

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 685 970**

51 Int. Cl.:

C07D 403/04 (2006.01)

A01N 43/713 (2006.01)

C07D 213/77 (2006.01)

C07D 401/04 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **06.03.2015 PCT/EP2015/054696**

87 Fecha y número de publicación internacional: **17.09.2015 WO15135843**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **06.03.2015 E 15707980 (7)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **06.06.2018 EP 3116868**

54 Título: **Compuestos heterocíclicos como agentes plaguicidas**

30 Prioridad:

10.03.2014 EP 14158461

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

15.10.2018

73 Titular/es:

**BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT
(100.0%)**

**Alfred-Nobel-Strasse 50
40789 Monheim, DE**

72 Inventor/es:

**BRETSCHNEIDER, THOMAS;
CEREZO-GALVEZ, SILVIA;
GRONDAL, CHRISTOPH;
FISCHER, REINER;
FÜSSLEIN, MARTIN;
REINISCH, PETER;
GÜCLÜ, MEHMET;
ILG, KERSTIN;
LÖSEL, PETER y
MALSAM, OLGA**

74 Agente/Representante:

CARPINTERO LÓPEZ, Mario

ES 2 685 970 T3

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

DESCRIPCIÓN

Compuestos heterocíclicos como agentes plaguicidas

La presente solicitud se refiere a nuevos compuestos heterocíclicos, a procedimientos e intermedios para su preparación y su uso para combatir plagas animales.

- 5 En el documento WO 2012/102387 A1 se han descrito compuestos heterocíclicos que pueden usarse en particular como insecticidas y acaricidas.

Los compuestos heterocíclicos para usos farmacéuticos se revelan en los documentos WO 2004/009597 A2, WO 2008/107418 A1, WO 2009/068617 A1 y US 2004/242596 A1.

En el documento JP H11 171702 A está descrito el uso de pirazoles con sustitución de fenilo en agricultura.

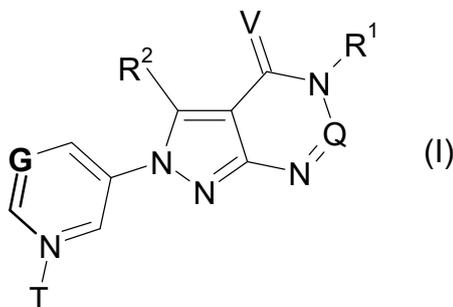
- 10 La preparación de pirazolouracilos y los productos intermedios usados en este caso son objeto de la publicación en Journal of Heterocyclic Chemistry, tomo 4, N.º 3, 1 de septiembre de 1967, páginas 325-334.

En Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters (2007), 17(15), 4303-4307 se informa de la síntesis y las propiedades farmacológicas de determinadas pirazolo[3,4-d]pirimidin-4-ona.

- 15 Los agentes fitosanitarios modernos deben cumplir con muchas exigencias, por ejemplo en relación con la intensidad, la duración y el alcance de su efecto y su posible uso. Son importantes aspectos de la toxicidad, de la capacidad de combinarse con otros principios activos o adyuvantes de formulación así como el aspecto del dispendio que debe realizarse para la síntesis de un principio activo. Además se pueden producir resistencias. Por todas estas razones no puede considerarse finalizada la investigación de nuevos agentes fitosanitarios y existe en forma constante la necesidad de disponer de nuevos
20 compuestos con propiedades mejoradas respecto de los compuestos conocidos, al menos en lo que respecta a distintos aspectos.

Objetivo de la presente invención fue proporcionar compuestos por medio de los cuales se amplía el espectro de los agentes para combatir parásitos en distintos aspectos y/o se mejora su actividad.

- 25 Se cumple con el objetivo así como con otros objetivos no mencionados aquí en forma explícita que pueden deducirse o interpretarse a partir de los contextos aquí explicados mediante la disposición de compuestos de la fórmula (I)



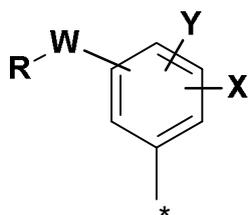
en la que

G representa N o C-A¹,

- 30 A¹ representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi o cicloalquilo y cicloalqueno dado el caso sustituidos respectivamente,

T representa un par de electrones u oxígeno,

R¹ representa el resto de la fórmula

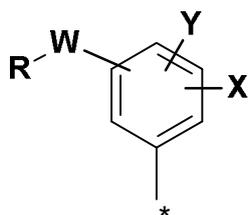


en el que la unión con el átomo de nitrógeno en el grupo C(=V)-N-Q en la fórmula (I) está marcado con el asterisco (*),

- 5 R representa NR^7R^8 o representa un resto dado el caso sustituido respectivamente de la serie alquilo, alqueno, alquino, alcoxilalquilo, alquilo-S(O)_m-alquilo, $\text{R}^7\text{-CO-alquilo}$, $\text{NR}^7\text{R}^8\text{-CO-alquilo}$, cicloalquilo, cicloalqueno, cicloalquilalquilo, cicloalquenalalquilo, heterociclilo, heterocicilalquilo, fenilo, fenilalquilo, hetarilo y hetarilalquilo,
- W representa un resto de la serie O, S, SO y SO₂,
- 10 X representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi y cicloalquilo,
- Y representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, cicloalquilo y NR^5R^6 ,
- R² representa hidrógeno o alquilo,
- Q representa nitrógeno o C-R³, en el que
- 15 R³ representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, cicloalquilalquilo, alcoxilalquilo, haloalcoxilalquilo, SH, alquilsulfanilo, alquilsulfino, alquilsulfonilo, haloalquilsulfanilo, haloalquilsulfino, haloalquilsulfonilo, NH₂, alquilamino y dialquilamino,
- V representa un resto de la serie oxígeno, azufre y NR⁴ y
- 20 R⁴ representa un resto de la serie hidrógeno, ciano, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, nitro, carbonilalquilo, carbonilhaloalquilo y carbonilalcoxi,
- R⁵ representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo y haloalquilo,
- R⁶ representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo y haloalquilo,
- o
- 25 R⁵ y R⁶ junto con el nitrógeno, al que están unidos, representan un anillo saturado o insaturado de 3 a 6 miembros, que dado el caso está sustituido y dado el caso contiene otros heteroátomos.
- R⁷ representa hidrógeno, hidroxilo o un resto dado el caso sustituido respectivamente de la serie alquilo, alcoxi, alcoxilalquilo, alquilo-S(O)_m-alquilo, alquilcarbonilo, alcoxycarbonilo, cicloalquilo, cicloalqueno, cicloalquilalquilo, cicloalquenalalquilo, heterociclilo, heterocicilalquilo, fenilo, fenilalquilo, hetarilo y hetarilalquilo,
- 30 R⁸ representa hidrógeno, un ión metálico, un ión de amonio dado el caso sustituido o un resto dado el caso sustituido respectivamente de la serie alquilo, alcoxi, alcoxilalquilo, alquilo-S(O)_m-alquilo y
- m representa un número de la serie 0, 1 y 2.

Sustituyentes o bien intervalos preferidos de los restos indicados en los compuestos de la fórmula (I) se explican a continuación. Su combinación conforma el intervalo de preferencia (1).

- 35 G representa N o C-A¹.
- A¹ representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ y cicloalquilo C₃-C₆.
- T representa un par de electrones libres u oxígeno.
- R¹ representa el resto de la fórmula



en el que la unión con el átomo de nitrógeno en el grupo C(=V)-N-Q en la fórmula (I) está marcado con el asterisco (*).

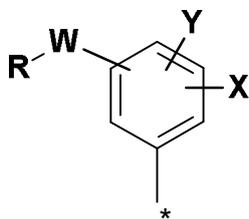
- 5 R representa NR^7R^8 o representa alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_3-C_6 , alquinilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_4 , alquilo $C_1-C_6-S(O)_m$ -alquilo C_1-C_4 dado el caso sustituido respectivamente con halógeno o ciano, representa R^7-CO -alquilo C_1-C_4 , representa NR^7R^8-CO -alquilo C_1-C_4 , representa cicloalquilo C_3-C_8 dado el caso mono o disustituido respectivamente con oxígeno (lleva a C=O), halógeno, ciano, alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 y haloalquilo C_1-C_4 , representa cicloalquenilo C_3-C_8 dado el caso mono o disustituido respectivamente con oxígeno (lleva a C=O), alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 y haloalquilo C_1-C_4 , representa cicloalquil C_3-C_6 -alquilo C_1-C_4 dado el caso mono o disustituido con oxígeno (lleva a C=O), halógeno, ciano, alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 y haloalquilo C_1-C_4 , representa cicloalquenil C_3-C_6 -alquilo C_1-C_4 dado el caso mono o disustituido con oxígeno (lleva a C=O), alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 y haloalquilo C_1-C_4 , representa heterociclilo dado el caso mono o disustituido con oxígeno (lleva a C=O), alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 y haloalquilo C_1-C_4 , representa heterocicli-alquilo C_1-C_4 dado el caso mono o disustituido con oxígeno (lleva a C=O), alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 y haloalquilo C_1-C_4 o representa fenilo, fenil-alquilo C_1-C_4 , hetarilo y hetaril-alquilo C_1-C_4 dado el caso mono a trisustituido respectivamente con halógeno, ciano, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 .
- m representa un número de la serie 0, 1 y 2.
- W representa un resto de la serie O, S, SO y SO_2 .
- 20 X representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 y cicloalquilo C_3-C_6 .
- Y representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 y NR^5R^6 .
- R^2 representa hidrógeno o alquilo C_1-C_6 .
- 25 Q representa nitrógeno o C- R^3 .
- R^3 representa un resto de la serie hidrógeno, hidroxilo, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , cicloalquil C_3-C_6 -alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_4 , SH, alquilsulfanilo C_1-C_6 , alquilsulfínilo C_1-C_6 , alquilsulfonilo C_1-C_6 , NH_2 , alquilamino C_1-C_6 y di-(alquil C_1-C_6)-amino.
- 30 V representa un resto de la serie oxígeno, azufre y NR^4 .
- R^4 representa un resto de la serie hidrógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_2-C_6 y cicloalquilo C_3-C_6 .
- R^5 representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo C_1-C_6 y haloalquilo C_2-C_6 .
- R^6 representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo C_1-C_6 y haloalquilo C_2-C_6 .
- 35 R^5 y R^6 también junto con el átomo de nitrógeno, al que están unidos, pueden representar un anillo saturado hasta insaturado tres veces, de 3 a 6 miembros dado el caso sustituido con halógeno, ciano, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , en particular pueden representar aziridinilo, azirenilo, diaziridinilo, diazirenilo, azetidínilo, dihidroazetilo, diazetidinilo, dihidrodiazetilo, oxazetidínilo, oxazetilo, tiazetidínilo, tiazetilo, pirrolidinilo, dihidropirrolilo, pirazolidínilo, dihidropirazolilo, imidazolidínilo, dihidroimidazolilo, oxazolidínilo, dihidroxazolilo, tiazolidínilo, dihidrotiazolilo, piperidinilo, piperazinilo, hexahidropiridazinilo, hexahidropirimidinilo, morfolino, dioxazinanilo, tiomorfolino, ditiazinano, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, triazolilo y tetrazolilo.
- 40 R^7 representa un resto de la serie hidrógeno, hidroxilo, representa alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_4 , alquilo $C_1-C_6-S(O)_m$ -alquilo C_1-C_4 , alquilcarbonilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 -carbonilo, cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquenilo C_3-C_6 , cicloalquil C_3-C_6 -alquilo C_1-C_3 , cicloalquenil C_3-C_6 -alquilo C_1-C_3 , heterociclilo, heterocicli-alquilo C_1-C_3 dado el caso respectivamente mono o polisustituido con halógeno o mono o disustituido con ciano y fenilo, fenil-alquilo C_1-C_3 , hetarilo y hetaril-alquilo C_1-C_3 dado el caso mono a tetrasustituido con
- 45

respectivamente con alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halógeno o ciano.

- 5 R⁸ representa hidrógeno, un ión metálico o representa un ión de amonio dado el caso mono- a tetrasustituido con alquilo C₁-C₄ o representa un resto de la serie alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ y alquilo C₁-C₄-S(O)_m-alquilo dado el caso respectivamente mono o polisustituido con halógeno o mono o disustituido con ciano.

Los sustituyentes o bien intervalos muy preferentes de los restos indicados en los compuestos de la fórmula (I) se explican a continuación. Su combinación conforma el intervalo de preferencia (2).

- G representa N o C-A¹.
- 10 A¹ representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄.
- T representa un par de electrones libres u oxígeno.
- R¹ representa el resto de la fórmula



- 15 en el que la unión con el átomo de nitrógeno en el grupo C(=V)-N-Q en la fórmula (I) está marcado con el asterisco (*).

- R representa NR⁷R⁸ o representa alquilo C₁-C₆, alqueno C₃-C₆, alquino C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₃, alquilo C₁-C₄-S(O)_m-alquilo C₁-C₃ dado el caso respectivamente mono a heptasustituido con halógeno, o mono o disustituido con ciano, representa R⁷-CO-alquilo C₁-C₂, representa NR⁷R⁸-CO-alquilo C₁-C₂, representa cicloalquilo C₃-C₈ dado el caso mono o disustituido con oxígeno (lleva a C=O), halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄, representa cicloalqueno C₃-C₈ dado el caso mono o disustituido con oxígeno (lleva a C=O), alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄, representa cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ dado el caso mono o disustituido con oxígeno (lleva a C=O), halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄, representa cicloalquenoil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ saturado o insaturado dado el caso mono o disustituido con oxígeno (lleva a C=O), alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄, representa heterociclilo dado el caso mono o disustituido con oxígeno (lleva a C=O), alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄, representa heterocicliil-alquilo C₁-C₄ dado el caso mono o disustituido con oxígeno (lleva a C=O), alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄ o representa fenilo, fenil-alquilo C₁-C₃, hetarilo, y hetaril-alquilo C₁-C₃ dado el caso respectivamente mono a trisustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄,

- 30 W representa un resto de la serie S, SO y SO₂.

X representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄.

Y representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄.

- 35 R² representa hidrógeno o alquilo C₁-C₄.

Q representa nitrógeno o C-R³.

- R³ representa un resto de la serie hidrógeno, hidroxilo, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₃, SH, alquilsulfanilo C₁-C₄, alquilsulfino C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, NH₂, alquilamino C₁-C₄ y di-(alquil C₁-C₄)-amino.

- V representa oxígeno.

R⁷ representa hidrógeno, hidroxilo o representa un resto de la serie alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquilo C₁-C₄-S(O)_m-alquilo C₁-C₃, alquilo C₁-C₄-carbonilo, alcoxi C₁-C₄-carbonilo, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₃, heterociclilo, heterocicliil-alquilo C₁-C₃ dado el caso respectivamente mono o

polisustituido con halógeno o mono o disustituido con ciano y representa fenilo, bencilo, piridilo, pirimidilo, tiazolilo, oxazolilo, pirazolilo, tienilo, furanilo, piridinil-metilo y tiazolilmetilo dado el caso respectivamente mono a trisustituido con alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, ciclopropilo, flúor, cloro, bromo o ciano.

5 R⁸ representa hidrógeno, representa un ión metálico o representa un ión de amonio dado el caso mono- a tetrasustituido con alquilo C₁-C₄ o representa un resto de la serie alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₂ y alquilo C₁-C₄-S(O)_m-alquilo C₁-C₂ dado el caso respectivamente mono o polisustituido con halógeno o mono o disustituido con ciano.

m representa un número de la serie 0, 1 y 2.

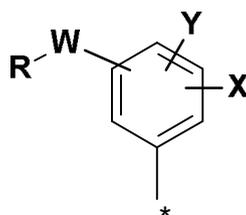
10 Sustituyentes o bien intervalos muy especialmente preferentes de los restos indicados en los compuestos de la fórmula (I) se explican a continuación. Su combinación conforma el intervalo de preferencia (3).

G representa N o C-A¹.

A¹ representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, isopropilo, *terc*-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, 2,2,2-trifluoroetilo y 2,2-difluoretilo.

15 T representa un par de electrones libres u oxígeno.

R¹ representa el resto de la fórmula



en el que la unión con el átomo de nitrógeno en el grupo C(=V)-N-Q en la fórmula (I) está marcado con el asterisco (*).

20 R representa NR⁷R⁸ o representa un resto de la serie alquilo C₁-C₄, alqueno C₃-C₄, alquino C₃-C₄, alcoxi C₁-C₂-alquilo C₁-C₂ y alquilo C₁-C₂-S(O)_m-alquilo C₁-C₂ sustituido dado el caso respectivamente una, dos, tres, cuatro o cinco veces con flúor, cloro o disustituido con ciano, representa R⁷-CO-alquilo C₁-C₂, representa NR⁷R⁸-CO-alquilo C₁-C₂, representa cicloalquilo C₃-C₆ dado el caso mono o disustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂ o haloalquilo C₁-C₂ o sustituido con un átomo de oxígeno (lleva a C=O), representa cicloalqueno C₃-C₆ dado el caso mono o disustituido con alquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂ o haloalquilo C₁-C₂ o sustituido con un átomo de oxígeno (lleva a C=O), representa cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₂ dado el caso mono a disustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂ o haloalquilo C₁-C₂, representa cicloalquénil C₃-C₆-alquilo C₁-C₂ dado el caso mono o disustituido con alquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂ o haloalquilo C₁-C₂, representa heterociclilo dado el caso mono o disustituido con alquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂ o haloalquilo C₁-C₂, representa heterociclil-alquilo C₁-C₂ dado el caso mono o disustituido con alquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂ o haloalquilo C₁-C₂ y representa fenilo, bencilo, piridilo, pirimidilo, tiazolilo, oxazolilo, pirazolilo, tienilo, furanilo, piridinilmetilo y tiazolilmetilo dado el caso respectivamente mono o disustituido con flúor, cloro, bromo, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄.

W representa un resto de la serie S, SO y SO₂.

35 X representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi.

Y representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi.

