pueden obtener mediante la transformación de la planta que codifica la sintasa de la enzima 5-enolpiruvilsiquimato-3-fosfato (EPSPS) con un gen. Ejemplos de tales genes son el gen EPSPS AroA (mutante CT7) de la bacteria *Salmonella typhimurium*, el gen CP4 de la bacteria *Agrobacterium sp.*, los genes que confieren EPSPS de petunia, para EPSPS de tomate o EPSPS de eleusina. También puede ser un EPSPS mutado. Las plantas tolerantes a glifosato también pueden obtenerse mediante la expresión de un gen que codifica una enzima glifosato óxidorreductasa. Las plantas tolerantes al glifosato también se pueden obtener expresando un gen que codifica una enzima glifosato acetiltransferasa. Las plantas tolerantes a glifosato también pueden obtenerse seleccionando plantas que reconocen mutaciones de origen natural de los genes mencionados anteriormente.

Otras plantas resistentes a los herbicidas son, por ejemplo, plantas que se han hecho tolerantes a herbicidas que inhiben la enzima glutamina sintasa, tal como bialafos, fosfinotricina o glufosinato. Dichas plantas pueden obtenerse expresando una enzima que desintoxica el herbicida o un mutante de la enzima glutamina sintasa, que es resistente a la inhibición. Una de tales enzimas desintoxicante eficiente es, por ejemplo una enzima que codifica una fosfinotricina acetiltransferasa (tal como la proteína bar o pat de especies de *Streptomyces*). Se describen plantas que expresan fosfinotricina acetiltransferasa exógena.

Otras plantas tolerantes a los herbicidas son también plantas que se han hecho tolerantes a los herbicidas que inhiben la enzima hidroxifenilpiruvato dioxigenasa (HPPD). Las hidroxifenilpirrolidodioxigenasas son enzimas que catalizan la reacción en la que el parahidroxifenilpiruvato (HPP) se hace reaccionar para formar un homogenizado. Las plantas tolerantes a los inhibidores de HPPD pueden transformarse con un gen que codifica una enzima resistente a HPPD que se produce de manera natural o un gen que codifica una enzima HPPD mutante. La

- tolerancia a los inhibidores de HPPD también se puede lograr mediante la transformación de plantas con genes que codifican ciertas enzimas que permiten la formación de homogénizado a pesar de la inhibición de la enzima HPPD nativa por el inhibidor de HPPD. La tolerancia de las plantas a los inhibidores de HPPD también puede mejorarse mediante la transformación de plantas, además de un gen que codifica una enzima tolerante a HPPD, con un gen que codifica una enzima prepenato deshidrogenasa.
- Otras plantas resistentes a los herbicidas son plantas que se han hecho tolerantes a los inhibidores de acetolactato sintasa (ALS). Inhibidores de ALS Conocidos incluyen, por ejemplo, herbicidas de sulfonilurea, imidazolinona, triazolopirimidinas, pirimidiniloxi(tio)benzoatos, y/o sulfonilaminocarboniltriaolinona. Se sabe que diversas mutaciones en la enzima ALS (también conocida como acetohidroxi ácido sintasa, AHAS) confieren tolerancia a diferentes herbicidas o grupos de herbicidas. La preparación de plantas tolerantes a la sulfonilurea y plantas tolerantes a la imidazolinona se describe en la publicación internacional WO 1996/033270. Otras plantas tolerantes a sulfonilurea e imidazolinona también se describen, por ejemplo, en, WO 2007/024782.
- Se pueden obtener plantas adicionales tolerantes a imidazolinona y/o sulfonilurea por mutagénesis inducida, por selección en cultivos celulares en presencia del herbicida o por cultivo de mutación.
- Las plantas o los cultivares vegetales (que se han obtenido mediante procedimientos de biotecnología vegetal, como la ingeniería genética), que también pueden tratarse de acuerdo con la invención, son plantas transgénicas resistentes a los insectos, esto es, plantas que han sido resistentes al ataque con ciertos insectos objetivo. Dichas plantas pueden obtenerse mediante transformación genética o seleccionando plantas que contengan una mutación que imparta dicha resistencia a los insectos.
- En el presente contexto, el término "planta transgénica resistente a insectos" abarca cualquier planta que contiene al menos un transgén que comprende una secuencia de codificación lo siguiente:
1. 1) una proteína cristalina insecticida de *Bacillus thuringiensis* o una parte insecticida de la misma, tales como las proteínas cristalinas insecticidas enumerados en línea en: http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/, o partes insecticidas de las mismas, por ejemplo las proteínas de las clases de proteínas Cry Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry2Ab, Cry3Bb o Cry3Ae o partes insecticidas de las mismas; o
 2. 2) una proteína cristalina de *Bacillus thuringiensis* o una parte del mismo, el insecticida en la presencia de una segunda otra proteína cristalina como *Bacillus thuringiensis* o una parte de la misma, tal como la toxina binaria compuesta por las proteínas cristalinas Cy34 y Cy35; o
 3. 3) comprende una proteína insecticida híbrida que comprende partes de diferentes proteínas cristalinas insecticidas de *Bacillus thuringiensis*, tales como un híbrido de las proteínas de 1) anterior, o un híbrido de las proteínas de 2) anterior, por ejemplo, la proteína Cry1A.105, producida por la serie de maíz MON98034 (WO 2007/027777); o
 4. 4) una proteína de cualquiera de los puntos 1) a 3) anteriores en la que algunos, en particular 1 a 10, aminoácidos han sido sustituidos por otro aminoácido para obtener una mayor actividad insecticida a una diana especies de insectos, y/o al espectro para expandir el objetivo especies de insectos y/o debido a los cambios que se introdujeron en el ADN codificante durante la clonación o transformación, tales como la proteína Cry3Bb1 en las serie de maíz MON863 o MON88017, o la proteína Cry3A en la serie de maíz MIR604;
 5. 5) una proteína insecticida secretada de *Bacillus thuringiensis* o *Bacillus cereus*, o una porción insecticida de la misma, tales como las proteínas vegetativas de toxicidad que actúan sobre insectos (proteínas insecticidas vegetativas, VIP) bajo http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Inicio/Neil_Crickmore/Bt/vip.html, por ejemplo, proteínas de la clase de proteínas VIP3Aa; o
 6. 6) una proteína secretada de *Bacillus thuringiensis* o *Bacillus cereus* que es insecticida en presencia de una segunda proteína secretada de *Bacillus thuringiensis* o *B. cereus*, tal como la toxina binaria compuesta por las proteínas VIP1A y VIP2A.
 7. 7) una proteína insecticida híbrida que comprende partes de diferentes proteínas secretadas a partir de *Bacillus thuringiensis* o *Bacillus cereus*, tales como un híbrido de las proteínas de 1) anterior, o un híbrido de las proteínas de 2) anterior; o
 8. 8) una proteína de acuerdo con uno cualquiera de los puntos 1) a 3) anteriores, en la cual algunos, en particular 1 a 10, aminoácidos se han reemplazado por otro aminoácido para lograr una mayor actividad insecticida contra una especie de insecto objetivo y/o el espectro de las especies de insectos objetivo correspondientes y/o debido a las alteraciones inducidas en el ADN de codificación durante la clonación o transformación (la codificación de una proteína insecticida que se retiene), como la proteína VIP3Aa en la serie de algodón COT 102.

Por supuesto, las plantas transgénicas resistentes a insectos en el presente contexto también incluyen cualquier planta que comprenda una combinación de genes que codifican las proteínas de una de las clases 1 a 8 mencionadas anteriormente. En una realización, una planta resistente a los insectos contiene más de un transgén que codifica una proteína de acuerdo con uno de los anteriores 1 a 8, para extender el espectro de la especie de insecto objetivo correspondiente o para retrasar el desarrollo de una resistencia de los insectos a las plantas mediante el uso de diferentes proteínas que son insecticidas para la misma especie de insecto objetivo pero tienen un modo de acción diferente tal como unión a diferentes sitios receptores en el insecto.

Las plantas o los cultivares vegetales (que se han obtenido mediante procedimientos de biotecnología vegetal, tales como ingeniería genética) que también pueden tratarse de acuerdo con la invención son tolerantes a los factores de estrés abiótico. Dichas plantas pueden obtenerse mediante transformación genética o seleccionando plantas que contengan una mutación que imparta dicha resistencia al estrés. Plantas particularmente útiles con tolerancia al estrés incluyen las siguientes:

a. Plantas que contienen un transgén que es capaz de reducir la expresión y/o la actividad del gen para la poli(ADP-ribosa)polimerasa (PARP) en las células vegetales o en las plantas.

b. Plantas que contienen un transgén tolerante al estrés que es capaz de reducir la expresión y/o la actividad de los genes que codifican PARG de plantas o células vegetales;

c. Plantas que contienen un transgén tolerante al estrés que codifica una enzima funcional de la nicotinamida adenina dinucleótido que elude la ruta biosintética, que incluye nicotinamidasa, nicotinato fosfato transferrina, ácido nicotínico mononucleótido adeniltransferasa, nicotinamida adenina dinucleótido sintetasa o nicotinamida fosforibosiltransferasa.

Las plantas o variedades de plantas (obtenidas por procedimientos de biotecnología de plantas tales como la ingeniería genética) que también pueden tratarse de acuerdo con la invención, para mostrar cantidad, calidad y/o estabilidad de almacenamiento modificadas del producto cosechado y/o propiedades alteradas de ingredientes específicos del producto cosechado, como por ejemplo:

1) Plantas transgénicas que sintetizan un almidón modificado, que en sus propiedades físicoquímicas, en particular, el contenido de amilosa o la relación amilosa/amilopectina, el grado de ramificación, la longitud media de la cadena, la distribución de las cadenas laterales, el comportamiento de la viscosidad, la resistencia del gel, el tamaño de grano de almidón y/o la morfología de grano de almidón, se cambia en comparación con el almidón sintetizado en células vegetales de tipo salvaje o plantas, por lo que este almidón modificado es más adecuado para ciertas aplicaciones.

2) Plantas transgénicas que sintetizan polímeros diferentes de almidón de hidratos de carbono o polímeros de carbohidratos diferentes de almidón con propiedades alteradas en comparación con plantas de tipo silvestre sin modificación genética. Ejemplos son plantas que producen polifruktosa, en particular de tipo Inulin y Levant, plantas que producen alfa-1,4-glucanos, plantas que producen alfa-1,4-glucanos ramificados en alfa-1,6-, y plantas que son adecuadas para la producción alternante.

3) Plantas transgénicas que producen hialuronano.

Las plantas o los cultivares de plantas (que se han obtenido mediante procedimientos de biotecnología vegetal, tales como ingeniería genética) que también pueden tratarse de acuerdo con la invención son plantas tales como plantas de algodón con propiedades de fibra modificadas. Tales plantas pueden obtenerse mediante transformación genética o mediante selección de plantas que contienen una mutación que confiere tales propiedades de fibra alteradas; incluyendo:

(a) Plantas tales como plantas de algodón que contienen una forma modificada de genes de celulosa sintasa,

(b) Plantas tales como plantas de algodón que contienen una forma modificada de ácidos nucleicos homólogos de rsw2 o rsw3;

(c) Plantas tales como plantas de algodón con expresión incrementada de sacarosa fosfato sintasa;

(d) Plantas tales como plantas de algodón con expresión incrementada de sacarosa sintasa;

(e) Plantas tales como plantas de algodón en las que se cambia el tiempo de paso de los plasmodemas en la base de la célula de fibra, por ejemplo, regulando por disminución la β -1,3-glucanasa selectiva de la fibra;

f) Plantas tales como plantas de algodón con fibras con reactividad alterada, por ejemplo, mediante la expresión del gen de la N-acetilglucosamina transferasa, incluidos los genes nodC y quitina sintasa.

Las plantas o los cultivares de plantas (obtenidos según procedimientos de biotecnología de plantas, tales como ingeniería genética) que también pueden tratarse de acuerdo con la invención son plantas tales como plantas como la colza o plantas de Brassica relacionadas con propiedades modificadas en la composición del aceite. Dichas plantas pueden obtenerse mediante transformación genética o mediante selección de plantas que contienen una mutación que confiere tales propiedades de aceite modificadas; incluyendo:

- (a) plantas tales como semillas de colza que producen aceite con un alto contenido de ácido oleico;
- (b) Plantas tales como semillas de colza que producen aceite con un bajo contenido de ácido linoleico.
- (c) Plantas tales como semillas de colza que producen aceite con un bajo contenido de ácidos grasos saturados.

Plantas transgénicas particularmente útiles que se pueden tratar de acuerdo con la invención son plantas que comprenden uno o más genes que codifican una o más toxinas son las plantas transgénicas que se venden bajo los nombres comerciales: YIELD GARD® (por ejemplo maíz, algodón, soja), KnockOut® (por ejemplo maíz), BiteGard® (por ejemplo maíz), BT-Xtra® (por ejemplo maíz), StarLink® (por ejemplo maíz), Bollgard® (algodón), Nucotn® (algodón), NuCOTN 33B® (algodón), NatureGard® (por ejemplo, maíz), Protecta® y NewLeaf® (patata). Plantas tolerantes a herbicidas que pueden mencionarse son variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja que se comercializan bajo los siguientes nombres comerciales: Roundup Ready® (tolerancia frente a glifosato, por ejemplo maíz, algodón, soja), Liberty Link® (intolerancia a la fosfotricidad, por ejemplo, colza), IMI® (imidazolinona) y SCS® (Tolerancia a la sulfonilurea), por ejemplo, el maíz. Como plantas resistentes a herbicidas (tradicionalmente plantas cultivadas para tolerancia a herbicidas) que pueden mencionarse incluyen las variedades comercializadas bajo el nombre Clearfield® (por ejemplo maíz).

Plantas transgénicas particularmente útiles que pueden tratarse de acuerdo con la invención son plantas que contienen eventos de transformación, o combinación de eventos de transformación, y que se enumeran por ejemplo en las bases de datos de diversas autoridades nacionales o regionales (véase, por ejemplo, http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browse.aspx y <http://www.agbios.com/dbase.php>).

El tratamiento según la invención de las plantas y partes de plantas con las combinaciones de principios activos se realiza directamente o mediante acción sobre su entorno, hábitat o espacio de almacenamiento según los procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo mediante inmersión, pulverización, evaporación, nebulización, dispersión, aplicación a brocha y el caso de material de propagación, en las semillas particulares, además mediante recubrimiento con una o varias capas.

En particular, las mezclas de acuerdo con la invención son adecuadas para el tratamiento de la semilla. Aquí se da preferencia a las combinaciones según la invención mencionadas anteriormente como preferidas o particularmente preferidas. Por lo tanto, una gran parte del daño es causado por las plagas en las plantas de cultivo y por la infestación de la semilla durante el almacenamiento y después de que la semilla se introduce en el suelo, durante e inmediatamente después de la germinación de las plantas. Esta fase es particularmente crítica, ya que las raíces y los brotes de la planta en crecimiento son particularmente sensibles e incluso un pequeño daño puede llevar a la muerte de toda la planta. Por lo tanto, existe un interés particularmente grande en la protección de la semilla y la planta germinante mediante el uso de agentes adecuados.

El control de plagas por el tratamiento de la semilla de plantas ha sido conocido desde hace tiempo y está sujeto a mejoras continuas. Sin embargo, en el tratamiento de la semilla, hay una serie de problemas que no siempre se pueden resolver satisfactoriamente. Por lo tanto, es deseable desarrollar procedimientos para proteger la semilla y la planta germinadora, lo que hace que la aplicación adicional de agentes fitosanitarios después de la siembra o después de la emergencia de las plantas sea superflua. Además, es deseable optimizar la cantidad de material activo aplicada de tal manera que la semilla y la planta en germinación se proteja mejor del ataque por plagas, pero sin dañar la planta misma por el compuesto activo. En particular, los procedimientos para el tratamiento de semillas deben incluir también las propiedades insecticidas intrínsecas de las plantas transgénicas con el fin de conseguir una protección óptima de la semilla y la planta en germinación con un mínimo de productos fitosanitarios.

Por lo tanto, la presente invención también se refiere, en particular, a un procedimiento para la protección de semillas y plantas en germinación contra la infestación de plagas mediante el tratamiento de la semilla con una composición de acuerdo con la invención. La invención también se refiere al uso de las composiciones según la invención para el tratamiento de semillas para la protección de la semilla y la planta resultante, contra las plagas. Además, la invención se refiere a semillas que han sido tratadas con una composición según la invención para protección contra plagas.

Una de las ventajas de la presente invención es que debido a las propiedades sistémicas especiales de las composiciones de la invención, el tratamiento de la semilla con estas composiciones no sólo protege a la semilla en

sí, sino también las plantas resultantes después de la emergencia, frente a las plagas. De esta manera, se puede prescindir del tratamiento directo del cultivo en el momento de la siembra o poco después.

5 Una ventaja adicional es el aumento sinérgico de la actividad insecticida de las composiciones según la invención en comparación con el compuesto activo insecticida individual, que supera la actividad esperada de los dos compuestos activos aplicados individualmente. El aumento sinérgico de la actividad fungicida de las composiciones de acuerdo con la invención, en comparación con el compuesto activo individual fungicida, que supera la actividad esperada de la aplicación individual del ingrediente activo, es beneficioso. Esto permite optimizar la cantidad de ingredientes activos utilizada.

10 También es considerado como ventajoso que las mezclas según la invención se pueden emplear en particular en semillas transgénicas, en el que las plantas que emergen de esta semilla son capaces de expresar una proteína dirigida contra plagas. Mediante el tratamiento de dichas semillas con las composiciones de acuerdo con la invención, ya se pueden controlar ciertas plagas mediante la expresión de, por ejemplo, proteína insecticida y, además, se protegen contra el daño por medio de las composiciones de acuerdo con la invención.

15 Las composiciones de la invención son adecuadas para la protección de semillas de cualquier variedad de planta como ya se mencionó anteriormente que se emplee en agricultura, en invernadero, en bosques o en horticultura. En particular, se trata de semillas de maíz, cacahuete, canola, colza, amapola, semillas de soja, algodón, remolacha (por ejemplo, remolacha de azúcar y remolacha forrajera), arroz, mijo, trigo, cebada, avena, centeno, girasol, tabaco, patatas u hortalizas (por ejemplo, tomates, plantas de repollo). Las composiciones de la invención también son adecuadas para el tratamiento de semillas de vegetales y frutales como ya se mencionó anteriormente. De particular importancia es el tratamiento de semillas de maíz, soja, algodón, trigo y canola o colza.

20 Como ya se ha mencionado anteriormente, el tratamiento de semillas transgénicas es de particular importancia con una composición de la invención. Son semillas de plantas que contienen generalmente al menos un gen heterólogo que controla la expresión de un polipéptido con, en particular, propiedades insecticidas. Los genes heterólogos en semillas transgénicas pueden proceder de microorganismos tales como Bacillus, Rhizobium, Pseudomonas, Serratia, Trichoderma, Clavibacter, Glomus o Gliocladium. La presente invención es particularmente adecuada para el tratamiento de semillas transgénicas que contienen al menos un gen heterólogo procedente de Bacillus sp. y cuyo producto génico muestra actividad contra el barrenador europeo del maíz y/o el gusano de la raíz del maíz. De manera especialmente preferida, se trata de un gen heterólogo derivado de Bacillus thuringiensis.

30 Dentro del alcance de la presente invención, la composición según la invención se aplica sola o en una formulación adecuada a la semilla. Preferiblemente, la semilla se trata en un estado que es tan estable que no se produce ningún daño en el tratamiento. En general, la semilla se puede tratar en cualquier momento entre la cosecha y la siembra. La semilla normalmente utilizada ha sido separada de las de la planta y liberada de mazorcas, cáscaras, tallos, envolturas, pelos o pulpa de fruta.

35 Por lo general, se debe tener cuidado en el tratamiento de semillas para asegurar que la cantidad de fuerza aplicada a la composición de la semilla de la invención y/o de otros aditivos se elige de tal manera que la germinación de la semilla no se deteriore y la planta emergente no se dañe. Esto es particularmente importante para las sustancias activas que pueden exhibir efectos fitotóxicos en ciertas tasas de aplicación.

40 Además, los compuestos de acuerdo con la invención se pueden usar para controlar varias plagas diferentes que incluyen, por ejemplo, insectos succionadores dañinos, insectos picadores y otras plagas parasitantes de plantas, plagas silvestres, plagas que destruyen materiales industriales y usan plagas higiénicas, incluyendo parásitos en la salud animal, para su extinción y erradicación. La presente invención también incluye, por lo tanto, un procedimiento para controlar plagas parasitarias de plantas, plagas silvestres o plagas que destruyen materiales industriales.

45 En el campo de la salud animal, esto es, en el campo veterinario, las sustancias activas según la presente invención actúan contra parásitos animales, en particular ectoparásitos o endoparásitos. El término endoparásitos incluye, en particular, helmintos tales como cestodos, nematodos o trematodos, y protozoos tales como cozzidias. Los ectoparásitos son normalmente y preferiblemente artrópodos, particularmente insectos tales como moscas (picadoras y lamedoras), larvas de moscas parásitas, piojos, piojos del pelo, piojos de las plumas, pulgas y similares; o ácaros tales como garrapatas, por ejemplo, garrapatas de escudo o garrapatas de cuero, o ácaros tales como ácaros de la sarna, ácaros del vello, ácaros de plumas y similares.

50 Estos parásitos incluyen:

Del orden de los Anoplurida por ejemplo Haematopinus spp, Linognathus spp, Pediculus spp, Phthirus spp, Solenopotes spp.; Ejemplos específicos son: Linognathus setosus, Linognathus vituli, Linognathus ovillus, Linognathus oviformis, Linognathus pedalis, Linognathus stenopsis, Haematopinus asini macrocephalus,

Haematopinus eurysternus, Haematopinus suis, Pediculus humanus capitis, Pediculus humanus corporis, Philloera vastatrix, Phthirus pubis, Solenopotes capillatus;

5 Del orden de los Mallophagida y los subórdenes Amblycerina así como Ischnocerina por ejemplo Trimenopon spp, Menopon spp, Trinoton spp, Bovicola spp, Wernecki spp, Lepikentron spp, Damalina spp, Trichodectes spp, Felicola spp.; ejemplos específicos son: Bovicola bovis, Bovicola ovis, Bovicola limbata, Damalina bovis, Trichodectes canis, Felicola subrostratus, Bovicola caprae, Lepikentron ovis, Werneckiella equi;

10 Del orden de los dípteros y los subórdenes Nematocerina y Brachycerina, por ejemplo, Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Simulium spp., Eusimulium spp., Phlebotomus spp., Lutzomyia spp., Culicoides spp., Chrysops spp., Odagmia spp., Wilhelmia spp., Hybomitra spp., Atilotus spp., Tabanus spp., Haematopota spp., Philipomyia spp., Braula spp., Musca spp., Hydrotaea spp., Stomoxis spp., Haematobia spp., Morellia spp., Fannia spp., Glossina spp., Calliphora spp., Lucilia spp, Chrysomyia spp, Wohlfahrtia spp, Sarcophaga spp, estro spp, Hypoderma spp, Gasterophilus spp, Hippobosca spp, Lipoptena spp, Melophagus spp, Rhinoestrus spp, Tipula spp.; ejemplos específicos son: Aedes aegypti, Aedes albopictus, Aedes taeniorhynchus, Anopheles gambiae, Anopheles maculipennis, Calliphora erythrocephala, Chrysozona pluvialis, Culex quinquefasciatus, Culex pipiens, Culex tarsalis, Fannia canicularis, Sarcophaga carnaria, Stomoxis calcitrans, Tipula paludosa, Lucilia cuprina Lucilia sericata, reptans Simulium, Phlebotomus papatasi, longipalpis Phlebotomus, Odagmia ornata, Wilhelmia equina, Boophthora erythrocephala, Tabanus Bromio, Tabanus spodopteris, atratus Tabanus, Tabanus sudeticus, Hybomitra Ciurea, Chrysops caecutiens, Chrysops relictus, Haematopota pluvialis, Haematopota italica, Musca autumnalis, Musca domestica, Haematobia irritans irritans, Haematobia irritans exigua, stimulans Haematobia, Hydrotaea irritans, Hydrotaea albipuncta, Chrysomya cloropyga, Chrysomya bezziana, estro ovis, Hypoderma bovis, Hypoderma lineatum, Przhevalskiana silenus, Dermatobia hominis, Melophagus ovinus, Lipoptena Capreoli, Lipoptena cervi, Hippobosca variegata, Hippobosca equina, Gasterophilus intestinalis, Gasterophilus hemorroidal, Gasterophilus inermis, Gasterophilus nasalis, Gasterophilus nigricomis, Gasterophilus pecorum, Braula coeca;

25 Del orden de los Siphonapterida por ejemplo Pulex spp, Ctenocephalides spp, Tunga spp, Xenopsilla spp, Ceratophyllus spp.; ejemplos específicos son: Ctenocephalides canis, Ctenocephalides felis, Pulex irritans, Tunga penetrans, Xenopsilla cheopis;

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

Del orden de los Blattarida por ejemplo Blatta orientalis, Periplaneta americana, Blatella germanica, Supella spp. (Por ejemplo, Suppella longipalpa);

30 De la subclase de los Acari (Acarina) y los órdenes Meta- y Mesostigmata, por ejemplo, Argas spp., Ornithodoros spp., Otobius spp., Ixodes spp., Amblyomma spp., Rhipicephalus (Boophilus) spp., Dermacentor spp., Haemaphysalis spp., Hyalomma spp., Dermanyssus spp., Rhipicephalus spp. (El género original de anfitrión de múltiples garrapatas) Ornithonyssus spp, Pneumonyssus spp, raillietiidae spp, Pneumonyssus spp, Sternostoma spp, Varroa spp, Acarapis spp.; ejemplos específicos son: Argas persicus, Argas reflexus, Ornithodoros moubata, Otobius megnini, Rhipicephalus (Boophilus) microplus, Rhipicephalus (Boophilus) decoloratus, Rhipicephalus (Boophilus) annulatus, Rhipicephalus (Boophilus) calceratus, Hyalomma anatolicum, Hyalomma aegypticum, Hyalomma marginado, Hyalomma transiens, Rhipicephalus evertsi, Ixodes ricinus, Ixodes hexagonus, Ixodes canisuga, Ixodes pilosus, Ixodes rubicundus, Ixodes scapularis, Ixodes holociclus, Haemaphysalis concinna, Haemaphysalis punctata, Haemaphysalis cinnabarina, Haemaphysalis otophila, Haemaphysalis leachi, Haemaphysalis longicorni, Dermacentor marginatus, Dermacentor reticulatus, Dermacentor pictus, Dermacentor albipictus, Dermacentor andersoni, Dermacentor variabilis, Hyalomma mauritanicum, Rhipicephalus sanguineus, Rhipicephalus bursa, Rhipicephalus appendiculatus, Rhipicephalus capensis, Rhipicephalus turanicus, Rhipicephalus zambeziensis, Amblyomma americanum, Amblyomma variegatum, Amblyomma maculatum, Amblyomma hebraeum, Amblyomma cajennense, Dermanyssus gallinae, Ornithonyssus bursa, Ornithonyssus silviarum, Varroa jacobsoni;

50 Del orden de los Actinedida (Prostigmata) y Acaridida (Astigmata), por ejemplo, Acarapis spp., Cheiletiella spp., Ornithocheiletia spp., Myobia spp., Psorergates spp., Demodex spp., Trombicula spp., Listrophorus spp., Acarus spp., Tyrophagus spp., Caloglyphus spp., Hypodectes spp., Pterolichus spp., Psoroptes spp, Chorioptes spp, Otodectes spp, Sarcoptes spp, Notoedres spp, Knemidocoptes spp, Cytodites spp, Laminosioptes spp.; ejemplos específicos son: Cheiletiella yasguri, Cheiletiella blakei, Demodex canis, Demodex bovis, Demodex ovis, Demodex caprae, Demodex equi, Demodex caballi, Demodex suis, Neotrombicula autumnalis, Neotrombicula desaleri, Neoschöngastia xerothermobia, Trombicula akamushi, Otodectes cynotis, Notoedres cati, Sarcoptes canis, Sarcoptes bovis, Sarcoptes ovis, Sarcoptes rupicaprae (= S. caprae), Sarcoptes equi, Sarcoptes suis, Psoroptes ovis, Psoroptes cuniculi, Psoroptes equi, Chorioptes bovis, Psorergates ovis, sarna Pneumonyssoidic, Pneumonyssoides caninum, Acarapis woodi.

55

5 Los compuestos activos de acuerdo con la invención también son adecuados para controlar artrópodos, helmintos y protozoos que atacan a los animales. Los animales incluyen animales de granja, por ejemplo, ganado, ovejas, cabras, caballos, cerdos, burros, camellos, búfalos, conejos, gallinas, pavos, patos, gansos, peces de cultivo, abejas melíferas. Los animales también incluyen animales de compañía, también conocidos como mascotas, por ejemplo, perros, gatos, aves domésticas, peces de acuario y los denominados animales experimentales, por ejemplo, hámsteres, cobayas, ratas y ratones.

Al controlar estos artrópodos, helmintos y/o protozoos, se deben reducir las muertes y mejorar el rendimiento (en el caso de la carne, la leche, la lana, las pieles, los huevos, la miel, etc.) y la salud del animal huésped. De acuerdo con la invención, es posible una cría de animales más económica y simple.

10 Por lo tanto, por ejemplo, es deseable prevenir o interrumpir la absorción de la sangre del huésped por parte de los parásitos (si corresponde). El control de los parásitos también puede ayudar a prevenir la transmisión de sustancias infecciosas.

15 El término "control", tal como se utiliza aquí con referencia al campo de la salud animal, significa que las sustancias activas actúan reduciendo la aparición del parásito en un animal parasitado a niveles inofensivos. Más específicamente, el "control", como se usa aquí, significa que el agente mata a los parásitos implicados, inhibe su crecimiento o inhibe su proliferación.

En general, los compuestos activos según la invención, cuando se usan para el tratamiento de animales, se pueden usar directamente. Preferiblemente se aplican como composiciones farmacéuticas que pueden contener excipientes y/o adyuvantes farmacéuticamente aceptables conocidos en la técnica.

20 La aplicación (= administración) de los ingredientes activos en el campo de la salud animal y en la cría de animales se puede realizar de una manera conocida mediante administración enteral en forma de por ejemplo comprimidos, cápsulas, pociones, gránulos, pastas, bolos, el procedimiento de alimentación a través de las bebidas, supositorios, mediante administración parenteral, tales como, por ejemplo, mediante inyecciones (intramuscular, subcutánea, intravenosa, intraperitoneal, etc.), implantes, mediante aplicación nasal, mediante aplicación dérmica en forma de, por ejemplo, de inmersión o de baño (inmersión), pulverización (aspersión), infusión (vertimiento y aplicación directa), lavado, empolvado, y con la ayuda de cuerpos moldeados que contengan el producto activo tales como collarines, marcas para las orejas, marcas para la cola, bandas para las extremidades, cabestros, dispositivos de marcación, etc. Los ingredientes activos se pueden utilizar como champú o como sea adecuado, en formulaciones aplicables en aerosoles o pulverizadores sin presión, por ejemplo, aspersores de bomba y aspersores de nebulización.

25

30

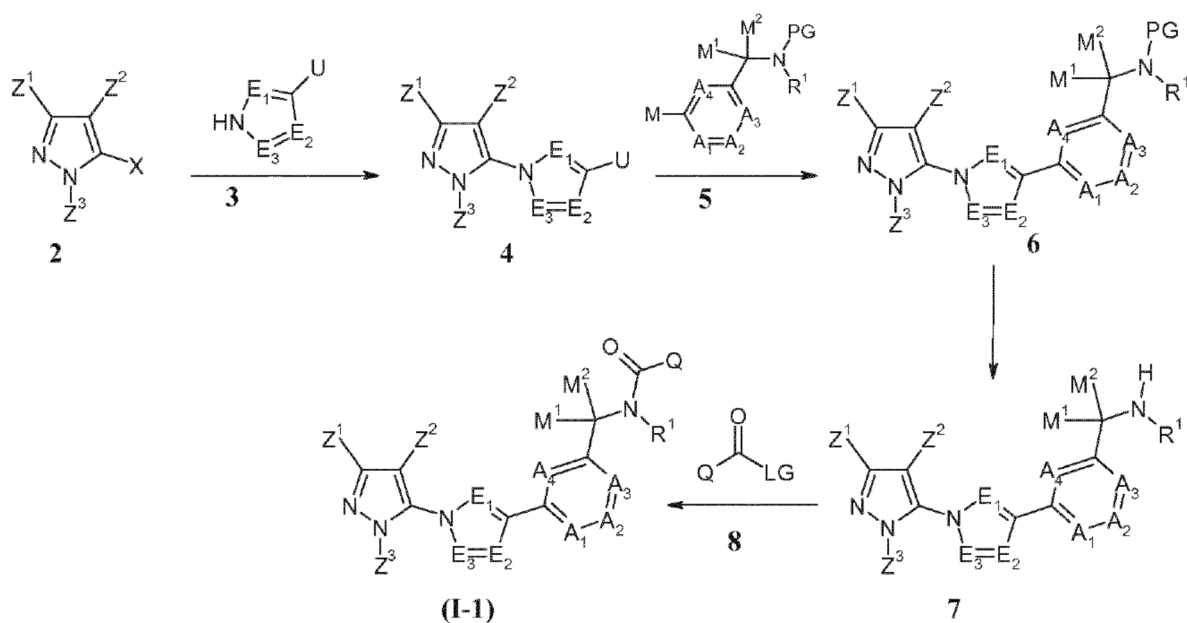
35 Cuando se usan para ganado, aves de corral, animales domésticos, etc., los compuestos activos de acuerdo con la invención pueden usarse como formulaciones (por ejemplo, polvos, polvos humectables [polvos, "WP" humectables], emulsiones, concentrados emulsionables [concentrados emulsionables, "CE"], fluibles, soluciones homogéneas y concentrados en suspensión [concentrados en suspensión, "SC"]) que comprenden los compuestos activos en una cantidad de 1 a 80 % en peso, directamente o después de dilución (por ejemplo, dilución de 100 a 10.000 veces) o como un baño químico.

Cuando se usan en salud animal, los compuestos activos según la invención pueden usarse en combinación con sinergistas u otros ingredientes activos adecuados, por ejemplo acaricidas, insecticidas, antihelmínticos, agentes para protozoarios.

40 Los compuestos de acuerdo con la invención pueden prepararse por procedimientos habituales conocidos por un experto en la materia.

El proceso de preparación general A para los compuestos (1-1) de acuerdo con la invención se muestra en el esquema de reacción 1.