R² representa hidrógeno o metilo.

40 Q representa nitrógeno o C-R³.

R³ representa un resto de la serie hidrógeno, metilo, trifluorometilo y ciclopropilo.

V representa oxígeno.

R⁷ representa un resto de la serie hidrógeno, hidroxilo, un resto alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-

5 C₄, alquilo C₁-C₄-S(O)_m-alquilo C₁-C₂, alquilcarbonilo C₁-C₄, alcoxicarbonilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₃, heterociclilo y heterocicilil-alquilo C₁-C₃ dado el caso sustituido una, dos, tres, cuatro o cinco veces con flúor, cloro o mono o disustituido con ciano y fenilo, bencilo, piridilo, pirimidilo, tiazolilo, oxazolilo, pirazolilo, tienilo, furanilo, piridinilmetilo y tiazolilmetilo dado el caso mono a trisustituido respectivamente con alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, ciclopropilo, flúor, cloro, bromo o ciano.

10 R⁸ representa hidrógeno, un ión alcalino o alcalinotérreo, representa un ión de amonio dado el caso mono- a tetrasustituido con alquilo C₁-C₄ o representa un resto de la serie alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₂ y alquilo C₁-C₄-S(O)_m-C₁-C₂-alquilo dado el caso respectivamente mono o polisustituido con flúor, cloro o mono o disustituido con ciano.

m representa un número de la serie 0, 1 y 2.

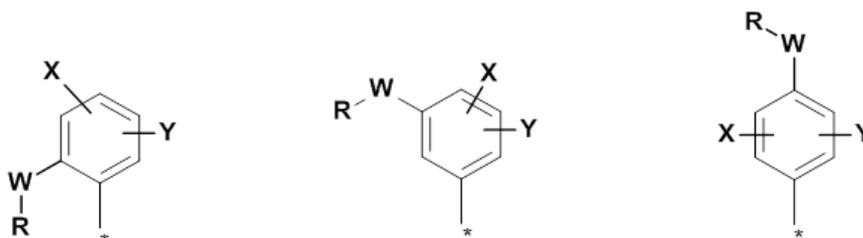
Los sustituyentes o bien intervalos que expresamente son muy especialmente preferentes de los restos indicados en los compuestos de la fórmula (I) se indican a continuación. Su combinación conforma el intervalo de preferencia (4).

G representa N o C-A¹.

15 A¹ representa un resto de la serie hidrógeno y flúor.

T representa un par de electrones libres u oxígeno.

R¹ representa uno de los siguientes restos



20 en el que la unión con el átomo de nitrógeno en el grupo C(=V)-N-Q en la fórmula (I) está marcado con el asterisco (*).

25 R representa metilo, etilo, propilo, iso-propilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, terc-butilo, alilo, 2-butenilo, propargilo, 2-butenilo dado el caso respectivamente sustituido una, dos o tres veces con flúor o monosustituido con ciano, representa cicloalquilo C₃-C₆ dado el caso monosustituido con flúor, cloro, ciano, metilo, etilo, metoxi, etoxi o trifluorometilo, representa cicloalquilmetilo C₃-C₆ dado el caso monosustituido con flúor, cloro, ciano, metilo, etilo, metoxi o trifluorometilo o representa fenilo, bencilo, piridilo, pirimidilo, tiazolilo y piridinilmetilo dado el caso mono o disustituido respectivamente con flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, iso-propilo, terc-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi o trifluorometoxi.

W representa un resto de la serie S, SO y SO₂.

30 X representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi.

Y representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi.

R² representa hidrógeno o metilo.

Q representa nitrógeno o C-R³.

35 R³ representa un resto de la serie hidrógeno, metilo, trifluorometilo y ciclopropilo.

V representa oxígeno.

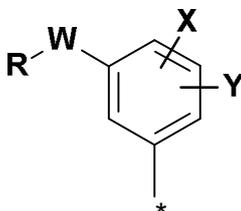
Los sustituyentes o bien intervalos preferidos de modo excepcional de los restos indicados en los compuestos de la fórmula (I) se explican a continuación. Su combinación conforma el intervalo de preferencia (5).

G representa N o C-A¹.

40 A¹ representa un resto de la serie hidrógeno y flúor.

T representa un par de electrones.

R¹ representa el resto de la fórmula



5 en el que la unión con el átomo de nitrógeno en el grupo C(=V)-N-Q en la fórmula (I) está marcado con el asterisco (*).

R representa metilo, etilo, propilo, iso-propilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, terc-butilo, alilo, 2-butenilo, propargilo, 2-butinilo dado el caso respectivamente sustituido una, dos o tres veces con flúor o monosustituido con ciano, representa cicloalquilo C₃-C₆ dado el caso monosustituido con flúor, cloro, ciano, metilo, etilo, metoxi, etoxi o trifluorometilo, representa cicloalquilmetilo C₃-C₆ dado el caso monosustituido con flúor, cloro, ciano, metilo, etilo, metoxi o trifluorometilo o representa fenilo, bencilo, piridilo, pirimidilo, tiazolilo y piridinilmetilo dado el caso respectivamente mono o disustituido con flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, iso-propilo, terc-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi o trifluorometoxi.

W representa un resto de la serie S, SO y SO₂.

X representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo y trifluorometilo.

15 Y representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo y trifluorometilo.

R² representa hidrógeno o metilo.

Q representa nitrógeno o C-R³.

R³ representa un resto de la serie hidrógeno y metilo.

V representa oxígeno.

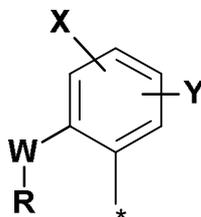
20 Otros sustituyentes o bien intervalos especialmente preferentes de los restos indicados en los compuestos de la fórmula (I) se explican a continuación. Su combinación forma el intervalo de preferencia (6).

G representa N o C-A¹.

A¹ representa un resto de la serie hidrógeno o flúor,

T representa un par de electrones

25 R¹ representa el resto de la fórmula



en el que la unión con el átomo de nitrógeno en el grupo C(=V)-N-Q en la fórmula (I) está marcado con el asterisco (*).

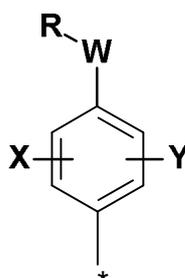
30 R representa metilo, etilo, propilo, iso-propilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, terc-butilo, alilo, 2-butenilo, propargilo, 2-butinilo dado el caso respectivamente sustituido una, dos o tres veces con flúor o monosustituido con ciano, representa cicloalquilo C₃-C₆ dado el caso monosustituido con flúor, cloro, ciano, metilo, etilo, metoxi, etoxi o trifluorometilo, representa cicloalquilmetilo C₃-C₆ dado el caso monosustituido con flúor, cloro, ciano, metilo, etilo, metoxi o trifluorometilo o representa fenilo, bencilo, piridilo, pirimidilo, tiazolilo y piridinilmetilo dado el caso mono o disustituido con flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, iso-propilo, terc-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi o trifluorometoxi.

35

- W representa un resto de la serie S, SO y SO₂.
- X representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo y trifluorometilo.
- Y representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo y trifluorometilo.
- R² representa hidrógeno o metilo.
- 5 Q representa nitrógeno o C-R³.
- R³ representa un resto de la serie hidrógeno y metilo.
- V representa oxígeno.

Otros sustituyentes o bien intervalos especialmente preferentes de los restos indicados en los compuestos de la fórmula (I) se explican a continuación. Su combinación forma el intervalo de preferencia (7).

- 10 G representa N o C-A¹.
- A¹ representa un resto de la serie hidrógeno o flúor.
- T representa un par de electrones.
- R¹ representa el resto de la fórmula



- 15 en el que la unión con el átomo de nitrógeno en el grupo C(=V)-N-Q en la fórmula (I) está marcado con el asterisco (*).

- R representa metilo, etilo, propilo, iso-propilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, terc-butilo, alilo, 2-butenilo, propargilo, 2-butinilo dado el caso respectivamente sustituidos una, dos o tres veces con flúor o monosustituido con ciano, representa cicloalquilo C₃-C₆ dado el caso monosustituido con flúor, cloro, ciano, metilo, etilo, metoxi, etoxi o trifluorometilo, representa cicloalquilmetilo C₃-C₆ dado el caso monosustituido con flúor, cloro, ciano, metilo, etilo, metoxi o trifluorometilo o representan fenilo, bencilo, piridilo, pirimidilo, tiazolilo y piridinilmetilo dado el caso respectivamente mono o disustituido con flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, iso-propilo, terc-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi o trifluorometoxi.
- 20

W representa un resto de la serie S, SO y SO₂.

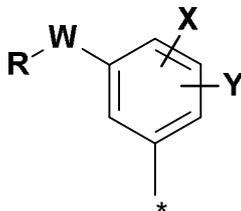
- 25 X representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo y trifluorometilo,
- Y representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo y trifluorometilo,
- R² representa hidrógeno o metilo.
- Q representa nitrógeno o C-R³.
- R³ representa un resto de la serie hidrógeno y metilo.

- 30 V representa oxígeno.

Otra realización especial (intervalo de preferencia (8)) de la invención se refiere a compuestos de la fórmula (I) en los cuales

- G representa C-A¹,
- A¹ representa hidrógeno,
- 35 T representa un par de electrones u oxígeno,

R¹ representa el resto de la fórmula



en el que la unión con el átomo de nitrógeno en el grupo C(=V)-N-Q en la fórmula (I) está marcado con el asterisco (*),

5 R representa un resto de la serie metilo, trifluoroetilo y ciclopropilmetilo,

W representa un resto de la serie S y SO,

X representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro y metilo,

Y representa un resto de la serie hidrógeno, cloro y metilo,

R² representa hidrógeno,

10 Q representa nitrógeno o C-R³,

R³ representa hidrógeno o metilo y

V representa oxígeno.

En el intervalo de preferencia (1), salvo que no se haya indicado lo contrario,

15 Halógeno se seleccionó de la serie flúor, cloro, bromo y yodo, a su vez preferentemente de la serie flúor, cloro y bromo,

20 Heterilo (con el mismo significado que heteroarilo, también como parte de una unidad más grande, como a modo de ejemplo hetarilalquilo) se seleccionó de la serie furilo, tienilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, benzofurilo, benzisofurilo, benzotienilo, benzisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, benzisotiazolilo, benzoxazolilo, benzisoxazolilo, bencimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazol, quinolinilo, isoquinolinilo, cinnolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo e indolizininilo,

25 heterociclilo representa un anillo saturado de 3, 4, 5 o 6 miembros, que contiene 1 o 2 átomos de nitrógeno y/o un átomo de oxígeno y/o un átomo de azufre, aunque no deben encontrarse directamente adyacentes 2 átomos de nitrógeno, a modo de ejemplo representa aziridinilo, azetidínilo, azolidinilo, azinanilo, oxiranilo, oxetanilo, oxolanilo, oxanilo, dioxanilo, tiiranilo, tietanilo, tiolanilo, tianilo, tetrahidrofurilo.

En el intervalo de preferencia (2), salvo que no se haya indicado lo contrario,

halógeno representa flúor, cloro, bromo y yodo, preferentemente representa flúor, cloro y bromo,

30 Heterilo (también como parte de una unidad más grande, como hetarilalquilo) representa piridilo, pirimidilo, tiazolilo, oxazolilo, pirazolilo, tienilo, furanilo, bencilo, piridinilmetilo y tiazolilmetilo así como

35 heterociclilo (también como parte de una unidad más grande, como heterociclilalquilo) un anillo saturado o insaturado de 3, 4 o 5 miembros que contiene 1 o 2 átomos de nitrógeno y/o un átomo de oxígeno y/o un átomo de azufre, aunque no deben encontrarse directamente adyacentes 2 átomos de nitrógeno, a modo de ejemplo representa 1- o 2-aziridinilo, 2-oxiranilo, 2-tiiranilo, 1- o 2-azetidínilo, 2- o 3-oxetanilo, 2- o 3-tietanilo, 1,3-dioxetan-2-ilo, 1-, 2- o 3-pirrolidinilo.

En el intervalo de preferencia (3), salvo que no se haya indicado lo contrario,

Halógeno representa flúor, cloro, bromo y yodo, preferentemente representa flúor, cloro y bromo y

40 heterociclilo (también como parte de una unidad más grande, como heterociclilalquilo) un anillo saturado o insaturado de 3 o 4 miembros que contiene 1 o 2 átomos de nitrógeno y/o un átomo de oxígeno y/o un átomo de azufre, aunque no deben encontrarse directamente adyacentes 2 átomos de nitrógeno, a modo de ejemplo representa 1- o 2-aziridinilo, 2-oxiranilo, 2-tiiranilo, 1- o 2-azetidínilo, 2- o 3-oxetanilo, 2- o 3-tietanilo o 1,3-dioxetan-

2-ilo.

5 Los restos sustituidos con halógeno, p. ej., haloalquilo (= haloalquilo) están, salvo que se haya indicado lo contrario, mono- o polihalogenados hasta el número máximo de sustituyentes. En caso de halogenación múltiple, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes. Halógeno en ese caso representa flúor, cloro, bromo o yodo, en particular representa flúor, cloro o bromo.

El concepto ión metálico comprende iones alcalinos y alcalinotérreos, pero sin limitarse a ello.

El concepto ión alcalino en esta solicitud representa un ión de la serie litio, sodio, potasio, rubidio y cesio, preferentemente de la serie litio, sodio y potasio.

10 El concepto ión alcalinotérreo representa en esta solicitud un ión de la serie berilio, magnesio, calcio, estroncio y bario, preferentemente de la serie magnesio y calcio.

Los restos hidrocarburo saturados o insaturados como alquilo o alqueno en cada caso, también en combinación con heteroátomos, como p. ej., en alcoxi, en lo posible pueden ser de cadena lineal o ramificada.

Los restos que dado el caso están sustituidos, salvo que se haya indicado lo contrario, pueden estar mono- o polisustituidos, pudiendo los sustituyentes ser iguales o diferentes en caso de polisustituciones.

15 Cuando T en los compuestos de la fórmula (I) representa oxígeno, estos compuestos están presentes como N-óxidos.

Cuando T en los compuestos de la fórmula (I) representa un par de electrones, estos compuestos están presentes como piridinas o para G = N como pirimidinas.

20 Las definiciones o bien explicaciones de restos generales o indicadas en intervalos de preferencias rigen de manera correspondiente para los productos finales y para los productos de partida y los intermedios. Estas definiciones de restos pueden combinarse a discreción entre sí, es decir también entre los respectivos intervalos de preferencia.

De manera preferente de acuerdo con la invención se usan los compuestos de la fórmula (I), que presentan una combinación de los significados indicados precedentemente como preferentes (intervalo de preferencia (1)).

25 Especialmente preferidos de acuerdo con la invención se usan los compuestos de la fórmula (I), que presentan una combinación de los significados indicados precedentemente como muy preferentes (intervalo de preferencia (2)).

Muy especialmente preferidos de acuerdo con la invención se usan los compuestos de la fórmula (I), que presentan una combinación de los significados indicados precedentemente como preferentes en particular (intervalo de preferencia (3)).

Otra realización preferente de la invención está definida por el intervalo de preferencia (4).

30 Otra realización preferente de la invención está definida por el intervalo de preferencia (5).

Otra realización preferente de la invención está definida por el intervalo de preferencia (6).

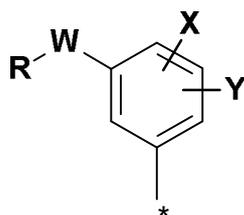
Otra realización preferente de la invención está definida por el intervalo de preferencia (7).

Otra realización preferente de la invención está definida por el intervalo de preferencia (8).

Otra realización preferente de la invención se refiere a compuestos de la fórmula (I) en los que G representa CH.

35 Otra realización preferente de la invención se refiere a compuestos de la fórmula (I) en los que V representa O.

Otra realización preferente de la invención se refiere a compuestos de la fórmula (I) en los que R¹ representa el resto de la fórmula



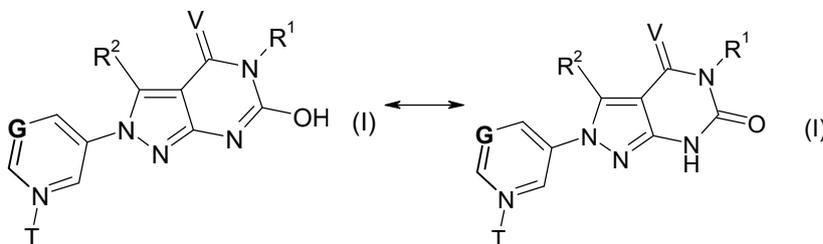
Otra realización preferente de la invención se refiere a compuestos de la fórmula (I), en los que R² representa H.

Los compuestos de la fórmula (I) pueden estar disponibles, dependiendo de la naturaleza de los sustituyentes, en la forma de isómeros geométricos y/o isómeros óptimamente activos o mezclas de los isómeros correspondientes en diferentes composiciones. La invención se refiere tanto al uso de los isómeros puros como también cualquier mezcla de estos isómeros, aunque aquí en general solo se habla de compuestos de la fórmula (I).

5 Aunque preferentemente se usan de acuerdo con la invención las formas ópticamente activas, estereoisómeras y tautómeros de los compuestos de la fórmula (I) y sus sales.

Como sales que son adecuadas de los compuestos de la fórmula general (I) pueden mencionarse las sales no tóxicas habituales, es decir sales con las correspondientes bases y sales con adición de ácidos. Se da preferencia a sales con bases inorgánicas tales como, por ejemplo, sales de metales alcalinos, por ejemplo sales de sodio, potasio o cesio, sales de metales alcalinotérreos, por ejemplo sales de calcio o magnesio, sales de amonio o sales con bases orgánicas, en particular con aminas orgánicas, tales como, por ejemplo, trietilamonio, dicitohexilamonio, N,N'-dibenciletilenediamonio, sales de piridinio, picolinio o etanolamonio, sales con ácidos orgánicos, por ejemplo clorhidratos, bromhidratos, dihidrosulfatos, trihidrosulfatos o fosfatos, sales con ácidos carboxílicos orgánicos o sulfoácidos orgánicos, por ejemplo formiatos, acetatos, trifluoroacetatos, maleatos, tartratos, metanosulfonatos, bencenosulfonatos o para-toluenosulfonatos, sales con aminoácidos, a modo de ejemplo arginatos, aspartatos o glutamatos y similares.