Esquema de reacción 1

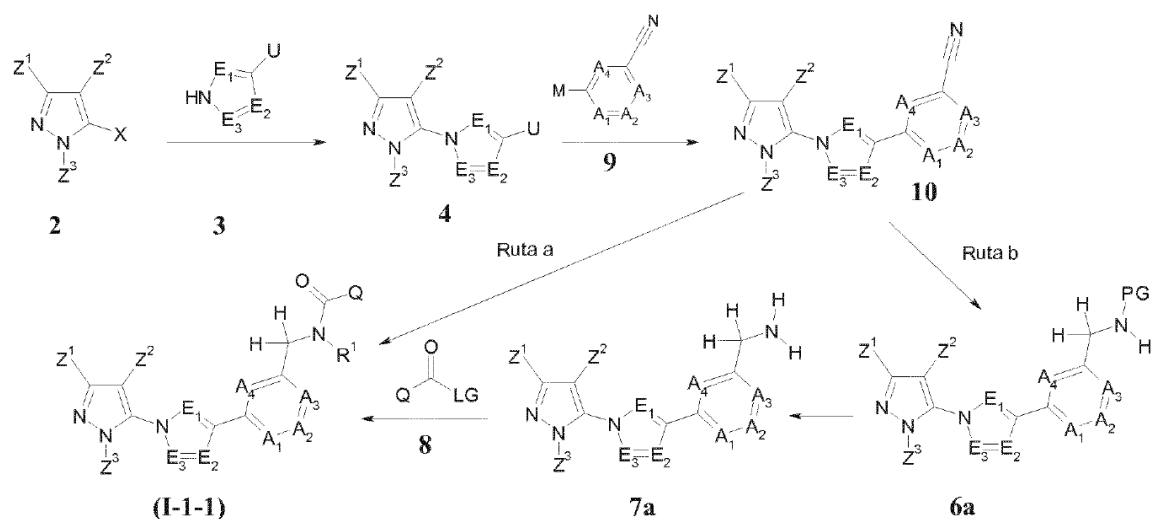


Los radicales A_1 - A_4 , R^1 , M^1 , M^2 , Q y Z^1 - Z^3 tienen los significados descritos anteriormente. PG representa un grupo protector adecuado, por ejemplo, t-butoxicarbonilo. LG representa un grupo saliente, por ejemplo, cloro. Los ciclos de cinco miembros de E_1 - E_3 , carbono y nitrógeno representan los heterociclos de 5 miembros definidos en T. X es un halógeno, por ejemplo, flúor. U es bromo, yodo o triflato, cuando M es un ácido borónico, éster borónico o trifluoroboronato. U es un ácido borónico, éster de ácido borónico o trifluoroboronato, cuando M es bromo, yodo o triflato.

Los compuestos de la invención de la estructura general (1-1) se pueden preparar con reactivos de acilación de estructura general 8 por procedimientos de la bibliografía por reacción del compuesto intermedio 7 [WO2010-051926; WO2010-133312]. Los intermedios de la estructura general 7 pueden prepararse a partir de derivados N-protectados de la estructura general 6. Los compuestos de la estructura general 6 pueden prepararse por medio de reacciones catalizadas por paladio de los asociados de reacción 4 y 5 [WO2005-040110; WO2009-089508]. Los compuestos de la estructura general 5 están disponibles comercialmente o se pueden preparar por procedimientos conocidos por un experto en la materia. Los compuestos de estructura general 4 se pueden preparar por procesos de la literatura, ya sea por sustitución nucleófila en el anillo aromático (X = cloro o flúor) [WO2007-107470; Tetrahedron Letters 2003, 44, 7629-7632] o mediante una reacción catalizada por un metal de transición (X = bromo o yodo) [WO2012-003405; WO2009-158371] de los materiales de partida correspondientes 2 y 3.

Alternativamente, los compuestos (1-1) de acuerdo con la invención pueden prepararse mediante el proceso de preparación general B (esquema de reacción 2).

Esquema de reacción 2

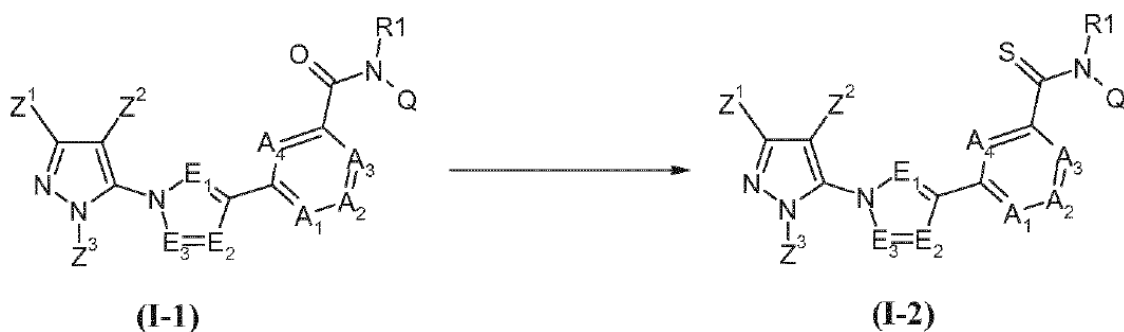


Los radicales A_1 - A_4 , R^1 , Q y R^1 - R^3 tienen los significados descritos anteriormente. PG representa un grupo protector adecuado, por ejemplo, t-butoxicarbonilo. LG representa un grupo saliente, por ejemplo, cloro. Los ciclos de cinco miembros de E_1 - E_3 , carbono y nitrógeno representan los heterociclos de 5 miembros definidos en T. X es un halógeno, por ejemplo, flúor. U es bromo, yodo o triflato, cuando M es un ácido borónico, éster borónico o trifluoroboronato. U es un ácido borónico, éster de ácido borónico o trifluoroboronato, cuando M es bromo, yodo o triflato.

Los compuestos de la invención de la estructura general (1-1-1) se pueden preparar en analogía a los procedimientos de acoplamiento de péptidos literatura a partir de materiales 8 y 7a [WO2010-051926 de partida; WO2010-133312]. Alternativamente, los compuestos de la estructura general (1-1-1) también se pueden preparar directamente a partir de compuestos de estructura general 10 por procedimientos de la bibliografía [Tetrahedron Letters 2000, 41 (18) 3513-3516; Journal of the American Chemical Society, 1925, 47, 3051-7]. Los compuestos de estructura general 7 se pueden preparar por desprotección adecuada de la función amina de los compuestos de estructura general 6a [Greene Protective Groups in Organic Synthesis, 4ª Edición, P.G.M. Wuts, TW Greene, John Wiley & Sons, Inc., en función del grupo protector utilizado, Hoboken, New Jersey]. Los compuestos de estructura general se pueden presentar en analgesia a procedimientos de la bibliografía a partir de compuestos de estructura general 10 [Tetrahedron 2003, 59 (29), 5.417-5.423; Journal of Medicinal Chemistry, 2013, 56 (5), 1946-1960]. Los compuestos de la estructura general 10 se pueden preparar de forma análoga a la síntesis de 6 descrita anteriormente. La preparación de los compuestos de la estructura general 4 ya se lleva a cabo en el proceso de representación.

Los compuestos de la estructura general (1-2) de acuerdo con la invención pueden sintetizarse mediante el procedimiento de preparación C que se muestra en el esquema de reacción 3.

Esquema de reacción 3

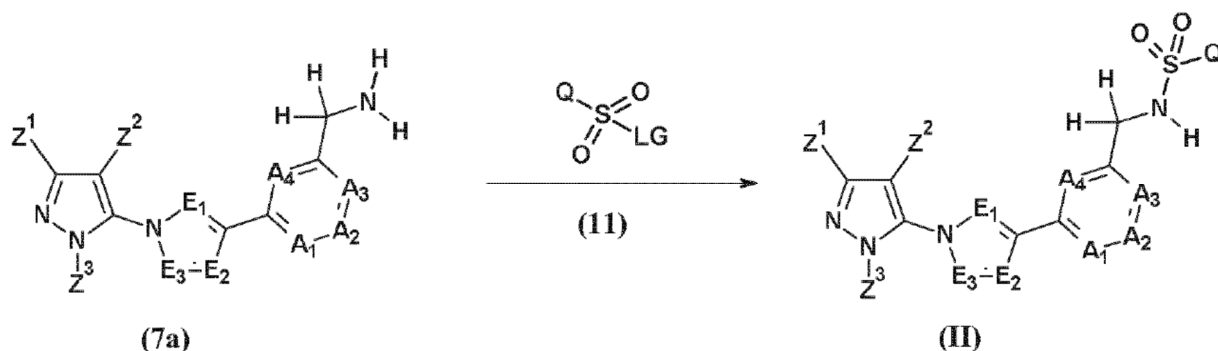


Los radicales A₁-A₄, Q, R¹ y R¹-R³ tienen los significados descritos anteriormente. Los ciclos de cinco miembros de E₁-E₃, carbono y nitrógeno representan los heterociclos de 5 miembros definidos en T.

Las estructuras de la estructura general (1-2) de acuerdo con la invención pueden prepararse a partir de compuestos de la estructura general (1-1) de manera análoga a procedimientos conocidos de la literatura [WO2012-056372; WO2003-066050].

Los compuestos de la estructura general (II) según la invención pueden sintetizarse mediante el procedimiento de preparación D mostrado en el esquema de reacción 4.

Esquema de reacción 4



Los radicales A₁-A₄, R¹, Q y R¹-R³ tienen los significados descritos anteriormente. LG representa un grupo saliente, por ejemplo, cloro. Los ciclos de cinco miembros de E₁-E₃, carbono y nitrógeno representan los heterociclos de 5 miembros definidos en T.

Los compuestos de la estructura general II de acuerdo con la invención pueden prepararse de forma análoga a procedimientos conocidos de la literatura a partir de compuestos de Struktur general 7a y 11 [US2007/0117858; WO2013/068462; US2009/0233878].

Los compuestos de la estructura general 5 están disponibles comercialmente o se pueden preparar por procedimientos conocidos por el experto en la materia o de manera análoga a estos procesos [documento WO2012004217; WO2009-130475; WO2008-107125; WO2003-099805; WO2012-0225061; WO2009-010488].

Los compuestos de la estructura general 2 están disponibles comercialmente o se pueden preparar por procedimientos conocidos por el experto en la materia o de manera análoga a estos procesos [WO2010-051926; WO2011-131615; WO2006-018725; WO2012-065932; WO2007077961; US2012-0115903; WO2010-017902; WO2010-127856; Tetrahedron Letters 2011, 44, 8451-8457].

Los compuestos de la estructura general 3 están disponibles comercialmente o se pueden preparar por procedimientos conocidos por el experto en la técnica o de manera análoga a estos procesos.

Los medios oxidantes para la oxidación de grupos alcohólicos son conocidos (véanse, por ejemplo, reactivos de oxidación en Organic Synthesis by Oxidation with Metal Compounds, Mijs, de Jonge, Plenum Verlag, New York, 1986; Manganese Compounds as Oxidizing Agents in Organic Chemistry, Arndt, Open Court Publishing Company, La Salle, ILO, 1981; The Oxidation of Organic Compounds by Permanganate Ion and Hexavalent Chromium, Lee, Open Court Publishing Company, La Salle, ILO, 1980). Eine Oxidation kann beispielsweise in Gegenwart von Permanganaten (z.B. Kaliumpermanganat), Metalloxiden (z.B. Mangandioxid, Chromoxide die beispielsweise in Dipiridin-chrom(VI)-oxid als Collins Reagenz (vgl. J. C. Collins et al., Tetrahedron Lett. 30, 3363-3366, 1968) verwendet werden durchgeführt werden. Ebenfalls in Gegenwart von Piridiniumchlorochromat (z.B. Corey's Reagenz) (vgl. auch R. O. Hutchins et al., Tetrahedron Lett. 48, 4167-4170, 1977; D. Landini et al. Synthesis 134-136, 1979) oder Ruthenium-tetroxid (vgl. S.-I. Murahashi, N. Komiya Ruthenium-catalyzed Oxidation of Alkenes, Alcohols, Amines, Amidas, β-Lactams, Phenols and Hydrocarbons, in: Modern Oxidation Methods, Baekvall, Jan-Erling (Eds.), Wiley-VCH-Verlag GmbH & Co. KGaA, 2004). Ebenfalls geeignet sind Ultraschall-induzierte Oxidationsreaktionen, sowie die Verwendung von Kaliumpermanganat (vgl. J. Yamawaki et al., Chem. Lett. 3, 379-380, 1983).

Cuando se usan grupos protectores para grupos amino del tipo carbamato, se utilizan preferiblemente auxiliares de reacción ácida. Por ejemplo, mezclas de ácidos minerales tales como ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido nítrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico o ácidos orgánicos tales como ácido benzoico, ácido fórmico, ácido acético,

ácido trifluoroacético, ácido metanosulfónico, ácido bencenosulfónico o ácido toluenosulfónico y un diluyente adecuado tal como agua y/o un disolvente orgánico tal como tetrahidrofurano, dioxano, diclorometano, cloroformo, acetato de etilo, etanol o metanol. Se da preferencia a mezclas de ácido clorhídrico o ácido acético con agua y/o un disolvente orgánico tal como éster acético.

- 5 Se sabe que algunas reacciones y procesos de preparación pueden llevarse a cabo particularmente bien en presencia de diluyentes o disolventes y auxiliares de reacción básicos o ácidos. También se pueden usar mezclas de diluyentes o disolventes. Los diluyentes o disolventes se usan ventajosamente en una cantidad tal que la mezcla de reacción se puede agitar fácilmente durante todo el proceso.

10 Los diluyentes o disolventes para llevar a cabo los procesos según la invención son en principio todos los disolventes orgánicos que son inertes en las condiciones de reacción específicas. Como ejemplos se pueden mencionar: hidrocarburos halogenados (por ejemplo, hidrocarburos clorados tales como etileno tetra, tetracloroetano, dicloropropano, cloruro de metileno, diclorobutano, cloroformo, tetracloruro de carbono, tricloraetano, tricloroetileno, pentacloroetano, difluorobenceno, 1,2-dicloroetano, clorobenceno, bromobenceno, diclorobenceno, clorotolueno, triclorobenceno), alcoholes (por ejemplo metanol, etanol, isopropanol, butanol), éteres (por ejemplo, etil propiléter, metil t-butiléter, n-butil-éter, anisol, fenetol, metil ciclohexilo, dimetiléter, dietiléter, dipropiléter, éter diisopropílico, di-n-butiléter, diisobutiléter, éter diisoamílico, éter dimetilico de etilenglicol, tetrahidrofurano, dioxano, éter diclorodietílico y poliéteres de óxido de etileno y/u óxido de propileno), aminas (por ejemplo, trimetil-, trietil-, tripropil-, tributilamina, N-metilmorfolina, piridina y tetrametilendiamina), nitrohidrocarburos (tales como nitrometano, nitroetano, nitropropano, nitrobenzoceno, cloronitrobenzoceno, o-nitrotolueno, nitrilos tales como acetonitrilo, propionitrilo, butironitrilo, isobutironitrilo, benzonitrilo, m-clorobenzonitrilo), tetrahidrotiofeno, dimetilsulfóxido, tetrametilsulfóxido, dipropilsulfóxido, bencilmetilsulfóxido, diisobutilsulfóxido, diisoamilsulfóxido, sulfonas (por ejemplo, dimetilo, dietilo, dipropilo, dibutilo, difenilo, dihexilo, metiletilcetona, etilpropilo, etilisobutil- y pentametileno sulfona), hidrocarburos alifáticos, cicloalifáticos o aromáticos (por ejemplo, hidrocarburos industriales pentano, hexano, heptano, octano, nonano), también llamados "alcoholes blancos" con componentes que tienen puntos de ebullición en el intervalo, por ejemplo 40 °C a 250 °C, cimeno, fracciones de bencina dentro de un intervalo de ebullición de 70 °C a 190 °C, ciclohexano, metilciclohexano, éter de petróleo, ligroína, octano, benceno, tolueno, clorobenceno, bromobenceno, nitrobenzoceno, xileno, ésteres (por ejemplo, metilo, etilo, butilo, acetato de isobutilo, de dimetilo, de dibutilo, carbonato de etileno); Amidas (por ejemplo, triamida hexametilfosfórica, formamida, N-metil-formamida, N,N-dimetil-formamida, N,N-dipropil-formamida, formamida N,N-dibutilo, N-metil-pirrolidina, caprolactama N-metilo, 1, 3-dimetil-3,4,5,6-tetrahidro-2(1H)-pirimidina, octilpirrolidona, octilcaprolactam, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-formil-piperidina, N,N-1,4-diformil-piperazina) y cetonas (por ejemplo acetona, acetofenona, metiletilcetona, metilbutilcetona).

20

25

30

Como auxiliares de reacción básicos para llevar a cabo los procedimientos según la invención, se pueden usar todos los agentes de unión a ácido adecuados. Los ejemplos incluyen: compuestos de metales alcalinos o alcalinotérreos (por ejemplo, hidróxidos, hidruros, óxidos y carbonatos de litio, sodio, potasio, magnesio, calcio y bario), bases de amidina o guanidina (por ejemplo, 7-metil-1,5,7-diazabicycloundeceno(4.3.0)noneno (DBN), diazabicyclo(2.2.2)octano(DABCO), 1,8-diazabicyclo(5.4.0); triaza-bicyclo(4.4.0)dic-5-eno (MTBD) (DBU), ciclohexiltetrabutyl-guanidina (CyTBG), ciclohexiltetrametilguanidina (CyTMG), N,N,N,N-tetrametil-1,8-naftalendiamina, pentametilpiperidina), y aminas, en particular aminas terciarias (por ejemplo trietilamina, trimetilamina, tribencilamina, triisopropilamina, tributilamina, triciclohexilamina, triamilamina, trihexilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-toluidina, N,N-dimetil-p-aminopiridina, N-metil-pirrolidina, N-metilpiperidina, N-metilimidazol, N metil-pirazol, N-metilmorfolina, N-metilhexametilenodiamina, piridina, 4-pirrolidinopiridina, 4-dimetilamino-piridina, quinolina, α -picolina, β -picolina, isoquinolina, pirimidina, acridina, N,N,N',N'-tetrametilendiamina, N,N, N',N'-tetraetilendiamina, quinoxalina, N-propil-diisopropilamina, N-etil-diisopropilamina, N,N'-dimetilciclohexilamina, 2, 6-lutidina, 2,4-lutidina o trietildiamina).

35

40

45

Los auxiliares ácidos adecuados para llevar a cabo los procesos según la invención son todos los ácidos minerales (por ejemplo, ácidos hidrácidos halogenados, como ácido fluorhídrico, ácido clorhídrico, ácido bromhídrico o ácido yodhídrico así como ácido sulfúrico, ácido fosfórico, ácido fosforoso, ácido nítrico), ácidos de Lewis (por ejemplo, cloruro de aluminio (III), trifluoruro de boro o su eterato, titanio (V), cloruro de estaño (V) cloruro, y ácidos orgánicos (por ejemplo ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico, ácido malónico, ácido láctico, ácido oxálico, ácido fumárico, ácido adípico, ácido esteárico, ácido tartárico, ácido oleico, ácido metanosulfónico, ácido benzoico, ácido bencenosulfónico o ácido para-toluenosulfónico).