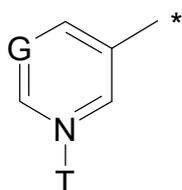
Las formas tautómeras se presentan, por ejemplo para el caso que R³ represente hidroxilo:



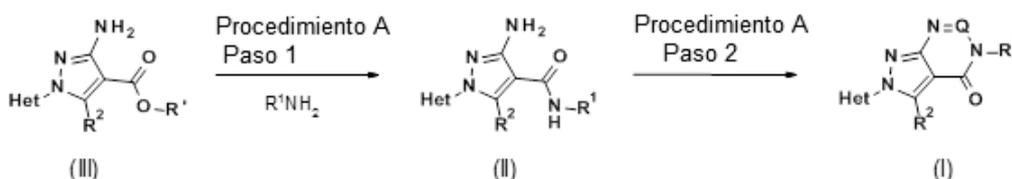
La invención, por lo tanto, se refiere tanto a los enantiómeros y diastereómeros puros, como también sus mezclas para combatir plagas animales en las que se incluyen artrópodos y en particular insectos.

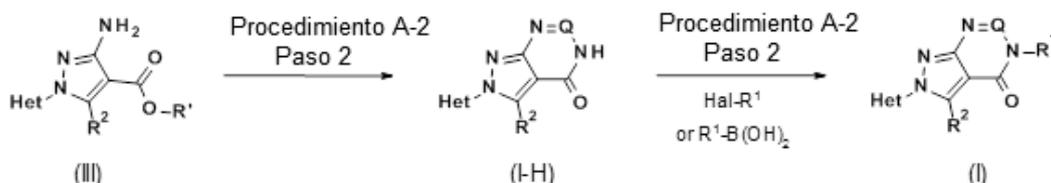
Además se ha encontrado que los nuevos compuestos de la fórmula (I) pueden prepararse de acuerdo con los procedimientos descritos a continuación.

Los compuestos de la fórmula (I) pueden prepararse a modo de ejemplo según el procedimiento A-1 y A-2 en dos pasos, como se representó en el siguiente esquema. Het representa en este y en los siguientes esquemas, salvo que del contexto resulta lo contrario, el resto

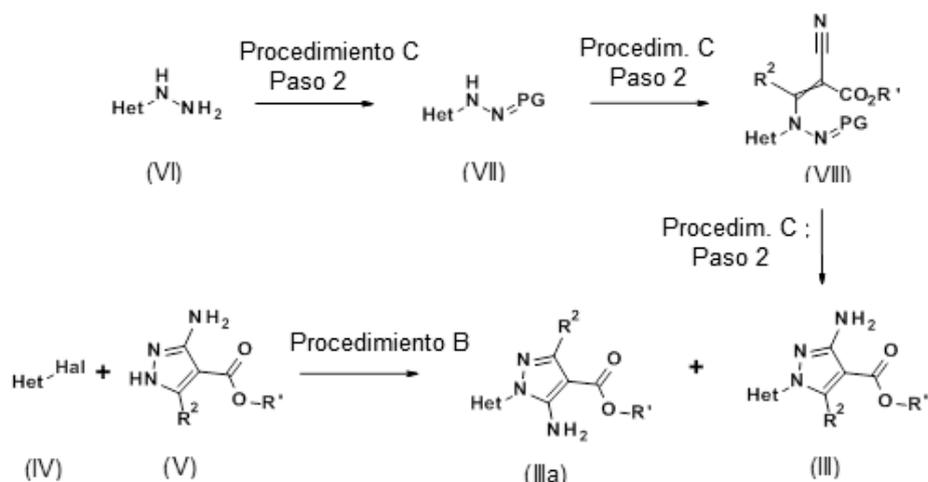


que está unido por medio del enlace identificado con el asterisco, con el nitrógeno del anillo pirazol.





Los aminopirazoles de la fórmula (III) requeridos para los procedimientos A-1 y A-2 pueden prepararse por ejemplo según los procedimientos B y C.



- 5 en el que het, Q, R¹ y R² tienen los significados antes indicados, R' representa hidrógeno o alquilo (en particular metilo y etilo), Hal representa halógeno (preferentemente cloro, bromo y yodo) y PG representa un grupo de protección adecuado.

Procedimiento A-1

10 Los compuestos de la fórmula (I) pueden sintetizarse en dos pasos usando procedimientos conocidos en la literatura.

En el primer paso de síntesis, pueden transformarse compuestos de la fórmula (III) según diferentes procedimientos en amidas de ácido carboxílico de las fórmulas (II). Para R' = alquilo, esta reacción puede producirse sin activación, (cf. B. M. Trost y I. Fleming en *Comprehensive Organic Synthesis*, Ed. Pergamon, 1991, Vol. 6). Alternativamente, se conocen de la literatura procedimientos de activación por medio de la formación de una amida de aluminio (véase T. Ooi y K. Marouka en *Science of Synthesis*, Ed. Georg Thieme, 2003, Vol. 7, 225-246). Estas amidas de aluminio pueden prepararse por ejemplo de las aminas o sus sales mediante la transformación con trimetilaluminio o su aducto estable al aire con 1,4-diazobiclo[2.2.3]octano (DABCO) (cf. S. Woodward en *Tet. Lett.* 2006, 47, 5767-5769).

20 En forma alternativa, los aminopirazoles de la fórmula (III), con R' = alquilo, en dos pasos pueden transformarse en las amidas de las fórmulas (II): primero saponificación en los carboxilatos, por ejemplo mediante la reacción con una base inorgánica (preferentemente lejías sódicas y de potasa cáustica), dado el caso en un disolvente orgánico inerte, dado el caso pueden prepararse y aislarse mediante la acidificación con un ácido diluido (p. ej., ácido clorhídrico acuoso) los ácidos carboxílicos de la fórmula (III) con R' = hidrógeno; la posterior reacción de amidación con la posterior reacción de amidación con las aminas deseadas produce los compuestos de la fórmula (II). Para el paso de amidación se han descrito numerosas condiciones de reacción, p. ej., G. Benz en *Comprehensive Organic Synthesis*, 1st Ed., Pergamon Press, Oxford, 1991, Vol. 6, S. 381-417; P.D. Bailey et al. en *Comprehensive Organic Functional Group Transformation*, 1st Ed., Elsevier Science Ltd., Oxford, 1995, Vol. 5, S. 257-308 y R.C. Larock en *Comprehensive Organic Transformations*, 2nd Ed., Wiley-VCH, New York, Weinheim, 1999, S. 1929-1994. Algunas de estas reacciones proceden a través de cloruros de carbonilo intermedios, que se pueden usar en forma aislada o después de haber sido generados in situ.

30 Las reacciones de amidación se efectúan opcionalmente en presencia de un agente de condensación, opcionalmente en presencia de un aceptor de ácido y opcionalmente en presencia de un disolvente.

Son agentes de condensación útiles todos los agentes de condensación que pueden usarse comúnmente para tales reacciones de amidación. Los ejemplos incluyen formadores de haluro de ácido tales como fosgeno, tricloruro de fósforo, cloruro de oxalilo o cloruro de tionilo; carbodiimidas tales como *N,N*-diciohexilcarbodiimida (DCC) y 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (EDCI), u otros agentes de condensación usuales, tales como pentóxido de fósforo, ácido polifosfórico, *N,N'*- carbonildiimidazol, 1-metoyoduro de 2-cloropiridina (reactivo de Mukaiyama), 2-etoxi-*N*-etoxicarbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), trifenilfosfina/tetracloruro de carbono, hexafluorofosfato de bromotripirrolidinofosfonio (BROP), hexafluorofosfato de *O*-(1*H*-benzotriazol-1-il)tris(dimetilamino)fosfonio (BOP), tetrafluoroborato de *N,N,N',N'*-bis(tetrametilen)cloruronio, hexafluorofosfato de *O*-(1*H*-benzotriazol-1-il)-*N,N,N',N'*-tetrametiluronio (HBTU), hexafluorofosfato de *O*-(1*H*-benzotriazol-1-il)-*N,N,N',N'*-bis(tetrametilen)uronio, tetrafluoroborato de *O*-(1*H*-benzotriazol-1-il)-*N,N,N',N'*-tetrametiluronio (TBTU), tetrafluoroborato *O*-(1*H*-benzotriazol-1-il)-*N,N,N',N'*-bis(tetrametilen)uronio, hexafluorofosfato de *O*-(7-azabenzotriazol-1-il)-*N,N,N',N'*-tetrametiluronio (HATU), 1-hidroxibenzotriazol (HOBt) y sal de 4-(4,6-dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il)-4-metilmorfolinio (DMT.MM), usualmente disponible como cloruro. Estos reactivos pueden ser usados por separado o, si es apropiado, en combinación.

Son aceptores de ácido útiles todas las bases inorgánicas u orgánicas usuales, por ejemplo trietilamina, diisopropilamina, *N*-metilmorfolina o *N,N* dimetilaminopiridina. El procedimiento A de acuerdo con la invención se lleva a cabo opcionalmente en presencia de un coadyuvante de la reacción adecuado, por ejemplo *N,N*-dimetilformamida o *N,N*-dimetilaminopiridina. Los disolventes o diluyentes útiles incluyen todos los disolventes orgánicos inertes, por ejemplo hidrocarburos alifáticos o aromáticos (tales como éter de petróleo, tolueno), hidrocarburos halogenados (tales como clorotolueno, diclorometano, cloroformo, 1,2-dicloroetano), éteres (tales como éter dietílico, dioxano, tetrahydrofurano, 1,2-dimetoxietano), ésteres (tales como acetato de etilo o de metilo), nitrohidrocarburos (tales como nitrometano, nitroetano, nitrobenzeno), nitrilos (tales como acetonitrilo, benzonitrilo), amidas (tales como *N,N*-dimetilformamida, *N,N*-dimetilacetamida, *N*-metilformanilida, *N*-metilpirrolidona, hexametilfosforamida), y también dimetilsulfóxido o agua o mezclas de los disolventes mencionados.

También es posible usar anhídridos mixtos para la preparación de compuestos de la fórmula (III) (véase J. Am. Chem. Soc. 1967, 5012). En este procedimiento, es posible usar diversos ésteres de ácido clorofórmico, por ejemplo cloroformiato de isobutilo y cloroformiato de isopropilo. Es igualmente posible para este propósito usar cloruro de dietilacetilo, cloruro de trimetilacetilo y similares.

En un segundo paso de síntesis, las carboxamidas de la fórmula (II) pueden ser cicladas a los compuestos de las fórmulas (I).

En el caso de que $Q = C-R^3$ en el que R^3 es H o alquilo, la ciclación de carboxamidas de la fórmula (II) se puede realizar con un ortoéster, tal como ortoformiato de trietilo u ortoacetato de trietilo, opcionalmente en presencia de un disolvente o diluyente (por ejemplo, en presencia de alcoholes tales como etanol, pero también en presencia de *N,N*-dimetilformamida o *N,N*-dimetilacetamida), opcionalmente en presencia de un ácido orgánico (por ejemplo ácido *p*-toluenosulfónico o ácido acético) o un ácido inorgánico (por ejemplo ácido clorhídrico o ácido sulfúrico) en cantidades catalíticas o estequiométricas o en exceso. Los ácidos mencionados también se pueden usar en lugar del disolvente o diluyente. En el caso de que $R^3 = H$, hay ejemplos de tales reacciones con ortoformiato de trietilo en Archiv der Pharmazie 2000, 333(8), 261-266 (para la preparación de quinazolinonas), J. het. Chem. 1990, 27(7), 1953-1956 (idem.), WO2010/54398 (para la preparación de pirazinopirimidinonas). En el caso de que $R^3 =$ metilo, véase, por ejemplo, el documento WO2010/100189 (para la preparación de quinazolinonas).

En el caso de que $Q = CR^3$ en el que R^3 es alquilo o haloalquilo, las pirazolopirimidinonas de la fórmula (I) se puede preparar también por reacción de las carboxamidas de la fórmula (II), respectivamente, con haluros de carbonilo o anhídridos de ácidos carboxílicos adecuados por procedimientos conocidos en la literatura, como se describe, por ejemplo, en el documento WO2009/143049 en el caso de que $R^3 =$ metilo y en el documento WO 2008/039489 en el caso de que $R^3 =$ trifluorometilo.

En el caso de que $Q = N$, las pirazolopirimidinonas de la fórmula (I) se pueden preparar por azodiazotización de las carboxamidas de la fórmula (II), respectivamente, por procedimientos conocidos de la literatura. Por ejemplo, los compuestos de la fórmula (II) se mezclan a 0 a 5 °C con una fuente de nitrito, tal como nitrito de sodio o nitrito de isobutilo, comúnmente en agua, alcohol o un disolvente polar inerte, y en presencia de un ácido orgánico o inorgánico. Ejemplos de condiciones de reacción se pueden encontrar en el documento WO 2004/242572 o en J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 1980, 633-638.

Procedimiento A-2

Las pirazolopirimidinonas *N*-sustituidas de la fórmula (I) con $Q = C-R^3$, en la que R^3 representa H o alquilo, pueden prepararse en dos pasos a partir de los aminopirazoles de la fórmula (III), transformándolos primero en intermedios de la fórmula (I-H) y estos se sustituyen entonces en el nitrógeno.

La transformación de los aminopirazoles de la fórmula (III) en pirazolopirimidinonas de la fórmula (I-H) es conocido en la literatura para $Q = C-H$, véase el documento US 2007/0281949, mediante la reacción con

acetato de formamidina en metoxietanol durante la noche bajo reflujo.

La N-sustitución de las pirazolopirimidinonas de la fórmula (I-H) puede efectuarse de diferente manera. Se conocen en la literatura las N-arilaciones de pirimidinonas mediante la reacción S_NAr con un sustrato de arilo adecuado, como p. ej., arilfluoruros activados mediante grupos nitro, nitrilo o trifluorometilo en presencia de una base y un disolvente orgánico inerte, véase ejemplos en el documento DE 4431218. Para diferentes compuestos arilo y hetarilo, la reacción se produce preferentemente mediante catálisis o intermediación de metales de transición. Se han descrito numerosas condiciones de reacción ejemplares, por ejemplo en el documento WO2007/146824. Preferentemente se usan como catalizadores cobre o sales de cobre, por ejemplo yoduro de cobre(I), óxido de cobre(I), triflato de cobre(I) o triflato de cobre(II), frecuentemente en presencia de un ligando, por ejemplo un ligando de diamina como *N,N*-dimetiletilendiamina, *N,N*-dimetiletilendiamina o *trans-N,N*-dimetil-1,2-ciclohexandiamina. Una sinopsis figura por ejemplo en Chem. Sci. 2010, Vol. 1, 13-31. Alternativamente pueden usarse 1,3-dicetonas, como p. ej., 2,4-pentandiona, 2,2,6,6-tetrametil-3,5-heptandiona o dibenzoilmetano, aminoácidos, como p. ej., L-prolina o glicina u otros compuestos como 8-hidroxiquinolina (Tetrahedron Lett. 2009, Vol. 50, 7293-7296), dibencilidenacetona, biperidina o fenantrolina. En general, la reacción se realiza en presencia de una base, con frecuencia bases de carbonato o fosfato, por ejemplo carbonato de potasio, carbonato de sodio, carbonato de cesio o fosfato de potasio, en disolventes adecuados, por ejemplo, dioxano, tolueno, sulfóxido de dimetilo o *N,N*-dimetilformamida. También es posible usar otros aditivos, por ejemplo, yoduro de potasio, fluoruro de cesio u otras sales.

Alternativamente, es posible llevar a cabo reacciones de este tipo bajo catálisis con paladio, por ejemplo, usando catalizadores tales como acetato de paladio, tetraquis(trifenilfosfina)paladio, cloruro de bis(trifenilfosfina)paladio (II), cloruro de tris(dibencilidenacetona)dipaladio (0) en presencia de ligandos, por ejemplo 2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftilo, 9,9-dimetil-4,5-bis-(difenilfosfino)xanteno, 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno, y bases, por ejemplo, carbonato de potasio, carbonato de sodio, carbonato de cesio o fosfato de potasio, en disolventes adecuados, por ejemplo dioxano, tolueno, sulfóxido de dimetilo o *N,N*-dimetilformamida.

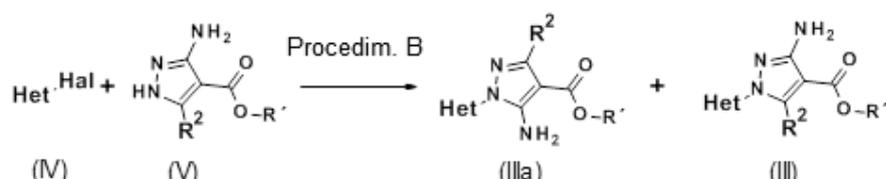
En general, los compuestos de la fórmula (I) se pueden preparar alternativamente por reacción de ácidos borónicos adecuados con las pirazolopirimidinonas de las fórmulas (I-H). En general, las reacciones tienen lugar bajo catálisis o mediación por sales de cobre (II), por ejemplo, acetato de cobre (II), triflato de cobre (II), o bien por sales de cobre (I), por ejemplo, cloruro de cobre (I), acetato de cobre (I), bajo una atmósfera de aire o de oxígeno, con frecuencia bajo condiciones de deshidratación (por ejemplo, en presencia de tamiz molecular). Las bases usadas son, por ejemplo, trietilamina, *N*-etil-diisopropilamina, piridina, 2,6-lutidina, *N*-metilmorfolina o 1,8-diazabicycloundec-7-eno en disolventes adecuados, por ejemplo, diclorometano, dicloroetano, metanol, *N,N*-dimetilformamida, tetrahydrofurano, dioxano, acetonitrilo, acetato de etilo o tolueno. La literatura describe numerosos ejemplos, incluyendo el documento WO 2008/062905 o el documento WO 2009/133970, que describen pirimidinonas. Pueden encontrarse recapitulaciones completas en Synthesis 2011, N° 6, 829-856 o en Tetrahedron 2012, vol. 68, 7735-7754. En lugar del ácido borónico, también es posible usar otros compuestos de boro, por ejemplo, trifluoroborato de potasio, ésteres borónicos, etc., o bien otros compuestos organometálicos, para ejemplo, estannanos, silanos o bismutanos.

Los aminopirazoles requeridos en los procedimientos A-1 y A-2 de las fórmulas (III) pueden prepararse por ejemplo según los procedimientos B y C.

Procedimiento B

Los aminopirazoles de las fórmulas (III) y (IIIa) pueden prepararse en un paso, por ejemplo mediante una reacción de Ullmann según procedimientos conocidos en principio (cf. Chem. Rev. 2008, 108, 3054-3131) de los correspondientes bromuros de la fórmula (IV) y los aminopirazoles de la fórmula (V).

En el documento WO2007/039146 se describen ejemplos de la arilación de aminopirazoles. Para las reacciones de este tipo se usan, por ejemplo, catalizadores a base de cobre (I) (por ejemplo, yoduro de cobre (I)), en presencia de una base (por ejemplo carbonato de potasio), y de un ligando (por ejemplo, *trans*-1,2-diaminociclohexano o *trans-N,N'*-dimetil-1,2-ciclohexanodiamina) o de una combinación de los mismos en un disolvente adecuado (por ejemplo, dioxano, *N,N*-dimetilformamida, *N,N*-dimetilacetamida o piridina) o de una combinación de disolventes. Para la reacción generalmente se requieren temperaturas de entre 80 y 180 °C.

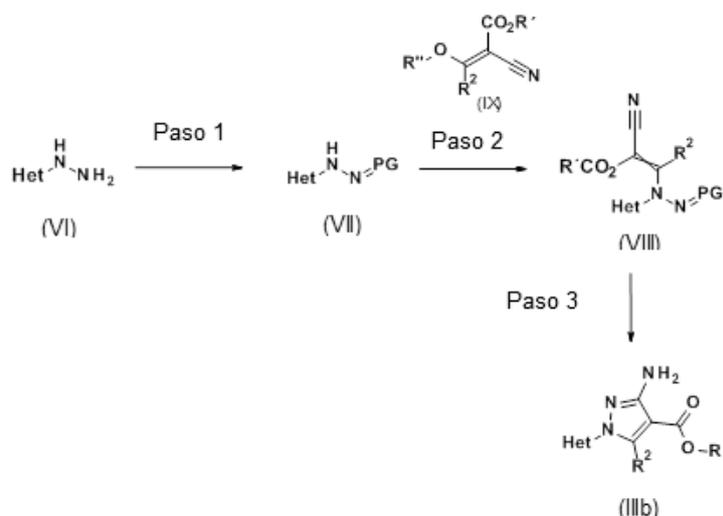


En la realización del procedimiento B de acuerdo con la invención, es posible usar cualquier aparato de microondas comercial adecuado para estas reacciones (por ejemplo, Anton Paar MonoWave 300, CEM Discover S, Biotage Initiator 60).

- 5 Los aminopirazoles de las fórmulas (IIIa) y (IIIb) preparados de esta manera se pueden separar, por ejemplo, por separación cromatográfica usando gel de sílice o RP(C-18), o por agitación o recristalización usando disolventes adecuados.

Procedimiento C

- 10 Alternativamente, los aminopirazoles de la fórmula (IIIa) se pueden preparar por procedimientos conocidos en principio a partir de hidrazinas de la fórmula (VI) o sales de las mismas (dándose preferencia a los clorhidratos) (cf. E. J. Med. Chem. 2011, 46, 3867-3876).



- 15 En el paso 1, la hidrazina de la fórmula (VI) se protege, por ejemplo por reacción con un aldehído (comúnmente benzaldehído, véase Biorg. Med. Chem. Let 2004, 14, 4585-4589), mediante la formación de una hidrazona de la fórmula (VII). El compuesto protegido de la fórmula (VII) puede hacerse reaccionar con un derivado ciano de la fórmula (IX) para dar compuestos de la fórmula (VIII) (cf. J. het. Chem. 1990, 27, 1805-1807), comúnmente en un disolvente orgánico inerte (por ejemplo, un alcohol) a una temperatura en el intervalo de 50 °C a 100 °C (paso 2). La reacción subsiguiente de los compuestos de la fórmula (VIII) con un ácido (por ejemplo, ácido clorhídrico) conduce al aminopirazol de la fórmula (IIIb) (paso 3).

Procedimientos generales para la oxidación de tioéteres en sulfóxidos y sulfonas

- 20 Los compuestos de la fórmula (I) en los que W representa SO (sulfóxido) o W representa SO₂ (sulfonas) pueden prepararse mediante oxidación según procedimientos conocidos en la literatura, a partir de compuestos de la fórmula (I), en los que W representa S (tioéteres), a modo de ejemplo mediante un agente de oxidación en un disolvente o diluyente adecuado. Como agentes de oxidación son adecuados, por ejemplo, ácido nítrico diluido, peróxido de hidrógeno, Oxone® y peroxiácidos carboxílicos, como por
- 25 ejemplo ácido *meta*-cloroperbenzoico. Como disolventes o bien diluyentes son adecuados disolventes orgánicos inertes, normalmente acetonitrilo y disolventes halogenados como diclorometano, cloroformo o dicloroetano, así como agua y alcoholes como metanol para la reacción con Oxone®.

- 30 También es posible la introducción de anilinas R¹-NH₂, halogenuros R¹-Hal o ácidos borónicos R¹-B(OH)₂ adecuados en los que W representa SO o SO₂, según el procedimiento A-1 o A-2. Estos pueden oxidarse a partir de los correspondientes precursores en los que W representa S, de acuerdo con procedimientos conocidos en la literatura, como por ejemplo se ha descrito en el documento WO 2013/092350.

- 35 Para la producción de sulfóxidos enriquecidos enantioméricamente son apropiados una multiplicidad de métodos, como descritos por A.R. Maguire en ARKIVOC, 2011(i), 1-110, : oxidaciones asimétricas catalizadas por metales de tioéteres, por ejemplo con titanio y vanadio como fuentes de catalizadores más usuales, en forma de Ti(OiPr)₄ y VO(acac)₂, junto con un ligando quiral y un agente de oxidación

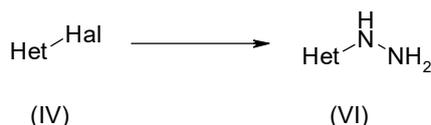
como peróxido de *tert*-butilhidrógeno (TBHP), 2-fenilpropan-2-ilhidroperóxido (CHP) o peróxido de hidrógeno; oxidaciones asimétricas catalizadas sin metales mediante el uso de agentes de oxidación quirales o catalizadores quirales; oxidaciones asimétricas biológicas o electroquímicas así como resolución cinética de sulfóxidos y sustitución nucleofílica (según el procedimiento de Andersen).

- 5 Los enantiómeros también pueden obtenerse de un racemato, a modo de ejemplo mediante separación preparativa mediante una HPLC quiral.

Explicación de las sustancias de partida e intermedios

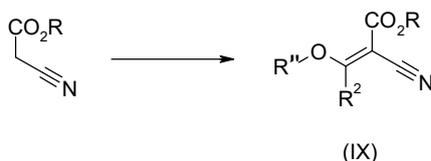
10 Los **halogenuros de la fórmula (IV)** (preferentemente cloruros, bromuros y yoduros) están comercialmente disponibles y pueden ser sintetizados por procedimientos conocidos de la literatura; véase, por ejemplo, Y. Yamamoto, *Heterocycles* 1981, 16 (7), 1161-1164, para 3-yodopiridina (Hal = yodo); S. M. E. Englert, *J. Amer. Chem. Soc.* 1929, 51(3), 863-866, para 3-bromopiridina (Hal = bromo); D. E. Pearson, *J. Org. Chem.* 1961, 26, 789-792, y para 3-cloropiridina (Hal = cloro); WO 2006/074884 para 3-bromo-5-fluoropiridina y M. Schlosser, *Eur. J. Org. Chem.* 2002, 24, 4174-4180, para 3-fluoro-5-yodopiridina.

15 Las **hidrazinas heterocíclicas** de la fórmula (VI) están disponibles comercialmente o se pueden preparar por procedimientos conocidos de la literatura a partir de los haluros correspondientes de la fórmula (IV), como se describe, por ejemplo, en el documento WO 2010/015849 para diversos heterociclos: por reacción con hidrato de hidrazina, opcionalmente en un disolvente orgánico inerte (por ejemplo, etanol), a temperaturas en el intervalo de 60 a 120 °C; o por reacción con dicarbonato de hidrazodicarboxilato de di-*tert*-butilo y posterior escisión de los grupos *tert*-butilo carboxilato por adición de un ácido (comúnmente ácido clorhídrico en un disolvente orgánico, por ejemplo dioxano; también con ácido trifluoroacético), que conduce a la formación de las sales correspondientes.



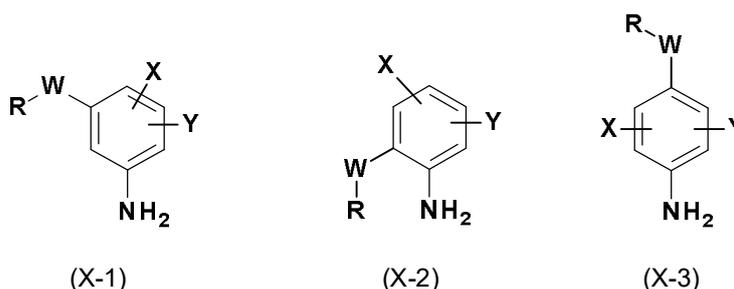
Pueden obtenerse comercialmente, p. ej., las siguientes hidrazinas de la fórmula (VI): 3-hidrazinilpiridina, 5-hidrazinilpirimidina.

25 Los **compuestos ciano de la fórmula (IX)** pueden prepararse a partir de alquiléster de ácido cianoacético (preferentemente –metiléster y –etiléster) de acuerdo con procedimientos conocidos en la literatura.



30 Se encuentran disponibles en el mercado, p. ej., 2-ciano-3-etoxiacrilato de etilo (R = R'' = etilo; R² = hidrógeno), 2-ciano-3-etoxibut-2-enoato de etilo –también denominado etil-2-ciano-3-etoxicrotona - (R = R'' = etilo; R² = metilo), (2E)-2-cian-3-etoxipent-2-enoato de etilo (R = R'' = R² = etilo). Para otros grupos alquilo, la síntesis de los compuestos ciano de la fórmula (IX) puede efectuarse según el procedimientos descrito en *J. Amer. Chem. Soc.* 1956, 75, 5294-5299. Esta prevé la transformación de los correspondientes ortoésteres (p. ej., trietiléster de ácido ortopropiónico para R² = propilo) con un alquiléster de ácido cianoacético a temperaturas más elevadas.

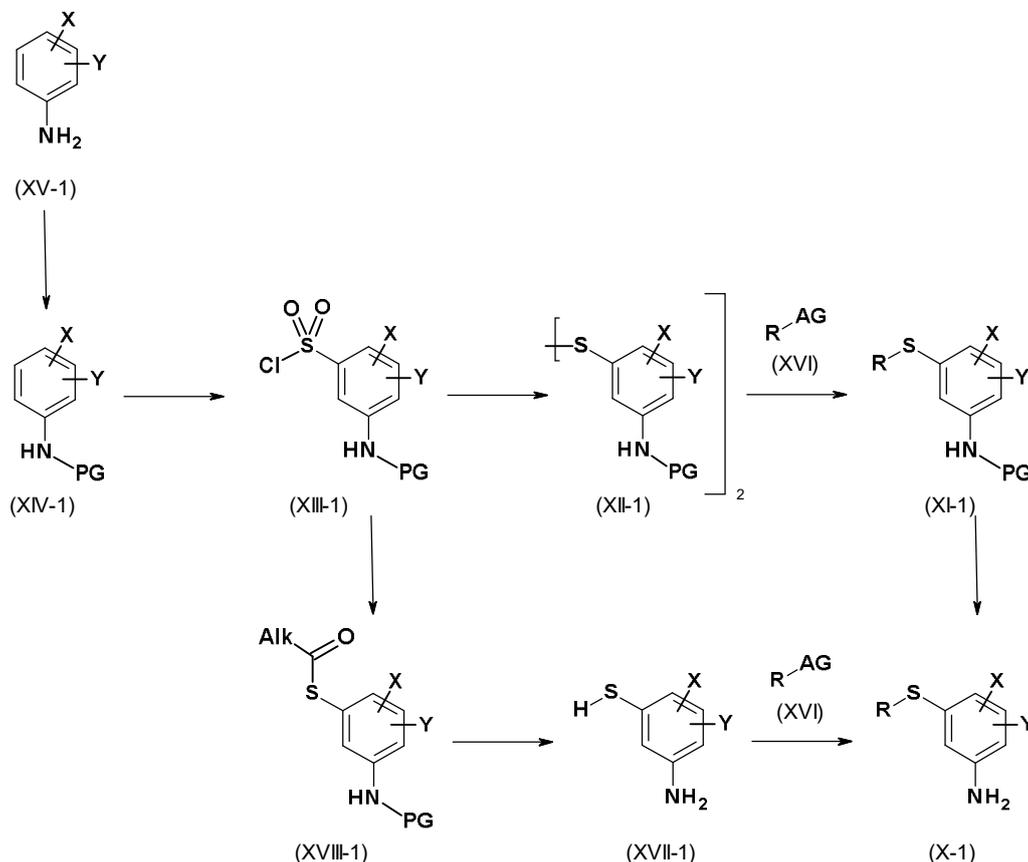
35 Las **anilinas de la fórmula R¹-NH₂** están disponibles en el mercado o pueden prepararse según procedimientos conocidos en la literatura. Pueden subdividirse en compuestos de la fórmula (X-1), (X-2) y (X-3).



Las anilinas de la fórmula (X-1) son conocidas en la literatura, p. ej., del documento JP 2007/284356, o

pueden sintetizarse mediante procedimientos conocidos en la literatura, en particular según las condiciones indicadas en los ejemplos de preparación. De manera análoga pueden sintetizarse anilinas de la fórmula (X-2) y (X-3).

5 Las anilinas de la fórmula (X-1) en los que W representa S, a modo de ejemplo pueden prepararse preferentemente como se muestra en el siguiente esquema.

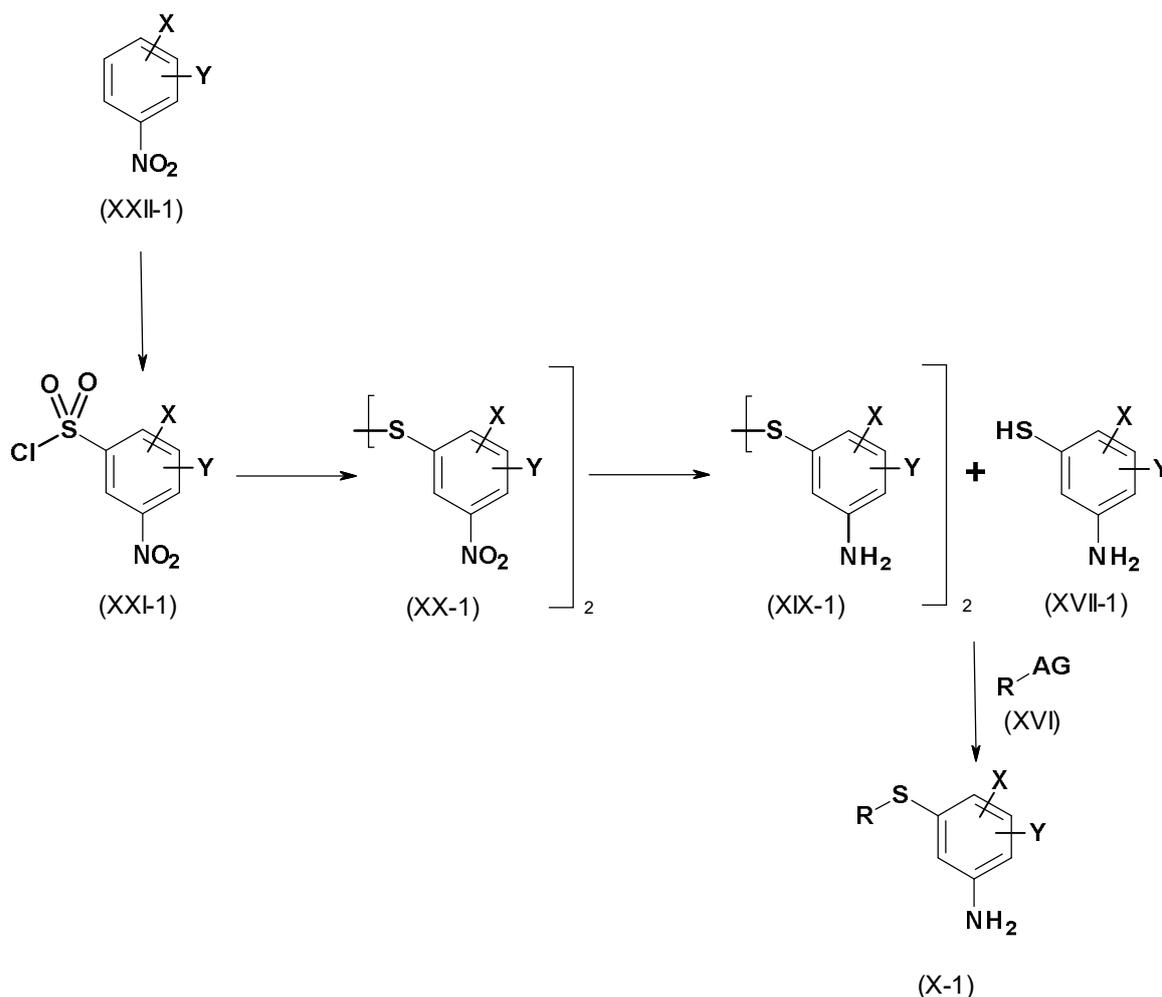


en el que X e Y tienen los significados antes indicados, AG representa un grupo saliente y PG representa un grupo de protección.