50

Si se proporcionan grupos protectores en el esquema de reacción, se pueden usar todos los grupos protectores generalmente conocidos. En particular, los descritos por Greene T.W., Wuts P.G.W. en Protective Groups in Organic Synthesis; John Wiley & Sons, Inc., 1999, "Protection for the hidroxil group including 1,2- and 1,3-diols".

55

También son adecuados los grupos protectores

- del tipo de un éter metílico sustituido, por ejemplo metoximetilo (MOM), metiltiommetilo (MTM), (fenil-dimetilsilil)éter de metoximetilo (SNOM-OR), benciloximetilo (BOM-OR) para-metoxibenciloximetiléter (PMBM-OR), para-Nitrobenciloximetiléter, orto-Nitrobenciloximetiléter (NBOM-OR), (4-metoxifenoxi)metiléter (p-AOM-OR), guayacolmetiléter (GUM-OR), t-butoximetiléter, 4-pentiloxi-metiléter (POM-OR), sililoximetiléter, 2-metoxi-etoximetiléter (MEM-OR), 2,2,2-tricloroetoximetiléter, bis(2-cloroetoxi)metiléter, 2-(trimetil-silil)etoximetiléter (SEM-OR), metoximetiléter (MM-OR));
- del tipo de un éter de etilo sustituido, por ejemplo, 1-etoxietiléter (EE-OR), 1-(2-cloroetoxi)etiléter (CEE-OR), 1-[2-(trimetilsilil)etoxi]etiléter (SEE-OR), 1-metil-1-metoxietiléter (MIP-OR), 1-metil-1-benciloxietiléter (MBE OR), 1-metil-1-benciloxi-2-fluoro-etiléter (MIP-OR), 1-metil-1-fenoxietiléter, 2,2, -tricloroetiléter, 1,1-dianisil-2,2,2-tricloroetiléter (FECHA-OR), 1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-fenilisopropiléter (HIP-OR), 2-trimetilsililetiléter 2-(benciltio)etiléter, 2-(fenilselenil)etiléter), un éter (por ejemplo, tetrahidropiraniéter (THP-OR), 3-bromo-tetrahidropiraniéter, (3-BrTHP-OR), tetrahidrothiopiiraniéter, 1-metoxi-ciclohexitó éter, 2- y 4-picoliléter, 3-metil-2-picolil-N-óxido éter, 2-Quinolinilmetiléter (Qm-OR), 1-pirenilmetiléter, dipenilmetiléter (DPM-OR), para,para'-Dinitrobenzhidriéter (DNB-OR), 5-dibenzosuberiléter, trifenilmetiléter (Tr-OR), alfa-naftildifenilmetiléter, para-metoxi-fenildifenilmetiléter (MMTrOR), di(para-metoxi-fenil)fenilmetiléter (DMTr-OR), tri(para-metoxi-fenil)fenilmetiléter (TMTr-OR), 4-(4'-bromo-fenacilo)fenildifenilmetiléter, 4,4',4''tris(4,5-diclorophthalimido-fenil)metiléter (CPTR-OR), 4,4',4''-tris(benzoiloxifenil)metiléter (TBTR-OR), 4,4'-dimetoxi-3''-[N-(imidazolilmetil)]-triléter (IDTR-OR), 4,4'-dimetoxi-3''-[N-(imidazoliletilo)carbamoil]triléter (IETr-OR), 1,1-bis(4-metoxi-fenil)1'pirenilmetiléter (Bmpm-OR), 9-antriléter, 9-(9-fenil)xanteniléter (pixilo OR), 9-(9-fenil-10-oxo)antril(Tritilon-éter), 4-metoxi-tetrahidropiraniéter (MTHP-OR), 4-metoxi-tetrahidrothiopiiraniéter, 4-metoxi-tetrahidrothiopiirani-S,S-dióxido éter, 1-[(2-cloro-4-metil)fenil]-4-metoxipiperidin-4-il-éter (CTMP-OR), 1-(2-fluorofenil)éter-4-metoxi-piperidin-4-ilo (Fpmp-OR), 1,4-dioxano-2-iléter, tetrahidrofuraniléteres, tetrahidrotiofuraniléter, 2,3,3a,4,5,6,7,7a-octahidro-7,8,8-trimetil-4,7-methanbenzofuran-2-iléter (MBF-OR), t-butiléter, éter de alilo, éter de propargilo, para-clorofeniléter, para-metoxifeniléter, para-nitrofeniléter, para-2,4-dinitro-feniléter (DNP-OR), 2,3,5,6-tetrafluoro-4-(trifluorometil)feniléter, benciléter (Bn-OR));
- del tipo éter de bencilo sustituido (por ejemplo, para-metoxibenciléter (MPM-OR), 3,4-dimetoxibenciléter (DMPM-OR), orto-nitro-benciléter, para-nitro-benciléter, p-halo-benciléter, 2,6 dicloro-benciléter, para-aminoacil-benciléter (PAB-OR), para-azido-benciléter (Azb-OR), 4-azido-3-cloro-benciléter, 2-trifluorometil-benciléter, p-(metilsulfinil)benciléter (Msib-O));
- del tipo de un éter de sililo tal como trimetilsililéter (TMS-OR), trietilsililéter (TES-OR), triisopropilsililéter (TIPS-OR), dimetilisopropilsililéter (IPDMS-OR), dietilisopropilsililéter (DEIPS-OR), dimetilhexilsililéter (TDS-OR), t-butildimetilsililéter (TBDMS-O), t-butildifenilsililéter (TBDPS-OR), tribencilsililéter, tri-para-xililsililéter, trifenilsililéter (TPS-OR), difenilmetilsililéter (DPMS-OR), di-t-butilmetsililéter (DTBMS-OR), tris(trimetilsilil)sililéter (sisiléter), di-t-butilmetsililéter (DTBMS-OR), tris(trimetilsilil)sililéter (Sisiléter), (2-hidroxiestiril)-dimetilsililéter, diisopropilsililéter (2-hidroxiestiril)(HSDMS-OR) (HSDIS- OR), t-butilmetoxifenil-sililéter (TBMPs-OR), t-butoxidifenilsililéter (DPTBOS-OR));
- del tipo de un éster (por ejemplo, éster de formiato, éster de benzoilformiato, éster de acetato (Ac-OR), éster de cloroacetato, éster de dicloroacetato, éster de tricloroacetato, trifluoroacetato, (TFA-OR), éster de metoxiacetato, éster de trifenilmetoxiacetato, éster de fenoxiacetato, éster de para-clorofenoxiacetato, éster de fenilacetato, éster de difenilacetato (DPA-OR), ésteres de nicotinato, éster de 3-fenil-propionato, éster de 4-pentoato, éster de 4-oxopentoato (levulinato) (Lev-OR), éster de 4,4-(etilenditio)-pentanoato (LevS-OR), éster de 5-[3-bis(4-metoxifenil)hidroxi-metoxifenoxi]-levulinato, éster de pivaloato (Pv-OR), éster de 1-adamantanoato, éster de crotonato, éster de 4-metoxi-crotonato, éster de benzoato (Bz-OR), éster de para-fenilbenzoato, 2,4,6-trimetilbenzoato de metilo (mesitoato), éster de 4-(metiltiommetoxi)-butirato (MTMB-OR), éster de 2-(metiltiommetoximetil)-benzoato (MTMT-OR),
- del tipo de un éster, (por ejemplo carbonato de metilo, carbonato de metoximetilo, carbonato de 9-fluorenilmetilo (Fmoc-OR), carbonato de etilo, carbonato de 2,2,2-tricloroetilo (Troc-OR), carbonato de 1,1-dimetil-2,2,2-tricloroetilo (TCBOC- OR), carbonato de 2-(trimetilsilil)etil (TMS-OR), carbonato de 2-(fenilsulfonil)-etilo (Ps-OR), carbonato de 2-(trifenilfosfonio)-etilo (Peoc-OR), carbonato de t-butilo (Boc-OR), carbonato de isobutilo, carbonato de vinilo, carbonato de alilo (alloc-OR), carbonato de para-nitrofenilo, carbonato de bencilo (Z-OR), carbonato de para-metoxibencilo, carbonato de 3,4-dimetoxi-bencilo, carbonato de orto-nitro-bencilo, carbonato de para-nitro-bencilo, carbonato de 2-dansiletilo (Dnseoc-OR), carbonato de 2-(4-nitrofenil)etilo (Npeoc-OR), carbonato de 2-(2,4-dinitrofenil)etilo (Dnpeoc)), y
- del tipo sulfato (por ejemplo, alilosulfonato (Al-OR), metanosulfonato (Ms-OR), bencilosulfonato, tosilito (Ts-OR), 2-[(4-nitrofenil)etil]sulfonato (Npes-OR)).
- Los catalizadores adecuados para llevar a cabo un procedimiento de hidrogenación catalítica de la invención todos los catalizadores de hidrogenación usuales, tales como catalizadores de platino (por ejemplo, placa de platino, esponja de platino, negro de platino, platino coloidal, óxido de platino, alambre de platino), catalizadores de paladio (por ejemplo, esponja de paladio, negro de paladio, óxido de paladio, paladio-carbono, paladio coloidal, paladio-sulfato de bario, carbonato de paladio-bario, hidróxido de paladio, catalizadores de níquel (por ejemplo níquel reducido, óxido de níquel, níquel Raney), catalizadores de rutenio, catalizadores de cobalto (por ejemplo, cobalto

reducido a cobalto Raney), catalizadores de cobre (por ejemplo cobre reducido, cobre Raney, cobre Ullman). Preferiblemente catalizadores de metales nobles (por ejemplo, catalizadores que usan platino y paladio o rutenio), se utilizan dado el caso sustituidos (en un soporte adecuado, por ejemplo de carbono o silicio), catalizadores de rodio (por ejemplo cloruro de tris(trifenilfosfina)rodio(I) en presencia de trifenilfosfina). Además, se pueden utilizar

5 "catalizadores de hidrogenación quirales" (por ejemplo, pueden contener ligandos de difosfina quiral tales como (2S, 3S)-(-)- 2,3-bis(difenilfosfino)butano [(S, S)-quirafos] o (R)-(+)- 2,2' o (S)-(-)- 2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftaleno [R(+)-BINAP o S (-)- BINAP]), con lo cual se aumenta la proporción de un isómero en la mezcla de isómeros y la formación de otro isómero es suprimida casi completamente.

10 La preparación de sales de los compuestos de acuerdo con la invención se lleva a cabo de acuerdo con procedimientos estándar. Sales de adición de ácido representativas incluyen, por ejemplo las formadas por reacción con ácidos inorgánicos tales como ácido sulfúrico, ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido fosfórico o ácidos carboxílicos orgánicos tales como ácido acético, ácido trifluoroacético, ácido cítrico, ácido succínico, ácido butírico, ácido láctico, ácido fórmico, ácido fumárico, ácido maleico, ácido malónico, ácido canfórico, ácido oxálico, ácido ftálico se forman ácidos, ácido propiónico, ácido glicólico, ácido glutárico, ácido esteárico, ácido salicílico, ácido

15 sórbico, ácido tartárico, ácido cinámico, ácido valérico, ácido pícrico, ácido benzoico, o ácidos sulfónicos orgánicos tales como ácido metanosulfónico y ácido 4-toluenosulfónico.

Representativas son también las sales de los compuestos de la invención que se forman a partir de bases orgánicas, tales como piridina o trietilamina, o las formadas a partir de bases inorgánicas tales como hidruros, hidróxidos, o carbonatos de sodio, litio, calcio, magnesio o bario, cuando los compuestos de la fórmula general (I)

20 tienen un elemento estructural adecuado para esta formación de sal.

Se conocen procedimientos de síntesis para la preparación de N-óxidos heterocíclicos y t-aminas. Pueden ser obtenidos con peroxiácidos (por ejemplo, ácido peracético y ácido meta-cloro-perbenzoico (MCPBA), peróxido de hidrógeno), hidroperóxidos de alquilo (por ejemplo, hidroperóxido de t-butilo), perborato de sodio y dioxiranos (por ejemplo dimetildioxirano). Estos procedimientos son, por ejemplo, de T. L. Gilchrist en *Comprehensive Organic*

25 *Synthesis*, Vol 7, pp 748-750, 1992, S. V. Ley, (Ed.), Pergamon Press. M. Tisler B. Stanovnik en *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, Vol 3, pp 18-20, 1984, A. J. Boulton, A. McKillop (Eds.), Pergamon Press. M. R. Grimmett B. R. T. Keene en *Advances in Heterocyclic Chemistry*, Vol 43, pp 149-163, 1988, A. R. Katritzky (Ed.), Academic Press. . M. Tisler B. Stanovnik en *Advances in Heterocyclic Chemistry*, Vol 9, pp 285-291, 1968, A. R. Katritzky, A. J. Boulton, Academic Press (Ed.); descrito G. W. H. Cheeseman, E. S. G. Werstiuk en *Advances in Heterocyclic*

30 *Chemistry*, Vol. 22, páginas 390-392, 1978, A. R. Katritzky, A. J. Boulton, (Eds.), Academic Press.

Sección experimental

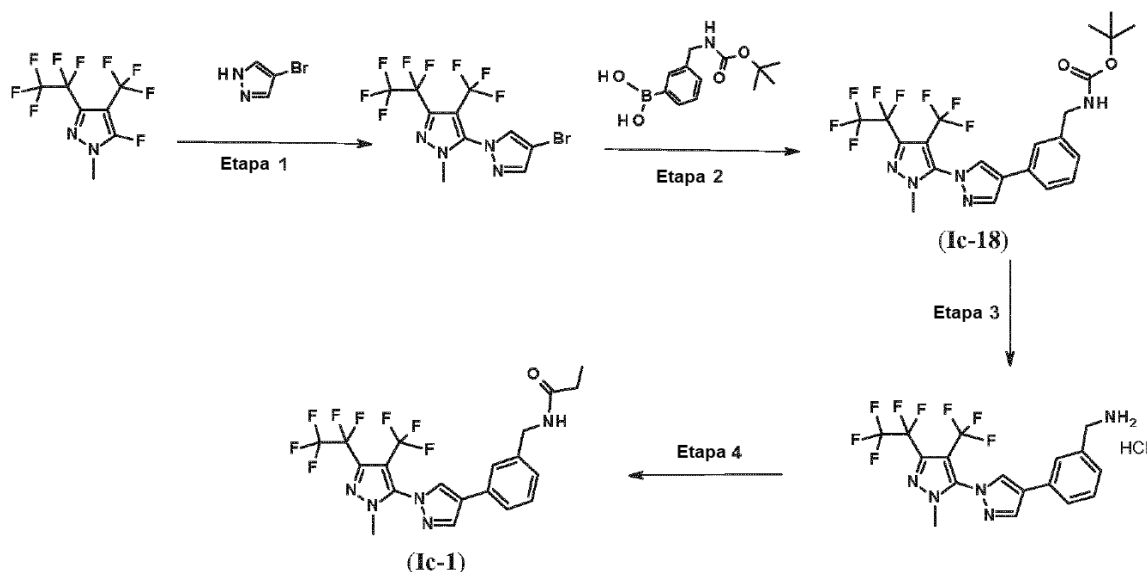
Procedimiento de preparación A

Preparación de N-{2-fluoro-5-[5'-(pentafluoroetil)-4'-(trifluorometil)-2'H-1,3'-bipirazol-4-il]bencil}propanamida (Ejemplo Ic-1) y tert-butil-{3-[2'-metil-5'-(pentafluoroetil)-4'-(trifluorometil)-2'H-1,3'-bipirazol-4-il]bencil}carbamato (Ejemplo Ic-18)

35

El esquema de reacción 5 muestra la síntesis de los compuestos (Ic-18) y (Ic-1) según la invención.

Esquema de reacción 5



Etapa 1: Síntesis de 4-bromo-2'-metil-5'-(pentafluoroetil)-4'-(trifluorometil)-2'H-1,3'-bipirazol

- 5 16,0 g (55,9 mmol) de 5-fluoro-1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol, 8,22 g (55,9 mmol) de 4-bromo-1H-pirazol y 15,5 g (112 mmol) de carbonato de potasio se suspenden en 250 ml de tetrahidrofurano. La mezcla de reacción se calienta a reflujo durante 16 h. Los componentes sólidos de la reacción se separan por filtración y se lavan con tetrahidrofurano. Las fases orgánicas combinadas se concentran en un evaporador rotatorio a presión reducida.

Esto da 23,0 g de 4-bromo-2'-metil-5'-(pentafluoroetil)-4'-(trifluorometil)-2'H-1,3'-bipirazol ¹H-RMN (400 MHz, d₆-DMSO) : δ = 8,58 (s, 1H); 8,16 (s, 1H); 3,32 (s, 3H);

- 10 HPLC-MS: logP^a) = 4,17

Etapa 2: Síntesis de tert-Butil-{3-[2'-metil-5'-(pentafluoroetil)-4'-(trifluorometil)-2'H-1,3'-bipirazol-4-il]bencil}carbamato (Ic-18)

- 15 500 mg (1,21 mmol) de 4-bromo-2'-metil-5'-(pentafluoroetil)-4'-(trifluorometil)-2'H-1,3'-bipirazol, 304 mg (1,21 mmol) de (3-[[tert-butoxicarbonil]amino]metil]fenil)borónico y 69,9 mg (0,06 mmol) de tetrakis(trifenilfosfina)paladio (0), se disolvieron en una mezcla de 10 ml de 2-propanol y 3,69 ml de solución de bicarbonato de sodio 1N. Las soluciones se desgasificaron por completo previamente. La mezcla de reacción se calienta a 90 °C bajo una atmósfera de gas protector durante 16 h. La mezcla de reacción se diluye con agua y se extrae varias veces con cloroformo. Las fases orgánicas combinadas se secan sobre sulfato de sodio, se filtran y el evaporador rotatorio se concentra a presión reducida. El producto en bruto se purifica en la fase RP.

- 20 Esto da 410 mg de tert-butil {3-[2'-metil-5'-(pentafluoroetil)-4'-(trifluorometil)-2'H-1,3'-bipirazol-4-il]bencil}carbamato de metilo (Ic-18).