10 Las anilinas de la fórmula (XV-1) ya sea que estén disponibles comercialmente o pueden prepararse según procedimientos conocidos. Pueden protegerse con un grupo de protección adecuado, como p. ej., un grupo acetilo, para dar compuestos de la fórmula (XIV-1). Por ejemplo en presencia de ácidos, anhídridos ácidos o cloruros ácidos, las anilinas (XV-1) pueden transformarse en las correspondientes anilidas (XIV-1). La clorosulfonación de las anilinas protegidas (XIV-1) con ácido clorosulfónico provee los correspondientes cloruros de sulfonilo (XIII-1). La reducción de los cloruros de sulfonilo (XIII-1) en los disulfuros (XII-1) es posible mediante procedimientos conocidos en la literatura como por ejemplo hierro en ácido clorhídrico o yoduro. La transformación de los disulfuros (XII-1) con haloalquilo electrófilos de la fórmula (XVI), donde AG representa un grupo saliente como por ejemplo cloro, bromo, tosilo, mesilato o triflato, provee los sulfuros (XI-1). El grupo de protección puede escindirse mediante métodos adecuados conocidos en la literatura, de modo que se obtienen anilinas de la fórmula (X-1).

20 En lugar de la reducción para obtener el disulfuro (XII-1), se puede reducir el cloruro de sulfonilo (XIII-1) con un agente de reducción adecuado como por ejemplo yodo / fósforo para dar alquiltioato (XVIII-1) y a continuación realizar la desprotección mediante un método adecuado, como por ejemplo la reacción con solución de hidróxido de potasio, para obtener los tioles de la fórmula (XVII-1). La transformación de los tioles (XVII-1) con haloalquilo electrófilos de la fórmula (XVI) provee los sulfuros (X-1).

25 Asimismo, los tioéteres de la fórmula (X-1) preferentemente pueden prepararse de acuerdo con el siguiente esquema,



en el que X e Y tienen los significados antes indicados, AG representa un grupo saliente y PG representa un grupo de protección.

- Die clorosulfonación de los nitroaromáticos de la fórmula (XXII-1) con ácido clorosulfónico provee los correspondientes cloruros de sulfonilo (XXI-1). La reducción de los cloruros de sulfonilo (XXI-1) en los disulfuros de bis(nitroarilo) (XX-1) es posible con métodos conocidos en la literatura, como por ejemplo yoduro. La reducción de los disulfuros (XX-1) en las disulfanodiildianilinas (XIX-1), que en parte se forman como mezcla con los correspondientes aminoariltioles (XVII-1), es posible con agentes de reducción conocidos en general, como por ejemplo hidrógeno, dado el caso con ayuda de catalizadores heterogéneos, como por ejemplo níquel Raney, platino sobre carbón activado o paladio sobre carbón activado. La transformación de los disulfuros (XIX-1) o bien tiofenoles (XVII-1) con haloalquilo electrófilos de la fórmula (XVI) en la que AG representa un grupo saliente como por ejemplo cloro, bromo, yodo, tosilato, mesilato o triflato, provee las anilinas de la fórmula (X-1).

Isómeros

- Los compuestos de la fórmula (I) pueden eventualmente dependiendo del tipo de sustituyentes presentarse como isómeros geométricos y/o como isómeros ópticamente activos o en forma de correspondientes mezclas isoméricas en diferente composición. Estos estereoisómeros son por ejemplo enantiómeros, diaestereómeros, atropisómeros o isómeros geométricos. La invención se refiere tanto a los isómeros puros como a las mezclas isoméricas.

20 Procedimientos y usos

La invención se refiere también a procedimientos para combatir parásitos animales en los que se deja actuar compuestos de la fórmula (I) sobre parásitos animales y/o su hábitat. Preferentemente se combate los parásitos animales en la agricultura y la silvicultura y en la protección de materiales. Aquí

preferentemente se excluyen los procedimientos para el tratamiento quirúrgico o terapéutico del cuerpo humano o animal y procedimientos de diagnóstico que se realizan en el cuerpo humano o animal.

La invención se refiere además al uso de los compuestos de la fórmula (I) como agentes para combatir parásitos de plantas, en particular agentes fitoprotectores.

- 5 En el marco de la presente solicitud, el concepto agentes plaguicidas también incluye siempre el concepto agentes fitoprotectores.

Los compuestos de la fórmula (I) resultan apropiados en cuanto a la buena compatibilidad con plantas, adecuada toxicidad en relación a animales de sangre caliente y buena compatibilidad con el medio ambiente para la protección de plantas y órganos de plantas, para el aumento del rendimiento de la cosecha, el mejoramiento de la calidad del fruto de la cosecha y para combatir los parásitos animales, especialmente insectos, arácnidos, helmintos, nematodos y moluscos que existen en la agricultura, la horticultura, la cría de animales, en bosques y elementos de ocio, en la protección de materiales y acopio así como en el sector de la higiene. Preferentemente pueden usarse como agentes para combatir parásitos. Son efectivos contra especies de sensibilidad normal y resistentes, así como contra todos o algunos de los estadios de desarrollo. Se incluyen en los parásitos antes mencionados:

Parásitos de la cepa de los artrópodos, en particular de la clase de los **arácnidos** p. ej., *Acarus* spp., p. ej., *Acarus siro*, *Aceria kuko*, *Aceria sheldoni*, *Aculops* spp., *Aculus* spp., p. ej., *Aculus fockeui*, *Aculus schlechtendali*, *Amblyomma* spp., *AmphiTetranychus viennensis*, *Argas* spp., *Boophilus* spp., *Brevipalpus* spp., p. ej., *Brevipalpus phoenicis*, *Bryobia graminum*, *Bryobia praetiosa*, *Centruroides* spp., *Choriopetes* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Dermatophagoides pteronyssinus*, *Dermatophagoides farinae*, *Dermacentor* spp., *EoTetranychus* spp., p. ej., *EoTetranychus hicoriae*, *Epitrimerus piri*, *EuTetranychus* spp., p. ej., *EuTetranychus banksi*, *Eriophyes* spp., p. ej., *Eriophyes piri*, *Glycyphagus domesticus*, *Halotydeus destructor*, *Hemitarsonemus* spp., p. ej., *Hemitarsonemus latus* (=poliphagotarsonemus latus), *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Latrodectus* spp., *Loxosceles* spp., *Neutrombicula autumnalis*, *Nuphessa* spp., *Oligonychus* spp., p. ej., *Oligonychus coniferarum*, *Oligonychus ilicis*, *Oligonychus indicus*, *Oligonychus mangiferus*, *Oligonychus pratensis*, *Oligonychus punicae*, *Oligonychus yothersi*, *Ornithodoros* spp., *Ornithonyssus* spp., *Panonychus* spp., p. ej., *Panonychus citri* (=MetaTetranychus citri), *Panonychus ulmi* (=MetaTetranychus ulmi), *Phillocoptuta oleivora*, *Platytetranychus multidigituli*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psoroptes* spp., *Rhipicephalus* spp., *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., *Scorpio maurus*, *Steneotarsonemus* spp., *Steneotarsonemus spinki*, *Tarsonemus* spp., p. ej., *Tarsonemus confusus*, *Tarsonemus pallidus*, *Tetranychus* spp., p. ej., *Tetranychus canadensis*, *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus turkestani*, *Tetranychus urticae*, *Trombicula alfreddugesi*, *Vaejovis* spp., *Vasates lycopersici*;

de la clase de los **quilópodos** p. ej., *Geophilus* spp., *Scutigera* spp.;

35 del orden o de la clase de los **Collembola** p. ej., *Onychiurus armatus*; *Sminthurus viridis*;

de la clase de los **diplópodos** p. ej., *Blaniulus guttulatus*;

de la clase de los **insectos**, p. ej., del orden **de los Blattodea** p. ej., *Blatta orientalis*, *Blattella asahinai*, *Blattella germanica*, *Leucophaea maderae*, *Pancloroa* spp., *Pancoblatta* spp., *Periplaneta* spp., p. ej., *Periplaneta americana*, *Periplaneta australasiae*, *Supella longipalpa*;

40 del orden **de los coleópteros** p. ej., *Acalymma vittatum*, *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus* spp., *Agelastica alni*, *Agriotes* spp., p. ej., *Agriotes linneatus*, *Agriotes mancus*, *Alphitobius diaperinus*, *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora* spp., *Anthonomus* spp., p. ej., *Anthonomus grandis*, *antrenus* spp., *Apion* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp., p. ej., *Atomaria linearis*, *Attagenus* spp., *Baris caerulescens*, *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., p. ej., *Bruchus pisorum*, *Bruchus rufimanus*, *Cassida* spp., *Cerotoma trifurcata*, *Ceutorrhynchus* spp., p. ej., *Ceutorrhynchus assimilis*, *Ceutorrhynchus quadridens*, *Ceutorrhynchus rapae*, *Chaetocnema* spp., p. ej., *Chaetocnema confinis*, *Chaetocnema denticulata*, *Chaetocnema ectypa*, *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp., p. ej., *Cosmopolites sordidus*, *Costelytra zealandica*, *Ctenicera* spp., *Curculio* spp., p. ej., *Curculio caryae*, *Curculio caryatrypes*, *Curculio obtusus*, *Curculio sayi*, *Cryptolestes ferrugineus*, *Cryptolestes pusillus*, *Cryptorhynchus lapathi*, *Cryptorhynchus mangiferae*, *Cilindrocopturus* spp., *Cilindrocopturus adpersus*, *Cilindrocopturus furnissi*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., p. ej., *Diabrotica balteata*, *Diabrotica barberi*, *Diabrotica yecimpunctata howardi*, *Diabrotica yecimpunctata yecimpunctata*, *Diabrotica virgifera virgifera*, *Diabrotica virgifera zeae*, *Dichocrocis* spp., *Di cladispa armigera*, *Diloboderus* spp., *Epilachna* spp., p. ej., *Epilachna borealis*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix* spp., p. ej., *Epitrix cucumeris*, *Epitrix fuscula*, *Epitrix hirtipennis*, *Epitrix subcrinita*, *Epitrix tuberis*, *Faustinus* spp., *Gibbium psilloides*, *Gnathocerus cornutus*, *Hellula yalis*, *heteronychus arator*, *heteronyx* spp., *Hilamorpha elegans*, *Hilotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypomeces*

squamosus, Hypothenemus spp., p. ej., Hypothenemus hampei, Hypothenemus obscurus, Hypothenemus pubescens, Lachnosterna consanguinea, Lasyodoerma serricorne, Latheticus oryzae, Lathridius spp., Lema spp., Leptinotarsa decemlineata, Leucoptera spp., p. ej., Leucoptera coffeella, Lissorhoptrus oryzophilus, Lixus spp., Luperomorpha xanthoderata, Luperodes spp., Lyctus spp., Megascelis spp., Melanotus spp., p. ej., Melanotus longulus oregonensis, Meligethes aeneus, Melolontha spp., p. ej., Melolontha melolontha, Migdolus spp., Monochamus spp., Naupactus xanthographus, Necrobia spp., Niptus hololeucus, Oryctes rhinoceros, Oryzaephilus surinamensis, Oryzaphagus oryzae, Otiorynchus spp., p. ej., Otiorynchus cribricollis, Otiorynchus ligustici, Otiorynchus ovatus, Otiorynchus rugosostriatus, Otiorynchus sulcatus, Oxycetonia jucunda, Phaedon cochleariae, Phillophaga spp., Phillophaga helleri, Phyllotreta spp., p. ej., Phyllotreta armoraciae, Phyllotreta pusilla, Phyllotreta ramosa, Phyllotreta striolata, Popillia japonica, Premnotrypes spp., Prostophanus truncatus, Psillyodoe spp., p. ej., Psillyodoe affinis, Psillyodoe chrysocephala, Psillyodoe punctulata, Ptinus spp., Rhizobius ventralis, Rhizopertha dominica, Sitophilus spp., p. ej., Sitophilus granarius, Sitophilus linearis, Sitophilus oryzae, Sitophilus zeamais, Sfenophorus spp., Stegobium paniceum, Sternechus spp., p. ej., Sternechus paludatus, Symphiletes spp., Tanymecus spp., p. ej., Tanymecus dilaticollis, Tanymecus indicus, Tanymecus palliatus, Tenebrio molitor, Tenebrioides mauretanicus, tribolium spp., p. ej., tribolium audax, tribolium castaneum, tribolium confusum, Trogoderma spp., Tychius spp., Xilotrechus spp., Zabrus spp., p. ej., Zabrus tenebrioides;

del orden **de los dípteros** p. ej., Aedes spp., p. ej., Aedes aegypti, Aedes albopictus, Aedes sticticus, Aedes vexans, Agromyza spp., p. ej., Agromyza frontella, Agromyza parvicornis, Anastrepha spp., Anopheles spp., p. ej., Anopheles quadrimaculatus, Anopheles gambiae, Asphondilia spp., Bactrocera spp., p. ej., Bactrocera cucurbitae, Bactrocera dorsalis, Bactrocera oleae, Bibio hortulanus, Calliphora erythrocephala, Calliphora vicina, Ceratitis capitata, Chironomus spp., Chrysomya spp., Chrysops spp., Chrysozona pluvialis, Cochliomya spp., Contarinia spp., p. ej., Contarinia johnsoni, Contarinia nasturtii, Contarinia pivora, Contarinia schulzi, Contarinia sorghicola, Contarinia tritici, Cordilobia anthropophaga, Cricotopus silvestris, Culex spp., p. ej., Culex pipiens, Culex quinquefasciatus, Culicoides spp., Culiseta spp., Cuterebra spp., Dacus oleae, Dasineura spp., p. ej., Dasineura brassicae, Delia spp., p. ej., Delia antiqua, Delia coarctata, Delia florilega, Delia platura, Delia radicum, Dermatobia hominis, Drosophila spp., p. ej., Drosophila melanogaster, Drosophila suzukii, Equinocnemus spp., Fannia spp., Gasterophilus spp., Glossina spp., Haematopota spp., hidrellia spp., hidrellia griseola, Hilemya spp., Hippobosca spp., Hypoderma spp., Liriomyza spp., p. ej., Liriomyza brassicae, Liriomyza huidobrensis, Liriomyza sativae, Lucilia spp., p. ej., Lucilia cuprina, Lutzomyia spp., Mansonia spp., Musca spp., p. ej., Musca domestica, Musca domestica vicina, Oestrus spp., Oscinella frit, Paratanytarsus spp., Paralauterborniella subcincta, Pegomya spp., p. ej., Pegomya betae, Pegomya hyoscyami, Pegomya rubivora, Phlebotomus spp., Phorbia spp., Phormia spp., Piophilidae, Prodiptosis spp., Psila rosae, Rhagoletis spp., p. ej., Rhagoletis cingulata, Rhagoletis completa, Rhagoletis fausta, Rhagoletis indifferens, Rhagoletis mendax, Rhagoletis pomonella, Sarcophaga spp., Simulium spp., p. ej., Simulium meridionale, Stomoxys spp., Tabanus spp., Tetanops spp., Tipula spp., p. ej., Tipula paludosa, Tipula simplex;

del orden **de los hemipteros** p. ej., Acizzia acaciaebaileyanae, Acizzia dodonaeae, Acizzia uncatoides, Acrida turrita, Acyrthosiphon spp., p. ej., Acyrthosiphon pisum, Acrogonia spp., Aeneolamia spp., Agonosceana spp., Aleyrodes proletella, Aleurolobus barodensis, Aleurothrixus floccosus, Allocaridara malayensis, Amrasca spp., p. ej., Amrasca bigutulla, Amrasca devastans, Anuraphis cardui, Aonidiella spp., p. ej., Aonidiella aurantii, Aonidiella citrina, Aonidiella inornata, Aphanostigma piri, Aphis spp., p. ej., Aphis craccivora, Aphis fabae, Aphis forbesi, Aphis glycines, Aphis gossypii, Aphis hederiae, Aphis illinoisensis, Aphis middletoni, Aphis nasturtii, Aphis nerii, Aphis pomi, Aphis spiraeicola, Aphis viburniphila, Arboridia apicalis, Arytainilla spp., Aspidiella spp., Aspidiotus spp., p. ej., Aspidiotus nerii, Atanus spp., Aulacorthum solani, Bemisia tabaci, Blastopsilla occidentalis, Boreioglycaspis melaleuciae, Brachycaudus helichrysi, Brachycolus spp., Brevicoryne brassicae, Cacopsilla spp., p. ej., Cacopsilla piricola, Calligypona marginata, Carneoccephala fulgida, Ceratovacuna lanigera, Cercopidae, Ceroplastes spp., Chaetosiphon fragaefolii, Chionaspis tegalensis, cloroita onukii, Chondracris rosea, Chromaphis juglandicola, Chrysomphalus ficus, Cicadulina mbila, Coccomytilus halli, Coccus spp., p. ej., Coccus hesperidum, Coccus longulus, Coccus pseudomagnoliarum, Coccus viridis, Cryptomyzus ribis, Cryptoneossa spp., Ctenarytaina spp., Dalbulus spp., Dialeurodes citri, Diaphorina citri, Diaspis spp., Drosicha spp., Dysaphis spp., p. ej., Dysaphis apiifolia, Dysaphis plantaginea, Dysaphis tulipae, Dysmicoccus spp., Empoasca spp., p. ej., Empoasca abrupta, Empoasca fabae, Empoasca maligna, Empoasca solana, Empoasca stevensi, Eriosoma spp., p. ej., Eriosoma americanum, Eriosoma lanigerum, Eriosoma piricola, Erythronura spp., Eucalyptolygma spp., Euphillura spp., Euscelis bilobatus, Ferrisia spp., Geococcus coffeae, Glycaspis spp., heteropsilla cubana, heteropsilla spinulosa, Homalodisca coagulata, Hyalopterus arundinis, Hyalopterus pruni, Icerya spp., p. ej., Icerya purchasi, Idiocerus spp., Idioscopus spp., Laodelphax striatellus, Lecanium spp., p. ej., Lecanium corni (=Parthenolecanium corni), Lepidosaphes spp., p. ej., Lepidosaphes ulmi, Lipaphis erysimi, Macrosiphum spp., p. ej., Macrosiphum euphorbiae, Macrosiphum lili, Macrosiphum rosae, Macrosteles facifrons, Mahanarva spp., Melanaphis sacchari, Metcalfiella spp., Metopolophium dirhodum, Monellia costalis, Monelliopsis pecanica, Myzus spp., p. ej., Myzus ascalonicus, Myzus cerasi, Myzus ligustri, Myzus ornatus, Myzus persicae, Myzus nicotiana, Nasonovia ribisnigri, Nephrotettix spp., p. ej., Nephrotettix cincticeps, Nephrotettix nigropictus, Nilaparvata lugens, Oncometopia spp., Orthezia praelonga, Oxya chinensis, Pachypsilla spp., Parabemisia myricae, Paratrioza spp., p. ej., Paratrioza cockerelli, Parlatoria spp., Pemphigus spp., p. ej., Pemphigus bursarius, Pemphigus populivivae, Peregrinus maidis, fenacoccus spp., p. ej., fenacoccus madeirensis, Phloeomyzus passerinii,