¹H-RMN (400 MHz, d₆-DMSO) : δ = 8,68 (s, 1H); 8,44 (s, 1H); 7,64-7,19 (5H, m); 4,19 (m, 2H); 3,82 (s, 3H); 1,40 (s, 9H)

HPLC-MS: logP_a) = 4.74; Masa (m/z) = 540,1 [M + H]⁺

- 25 Etapa 3: Síntesis de 1-{3-[2'-metil-5'-(pentafluoroetil)-4'-(trifluorometil)-2'H-1,3'-bipirazol-4-il]fenil}metanamina clorhidrato (1:1)

400 mg (0,74 mmol) de tert-butil-{3-[2'-metil-5'-(pentafluoroetil)-4'-(trifluorometil)-2'H-1,3'-bipirazol-4-il]bencil}carbamato se disuelven en 5 ml de ácido clorhídrico 4N en dioxano y se agitan durante 1 h. El disolvente se elimina por evaporación rotatoria a presión reducida.

- 30 Esto da 410 mg de 1-{3-[2'-metil-5'-(pentafluoroetil)-4'-(trifluorometil)-2'H-1,3'-bipirazol-4-il]fenil}metanamina clorhidrato (1:1)

¹H-RMN (400 MHz, d₆-DMSO) : δ = 8,71 (s, 1H); 8,48 (s, 1H); 7,87-7,42 (m, 4H)

HPLC-MS: $\log P^a = 1,93$, masa (m/z) = 440,1 [M + H]⁺.

Etapa 4: Síntesis de N-{3-[2'-metil-5'-(pentafluoroetil)-4'-(trifluorometil)-2'H-1,3'-bipirazol-4-il]bencil}propanamida (Ic -1)

133 mg (0,32 mmol) de 1-{3-[2'-metil-5 (trifluorometil)-2'H-1,3'-bipirazol-4-il]-fenil}metanamina y 0,13 ml de N,N-dietil-N-isopropilamina se disuelven en 3 ml de cloroformo y luego se añadieron 29 μ l (0,35 mmol) de cloruro de propionilo. Después de 1 hora, se agrega solución de hidrogenofosfato de sodio al 5 % a la mezcla de reacción. La fase acuosa se extrae varias veces con cloroformo. Las fases orgánicas combinadas se secan sobre sulfato de sodio, se filtran y se concentran bajo presión reducida en un evaporador rotatorio. El producto en bruto se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice.

Esto da 40 mg de N-{3-[2'-metil-5'-(pentafluoroetil)-4'-(trifluorometil)-2'H-1,3'-bipirazol-4-il]bencil}propanamida (Ic -1)

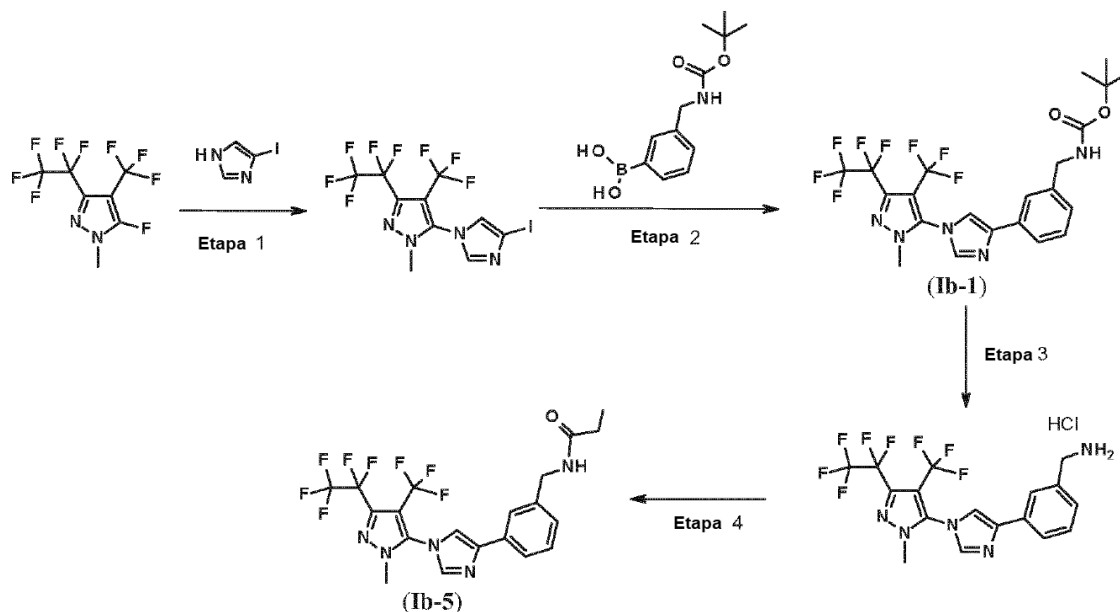
¹H-RMN véanse datos de RMN en la lista de picos

HPLC-MS: $\log P^a = 3,59$, masa (m/z) = 496,1 [M + H]⁺.

Preparación de N-(3-{1-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1H-imidazol-4-il}bencil)propanamida (Ib-5) y tert-butil-(3-{1-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1H-imidazol-4-il}bencil)carbamato (Ib-1)

El esquema de reacción 6 muestra la síntesis de los compuestos (Ib-5) y (Ib-1) según la invención.

Esquema de reacción 6



Etapa 1: Síntesis de 5-(4-yodo-1H-imidazol-1-il)-1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol

7,0 g (24,5 mmol) de 5-fluoro-1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol, 4,75 g (24,5 mmol) de 4-yodo-1H-imidazol y 6,76 g (48,9 mmol) de carbonato de potasio se suspenden en 100 ml de tetrahidrofurano. La mezcla de reacción se calentó a reflujo durante 16 h. Los componentes sólidos se separan por filtración y se lavan con tetrahidrofurano. El disolvente se concentra bajo presión reducida en un evaporador rotatorio. El producto en bruto se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice. Se obtienen 8,73 g de 5-(4-yodo-1H-imidazol-1-il)-1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol.

¹H-RMN (400 MHz, d₆-DMSO): $\delta = 8,073$ (s, 1H); 7,86 (s, 1H); 3,73 (s, 3H);

HPLC-MS: $\log P^a = 3,47$ masa (m/z) = 460,8; 461,8 [M + H]⁺.

Etapa 2: Síntesis de tert-butil-(3-{1-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1H-imidazol-4-il}bencil)carbamato (Ib-1)

5 2,00 g (4,35 mmol) de 5-(4-yodo-1H-imidazol-1-il)-1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol, 1,09 g (4,35 mmol) de ácido (3-[[tert-butoxicarbonil]amino]metil}fenil)borónico y 251 mg (0,22 mmol) de tetrakis(trifenilfosfina)paladio (0) se disuelven en una mezcla de 40 ml de 2-propanol y 13 ml de solución acuosa de bicarbonato de sodio 1N. Los disolventes se desgasificaron por completo previamente. La solución de reacción se calienta a 90 °C bajo atmósfera de gas protector durante 16 h. Después del final de la reacción, se agregan agua y cloroformo a la mezcla de reacción. La fase orgánica se extrae con cloroformo. Las fases orgánicas combinadas se concentran luego en un evaporador rotatorio a presión reducida. El producto en bruto luego se purifica en la fase RP.

Esto da 1,43 g de tert-butil-(3-{1-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1H-imidazol-4-il}bencil)carbamato (Ib-1)

10 ¹H-RMN (400 MHz, d₆-DMSO): δ = 8,17 (s, 1H); 8,06 (s, 1H); 7,72 (s, 1H); 7,65 (d, 1H); 7,55 (t, 1H); 7,45 (t, 1H); 7,25 (d, 1H); 4,17 (d, 2H); 3,78 (s, 3H); 1,40 (s, 9H)

HPLC-MS: logP^{a)} = 4,21; Masa (m/z) = 540,1 [M + H]⁺.

Etapa 3: Síntesis de 1-(3-{1-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1H-imidazol-4-il}fenil)metanamina clorhidrato

15 600 mg (1,11 mmol) de tert-butilo (3-{1-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1H-imidazol-4-il}bencil)carbamato se disuelven en 8,34 ml de ácido clorhídrico 4N en dioxano y se agita durante 1 h. El disolvente se elimina por evaporación rotatoria a presión reducida.

Se obtienen 650 mg de producto crudo, que se utiliza en las reacciones adicionales sin más purificación.

HPLC-MS: logP^{a)} = 1,83, masa (m/z) = 440,1 [M + H-Cl]⁺.

20 Etapa 4: Síntesis de N-(3-{1-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1H-imidazol-4-il}bencil)propanamida (Ib-5)

25 216 mg (0,45 mmol) de 1-(3-{1-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1H-imidazol-4-il}fenil)metanamina clorhidrato y 190 l (1,1 mmol) de N,N-dietil-N-isopropilamina se disuelven en cloroformo y después se añadieron 46 mg (0,5 mmol) de cloruro de propionilo. Se agregó una cantidad catalítica de 4-(dimetilamino)-piridina. Después de 1 hora, se agrega solución de hidrogenofosfato de sodio al 5 % a la mezcla de reacción. La fase acuosa se extrae varias veces con cloroformo. Las fases orgánicas combinadas se secan sobre sulfato de sodio, se filtran y se concentran bajo presión reducida en un evaporador rotatorio. El producto en bruto se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice.

30 Esto da 70 mg de N-(3-{1-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1H-imidazol-4-il}bencil)propanamida (Ib-5)

¹H-RMN véanse datos de RMN en la lista de picos

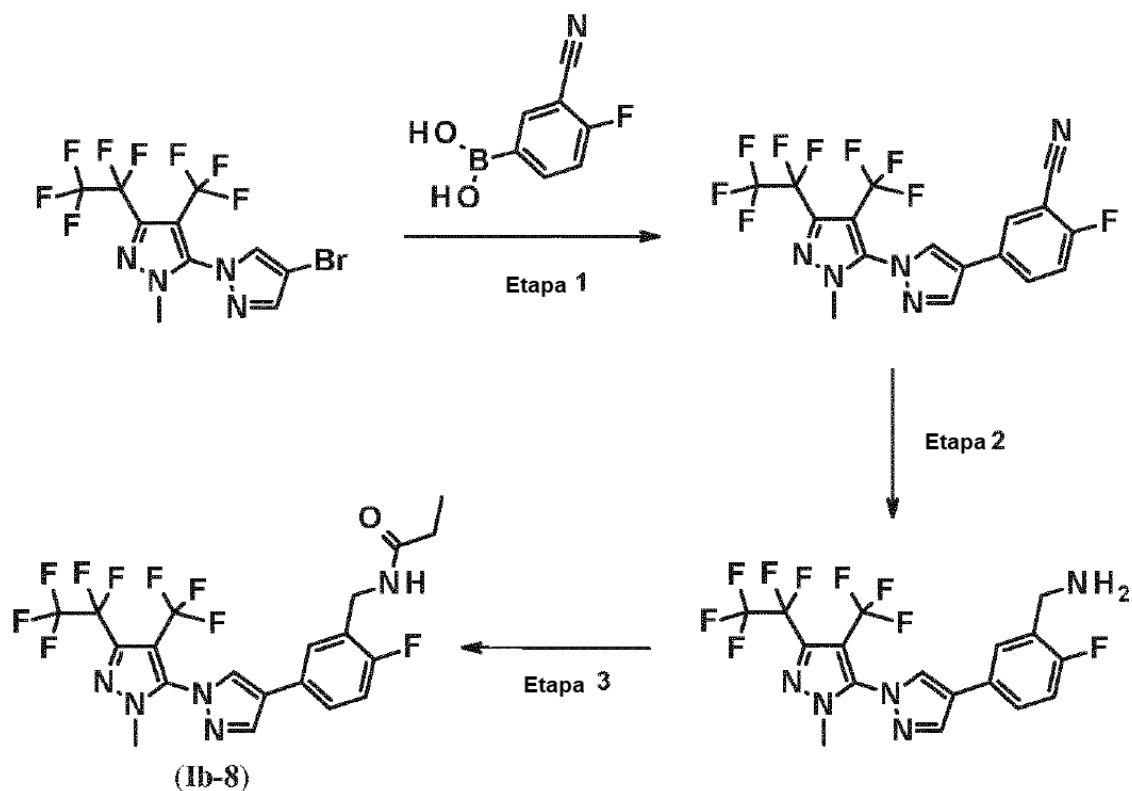
HPLC-MS: logP^{a)} = 3,14, masa (m/z) = 496,1 [M + H]⁺.

Procedimiento de preparación B

35 Preparación de N-{2-fluoro-5-[2'-metil-5'-(pentafluoroetil)-4'-(trifluorometil)-2'H-1,3'-bipirazol-4-il]bencil}propanamida (Ib-8)

El esquema de reacción 7 muestra la síntesis del compuesto (Ib-8) según la invención.

Esquema de reacción 7



Etapa 1: Síntesis de 2-fluoro-5-[2'-metil-5'-(pentafluoroetil)-4'-(trifluorometil)-2'H-1,3'-bipirazol-4-il]benzonitrilo

4,00 g (10 mmol) de 4-bromo-2'-metil-5'-(pentafluoroetil)-4'-(trifluorometil)-2'H-1,3'-bipirazol, 1,60 g (10 mmol) de ácido 3-ciano-4-fluorofenilborónico y 0,56 g (0,2 mmol) de tetrakis(trifenilfosfina)paladio(0) se disuelven en una mezcla de 80ml de 2-propanol y 30 ml de solución de bicarbonato sódico acuoso 1 N. Los disolventes se desgasificaron por completo previamente. La solución de reacción se calienta a 85 °C bajo una atmósfera de gas protector durante 5 h. Después del final de la reacción, se agregan agua y cloroformo a la mezcla de reacción. La fase orgánica se extrae con cloroformo. Las fases orgánicas combinadas se concentran luego en un evaporador rotatorio a presión reducida. El producto en bruto luego se purifica en la fase RP.

Esto da 3,31 g de 2-fluoro-5-[2'-metil-5'-(pentafluoroetil)-4'-(trifluorometil)-2'H-1,3'-bipirazol-4-il]benzonitrilo.

$^1\text{H-RMN}$ (400 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 8,83 (s, 1H); 8,60 (s, 1H); 8,37 (dd, 1H); 8,14-8,12 (m, 1H); 7,67-7,61 (m, 1H); 3,83 (s, 3H)

HPLC-MS: $\log P^{\text{a}}$ = 4.37, masa (m/z) = 454,0 $[\text{M} + \text{H}]^+$.

Etapa 2: Síntesis de 1-{2-fluoro-5-[5'-(pentafluoroetil)-4'-(trifluorometil)-2'H-1,3'-bipirazol-4-il]fenil}metanamina

4,60 g (10 mmol) de 2-fluoro-5-[2'-metil-5'-(pentafluoroetil)-4'-(trifluorometil)-2'H-1,3'-bipirazol 4-il]benzonitrilo se disuelven en 120 ml de metanol. La solución se enfría a 0 °C y luego se agregan 13 mg (0,1 mmol) de cloruro de níquel (II) x 6H₂O. Se agregan 768 mg (20 mmol) de borohidruro de sodio a la mezcla en pequeñas porciones. Después de la última adición, la mezcla de reacción se calienta lentamente a temperatura ambiente. Después de 1 h a temperatura ambiente, 4 mg (0,03 mmol) de níquel (II) cloruro de x 6H₂O y 220 mg (5,7 mmol) de borohidruro de sodio se añade de nuevo a la mezcla de reacción. La mezcla de reacción se agita durante una hora más a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se diluye luego con agua. La mezcla de reacción se extrae tres veces con cloroformo. Las fases orgánicas combinadas se secan sobre sulfato de sodio, se filtran y luego se concentran en un evaporador rotatorio a presión reducida. El residuo se purifica en la fase RP.

Se obtuvieron 1,25 g de 1-{2-fluoro-5-[5'-(pentafluoroetil)-4'-(trifluorometil)-2'H-1,3'-bipirazol-4-il]fenil}metanamina.

$^1\text{H-RMN}$ (400 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 8,68 (s, 1H); 8,45 (s, 1H); 7,83 (dd, 1H); 7,60-7,56 (m, 1H); 7,20 (t, 1H); 3,82 (s, 3H); 3,78 (s, 2H); 1,83 (s, 2H)

HPLC-MS: \log^{Pa} = 1,90, masa (m/z) = 458,0 [M + H-HCl]⁺.

Etapas 3: Síntesis de N-{2-fluoro-5-[5'-(pentafluoroetil)-4'-(trifluorometil)-2'H-1,3'-bipirazol-4-il]fenil}metanamina (Ib-8)

250 mg (0,55 mmol) de 1-{2-fluoro-5-[5'-(pentafluoroetil)-4'-(trifluorometil)-2'H-1,3'-bipirazol-4-il]fenil}metanamina y 0,23 ml (1,31 mmol) de N,N-dietil-N-isopropilamina se disuelven en 3 ml de cloroformo y se añaden 52 μ l (0,61 mmol) de cloruro de propionilo. Después de 1 hora, se agrega solución de hidrogenofosfato de sodio al 5 % a la mezcla de reacción. La fase acuosa se extrae varias veces con cloroformo. Las fases orgánicas combinadas se secan sobre sulfato de sodio, se filtran y se concentran bajo presión reducida en un evaporador rotatorio. El producto en bruto se purifica mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice. Después de la extracción y evaporación, el residuo obtenido se purificó mediante cromatografía instantánea en gel de sílice con ciclohexano y acetato de etilo como eluyentes. Esto proporcionó 100 mg (32 %) del compuesto del título.

Se obtienen 100 mg de N-{2-fluoro-5-[5'-(pentafluoroetil)-4'-(trifluorometil)-2'H-1,3'-bipirazol-4-il]bencil}propanamida (Ib-8).