Phorodon humuli, Phylloxera spp., p. ej., Phylloxera devastatrix, Phylloxera notabilis, Pinnaspis aspidistrae, Planococcus spp., p. ej., Planococcus citri, Prosopidopsilla flava, Protopulvinaria piriformis, Pseudaulacaspis pentagona, Pseudococcus spp., p. ej., Pseudococcus calceolariae, Pseudococcus comstocki, Pseudococcus longispinus, Pseudococcus maritimus, Pseudococcus viburni, Psilopsis spp., Psilla spp., p. ej., Psilla buxi, Psilla mali, Psilla piri, Pteromalus spp., pirilla spp., Quadraspidiotus spp., p. ej., Quadraspidiotus juglansregiae, Quadraspidiotus ostreaeformis, Quadraspidiotus perniciosus, Quesada gigas, Rastrococcus spp., Rhopalosiphum spp., p. ej., Rhopalosiphum maidis, Rhopalosiphum oxianthae, Rhopalosiphum padi, Rhopalosiphum rufiabdominale, Saissetia spp., p. ej., Saissetia coffeae, Saissetia miranda, Saissetia neglecta, Saissetia oleae, Scaphoideus titanus, Schizaphis graminum, Selenaspis articulatus, Sitobion avenae, Sogatata spp., Sogatella furcifera, Sogatodes spp., Stictocephala festina, Siphoninus phillyreae, Tenalaphara malayensis, tetragonocephala spp., Tinocallis caryaefoliae, Tomaspis spp., Toxoptera spp., p. ej., Toxoptera aurantii, Toxoptera citricidus, trialeurodes vaporariorum, trioza spp., p. ej., trioza diospiri, Typhlocyba spp., Unaspis spp., Viteus vitifolii, Zyginia spp.;

del suborden **de los heterópteros** p. ej., Anasa tristis, Antestiopsis spp., Boisea spp., Blissus spp., Calocoris spp., Campilomma livida, Cavelerius spp., Cimex spp., p. ej., Cimex adjunctus, Cimex hemipterus, Cimex lectularius, Cimex pilosellus, Collaria spp., Creontiades dilutus, Dasynus piperis, Dichelops furcatus, Diconocoris hewetti, Dysdercus spp., Euschistus spp., p. ej., Euschistus heros, Euschistus servus, Euschistus tristigmus, Euschistus variolarius, Eurygaster spp., Halyomorpha halys, Heliopeltis spp., Horcias nobillellus, Leptocoris spp., Leptocoris varicornis, Leptoglossus occidentalis, Leptoglossus phillopus, Lygocoris spp., p. ej., Lygocoris pabulinus, Lygus spp., p. ej., Lygus elisus, Lygus hesperus, Lygus lineolaris, Macropis excavatus, Monalonion atratum, Nezara spp., p. ej., Nezara viridula, Oebalus spp., Piesma quadrata, Piezodorus spp., p. ej., Piezodorus guildinii, Psallus spp., Pseudacysta perseae, Rhodnius spp., Sahlbergella singularis, Scaptocoris castanea, Scotinophora spp., Stephanitis nashi, Tibraca spp., Triatoma spp.;

del orden **de los himenópteros** p. ej., Acromyrmex spp., Athalia spp., p. ej., Athalia rosae, Atta spp., Diprion spp., p. ej., Diprion similis, Hoplocampa spp., p. ej., Hoplocampa cookei, Hoplocampa testudinea, Lasius spp., Monomorium pharaonis, Sirex spp., Solenopsis invicta, Tapinoma spp., Urocerus spp., Vespa spp., p. ej., Vespa crabro, Xeris spp.;

del orden **de los isópodos** p. ej., Armadillidium vulgare, Oniscus asellus, Porcellio scaber;

del orden **de los isópteros** p. ej., Coptotermes spp., p. ej., Coptotermes formosanus, Cornitermes cumulans, Cryptotermes spp., Incisitermes spp., Microtermes obesi, Odontotermes spp., Reticulitermes spp., p. ej., Reticulitermes flavipes, Reticulitermes hesperus;

del orden **de los lepidópteros** p. ej., Achroia grisella, Acronicta major, Adoxophyes spp., p. ej., Adoxophyes orana, Aedia leucomelas, Agrotis spp., p. ej., Agrotis segetum, Agrotis ipsilon, Alabama spp., p. ej., Alabama argillacea, Amyelois transitella, Anarsia spp., Anticarsia spp., p. ej., Anticarsia gemmatalis, Argyroploce spp., Barathra brassicae, Borbo cinnara, Bucculatrix thurberiella, Bupalus piniarius, Busseola spp., Cacoecia spp., Caloptilia theivora, Capua reticulana, Carpocapsa pomonella, Carposina niponensis, Cheimantobia brumata, Chilo spp., p. ej., Chilo plejadellus, Chilo suppressalis, Choristoneura spp., Clysia ambiguella, Cnaphalocerus spp., Cnaphalocrocis medinalis, Cnephasia spp., Conopomorpha spp., Conotrachelus spp., Copitarsia spp., Cydia spp., p. ej., Cydia nigricana, Cydia pomonella, Dalaca noctuides, Diaphania spp., Diatraea saccharalis, Earias spp., Ecdytolopa aurantium, Elasmopalpus lignosellus, Eldana saccharina, Ephestia spp., p. ej., Ephestia elutella, Ephestia kuehniella, Epinotia spp., Epiphyas postvittana, Etiella spp., Eulia spp., Eupoecilia ambiguella, Euproctis spp., p. ej., Euproctis chrysorrhoea, Euxoa spp., Feltia spp., Galleria mellonella, Gracillaria spp., Grapholitha spp., p. ej., Grapholita molesta, Grapholita prunivora, Hedilepta spp., Helicoverpa spp., p. ej., Helicoverpa armigera, Helicoverpa zea, Heliiothis spp., p. ej., Heliiothis virescens Hofmannophila pseudospretella, Homoeosoma spp., Homona spp., Hyponomeuta padella, Kakivoria flavofasciata, Laphygma spp., Leucinodes orbonalis, Leucoptera spp., p. ej., Leucoptera coffeella, Lithocolletis spp., p. ej., Lithocolletis blancardella, Lithophane antennata, Lobesia spp., p. ej., Lobesia botrana, Loxagrotis albicosta, Lymantria spp., p. ej., Lymantria dispar, Lyonetia spp., p. ej., Lyonetia clerkella, Malacosoma neustria, Maruca testulalis, Mamestra brassicae, Melanitis leda, Mocis spp., Monopis obviella, Mythimna separata, Nemapogon cloacellus, Nymphula spp., Oiketicus spp., Oria spp., Orthaga spp., Ostrinia spp., p. ej., Ostrinia nubilalis, Oulema melanopus, Oulema oryzae, Panolis flammea, Parnara spp., Pectinophora spp., p. ej., Pectinophora gossypiella, Perileucoptera spp., Phthorimaea spp., p. ej., Phthorimaea operculella, Phillocnistis citrella, Phyllonorycter spp., p. ej., Phyllonorycter blancardella, Phyllonorycter crataegella, Pieris spp., p. ej., Pieris rapae, Platynota stultana, Plodia interpunctella, Plusia spp., Plutella xylostella (=Plutella maculipennis), Prays spp., Prodenia spp., Protoperce spp., Pseudaletia spp., p. ej., Pseudaletia unipuncta, Pseudoplusia includens, pirausta nubilalis, Rachiplusia nu, Schoenobius spp., p. ej., Schoenobius bipunctifer, Scirpophaga spp., p. ej., Scirpophaga innotata, Scotia segetum, Sesamia spp., p. ej., Sesamia inferens, Sparganothis spp., Spodoptera spp., p. ej., Spodoptera eradiana, Spodoptera exigua, Spodoptera frugiperda, Spodoptera praefica, Stathmopoda spp., Stomopteryx subsecivella, Synanthedon spp., Tecia solanivora, Thermesia gemmatalis, Tinea cloacella, Tinea pellionella, Tineola bisselliella, Tortrix spp., trichophaga tapetzella, trichoplusia spp., p. ej., trichoplusia ni, Tryporyza incertulas, Tuta absoluta, Virachola spp.;

del orden **de los ortópteros** o Saltatoria p. ej., Acheta domesticus, Dichroplus spp., Grillotalpa spp., p. ej.,

Grillotalpa grillotalpa, Hieroglyphus spp., Locusta spp., p. ej., Locusta migratoria, Melanoplus spp., p. ej., Melanoplus devastator, Schistocerca gregaria;

del orden **de los ftirápteros** p. ej., Damalinia spp., Haematopinus spp., Linognathus spp., Pediculus spp., Philloxera vastatrix, Phthirus pubis, trichodectes spp.;

5 del orden **de los psocópteros** p. ej., Lepinotus spp., Liposcelis spp.;

del orden **de los sifonápteros** p. ej., Ceratophyllus spp., Ctenocephalides spp., p. ej., Ctenocephalides canis, Ctenocephalides felis, Pulex irritans, Tunga penetrans, Xenopsilla cheopis;

10 del orden **de los tisanópteros** p. ej., Anaphothrips obscurus, Baliothrips biformis, Drepanothrips reuteri, Enneothrips flavens, Frankliniella spp., p. ej., Frankliniella fusca, Frankliniella occidentalis, Frankliniella schultzei, Frankliniella tritici, Frankliniella vaccinii, Frankliniella williamsi, Heliothrips spp., Hercinothrips femoralis, Rhipiphorotherips cruentatus, Scirtothrips spp., Taeniothrips cardamomi, Thrips spp., p. ej., Thrips palmi, Thrips tabaci;

del orden **de los cigentomas (= tisanuros)**, p. ej., Ctenolepisma spp., Lepisma saccharina, Lepismodes inquilinus, Thermobia domestica;

15 de la clase de los **símfilos** p. ej., Scutigera spp., p. ej., Scutigera immaculata;

Parásitos de la cepa de los **moluscos**, en particular de la clase de los **bivalvos**, p. ej., Dreissena spp.;

20 así como de la clase de los **gastropodos** p. ej., Arion spp., p. ej., Arion ater rufus, Biomphalaria spp., Bulinus spp., Deroceras spp., p. ej., Deroceras laeve, Galba spp., Lymnaea spp., Oncomelania spp., Pomacea spp., Succinea spp.;

25 parásitos animales y humanos de las cepas de los **platelmintos y nematodos**, p. ej., Ancilostoma spp., Angiostrongilus spp., Anisakis spp., Anoplocephala spp., Ascaris spp., Ascaridia spp., Bailisascaris spp., Brugia spp., Bunostomum spp., Capillaria spp., Chabertia spp., Clonorchis spp., Cooperia spp., Crenosoma spp., Cyathostoma spp., Dicrocoelium spp., Dictyocaulus spp., Diphilobothrium spp., Dipilidium spp., Diofilaria spp., Dracunculus spp., Equinococcus spp., Equinostoma spp., Enterobius spp., Eucoleus spp., Fasciola spp., Fascioloides spp., Fasciolopsis spp., Filaroides spp., Gongylonema spp., Gyrodactylus spp., Habronema spp., Haemonchus spp., Heligmosomoides spp., heterakis spp., Hymenolepis spp., Hyostrongilus spp., Litomosoides spp., Loa spp., Metastrongilus spp., Metorchis spp., Mesocestoides spp., Moniezia spp., Muellerius spp., Necator spp., Nematodirus spp., Nippostrongilus spp., Oesophagostomum spp., Ollulanus spp., Onchocerca spp., Opisthorchis spp., Oslerus spp., Ostertagia spp., Oxyuris spp., Paracapillaria spp., Parafilaria spp., Paragonimus spp., Paramphistomum spp., Paranoplocephala spp., Parascaris spp., Passalurus spp., Protostrongilus spp., Schistosoma spp., Setaria spp., Spirocerca spp., Stephanofilaria spp., Stephanurus spp., Strongiloides spp., Strongilus spp., Syngamus spp., Taenia spp., Teladorsagia spp., Thelazia spp., Toxascaris spp., Toxocara spp., Trichinella spp., Trichobilharzia spp., Trichostrongilus spp., Trichuris spp., Uncinaria spp., Wuchereria spp.;

35 Parásitos de las plantas de la cepa de los **nematodos**, es decir, nematodos parásitos de plantas, en particular Aglenchus spp., p. ej., Aglenchus agricola, Anguina spp., p. ej., Anguina tritici, Aphelenchoides spp., p. ej., Aphelenchoides arachidis, Aphelenchoides fragariae, Belonolaimus spp., p. ej., Belonolaimus gracilis, Belonolaimus longicaudatus, Belonolaimus nortoni, Bursaphelenchus spp., p. ej., Bursaphelenchus cocophilus, Bursaphelenchus eremus, Bursaphelenchus xilophilus, Cacopaurus spp., p. ej., Cacopaurus pestis, Criconemella spp., p. ej., Criconemella curvata, Criconemella onoensis, Criconemella ornata, Criconemella rusium, Criconemella xenoplax (= Mesocriconema xenoplax), Criconemoides spp., p. ej., Criconemoides ferniae, Criconemoides onoense, Criconemoides ornatum, Ditylenchus spp., p. ej., Ditylenchus dipsaci, Dolichodorus spp., Globodera spp., p. ej., Globodera pallida, Globodera rostochiensis, Helicotilenchus spp., p. ej., Helicotilenchus dihystra, Hemicriconemoides spp., Hemiclictiophora spp., heterodera spp., p. ej., heterodera avenae, heterodera glycines, heterodera schachtii, Hoplolaimus spp., Longidorus spp., p. ej., Longidorus africanus, Meloidogyne spp., p. ej., Meloidogyne chitwoodi, Meloidogyne fallax, Meloidogyne hapla, Meloidogyne incognita, Meloinema spp., Nacobbus spp., Neotilenchus spp., Paraphelenchus spp., Paratrichodorus spp., p. ej., Paratrichodorus minor, Pratylenchus spp., p. ej., Pratylenchus penetrans, Pseudohalenchus spp., Psilenchus spp., Punctodera spp., Quinisulcius spp., Radopholus spp., p. ej., Radopholus citrophilus, Radopholus similis, Rotilenchulus spp., Rotilenchus spp., Scutellonema spp., Subanguina spp., Trichodorus spp., p. ej., Trichodorus obtusus, Trichodorus primitivus, Tilenchorhynchus spp., p. ej., Tilenchorhynchus annulatus, Tilenchulus spp., p. ej., Tilenchulus semipenetrans, Xiphinema spp., p. ej., Xiphinema index.

Además del subárea de los protozoos puede combatirse el **orden de los coccidios** p. ej., Eimeria spp.

55 Los compuestos de la fórmula (I) dado el caso pueden usarse en concentraciones o dosis determinadas también como herbicidas, protectores, reguladores de crecimiento o agentes químicos para mejorar las

características de plantas, o como microbicida o gametozidas, por ejemplo como funguicida, antimicótico, bactericida, viricida (incluyendo agentes contra viroides) o como agente contra *MLO* (*Mycoplasma-like-organism*) y *RLO* (*Rickettsia-like-organism*). Se los puede emplear también como productos intermedios o básicos para la síntesis de otros principios activos.

5 Formulaciones

La presente invención además se refiere a formulaciones y formas de uso preparadas a partir de las mismas en forma de composiciones para la protección de cultivos y/o plaguicidas, por ejemplo, licores para goteo, rociado y pulverización, que comprenden al menos uno de los ingredientes activos de la invención. En algunos casos, las formas de uso comprenden más agentes para la protección de cultivos y/o plaguicidas y/o adyuvantes que mejoran la acción, tales como penetrantes, por ej., aceites vegetales, por ejemplo aceite de colza, aceite de girasol, aceites minerales, por ejemplo aceites de parafina, ésteres de alquilo de ácidos grasos vegetales, por ejemplo metilo éster de aceite de colza, o metilo éster de aceite de soja, o alcoxilatos de alcohol y/o dispersantes, por ejemplo alquilsiloxanos y/o sales, por ejemplo sales de amonio o fosfonio orgánicas o inorgánicas, por ejemplo sulfato de amonio o hidrógeno fosfato de diamonio y/o promotores de retención, por ejemplo sulfosuccinato de dioctilo o polímeros de hidroxipropilo guar y/o humectantes, por ejemplo glicerol y/o fertilizantes, por ejemplo fertilizantes que contienen amonio, potasio, o fósforo.