¹H-RMN véanse datos de RMN en la lista de picos

HPLC-MS: \log^{Pa} = 3,27, masa (m/z) = 514,0 [M + H]⁺.

a) Comentarios acerca de la determinación de los valores de log P y detección de masas: La determinación de los valores de log P especificados se realizó de acuerdo con la Directiva CEE 79/831 anexo V.A8 mediante HPLC (cromatografía líquida de alto rendimiento) en una columna de fase reversa (C₁₈). Agilent 1100 LC System; 50 * 4.6 Zorbax Eclipse Plus C18 1.8 microm; eluyente A: acetonitrilo (ácido fórmico al 0,1 %); eluyente B: agua (0,09 % de ácido fórmico); gradiente lineal de 10 % de acetonitrilo a 95 % de acetonitrilo en 4,25 min, luego 95 % de acetonitrilo durante 1,25 min más; temperatura del horno 55 °C; flujo: 2,0 ml/min. La detección de masas se realiza a través de un sistema Agilent MSD.

La masa indicada es el pico del patrón isotópico del ion [M + H]⁺ con la intensidad más alta; si se detecta el ión [M-H]; la indicación de masa se marca con². ²La masa indicada es el pico del patrón isotópico del ion [M-H] con la intensidad más alta.

Los compuestos enumerados en la Tabla 1 se prepararon de forma análoga a los procesos de preparación descritos anteriormente A, B y D.

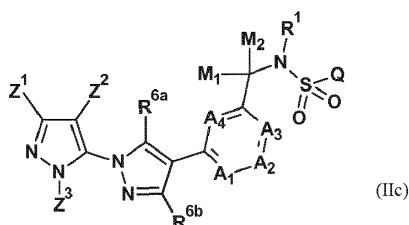


Tabla 1

Ej.- No.	Z ¹	Z ²	Z ³	R ¹	R ^{6a}	R ^{6b}	A ₄	A ₃	A ₂	A ₁	M ₁	M ₂	Q	log ^{Pa}	Masa ^a
IIc-1	C ₂ F ₅	CF ₃	CH ₃	H	H	H	C-H	C-F	C-H	C-H	H	H	ciclopentilo	4,37	590,1
IIc-2	C ₂ F ₅	CF ₃	CH ₃	H	H	H	C-H	C-F	C-H	C-H	H	H	propan-2-ilo	4,06	564,0
IIc-3	C ₂ F ₅	CF ₃	CH ₃	H	H	H	C-H	C-F	C-H	C-H	H	H	etilo	3,85	550,1
IIc-4	C ₂ F ₅	CF ₃	CH ₃	H	H	H	C-H	C-F	C-H	C-H	H	H	CH ₃	3,58	536,100

^a) el procedimiento siguiente para determinar el registro de los valores de P y la masa se utilizó a menos que se indique otra cosa: La determinación de los valores de log P especificados en conformidad con la Directiva CEE 79/831 anexo V.A8 mediante HPLC (cromatografía líquida de alto rendimiento) en una columna de fase reversa (C₁₈). Agilent 1100 LC System; 50 * 4.6 Zorbax Eclipse Plus C18 1,8 microm; Eluyente A: acetonitrilo (ácido fórmico al 0,1 %); Eluyente B: agua (0,09 % de ácido fórmico); gradiente lineal de 10 % de acetonitrilo a 95 % de acetonitrilo

ES 2 649 473 T3

Ej.- No.	Z ¹	Z ²	Z ³	R ¹	R ^{6a}	R ^{6b}	A ₄	A ₃	A ₂	A ₁	M ₁	M ₂	Q	log ^{Pa}	Masa ^a
<p>en 4,25 min, luego 95 % de acetonitrilo durante 1,25 min más; Temperatura del horno 55 °C; Flujo: 2,0 ml/min. La detección de masas se realiza a través de un sistema Agilent MSD.</p> <p>^b) Nota sobre el procedimiento alternativo para determinar los valores de log P y masas: La determinación de los valores de log P especificados en conformidad con la Directiva CEE 79/831Annex V.A8 por HPLC (Cromatografía líquida de alto rendimiento) en una columna de fase reversa (C18). Sistema Waters ACQUITY UPLC-MS; 2,1 * 50mm Zorbax Eclipse Plus C18 1,8µm 600 bar; volumen de inyección: 0,5µl aproximadamente 1000 ppm; Eluyente A: acetonitrilo (ácido fórmico al 0,1 %); eluyente B: agua (0,085 % de ácido fórmico); gradiente lineal de 10 % de acetonitrilo a 95 % de acetonitrilo en 1,5 min, luego 95 % de acetonitrilo durante 0,5 min más; Temperatura del horno 60 °C; Flujo: 1,0 ml/min. La detección de masas se realiza a través de un sistema Waters SQD.</p>															

La masa indicada es el pico del patrón isotópico del ion [M + H]⁺ con la intensidad más alta; si se detecta el ión [M-H]⁻, la especificación de masa se marca con². ² La masa indicada es el pico del patrón isotópico del ion [M-H]⁻ con la intensidad más alta.

Datos de RMN de ejemplos seleccionados

- 5 Los datos de ¹H-RMN de los ejemplos seleccionados se registran en forma de listas de picos de ¹H-RMN. Para cada pico de señal, el valor δ en ppm y la intensidad de la señal aparecen entre paréntesis.

Ejemplo Ilc-1: ¹H-RMN(400,0 MHz, DMSO):

δ= 10,267(0,6); 8,853(0,4); 8,678(5,4); 8,584(0,5); 8,424(5,7); 8,415(0,6); 8,316(0,4); 7,774(1,4); 7,768(1,5); 7,756(1,4); 7,750(1,3); 7,690(0,9); 7,684(0,9); 7,678(1,0); 7,670(1,2); 7,663(1,0); 7,657(1,0); 7,651(0,8); 7,620(0,9); 7,605(2,0); 7,590(1,0); 7,303(1,5); 7,279(1,9); 7,257(1,4); 5,756(0,5); 4,260(3,4); 4,245(3,3); 3,829(1,6); 3,813(16,0); 3,537(1,1); 3,518(1,7); 3,498(1,2); 3,479(0,3); 3,325(114,5); 2,675(0,6); 2,671(0,9); 2,666(0,7); 2,541(0,5); 2,511(51,6); 2,506(101,6); 2,502(132,7); 2,497(96,4); 2,493(46,9); 2,333(0,7); 2,329(0,9); 2,324(0,7); 1,887(1,5); 1,871(6,3); 1,853(4,1); 1,836(1,8); 1,664(0,9); 1,657(1,3); 1,646(1,7); 1,628(1,3); 1,614(0,4); 1,603(0,5); 1,576(0,6); 1,570(0,5); 1,564(0,5); 1,551(1,5); 1,544(0,9); 1,533(1,6); 1,520(1,2); 1,513(0,7); 1,504(0,5); 1,235(1,5); 1,218(1,3); 0,146(0,7); 0,008(6,7); 0,000(165,4); -0,009(6,3); -0,150(0,8)

Ejemplo Ilc-2: ¹H-RMN(400,0 MHz, DMSO):

δ=8,687(0,4); 8,676(4,6); 8,430(0,5); 8,419(5,0); 8,315(0,5); 7,777(1,1); 7,772(1,2); 7,760(1,1); 7,754(1,2); 7,689(0,7); 7,683(0,7); 7,677(0,8); 7,668(0,9); 7,662(0,8); 7,656(0,8); 7,650(0,7); 7,607(0,9); 7,592(1,7); 7,577(0,8); 7,302(1,3); 7,281(1,5); 7,278(1,6); 7,256(1,2); 4,256(2,9); 4,241(3,0); 3,813(12,7); 3,325(147,5); 3,294(0,3); 3,201(0,4); 3,184(1,1); 3,167(1,6); 3,150(1,2); 3,133(0,4); 2,676(0,5); 2,671(0,7); 2,666(0,5); 2,524(2,0); 2,511(43,1); 2,507(86,0); 2,502(112,8); 2,497(81,9); 2,493(39,9); 2,333(0,6); 2,329(0,8); 2,324(0,6); 1,236(16,0); 1,219(15,7); 0,915(0,6); 0,146(0,6); 0,008(5,9); 0,000(145,5); -0,009(5,8); -0,150(0,6)

Ejemplo Ilc-3: ¹H-RMN(400,0 MHz, DMSO):

δ= 8,690(5,9); 8,677(0,6); 8,433(6,8); 7,775(1,4); 7,770(1,6); 7,757(1,4); 7,752(1,5); 7,695(0,9); 7,689(0,8); 7,683(1,0); 7,674(1,2); 7,668(1,0); 7,661(1,0); 7,656(0,9); 7,637(1,1); 7,621(2,2); 7,606(1,1); 7,308(1,7); 7,286(1,9); 7,284(2,0); 7,262(1,5); 5,757(2,1); 4,235(3,9):

4,220(3,9); 3,814(16,0); 3,328(77,6); 3,042(1,5); 3,024(4,8); 3,006(4,9); 2,987(1,6); 2,671(0,4); 2,667(0,3); 2,524(1,3); 2,511(27,4); 2,507(53,8); 2,502(69,7); 2,498(50,0); 2,333(0,3); 2,329(0,4); 1,235(0,4); 1,204(5,2); 1,185(11,0); 1,167(4,9); 0,146(0,4); 0,008(3,2); 0,000(81,8); -0,009(3,3); -0,150(0,4)

Ejemplo Ilc-4: ¹H-RMN(400,0 MHz, DMSO):

δ= 8,701(3,0); 8,442(3,3); 7,765(0,7); 7,760(0,8); 7,748(0,7); 7,743(0,8); 7,696(0,4); 7,690(0,4); 7,684(0,5); 7,676(0,6); 7,669(0,5); 7,663(0,5); 7,657(0,4); 7,596(0,5); 7,580(1,1); 7,566(0,5); 7,312(0,8); 7,290(1,0); 7,288(1,0); 7,266(0,8); 4,254(2,0); 4,238(2,0); 3,813(7,9); 3,400(0,4); 3,328(164,6); 2,936(11,0); 2,675(0,5); 2,671(0,6); 2,667(0,5); 2,506(79,9); 2,502(103,3); 2,497(75,0); 2,333(0,5); 2,329(0,7); 2,324(0,5); 2,086(1,8); 1,398(16,0); 1,141(0,6); 1,125(0,4); 0,000(0,4)

La intensidad de las señales agudas se correlaciona con la altura de las señales en un ejemplo impreso de un espectro de RMN en cm y muestra las relaciones reales de las intensidades de la señal. Para señales amplias, se pueden mostrar múltiples picos o el centro de la señal y su intensidad relativa en comparación con la señal más intensa del espectro.

- 5 Las listas de los picos de ¹H-RMN son similares a las impresiones de ¹H-RMN clásicas y, por lo tanto, contienen habitualmente todos los picos que se enumeran en una interpretación clásica de RMN.

Además, pueden mostrar señales de disolvente, señales estereoisoméricas de los compuestos objetivo que también son objeto de la invención, y/o picos de impurezas, como las impresiones de ¹H-RMN clásicas.

- 10 Cuando se especifican señales compuestas en el rango delta de disolventes y/o agua, los picos habituales del disolvente, por ejemplo, picos de DMSO en DMSO-d₆ y el pico de agua, se muestran en nuestras listas de picos de ¹H RMN, que generalmente tienen en promedio una intensidad alta.

Los picos de los estereoisómeros de los compuestos diana y/o picos de impurezas normalmente tienen, en promedio, una intensidad menor que el pico de los compuestos diana (por ejemplo, con una pureza > 90 %).

- 15 Dichos estereoisómeros y/o impurezas pueden ser típicos del proceso de producción respectivo. Sus picos pueden ayudar a reconocer la reproducción de nuestro proceso de fabricación mediante "impresiones digitales de subproductos".

- 20 Un especialista que calcula los picos de los compuestos objetivo usando procedimientos conocidos (MestreC, simulación ACD, pero también con valores de expectativa evaluados empíricamente) puede, según sea necesario, aislar los picos de los compuestos objetivo, dado el caso usando filtros de intensidad adicionales. Este aislamiento sería similar a la recolección de picos en la interpretación clásica de ¹H-RMN.

Realizaciones biológicas para usos en el campo de la sanidad animal y la protección de las plantas.

Prueba de inyección de Boophilus microplus (BOOPMI Inj)

Disolvente: Dimetilsulfóxido

Para obtener una preparación adecuada del compuesto activo, se mezclan 10 mg de compuesto activo con 0,5 ml de disolvente y el concentrado se diluye con disolvente hasta la concentración deseada.

- 25 Se inyecta 1 µl de la solución de ingrediente activo en el abdomen de 5 garrapatas de bovino adulto hembra (Boophilus microplus). Los animales se transfieren a las placas y se mantienen en un recinto con aire acondicionado.

- 30 El control de la actividad se lleva a cabo después de 7 días en el depósito de huevos fértiles. Los huevos, cuya fertilidad no es visible externamente, se mantienen en el gabinete climático hasta que las larvas resbalan después de 42 días. Un efecto del 100 % significa que ninguna de las garrapatas ha puesto huevos fértiles, 0 % significa que todos los huevos son fértiles.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación tienen un efecto del 100 % a una velocidad de aplicación de 20 µg/animal: Ilc-3, Ilc-4

Ctenocephalides felis - Oraltest (CTECFE)

Disolvente: Dimetilsulfóxido

- 35 Para la obtención de una preparación adecuada de compuesto activo, se mezclan 10 mg de compuesto activo con 0,5 ml de dimetilsulfóxido. La concentración deseada se obtiene diluyendo con sangre bovina citrada.

Aproximadamente 20 pulgas de gato adulto en ayunas (Ctenocephalides felis) se colocan en una cámara que está cerrada en la parte superior e inferior con una gasa. Se coloca un cilindro de metal en la cámara, cuyo fondo se cierra con parafilm. El cilindro contiene la preparación del fármaco en sangre, que puede ser absorbida por las pulgas a través de la membrana de parafilm.

- 40 Después de 2 días, la mortandad se determina en %. 100 % significa que todas las pulgas han sido eliminadas; 0 % significa que ninguna de las pulgas ha sido eliminada.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación tienen un efecto del 100 % a una velocidad de aplicación de 100 ppm: Ilc-4

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación tienen un efecto del 95 % a una velocidad de aplicación de 100 ppm: Ilc-3

Lucilia cuprina - Prueba (LUCICU)

Disolvente: Dimetilsulfóxido

5 Para obtener una preparación adecuada de compuesto activo, se mezclan 10 mg de compuesto activo con 0,5 ml de dimetilsulfóxido y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Se transfieren cerca de 20 larvas L1 de la mosca de oro de oveja australiana (*Lucilia cuprina*) a un recipiente de prueba que contiene carne de caballo picada y a la preparación del ingrediente activo de la concentración deseada.

Después de 2 días, la mortandad se determina en %. 100 % significa que todas las larvas han sido eliminadas; 0 % significa que no se ha matado ninguna larva.

10 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación tienen un efecto del 100 % a una tasa de aplicación de 100 ppm: Ilc-3, Ilc-4

Prueba de Musca domestica (MUSCDO)

Disolvente: Dimetilsulfóxido

Para obtener una preparación adecuada de compuesto activo, se mezclan 10 mg de compuesto activo con 0,5 ml de dimetilsulfóxido y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

15 Los recipientes que contienen una esponja que ha sido tratada con solución de azúcar y la preparación del compuesto activo de la concentración deseada se llenan con 10 moscas adultas (*Musca domestica*).

Después de 2 días, la mortandad se determina en %. 100 % significa que todas las moscas han sido eliminadas; 0 % significa que no se ha matado ninguna de las moscas.

20 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación tienen un efecto del 100 % a una velocidad de aplicación de 100 ppm: Ilc-4

Prueba de Meloidogyne incognita (MELGIN)

Disolvente: 125,0 Partes de acetona

Para obtener una preparación adecuada de compuesto activo, se mezcla 1 parte en peso de compuesto activo con la cantidad indicada de disolvente y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

25 Los recipientes se llenan con arena, solución de ingrediente activo, una suspensión de larvas de huevo de nudo de raíz del sur (*Meloidogyne incognita*) y semillas de ensalada. Se desarrollan los gérmenes de semillas de ensalada y las plántulas. Se desarrollan nudos en las raíces.

30 Después de 14 días, el efecto nematocida se determina mediante la formación de nudos en %. 100 % significa que no se encontraron nudos; 0 % significa que el número de nudos en las plantas tratadas corresponde al control no tratado.

En esta prueba, Los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación tienen un efecto del 90 % a una tasa de aplicación de 20 ppm: Ilc-3, Ilc-4

Myzus persicae - ensayo de pulverización (MYZJPE)

Disolvente: 78 partes de acetona

1,5 partes de Dimetilformamida

Emulgente: alquilarilpoliglicoléter

Para obtener una preparación adecuada del compuesto activo, se disuelve 1 parte en peso de compuesto activo con los componentes del disolvente proporcionados, y la mezcla se llena con agua que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm hasta que se alcanza la concentración deseada. Para preparar más concentraciones de prueba, se diluye con agua que contiene emulsionante.

- 5 Discos de la hoja de Col china (*Brassica pekinensis*) que están infestados con todas las etapas del pulgón de durazno verde (*Myzus persicae*) se inyectan con una preparación de ingrediente activo de la concentración deseada.

Después de 6 días, se determina el efecto en %. 100 % significa que todos los áfidos han sido eliminados; 0 % significa que no se han eliminado áfidos.

- 10 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación tienen un efecto del 90 % a una tasa de aplicación de 100 g/ha: Ilc-3

Phaedon cochleariae - ensayo de rociado (PHAECO)

Disolvente: 78,0 Partes de acetona
1,5 Partes de dimetilformamida

Emulgente: alquilarilpoliglicoléter

- 15 Para obtener una preparación adecuada del compuesto activo, se disuelven 1 parte en peso de compuesto activo con las partes indicadas en peso de disolvente y la mezcla se llena con agua que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm hasta que se alcanza la concentración deseada. Para preparar más concentraciones de prueba, se diluye con agua que contiene emulsionante.