Las formulaciones habituales son, por ejemplo, líquidos hidrosolubles (LH), concentrados de emulsión (CE), emulsiones en agua (EA), concentrados de suspensión (SC, SE, FS, ROD), gránulos dispersables en agua (GA), gránulos (GR) y concentrados en cápsulas (CC); estos y otros posibles tipos de formulación se describen, por ejemplo, en Crop Life International y en las Especificaciones de Plaguicidas, Manual sobre el desarrollo y uso de las especificaciones FAO y WHO para plaguicidas, los Documentos sobre Protección y Producción de Plantas FAO – 173, preparados por la Junta FAO/WHO sobre Especificaciones de Plaguicidas, 2004, ISBN: 9251048576. Las formulaciones opcionalmente comprenden, como también uno o más compuestos de la fórmula (I), más ingredientes agroquímicos activos.

Preferentemente se trata de formulaciones o formas de uso que comprenden adyuvantes, por ejemplo, diluyentes, disolventes, promotores de la espontaneidad, vehículos, emulsionantes, dispersantes, anticongelantes, biocidas, espesantes y/u otros adyuvantes, por ejemplo adyuvantes. Un adyuvante en este contexto es un componente que intensifica el efecto biológico de la formulación, sin el componente mismo que tiene un efecto biológico. Ejemplos de adyuvantes son los agentes que promueven la retención, dispersión, unión a la superficie de la hoja o penetración.

Estas formulaciones se producen de una manera conocida, por ejemplo, mezclando los compuestos de la fórmula (I) con adyuvantes, por ejemplo diluyentes, disolventes y/o vehículos sólidos y/u otros adyuvantes, por ejemplo tensioactivos. Las formulaciones se producen o bien en las plantas adecuadas para la producción o bien antes o durante la aplicación.

Como adyuvantes pueden usarse sustancias adecuadas para impartir propiedades especiales, tales como ciertas propiedades físicas, técnicas y/o biológicas, a los compuestos de la fórmula (I) o a las formas de uso preparadas a partir de estas formulaciones (por ejemplo composiciones para la protección de cultivos listos para usar tales como licores para pulverización o productos para el tratamiento de semillas).

Los diluyentes adecuados son, por ejemplo, agua, líquidos químicos orgánicos polares y no polares, por ejemplo de las clases de los hidrocarburos aromáticos y no aromáticos (tales como parafinas, alquilbencenos, alquilnaftalenos, clorobencenos), los alcoholes y polioles (los cuales, de ser apropiado), además pueden ser sustituidos, eterificados y/o esterificados), las cetonas (tales como acetona, ciclohexanona), ésteres (incluyendo grasas y aceites) y (poli)éteres, las aminas sustituidas y no sustituidas, amidas, lactamos (tales como N-alquilpirrolidonas) y lactosas, las sulfonas y los sulfóxidos (tal como dimetilsulfóxido).

Si el diluyente usado es el agua, además es posible por ejemplo, usar disolventes orgánicos como disolventes adyuvantes. Los disolventes líquidos adecuados son esencialmente: aromáticos, tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, aromáticos clorados, o hidrocarburos alifáticos clorados, tales como clorobencenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano o parafinas, por ejemplo fracciones de aceite mineral, aceites minerales y vegetales, alcoholes, tales como

butanol o glicol, y sus éteres y ésteres, cetonas, tales como acetona, metilo etilo cetona, metilo isobutilo cetona o ciclohexanona, solventes fuertemente polares, tales como dimetilformamida y dimetilsulfóxido, así como agua.

5 En principio, es posible usar todos los disolventes adecuados. Ejemplos de disolventes adecuados son hidrocarburos aromáticos, tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, hidrocarburos aromáticos clorados o hidrocarburos alifáticos, tales como clorobenzenos, cloroetileno o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano, parafinas, fracciones de petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoholes, tales como metanol, etanol, isopropanol, butanol o glicol, y sus éteres y ésteres, cetonas, tales como acetona, metilo etilo cetona, metilo isobutilo cetona o ciclohexanona, disolventes fuertemente polares, tales como dimetilsulfóxido, y además agua.

10 En principio, es posible usar todos los vehículos adecuados. Los vehículos útiles incluyen especialmente: por ejemplo sales de amonio y minerales de la tierra naturales, tales como caolinas, arcillas, talco, creta, cuarzo, atapulgita, montmorillonita o tierra de diatomea, y minerales sintéticos de la tierra, tales como sílice finamente dividido, alúmina y silicatos naturales o sintéticos, resinas, ceras y/o fertilizantes sólidos. 15 Las mezclas de estos vehículos se pueden usar de igual modo. Los vehículos útiles para gránulos incluyen: por ejemplo rocas molidas y naturales fraccionadas, tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita, y además gránulos sintéticos de metales inorgánicos y orgánicos y además gránulos de material orgánico, tales como el aserrín, papel, las cáscaras de coco, mazorcas de maíz y los tallos de tabaco.

20 También pueden usarse diluyentes gaseosos licuados o disolventes. Los vehículos o diluyentes particularmente adecuados son aquéllos que son gaseosos a temperatura ambiente y a presión atmosférica, por ejemplo gases propulsores en aerosol, tales como los halohidrocarburos, y además butano, propano, nitrógeno y dióxido de carbono.

25 Ejemplos de emulsionantes y/o espumantes, dispersantes o humectantes con propiedades iónicas o no iónicas, o mezclas de estos tensioactivos, son sales de ácido poliacrílico, sales de ácido lignosulfónico, sales de ácido fenolsulfónico o ácido naftalenosulfónico, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o con ácidos grasos o con aminas grasas, con fenoles sustituidos (preferentemente alquilfenoles o arilfenoles), sales de ésteres sulfosuccínico, derivados taurinos (preferentemente alquilo tauratos), ésteres fosfóricos de alcoholes polietoxilados o fenoles, ésteres de ácido graso de polioles, y 30 derivados de los compuestos que contienen sulfatos, sulfonatos y fosfatos, por ejemplo alquilarilo poliglicol éteres, alquilo sulfonatos, alquilsulfatos, arilsulfonatos, hidrolizados de proteínas, licores residuales de lignosulfito y metilcelulosa. La presencia de un tensioactivo es ventajosa cuando uno de los compuestos de la fórmula (I) y/o uno de los vehículos inertes es insoluble en agua y cuando la aplicación se realiza en el agua.

35 Otros adyuvantes que pueden estar presentes en las formulaciones y las formas de uso que derivan de los mismos incluyen tintes tales como los pigmentos inorgánicos, por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, y azul de Prusia, y colorantes orgánicos, tales como colorantes de alizarina, colorantes estoicos, y colorantes de ftalocianina metálica, y nutrientes y oligonutrientes, tales como las sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y zinc.

40 Los componentes adicionales pueden ser estabilizantes, tales como estabilizantes fríos, conservantes, antioxidantes, estabilizantes livianos, u otros agentes que mejoran la estabilidad química y/o física. Los espumantes o antiespumantes también pueden estar presentes.

45 Además las formulaciones y las formas de aplicación derivadas de estos pueden contener agentes de pegajosidad adicionales, tales como carboximetilcelulosa y los polímeros naturales y sintéticos en forma de polvos, gránulos o redes cristalinas, tales como la goma arábiga, el alcohol polivinílico y el acetato de polivinilo, u otros fosfolípidos naturales, tales como las cefalinas, y lecitinas y los fosfolípidos sintéticos. Otros adyuvantes pueden ser aceites minerales y vegetales.

50 Dado el caso, las formulaciones y las formas de uso que derivan de las mismas también pueden comprender otros adyuvantes. Ejemplos de estos aditivos incluyen fragancias, coloides protectores, aglutinantes, adhesivos, espesantes, agentes tixotrópicos, penetrantes, promotores de retención, estabilizantes, secuestrantes, agentes formadores de complejos, humectantes, dispersantes. En general, los ingredientes activos se pueden combinar con cualquier aditivo sólido o líquido habitualmente usado para fines de formulación.

Los promotores de retención útiles incluyen todas aquellas sustancias que reducen la tensión superficial dinámica, por ejemplo sulfosuccinato de dioctilo, o aumentan la viscoelasticidad, por ejemplo polímeros de hidroxipropilguar.

5 Los agentes de penetración útiles en el presente contexto son todas aquellas sustancias que se usan normalmente para mejorar la penetración de los ingredientes agroquímicos activos en plantas. Los penetrantes se definen en este contexto por su capacidad para penetrar desde el licor de aplicación (generalmente acuoso) y/o desde el recubrimiento de pulverización dentro de la cutícula de la planta y de este modo incrementar la movilidad de los ingredientes activos en la cutícula. El procedimiento que se describe en la literatura (Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152) se puede usar para determinar esta propiedad. Ejemplos incluyen alcoxilatos de alcohol tal como etoxilato graso de coco (10) o isotridecilo etoxilato (12), ésteres de ácido graso, por ejemplo metilo éster de aceite de colza o metilo éster de aceite de soja, alcoxilatos de amina grasa, por ejemplo etoxilato de amina de sebo (15) o sales de amonio y/o fosfonio, por ejemplo sulfato de amonio o hidrógeno fosfato de diamonio.

15 Las formulaciones contienen preferentemente entre 0,00000001 y 98 % en peso de principio activo o especialmente preferente entre 0,01 y 95 % en peso de principio activo, especialmente preferente entre 0,5 y 90 % en peso del compuesto de la fórmula (I), respecto del peso de la formulación.

20 El contenido del compuesto de la fórmula (I) en las formas de uso (composiciones de protección del cultivo) preparadas a partir de las formulaciones puede variar dentro de límites amplios. La concentración del ingrediente activo de las formas de uso puede estar normalmente entre 0,00000001 % y 95 % en peso del ingrediente activo, preferentemente entre 0,00001 % y 1 % en peso, basado en el peso de la forma de uso. Los compuestos se aplican de manera habitual apropiada para las formas de uso.

Mezclas

25 Los compuestos de la fórmula (I) también pueden usarse mezcladas con otros principios activos como fungicidas, bactericidas, acaricidas, nematocidas, insecticidas, microbicidas, fertilizantes, cebos, agentes esterilizadores, sinergistas, protectores, semiquímicos y/o reguladores de crecimiento, para así por ejemplo ampliar el espectro de acción, prolongar la duración del efecto, aumentar la velocidad de acción, evitar la repelencia o prevenir la evolución de resistencias. Por lo demás tales combinaciones pueden mejorar el crecimiento de las plantas, aumentar la tolerancia de temperaturas elevadas o bajas, a la sequía o al contenido de agua o sal en el suelo, incrementar la floración, facilitar la cosecha y aumentar los rendimientos de cosecha, acelerar la maduración, aumentar la calidad y/o el valor nutritivo de los productos cosechados, prolongar la capacidad de almacenamiento y/o mejorar la procesabilidad de los productos de cosecha.

30 Los compuestos de la fórmula (I) además pueden estar disponibles en mezcla con otros principios activos o semiquímicos, como cebos y/o repelentes de aves y/o activadores de plantas y/o reguladores de crecimiento y/o fertilizantes. Del mismo modo, los compuestos de la fórmula (I) pueden usarse en mezclas con agentes para mejorar las propiedades de las plantas, como por ejemplo, el crecimiento, el rendimiento y la calidad de los productos de cosecha.

35 En una realización especial de acuerdo con la invención, los compuestos de la fórmula (I) están disponibles en formulaciones o bien en las formas de uso preparadas a partir de estas formulaciones en mezcla con otros compuestos, preferentemente aquellos como se han descrito a continuación.

40 Si uno de los compuestos indicados a continuación puede presentarse en diferentes formas tautoméricas, también se incluyen estas formas aunque no se las mencione explícitamente en cada caso.

Insecticidas / Acaricidas / Nematicidas

45 Los ingredientes activos especificados en la presente memoria descriptiva por su "nombre común" se conocen y describen, por ejemplo, en el Pesticide Manual ("The Pesticide Manual", 14^a Ed., British Crop Protection Council 2006) o pueden buscarse en internet (por ejemplo <http://www.alanwood.net/pesticides>).

50 (1) Inhibidores de acetilcolinesterasa (AChE), por ejemplo, carbamatos, por ejemplo, Alanycarb, Aldicarb, Bendiocarb, Benfuracarb, Butocarboxim, Butoxicarboxim, Carbarilo, Carbofuran, Carbosulfan, Etiofencarb, Fenobucarb, Formetanato, Furatiocarb, Isoprocarb, Metiocarb, Metomilo,

Metolcarb, Oxamilo, Pirimicarb, Propoxur, Tyodoicarb, Tiofanox, Triazamato, Trimetacarb, XMC, y Xililcarb; u organofosfatos, por ejemplo, Acefatos, Azametifos, Azinfos-etílico, Azinfos-metilico, Cadusafos, Cloretoxifos, Clorfenvinfos, Clormefos, Clorpirifos, Clorpirifos-metilico, Coumafos, Cianofos, Demeton-S-metilico, Diazinon, Diclorvos/DDVP, Dicrotofos, Dimetoato, Dimetilvinfos, Disulfoton, EPN, Etion, Etoprofos, Fampur, Fenamifos, Fenitroton, Fention, Fostiazato, Heptenofos, Imiciafos, Isofenfos, O-(metoxiaminotio-fosfoil) salicilato de isopropilo, Isoxation, Malation, Mecarbam, Metamidofos, Metidation, Mevinfos, Monocrotofos, Naled, Ometoato, Oxidemeton-metilico, Paration, Paration-metilico, Fentoato, Forato, Fosalona, Fosmet, Fosfamidona, Foxim, Pirimifos-meílico, Profenofos, Propetamfos, Protiofos, Piraclfos, Piridafention, Quinalfos, Sulfotep, Tebupirimfos, Temefos, Terbufos, Tetraclorvinfos, Tiometon, Triazofos, Triclorfon y Vamidotion.

(2) Antagonistas de los canales de cloruro activados por GABA, por ejemplo, organoclorados de ciclodieno, por ejemplo. Clordano y Endusulfan; o fenilpirazoles (fiproles), por ejemplo Etiprol y Fipronilo.

(3) Moduladores del canal de sodio / bloqueadores del canal de sodio dependiente del voltaje, por ejemplo, piretroides, por ejemplo, Acrinatrina, Aletrina, Aletrina d-cis-trans, Aletrina d-trans, Bifentrina, Bioaletrina, isómero S-ciclopentenilo de bioaletrina, Bioresmetrina, cicloprotrina, Ciflutrina, beta-Ciflutrina, Cihalotrina, lambda-Cihalotrina, gamma-Cihalotrina, Cipermetrina, alfa-Cipermetrina, beta-Cipermetrina, teta-Cipermetrina, zeta-Cipermetrina, Cffenotrina [isómeros (1R)-trans], Deltametrina, Empentrina [isómeros (EZ)-(1R)], Esfenvalerato, Etofenprox, Fenpropatrina, Fenvalerato, Flucitrinato, Flumetrina, tau-Fluvalinato, Halfenprox, Imiprotrina, Kadetrina, Permetrina, Fenotrina [isómero (1R)-trans], Praletrina, Piretrina (piretrum), Resmetrina, Silafluofeno, Teflutrina, Tetrametrina, Tetrametrina [isómeros (1R)], Tralometrina y Transflutrina o DDT; o metoxiclor.

(4) Agonistas del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR), por ejemplo, neonicotinoides, por ejemplo, Acetamiprid, Clotianidin, Dinotefuran, Imidacloprid, Nitenpiram, Tiacloprid y Tiametoxam; o Nicotina o Sulfoxaflor.

(5) Activadores alostéricos del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR), por ejemplo, espinosinas, por ejemplo Spinetoram y Spinosad.

(6) Activadores de los canales de cloruro, por ejemplo avermectinas / milbemicinas, por ejemplo abamectina, benzoato de emamectina, lepimectina y milbemectina.

(7) Miméticos de hormonas juveniles, por ejemplo, análogos de hormonas juveniles, por ejemplo, Hidropreno, Quinopreno y Metopreno; o Fenoxicab o Piriproxifen.

(8) Diversos inhibidores no específicos (multisitio), por ejemplo, haluros de alquilo, por ejemplo, bromuro de metilo y otros haluros de alquilo; o Cloropicrina; o fluoruro de azufre; o Borax; o tártaro emético.

(9) Bloqueantes selectivos de la alimentación de homópteros, por ejemplo Pimetrozina o Flonicamida.

(10) Inhibidores de crecimiento de ácaros, por ejemplo Clofentezina, Diflovidazina, Hexitiazox o Etoxazol.

(11) Alteradores microbianos de las membranas del intestino medio de insectos, por ejemplo *Bacillus thuringiensis* subespecie *israelensis*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* subespecie *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subespecie *kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* subespecie *tenebrionis*, y proteínas del cultivo BT: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry2Ab, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34/35Ab1.

(12) Inhibidores de ATP sintasa mitocondrial, por ejemplo Diafentiurón; o acaricidas de organotina, por ejemplo Azociclotina, Cihexatina y Óxido de fenbutatina; o propargita; Tetradifón.

(13) Desacopladores de fosforilación óxidoativa por medio de interrupción del gradiente de protones, por ejemplo clorfenapir, DNOC y Sufluramida.

(14) Bloqueantes de canales de receptores nicotínicos de acetilcolina, por ejemplo Bensultap, Clorhidrato de cartap, Tiociclam y Tiosultap-sodio.

(15) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 0, por ejemplo Bistrifluron, Clorfluazuron, Diflubenzuron, Flucicloxuron, Flufenoxuron, Hexaflumuron, Lufenuron, Novaluron, Noviflumuron,

Teflubenzuron y Triflumuron.

(16) Inhibidores de biosíntesis de quitina, de tipo 1, por ejemplo Buprofezina.

(17) Disruptores de muda, por ejemplo Ciromazina.

5 (18) Agonistas del receptor de ecdisona, por ejemplo Clomaenozida, Halofenozida, metoxifenozida y Tebufenozida.

(19) Agonistas de receptor de octopamina, por ejemplo Amitraz.