Se inyectan hojas de col china (*Brassica pekinensis*) con una preparación de compuesto activo de la concentración deseada y, después del secado, se llenan con larvas del escarabajo del rábano picante (*Phaedon cochleariae*).

Después de 7 días, se determina el efecto en %. 100 % significa que todas las larvas de escarabajos han sido eliminadas; 0 % significa que no se ha matado ninguna larva de escarabajo.

- 20 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación tienen un efecto del 100 % con una tasa de aplicación de 100 g/ha: Ilc-1, Ilc-2, Ilc-3, Ilc-4

Tetranychus urticae - ensayo de pulverización, resistente a OP (TETRUR)

Disolvente: 78,0 Partes de acetona
1,5 Partes de dimetilformamida

Emulgente: alquilarilpoliglicoléter

- 25 Para obtener una preparación adecuada del compuesto activo, se disuelven 1 parte en peso de compuesto activo con las partes indicadas en peso de disolvente y la mezcla se completa con agua que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm hasta que se alcanza la concentración deseada. Para preparar más concentraciones de prueba, diluya con agua que contiene emulsionante.

Discos de hojas de frijol (*Phaseolus vulgaris*) que están infestados con todas las etapas del ácaro araña común (*Tetranychus urticae*) se inyectan con una preparación de compuesto activo de la concentración deseada.

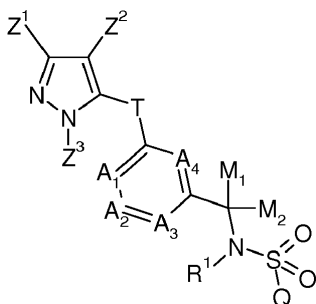
- 30 Después de 6 días, se determina el efecto en %. 100 % significa que todos los ácaros araña han sido eliminados; 0 % significa que no se ha matado ningún ácaro araña.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación tienen un efecto del 100 % a una tasa de aplicación de 100 g/ha: Ilc-2, Ilc-3, Ilc-4

- 35 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación tienen un efecto del 90 % a una tasa de aplicación de 100 g/ha: Ilc-1

REIVINDICACIONES

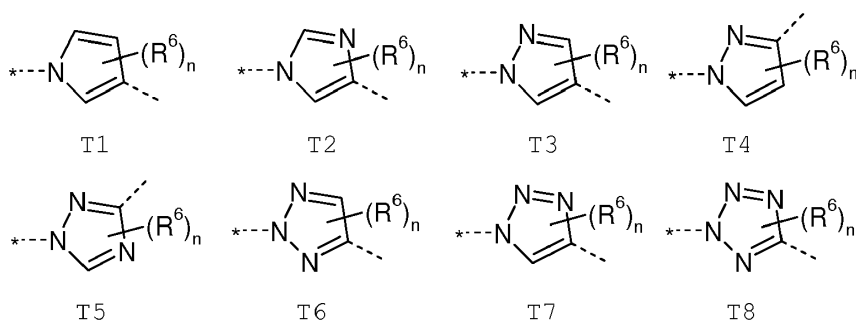
1. Compuestos de la fórmula general (II)



(II)

en la cual

- 5 R^1 representa hidrógeno y alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_3-C_6 , alquinilo C_3-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , alquilcarbonilo C_1-C_6 , alcocarbonilo C_1-C_6 , aril- (C_1-C_3) alquilo, heteroaril- (C_1-C_3) -alquilo, dado el caso sustituidos,
- M^1 y M^2 , cada uno independientemente uno del otro, representan hidrógeno, ciano o representan alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_1-C_6 , alcocarbonilo C_1-C_6 dado el caso mono- o polisustituidos o
- 10 M^1 y M^2 con el átomo de carbono al que están unidos forman un anillo de 3, 4, 5 o 6 miembros dado el caso sustituido que dado el caso contiene 0, 1 o 2 átomos de nitrógeno y/o 0, 1 o 2 átomos de oxígeno y/o 0, 1 o 2 átomos de azufre,
- los grupos químicos
- A_1 representa CR^2 o nitrógeno,
- A_2 representa CR^3 o nitrógeno,
- 15 A_3 representa CR^4 o nitrógeno y
- A_4 representa CR^5 o nitrógeno
- pero donde no más de tres de los grupos químicos A_1 a A_4 representan simultáneamente nitrógeno;
- R^2 , R^3 , R^4 y R^5 independientemente uno de otro representan hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, y alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , N-alcoxi C_1-C_6 -imino- alquilo C_1-C_3 , alquilsulfanilo C_1-C_6 , alquilsulfinilo C_1-C_6 , alquilsulfonilo C_1-C_6 , N-alquilamino C_1-C_6 o N,N-di-alquilamino C_1-C_6 , dado el caso sustituidos,
- 20 si ninguno de los grupos A_2 y A_3 representa nitrógeno, R^3 y R^4 junto con el átomo de carbono al que están unidos pueden formar un anillo de 5 o 6 miembros que contiene 0, 1 o 2 átomos de nitrógeno y/o 0 o 1 oxígeno átomo y/o 0 o 1 átomo de azufre, o
- si ninguno de los grupos A_1 y A_2 representa nitrógeno, R^2 y R^3 junto con el átomo de carbono al que están unidos pueden formar un anillo de 6 miembros que contiene 0, 1 o 2 átomos de nitrógeno;
- 25 W representa oxígeno o azufre;
- Q representa hidrógeno, hidroxilo, amino o uno de los grupos dado el caso sustituidos alquilo, alcoxi, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, cicloalquilalquilo, arilalquilo, heteroarilalquilo o representa un agrupamiento de N-alquilamino, N-alquilcarbonilamino, N,N-dialquilamino; o
- 30 Q representa un carbocíclico de 6 miembros insaturado que está dado el caso mono- o polisustituido con V o un anillo heterocíclico de 5 o 6 miembros insaturado que está dado el caso mono- o polisustituido con V, en donde
- V independientemente uno de otro representan halógeno, ciano, nitro, y alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, alcoxi, N-alcoxiiminoalquilo, alquilsulfanilo, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, N,N-dialquilamino, dado el caso sustituidos,
- 35 T representa uno de los heteroaromáticos de 5 miembros T1-T8 enumerados a continuación, donde el enlace al grupo de la cabeza de pirazol está marcado con un asterisco,



en los que

- 5 R^6 independientemente uno del otro representan halógeno, ciano, nitro, amino o un alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , alquilcarbonilo C_1-C_6 , alquilsulfanilo C_1-C_6 , alquilsulfinilo C_1-C_6 , alquilsulfonilo dado el caso sustituidos, y

n representa los valores 0-2;

Z^1 representa alquilo y cicloalquilo dado el caso sustituidos, y

Z^2 representa hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, amino o un alquilo, alquilcarbonilo, alquilsulfanilo, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo dado el caso sustituidos, y

- 10 Z^3 representa hidrógeno o alquilo, cicloalquilo, alqueno, alquino, arilo o heteroalquilo dado el caso sustituidos.

2. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1 en los cuales

R^1 representa hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , alqueno C_3-C_6 , alquino C_3-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , alquilcarbonilo C_1-C_6 , alcocarbonilo C_1-C_6 , aril- (C_1-C_3) alquilo, heteroaril- (C_1-C_3) -alquilo dado el caso sustituidos,

- 15 M^1 y M^2 , cada uno independientemente uno del otro, representan hidrógeno, ciano o representan alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcocarbonilo C_1-C_6 , dado el caso mono- o polisustituidos, o

M^1 y M^2 con el átomo de carbono al que están unidos forman un anillo de 3, 4, 5 o 6 miembros dado el caso sustituido que dado el caso contiene 0, 1 o 2 átomos de nitrógeno y/o 0, 1 o 2 átomos de oxígeno y/o 0, 1 o 2 átomos de azufre,

los grupos químicos

- 20 A_1 representa CR^2 o nitrógeno,

A_2 representa CR^3 o nitrógeno,

A_3 representa CR^4 o nitrógeno y

A_4 representa CR^5 o nitrógeno

pero donde no más de tres de los grupos químicos A_1 a A_4 representan simultáneamente nitrógeno;

- 25 R^2 , R^3 , R^4 y R^5 independientemente uno de otro representan hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, y alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , N-alcoxi C_1-C_6 alcxiimo-alquilo C_1-C_3 , alquilsulfanilo C_1-C_6 , alquilsulfinilo C_1-C_6 , alquilsulfonilo C_1-C_6 , N-alquilamino C_1-C_6 o N,N-di-alquilamino C_1-C_6 , dado el caso sustituidos;

- 30 si ninguno de los grupos A_2 y A_3 representa nitrógeno, R^3 y R^4 junto con el átomo de carbono al que están unidos pueden formar un anillo de 5 o 6 miembros que contiene 0, 1 o 2 átomos de nitrógeno y/o 0 ó 1 átomos de oxígeno y/o 0 o 1 átomo de azufre, o

si ninguno de los grupos A_1 y A_2 representa nitrógeno, R^2 y R^3 junto con el átomo de carbono al que están unidos pueden formar un anillo de 6 miembros que contiene 0, 1 o 2 átomos de nitrógeno;

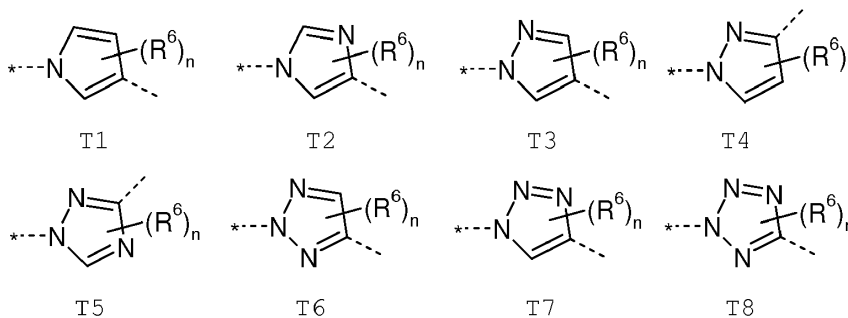
W representa oxígeno o azufre;

- 35 Q representa hidrógeno, formilo, hidroxilo, amino o uno de los grupos dado el caso sustituidos alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , heterocicloalquilo C_2-C_7 , alcoxi C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 -alquilo C_1-C_6 , aril- (C_1-C_3) -alquilo, heteroaril- (C_1-C_3) -alquilo o representa un grupo N-alquilamino- C_1-C_4 , N-alquilcarbonilamino C_1-C_4 , N,N-di-alquilamino C_1-C_4 ; o

Q representa un carbociclo de 6 miembros insaturado que está dado el caso mono- o polisustituido con V o un anillo heterocíclico de 5 o 6 miembros insaturado que está dado el caso mono- o polisustituido con V , donde

V independientemente uno del otro representan halógeno, ciano, nitro, y alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, N-alcoxi C₁-C₆ -iminoalquilo C₁-C₃, alquilsulfanilo C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, N,N-di- (alquilo C₁-C₆) amino, dado el caso sustituido;

5 T representa uno de los heteroaromáticos de 5 miembros T1-T8 enumerados a continuación, donde el enlace al grupo de la cabeza de pirazol está marcado con un asterisco,



en los que

10 R⁶ independientemente uno del otro representan halógeno, ciano, nitro, amino o un alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, alquilsulfanilo C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, alquilo C₁-C₆ sulfonilo dado el caso sustituidos con halógeno, y

n representa los valores 0-1;

Z¹ representa haloalquilo C₁-C₆, halocicloalquilo C₁-C₆, dado el caso sustituidos y

15 Z² representa hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, amino o un alquilo C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, alquilsulfanilo C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, dado el caso sustituidos, y

Z³ representa hidrógeno o alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₃-C₆, alquinilo C₃-C₆, arilo o heteroalquilo, dado el caso sustituidos.

3. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1 en los cuales

20 R¹ representa hidrógeno o alquilo C₁-C₆, alquenilo C₃-C₆, alquinilo C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₇, alquilcarbonilo C₁-C₆, alcoxicarbonilo C₁-C₆, aril(C₁-C₃)-alquilo, heteroaril(C₁-C₃)-alquilo que están dado el caso mono- a hepta sustituidos independientemente uno de otro con flúor, cloro, ciano, alcoxi C₁-C₆ y alcoxicarbonilo C₁-C₆

M¹ representa hidrógeno,

M² representa hidrógeno, ciano o alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxicarbonilo C₁-C₃ que están dado el caso mono- a pentasustituidos independientemente uno de otro con flúor, cloro, ciano o alcoxi C₁-C₆.

25 M¹ y M² con el átomo de carbono al que están unidos forman un anillo de 3 miembros dado el caso sustituido,

los grupos químicos

A₁ representa CR² o nitrógeno,

A₂ representa CR³ o nitrógeno,

A₃ representa CR⁴ o nitrógeno y

30 A₄ representa CR⁵ o nitrógeno

pero donde no más de tres de los grupos químicos A₁ a A₄ representan simultáneamente nitrógeno;

35 R², R³, R⁴ y R⁵ independientemente uno de otro representan hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro o alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, N-C₁-C₆ -alcoxiimino-alquilo C₁-C₃, alquilsulfanilo C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, N-alquilamino C₁-C₆ o N,N-di-alquilamino C₁-C₆ que están dado el caso mono- a pentasustituidos independientemente uno del otro con flúor, cloro, ciano, hidroxicarbonilo, alcoxicarbonilo C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆ o fenilo

W representa oxígeno o azufre;

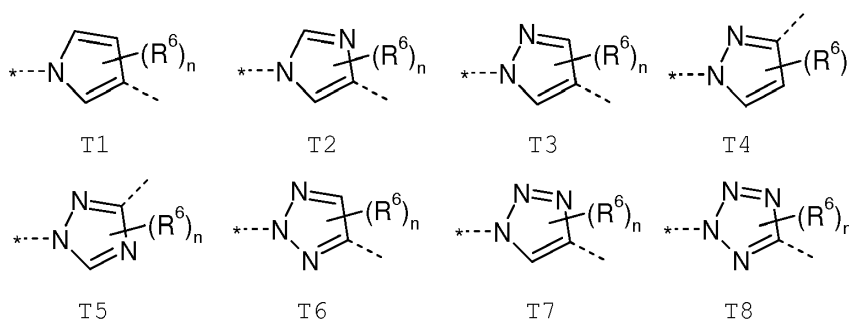
Q representa hidrógeno, amino o uno de los grupos alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, heterocicloalquilo C₂-C₅, alcoxi C₁-C₄, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, aril-(C₁-C₃)-alquilo, heteroaril-(C₁-C₃)-alquilo, N-

alquilamino C₁-C₄, N-alquilcarbonilamino C₁-C₄ o N,N-dialquilamino C₁-C₄ que están dado el caso, independientemente uno de otro, mono- a pentasustituídos con hidroxilo, nitro, amino, flúor, cloro, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, ciano, hidroxicarbonilo, alcoxicarbonilo C₁-C₄, alquilcarbamoilo C₁-C₄, cicloalquilcarbamoilo C₃-C₇, fenilo; o

5 Q representa arilo sustituido con 0-4 sustituyentes V o un heteroaromático de 5 o 6 miembros sustituido con 0-4 sustituyentes V, en donde

V independientemente uno de otro representan halógeno, ciano, nitro, o alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, N-alcoxiimino C₁-C₆-alquilo C₁-C₃, alquilsulfanilo C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, N,N-di-(alquil C₁-C₆)amino, dado el caso sustituidos

10 T representa uno de los heteroaromáticos de 5 miembros T1-T8 enumerados a continuación, donde el enlace al grupo de la cabeza de pirazol está marcado con un asterisco,



en los que

15 R⁶ independientemente uno de otro representan flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, amino o representa alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, alquilsulfanilo C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆ que dado el caso están independientemente uno del otro mono- a pentasustituídos con flúor y/o cloro, y

n representa los valores 0-1;

Z¹ representa haloalquilo C₁-C₆, halocicloalquilo C₁-C₆, dado el caso sustituidos,

y

20 Z² representa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, amino o representa alquilo C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, alquilsulfanilo C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆ que dado el caso están independientemente uno del otro mono- a pentasustituídos con flúor y/o cloro, y

Z³ representa hidrógeno o alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₃-C₄, alquino C₃-C₄, arilo y heteroalquilo, dado el caso sustituidos.

25 4. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1 en los cuales

R¹ representa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, s-butilo, t-butilo, metoximetilo, etoximetilo, propoximetilo, metilcarbonilo, etilcarbonilo, n-propilcarbonilo, isopropilcarbonilo, n-butilcarbonilo, isobutilcarbonilo, s-butilcarbonilo, t-butilcarbonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n-propoxicarbonilo, isopropoxicarbonilo, n-butoxicarbonilo, isobutoxicarbonilo, s-butoxicarbonilo, t-butoxicarbonilo, cianometilo, 2-cianoetilo, bencilo, 4-metoxibencilo, pirid-2-ilmetilo, pirid-3-ilmetilo, pirid-4-ilmetilo, 6-cloropirid-3-ilmetilo;

30 M¹ representa hidrógeno,

M² representa hidrógeno, metilo, etilo, difluorometilo, triclorometilo, diclorofluorometilo, trifluorometilo, ciclopropilo, ciclobutilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo,

M¹ y M² con el átomo de carbono al que están unidos forman un carbociclo de 3 miembros,

35 los grupos químicos

A₁ representa CR² o nitrógeno,

A₂ representa CR³ o nitrógeno,

A₃ representa CR⁴ o nitrógeno y

A₄ representa CR⁵ o nitrógeno

pero donde no más de tres de los grupos químicos A₁ a A₄ representan simultáneamente nitrógeno;

R² y R⁵ independientemente uno del otro representan hidrógeno, metilo, flúor o cloro y

R³ y R⁴ independientemente uno de otro representan hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, metilo, etilo, fluorometilo, difluorometilo, clorodifluorometilo, trifluorometilo, 2,2,2-trifluoroetilo, metoxi, etoxi, n-propoxi, 1-metiletoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, clorodifluorometoxi, diclorofluorometoxi, trifluorometoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, pentafluoroetoxi, N-metoxiiminometilo, 1-(N-metoxiimino)etilo, metilsulfanilo, trifluorometilsulfanilo, metilsulfonilo, metilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfinilo;

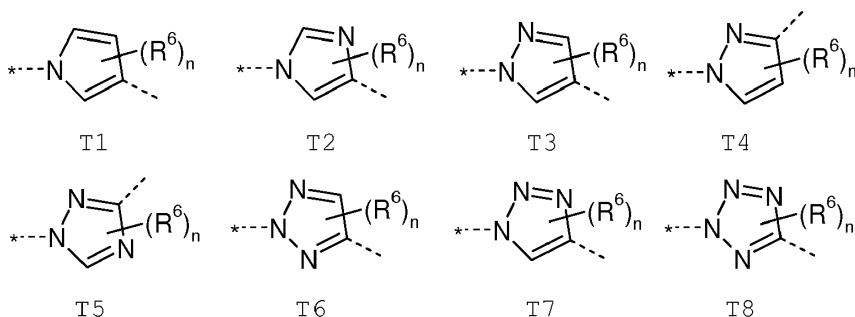
W representa oxígeno o azufre;

Q representa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, t-butilo, 1-metilpropilo, n-butilo, 2-metilpropilo, 2-metilbutilo, hidroximetilo, 2-hidroxi etilo, 2-hidroxi propilo, cianometilo, 2-cianoetilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 1-trifluorometiletilo, 2,2-difluoropropilo, 3,3,3-trifluoropropilo, 2,2-dimetil-3-fluoropropilo, ciclopropilo, 1-cianociclopropilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, 1-ciclopropiletilo, bis-(ciclopropil)metilo, 2,2-dimetilciclopropilmetilo, 2-fenilciclopropilo, 2,2-diclorociclopropilo, trans-2-clorociclopropilo, cis-2-clorociclopropilo, 2,2-difluorociclopropilo, trans-2-fluorociclopropilo, cis-2-fluorociclopropilo, trans-4-hidroxiciclohexilo, 4-trifluorometilciclohexilo, etenilo, 1-metiletenilo, prop-1-enilo, 2-metilprop-1-enilo, 3-metilbut-1-enilo, 3,3,3-trifluoroprop-1-enilo, 1-etilenilo, 1-metilprop-1-enilo, prop-2-inilo, 3-fluoroprop-2-enilo, oxetan-3-ilo, tetan-3-ilo, 1-oxidotetan-3-ilo, 1,1-dioxidotetan-3-ilo, tetrahidrofuran-3-ilo, 1,1-dioxidotetrahidrotiofen-3-ilo, isoxazol-3-ilmetilo, 1,2,4-triazol-3-ilmetilo, 3-metiloxetan-3-ilmetilo, bencilo, 2,6-difluorofenilmetilo, 3-fluorofenilmetilo, 2-fluorofenilmetilo, 2,5-difluorofenilmetilo, 1-feniletilo, 4-clorofeniletilo, 2-trifluorometilfeniletilo, 1-piridin-2-iletilo, piridin-2-ilmetilo, 5-fluoropiridin-2-ilmetilo, (6-cloropiridin-3-il)metilo, pirimidin-2-ilmetilo, tiofen-2-ilmetilo, 2-etoxietilo, 2-metoxietilo, 1-(metilsulfanil)etilo, 2-(metilsulfanil)etilo, 1-metil-2-(etilsulfanil)etilo, 2-metil-1-(metilsulfanil)propan-2-ilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, metoxicarbonilmetilo, NH₂, N-etilamino, N-alilamino, N,N-dimetilamino, N,N-dietilamino, metoxi, etoxi, propoxi, isopropoxi, tert-butoxi; o

Q representa fenilo, naftilo, piridazina, pirazina, pirimidina, triazina, piridina, pirazol, tiazol, isotiazol, oxazol, isoxazol, triazol, imidazol, furano, tiofeno, pirrol, oxadiazol, tiadiazol sustituidos con 0, 1, 2 o 3 sustituyentes V, en donde

V independientemente uno de otro representan flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, metilo, etilo, difluorometilo, triclorometilo, clorodifluorometilo, diclorofluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 1-cloro-1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 1,1-difluoroetilo, pentafluoroetilo, heptafluoro-n-propilo, heptafluoroisopropilo, nonafluoro-n-butilo, ciclopropilo, ciclobutilo, metoxi, etoxi, n-propoxi, 1-metiletoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, clorodifluorometoxi, clorodifluorometoxi, difluorometoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, pentafluoroetoxi, N-metoxiiminometilo, 1-(N-metoxiimino) etilo, metilsulfanilo, metilsulfonilo, metilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfinilo, trifluorometilsulfanilo, N,N-dimetilamino;

T representa uno de los heteroaromáticos de 5 miembros T1-T8 enumerados a continuación, donde el enlace al grupo de la cabeza de pirazol está marcado con un asterisco,



en los que

R⁶ independientemente uno de otro representan flúor, cloro, ciano, nitro, amino, metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, tert-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, etoxi, trifluorometoxi, 2,2-difluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, metilcarbonilo, etilcarbonilo, trifluorometilcarbonilo, metilsulfanilo, metilsulfinilo, metilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfanilo, trifluorometilsulfinilo y

n representa los valores 0-1;

Z¹ representa difluorometilo, triclorometilo, clorodifluorometilo, diclorofluorometilo, trifluorometilo, bromodiclorometilo, 1-fluoroetilo, 1-fluoro-1-metiletilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 1-cloro-1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 1,1-difluoroetilo, pentafluoroetilo, heptafluoro-n-

propilo, heptafluoroisopropilo, nonafluoro-n-butilo, ciclopropilo, 1-clorociclopropilo, 1-fluorociclopropilo, 1-bromociclopropilo, 1-cianociclopropilo, 1-trifluorometilciclopropilo, ciclobutilo o 2,2-difluoro-1-metilciclopropilo, y

5 Z^2 representa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, amino, metilo, etilo, 1,1-t-butilo, difluorometilo, triclorometilo, clorodifluorometilo, diclorofluorometilo, trifluorometilo, bromodifluorometilo, 1-fluoroetilo, 1-fluoro-1-metiletilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 1-cloro-1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 1,1-difluoroetilo, pentafluoroetilo, heptafluoro-n-propilo, heptafluoroisopropilo, nonafluoro-n-butilo, metilsulfanilo, metilsulfinilo, metilsulfonilo, etiltio, etilsulfinilo, etilsulfonilo, trifluorometilsulfanilo, trifluorometilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, clorodifluorometilsulfanilo, clorodifluorometilsulfinilo, clorodifluorometilsulfonilo, diclorofluorometilsulfanilo, diclorofluorometilsulfinilo, diclorofluorometilsulfonilo, y

10 Z^3 representa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, s-butilo, t-butilo, 1-propenilo, 1-propinilo, 1-butilo, difluorometilo, triclorometilo, clorodifluorometilo, diclorofluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 1-fluoro-1-metiletilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, fenilo, 2-clorofenilo, 3-clorofenilo, 4-clorofenilo, 2,4-diclorofenilo, 2,5-diclorofenilo, 3,4-diclorofenilo, 2,6-diclorofenilo, 2,6-dicloro-4-trifluorometilfenilo, 3-cloro-5-trifluorometilpiridin-2-ilo.

15 5. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1 en los que

Z^1 representa trifluorometilo, 1-clorociclopropilo, 1-fluorociclopropilo o pentafluoroetilo,

Z^2 representa trifluorometilo, nitro, metilsulfanilo, metilsulfinilo, metilsulfonilo, flúor, cloro, bromo, ciano o yodo,

Z^3 representa metilo, etilo, n-propilo o hidrógeno,

20 R^1 representa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, s-butilo, t-butilo, metoximetilo, etoximetilo, propoximetilo, metilcarbonilo, etilcarbonilo, n-propilcarbonilo, isopropilcarbonilo, n-butilcarbonilo, i-butilcarbonilo, s-butilcarbonilo, t-butilcarbonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n-propoxicarbonilo, isopropoxicarbonilo, n-butoxicarbonilo, i-butoxicarbonilo, s-butoxicarbonilo, t-butoxicarbonilo, cianometilo, 2-cianoetilo, bencilo, 4-metoxibencilo, pirid-2-ilmetilo, pirid-3-ilmetilo, pirid-4-ilmetilo, 6-cloropirid-3-ilmetilo;

M^1 representa hidrógeno;

25 M^2 representa hidrógeno o metilo;

M^1 y M^2 con el átomo de carbono al que están unidos forman un carbociclo de 3 miembros,

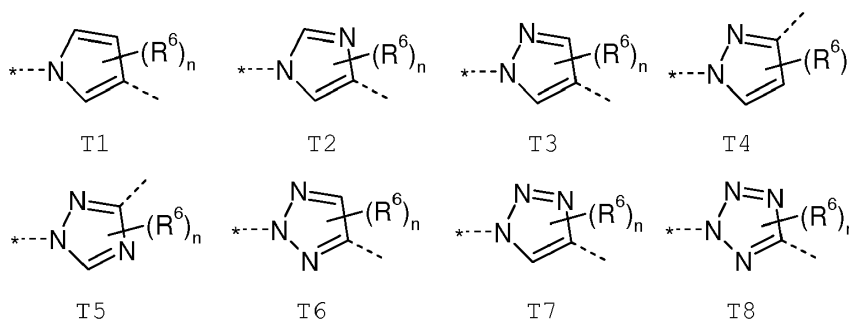
A_1 y A_4 representan CH,

A_2 representa CH o N,

A_3 representa CR^4 y

30 R^4 representa metilo, etilo, flúor, cloro, bromo o yodo,

T representa uno de los heteroaromáticos de 5 miembros T1-T8 enumerados a continuación, donde el enlace al grupo de la cabeza de pirazol está marcado con un asterisco,



35 en los que

R^6 representa hidrógeno, metilo, etilo, 2-metiletilo, 2,2-dimetiletilo, flúor, cloro, bromo, yodo, nitro, trifluorometilo, amino,

W representa oxígeno y

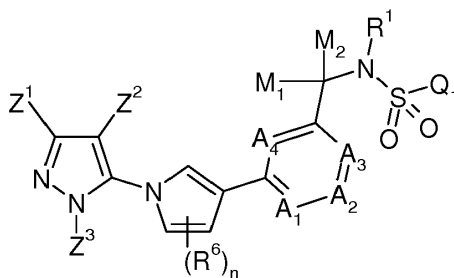
40 Q representa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, 1-metiletilo, 1,1-dimetiletilo, n-butilo, 1-metilpropilo, 2-metilpropilo, 2-metilbutilo, hidroximetilo, 2-hidroxipropilo, cianometilo, 2-cianoetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 1

trifluorometiletilo, 2,2 difluoropropilo, 3,3,3 trifluoropropilo, 2,2 dimetil-3-fluoropropilo, ciclopropilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, 1-ciclopropiletilo, bis-(ciclopropil)-metilo, 2,2-dimetilciclopropilmetilo, 2-fenilciclopropilo, 2,2-diclorociclopropilo, trans-2-clorociclopropilo, cis-2-clorociclopropilo, 2,2-difluorociclopropilo, trans-2-fluorociclopropilo, cis-2-fluorociclopropilo, trans-4-hidroxiciclohexilo, 4-trifluorometilciclohexilo, etenilo, 1-metiletenilo, prop-1-enilo, 2-metilprop-1-enilo, 3-metilbut-1-enilo, 3,3,3-trifluoroprop-1-enilo, 1-etilenilo, 1-metilprop-1-enilo, prop-2-inilo, 3-fluoroprop-2-enilo, oxetan-3-ilo, tietan-3-ilo, 1-oxidotietan-3-ilo, 1,1-dioxidotietan-3-ilo, isoxazol-3-ilmetilo, 1,2,4-triazol-3-ilmetilo, 3-metiloxetan-3-ilmetilo, bencilo, 2,6-difluorofenilmetilo, 3-fluorofenilmetilo, 2-fluorofenilmetilo, 2,5-difluorofenilmetilo, 1-feniletilo, 4-clorofeniletilo, 2-trifluormetilfeniletilo, 1-piridin-2-iletilo, piridin-2-ilmetilo, (6-cloropiridin-3-il)metilo, 5-fluoropiridin-2-ilmetilo, pirimidin-2-ilmetilo, metoxi, 2-etoxietilo, 2-(metilsulfanil)etilo, 1-metil-2-(etilsulfanil)etilo, 2-metil-1-(metilsulfanil)propan-2-ilo, metoxicarbonilo, metoxicarbonilmetilo, NH₂, N-etilamino, N-alilamino, NN-dimetilamino, NN-dietilamino, metoxi, etoxi, propoxi, isopropoxi, tert-butoxi; o

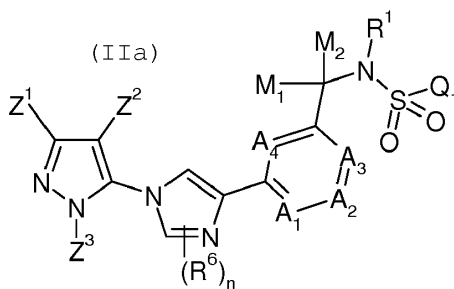
Q representa fenilo, naftilo, piridazina, pirazina, pirimidina, triazina, piridina, pirazol, tiazol, isotiazol, oxazol, isoxazol, triazol, imidazol, furano, tiofeno, pirrol, oxadiazol, tiadiazol sustituidos con 0, 1, 2 o 3 sustituyentes V, en donde

V independientemente uno de otro representan flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, metilo, etilo, difluorometilo, triclorometilo, clorodifluorometilo, diclorofluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 1-cloro-1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 1,1-difluoroetilo, pentafluoroetilo, heptafluoro-n-propilo, heptafluoroisopropilo, nonafluoro-n-butilo, ciclopropilo, ciclobutilo, metoxi, etoxi, n-propoxi, 1-metiletoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, clorodifluorometoxi, diclorofluorometoxi, trifluorometoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, pentafluoroetoxi, N-metoxiiminometilo, 1-(N-metoxiimino)etilo, metilsulfanilo, metilsulfonilo, metilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfinilo, trifluorometilsulfanilo, N,N-dimetilamino.

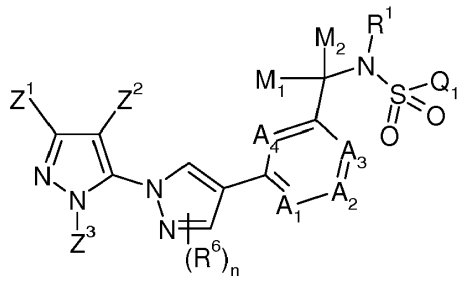
6. Compuestos de las fórmulas generales (IIa), (IIb), (IIc), (IId), (IIe), (IIf), (IIg), (IIh) en las que los radicales A₁-A₄, n, W, Q, R¹, R⁶, M¹, M² y Z¹-Z³ pueden asumir los significados de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5



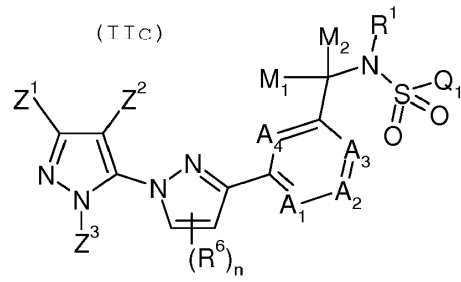
25



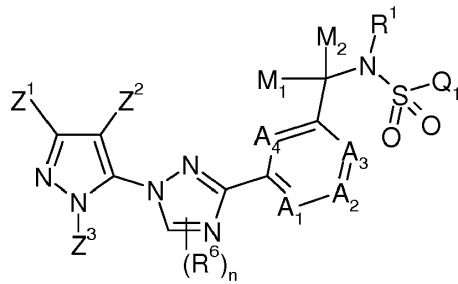
(IIb)



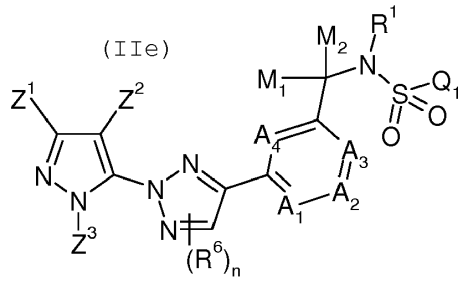
(IIc)



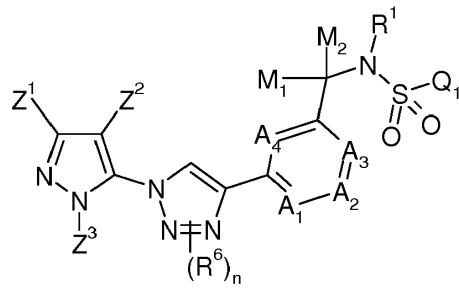
(IIId)



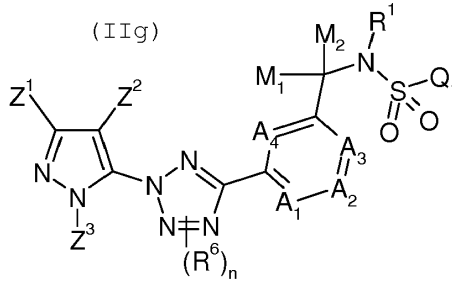
(IIe)



(IIIf)



(IIg)



(IIh)

7. Uso de compuestos de la fórmula general (II) o de las fórmulas generales (IIa) a (IIh) de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6 para controlar plagas que parasitan plantas, plagas de almacenes o plagas que destruyen materiales industriales.
- 5 8. Composiciones farmacéuticas que comprenden al menos un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6.
9. Compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6 para uso como medicamentos.
10. Uso de compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6 para preparar composiciones farmacéuticas para controlar parásitos en animales.
- 10 11. Procedimiento para preparar composiciones para protección de cultivos que comprenden compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6 y diluyentes y/o tensioactivos habituales.
12. Procedimiento para controlar plagas que parasitan plantas, plagas de almacenes o plagas que destruyen materiales industriales, caracterizado porque se permite que un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6 actúe sobre las plagas y/o su hábitat.
- 15 13. Uso de compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6 para proteger el material de propagación de plantas.