(20) Inhibidores de transporte de electrones del complejo III mitocondrial, por ejemplo Hidrametilnón; Acequinocilo o Fluacopirim.

10 (21) Inhibidores de transporte de electrones del complejo I mitocondrial, por ejemplo acaricidas METI, por ejemplo Fenazaquina, Fenpiroximato, Pirimidifeno, Piridabeno, Tebufenpirad, Tolfenpirad o Rotenona (Derris).

(22) Bloqueantes de canales de sodio dependientes de voltaje, por ejemplo Indoxacarb; Metaflumizona.

15 (23) Inhibidores de acetilo CoA carboxilasa, por ejemplo derivados del ácido tetrónico y tetrámico, por ejemplo Espirodiclofeno, Espiromesifeno y Espirotetramato.

(24) Inhibidores del transporte de electrones del complejo IV, por ejemplo fosfinas, por ejemplo Fosfuro de aluminio, Fosfuro de calcio, Fosfina y Fosfuro de cinc; o Cianuro.

(25) Inhibidores de transporte de electrones del complejo II mitocondrial, por ejemplo Cienopirafeno y ciflumetofeno.

20 (28) Moduladores del receptor de rianodina, por ejemplo, diaminas, por ejemplo, Clorantraniliprol y Flubendimida,

otros principios activos como a modo de ejemplo Afidopiropen, Azadirachtina, Benclotiaz, benzoximato, Bifenazato, Bromopropilato, Chinometionato, Cryolita,

25 Dicofol, Diflovidazina, Fluensulfona, Flometoquina, Flufenerim, Flufenoxiestrobina, Flufiprole, Fluopiram, Flupiradifurona, Fufenozida, Heptaflutrina, Imidaclothiz, Iprodiona, Meperflutrina, Paichongding, Pyflubumide, Pyrifluquinazona, Pyriminoestrobina, Tetrametilflutrina y Yodometano; además preparados sobre la base de *Bacillus firmus* (I-1582, BioNeem, Votivo), así como los siguientes compuestos: 3-bromo-N-{2-bromo-4-cloro-6-[(1-ciclopropyletil)carbamoil]fenil}-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocida del documento WO2005/077934) y 1-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoretil)sulfonil]fenil}-3-(trifluorometil)-1H-1,2,4-triazol-5-amina (conocida del documento WO2006/043635), {1'-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]-5-fluoro-espiro[indol-3,4'-piperidin]-1(2H)-il]}(2-cloropiridin-4-il)metanona (conocida del documento WO2003/106457), 2-cloro-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]piperidin-4-il}-4-(trifluorometil)fenil]isonicotinamida (conocida del documento WO2006/003494), 3-(2,5-dimetilfenil)-4-hidroxi-8-metoxi-1,8-diazaespiro[4.5]dec-3-en-2-ona (conocida del documento WO2009/049851), 3-(2,5-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1,8-diazaespiro[4.5]dec-3-en-4-il-etilcarbonato (conocido del documento WO2009/049851), 4-(but-2-in-1-iloxi)-6-(3,5-dimetilpiperidin-1-il)-5-fluoropirimidina (conocida del documento WO2004/099160), 4-(But-2-in-1-iloxi)-6-(3-clorofenil)pirimidina (conocida del documento WO2003/076415), PF1364 (CAS-Reg. N° 1204776-60-2), 4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-2-metil-N-{2-oxo-2-[(2,2,2-trifluoretil)amino]etil}-benzamida (conocida del documento WO2005/085216), 4-{5-[3-cloro-5-(trifluorometil)fenil]-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-N-[2-oxo-2-[(2,2,2-trifluoretil)amino]etil]-1-naftamida (conocida del documento WO2009/002809), 2-[2-({3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il}carbonil)amino]-5-cloro-3-metilbenzoil]-2-metilhidrazin-carboxilato de metilo (conocido del documento WO2005/085216), 2-[2-({3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il}carbonil)amino]-5-cian-3-metilbenzoil]-2-etilhidrazin-carboxilato de metilo (conocido del documento WO2005/085216), 2-[2-({3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il}carbonil)amino]-5-cian-3-metilbenzoil]-2-metilhidrazin-carboxilato de metilo (conocido del documento WO2005/085216), 2-[3,5-dibromo-2-({3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il}carbonil)amino]benzoil]-2-etilhidrazin-carboxilato de metilo (conocido del documento WO2005/085216), 1-(3-cloropiridin-2-il)-N-[4-cian-2-metil-6-(metilcarbamoil)-fenil]-3-[[5-(trifluorometil)-2H-tetrazol-2-il]metil]-1H-pirazol-5-carboxamida (conocida del documento WO2010/069502), 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 (conocida del documento CN102057925), 3-cloro-N-(2-cianpropan-2-il)-N-[4-(1,1,1,2,3,3,3-heptafluoropropan-2-il)-2-metilfenil]ftalimida (conocida del documento WO2012/034472), 8-cloro-N-[(2-cloro-5-metoxifenil)sulfonil]-6-(trifluorometil)imidazo[1,2-a]piridin-2-carboxamida (conocida del documento WO2010/129500), 4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-2-metil-N-(1-oxidotietan-3-il)-benzamida (conocida del documento WO2009/080250), 4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2-

oxazol-3-il]-2-metil-N-(1-oxidotietan-3-il)-benzamida (conocida del documento WO2012/029672), 1-[(2-cloro-1,3-tiazol-5-il)metil]-4-oxo-3-fenil-4H-pirido[1,2-a]pirimidina-1-ium-2-olato (conocido del documento WO2009/099929), 1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]-4-oxo-3-fenil-4H-

5 pirido[1,2-a]pirimidina-1-ium-2-olato (conocido del documento WO2009/099929), (5S,8R)-1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]-9-nitro-2,3,5,6,7,8-hexahidro-1H-5,8-epoxiidimidazo[1,2-a]azepina (conocida del documento WO2010/069266), (2E)-1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]-N'-nitro-2-pentilidenedrazin-carboximidamida (conocida del documento WO2010/060231), 4-(3-{2,6-dicloro-4-[(3,3-dicloroprop-2-en-1-il)oxi]fenoxi}propoxi)-2-metoxi-6-(trifluorometil)-pirimidina (conocida del documento CN101337940), N-[2-(terc-butylcarbamoil)-4-cloro-6-metilfenil]-1-(3-cloropiridin-2-il)-3-(fluorometoxi)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocida del documento WO2008/134969).

10 Fungicidas

Los principios activos especificados aquí con su "nombre común" se conocen, se han descrito por ejemplo en el "Pesticide Manual" o en la Internet (por ejemplo: <http://www.alanwood.net/pesticides>).

(1) Inhibidores de la biosíntesis de ergosterol, como a modo de ejemplo (1.1) Aldimorph, (1.2) Azaconazol, (1.3) Bitertanol, (1.4) Bromuconazol, (1.5) Cyproconazol, (1.6) Diclobutrazol, (1.7) Difenconazol, (1.8) Diniconazol, (1.9) Diniconazol-M, (1.10) Dodemorph, (1.11) Dodemorph Acetato, (1.12) Epoxiconazol, (1.13) Etaconazol, (1.14) Fenarimol, (1.15) Fenbuconazol, (1.16) Fenhexamida, (1.17) Fenpropidina, (1.18) Fenpropimorph, (1.19) Fluquinconazol, (1.20) Flurprimidol, (1.21) Flusilazol, (1.22) Flutriafol, (1.23) Furconazol, (1.24) Furconazol-Cis, (1.25) Hexaconazol, (1.26) Imazalilo, (1.27) Imazalilo sulfato, (1.28) Imibenconazol, (1.29) Iponazol, (1.30) Metconazol, (1.31) Myclobutanilo, (1.32) Naftifina, (1.33) Nuarimol, (1.34) Oxpoconazol, (1.35) Paclobutrazol, (1.36) Pefurazoato, (1.37) Penconazol, (1.38) Piperlina, (1.39) Procloroaz, (1.40) Propiconazol, (1.41) Protioconazol, (1.42) Pyributicarb, (1.43) Pyrifenox, (1.44) Quinconazol, (1.45) Simeconazol, (1.46) Spiroxamina, (1.47) Tebuconazol, (1.48) Terbinafina, (1.49) Tetraconazol, (1.50) Triadimefon, (1.51) Triadimenol, (1.52) Tridemorph, (1.53) Triflumizol, (1.54) Triforina, (1.55) Triticonazol, (1.56) Uniconazol, (1.57) Uniconazol-p, (1.58) Viniconazol, (1.59) Voriconazol, (1.60) 1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)cicloheptanol, (1.61) metil-1-2,2-dimetil-2,3-dihidro-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato, (1.62) N'-[5-(difluorometil)-2-metil-4-[3-(trimetilsilil)propoxi]fenil]-N-etil-N-metilimidofornamida, (1.63) N-etil-N-metil-N'-[2-metil-5-(trifluorometil)-4-[3-(trimetilsilil)propoxi]fenil]imido-formamida y (1.64) O-[1-(4-Metoxifenoxi)-3,3-dimetilbutan-2-il]-1H-imidazol-1-carbotioato, (1.65) Pyrisoxazoles.

(2) Inhibidores de la respiración (inhibidores de cadenas respiratorias), como a modo de ejemplo (2.1) Bixafen, (2.2) Boscalid, (2.3) carboxina, (2.4) Diflumetorim, (2.5) Fenfuram, (2.6) Fluopiram, (2.7) Flutolanilo, (2.8) Fluxapiraxad, (2.9) Furametpir, (2.10) Furmeciclox, (2.11) Isopirazam mezcla del racemato syn-epímero 1RS,4SR,9RS y del racemato anti-epímero 1RS,4SR,9SR, (2.12) Isopirazam (racemato anti-epímero), (2.13) Isopirazam (enantiómero anti-epímero 1R,4S,9S), (2.14) Isopirazam (enantiómero anti-epímero 1S,4R,9R), (2.15) Isopirazam (racemato syn-epímero 1RS,4SR,9RS), (2.16) Isopirazam (enantiómero syn-epímero 1R,4S,9R), (2.17) Isopirazam (enantiómero syn-epímero 1S,4R,9S), (2.18) Mepronilo, (2.19) Oxicarboxina, (2.20) Penflufen, (2.21) Penthiopirad, (2.22) Sedaxano, (2.23) Tifluzamida, (2.24) 1-metil-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluoretoxi)fenil]-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.25) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluoretoxi)fenil]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.26) 3-(difluorometil)-N-[4-fluoro-2-(1,1,2,3,3,3-hexafluoropropoxi)fenil]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.27) N-[1-(2,4-diclorofenil)-1-metoxipropan-2-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.28) 5,8-difluoro-N-[2-(2-fluoro-4-[[4-(trifluorometil)piridin-2-il]oxi]fenil)etil]quinazolin-4-amina, (2.29) benzo-vindiflupir, (2.30) N-[(1S,4R)-9-(Diclorometilen)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida y (2.31) N-[(1R,4S)-9-(Diclorometilen)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.32) 3-(difluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.33) 1,3,5-trimetil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.34) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.35) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.36) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.37) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.38) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.39) 1,3,5-trimetil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.40) 1,3,5-trimetil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.41) Benodanilo, (2.42) 2-cloro-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)piridin-3-carboxamida, (2.43) Isofetamida

(3) Inhibidores de la respiración (inhibidores de cadenas respiratorias) en el complejo III de la cadena respiratoria, como a modo de ejemplo (3.1) Ametoctradina, (3.2) Amisulbrom, (3.3) Azoxiestrobina, (3.4) Cyazofamida, (3.5) Coumetoxiestrobina, (3.6) Coumoxiestrobina, (3.5) Dimoxiestrobina, (3.8) Enestroburina, (3.9) Famoxadona, (3.10) Fenamidona, (3.11) Flufenoxiestrobina, (3.12) Fluoxaestrobina, (3.13) Kresoxim-metilo, (3.14) Metominoestrobina, (3.15) Orysaestrobina, (3.16) Picoxiestrobina, (3.17) Piracloestrobina, (3.18) Pirametoestrobina, (3.19) Piraoxiestrobina, (3.20) Pyribencarb, (3.21) Triclopircarb, (3.22) Trifloxiestrobina, (3.23) (2E)-2-(2-[[6-(3-cloro-2-metilfenoxi)-5-fluoropirimidin-4-il]oxi]fenil)-2-(metoxiimino)-N-metiletanamida, (3.24) (2E)-2-(metoxiimino)-N-metil-2-(2-[[{(1E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etiliden}amino)oxi]metil]fenil)etanamida, (3.25) (2E)-

- 2-(metoxiimino)-N-metil-2-{2-[(E)-{1-[3-(trifluorometil)fenil]etoxi}imino)-metil]-fenil}etanamida, (3.26) (2E)-2-{2-[[{(1E)-1-(3-[(E)-1-fluoro-2-feniletetil]oxi)}fenil]etiliden]amino}oxi)metil]fenil}-2-(metoxiimino)-N-metiletanamida, (3.27) (2E)-2-{2-[[{(2E,3E)-4-(2,6-dicloro-fenil)but-3-en-2-iliden]amino}oxi)metil]fenil}-2-(metoxiimino)-N-metiletanamida, (3.28) 2-cloro-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)piridin-3-carboxamida, (3.29) 5-Metoxi-2-metil-4-(2-[[{(1E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etiliden]amino}oxi]metil]fenil)-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-ona, (3.30) (2E)-2-{2-[[{(ciclopropil[(4-metoxifenil)-imino]metil]sulfanil)metil]fenil}-3-metoxiprop-2-enoato de metilo, (3.31) N-(3-etil-3,5,5-trimetilciclohexil)-3-(formilamino)-2-hidroxibenzamida, (3.32) 2-{2-[(2,5-dimetilfenoxi)metil]fenil}-2-metoxi-N-metilacetamida, (4) Inhibidores de mitosis y división celular, como a modo de ejemplo (4.1) Benomilo, (4.2) Carabendazima, (4.3) clorofenazol, (4.4) Dietofencarb, (4.5) Etaboxam, (4.6) Fluopicolid, (4.7) Fuberidazol, (4.8) Pencicuron, (4.9) Tiabendazol, (4.10) Tiofanat-metilo, (4.11) Tiofanato, (4.12) Zoxamida, (4.13) 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina y (4.14) 3-cloro-5-(6-cloropiridin-3-il)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)piridazina.
- (5) Compuestos con actividad multisitio, como a modo de ejemplo (5.1) mezcla bordalesa, (5.2) Captafol, (5.3) Captan, (5.4) clorotalonilo, (5.5) preparaciones de cobre como hidróxido de cobre, (5.6) naftenato de cobre, (5.7) óxido de cobre, (5.8) oxiclورو de cobre, (5.9) sulfato de cobre, (5.10) Diclofluanida, (5.11) Ditianona, (5.12) Dodine, (5.13) Dodine base libre, (5.14) Ferbam, (5.15) Fluorfolpet, (5.16) Folpet, (5.17) Guazatina, (5.18) acetato de guazatina, (5.19) Iminoctadina, (5.20) besilato de Iminoctadina, (5.21) triacetato de Iminoctadina, (5.22) cobre Man, (5.23) Mancozeb, (5.24) Maneb, (5.25) Metiram, (5.26) metiram de zinc, (5.27) oxina de cobre, (5.28) Propamidina, (5.29) Propineb, (5.30) azufre y preparaciones de azufre como a modo de ejemplo polisulfuro de calcio, (5.31) Tiram, (5.32) Toliifluanida, (5.33) Zineb, (5.34) Ziram y (5.35) Anilazina.
- (6) Inductores de resistencia, como a modo de ejemplo (6.1) Acibenzolar-S-metilo, (6.2) Isotianilo, (6.3) Probenazol, (6.4) Tiadinilo y (6.5) Laminarin.
- (7) Inhibidores de la biosíntesis de aminoácidos y proteínas, como a modo de ejemplo (7.1), (7.2) Blasticidin-S, (7.3) Cyprodinilo, (7.4) Kasugamicina, (7.5) clorhidrato hidrato de Kasugamicina, (7.6) Mepanipirim, (7.7) Pyrimetanilo, (7.8) 3-(5-fluoro-3,3,4,4-tetrametil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina y (7.9) Oxitetraciclina y (7.10) estreptomina.
- (8) Inhibidores de la producción de ATP, como a modo de ejemplo (8.1) acetato de fentino, (8.2) cloruro de fentino, (8.3) hidróxido de fentino y (8.4) Siltiofam.
- (9) Inhibidores de la síntesis de la pared celular, como a modo de ejemplo (9.1) Bentiavalicarb, (9.2) Dimetomorph, (9.3) Flumorph, (9.4) Iprovalicarb, (9.5) Mandipropamida, (9.6) polioxinas, (9.7) polioxorim, (9.8) Validamicina A, (9.9) Valifenalato y (9.10) polioxina B.
- (10) Inhibidores de la síntesis de lípidos y membranal, como a modo de ejemplo (10.1) Bifenilo, (10.2) cloroneb, (10.3) Dicloran, (10.4) Edifenphos, (10.5) Etridiazol, (10.6) Iodocarb, (10.7) Iprobenfos, (10.8) isoprotilan, (10.9) Propamocarb, (10.10) clorhidrato de Propamocarb, (10.11) Protiocarb, (10.12) Pirazophos, (10.13) Quintozen, (10.14) Tecnazeno y (10.15) Tolclofos-metilo.
- (11) Inhibidores de la biosíntesis de melanina, como a modo de ejemplo (11.1) Carpropamida, (11.2) Diclocymet, (11.3) Fenoxanilo, (11.4) Ftalida, (11.5) Pyroquilona, (11.6) Triciclazol, y (11.7) {3-metil-1-[(4-metilbenzoil)amino]butan-2-il}carbarnato de 2,2,2-trifluoretilo.
- (12) Inhibidores de la síntesis de ácido nucleico, como a modo de ejemplo (12.1) Benalaxilo, (12.2) Benalaxil-M (Kiralaxil), (12.3) Bupirimato, (12.4) Clozilacon, (12.5) Dimetirimol, (12.6) Etirimol, (12.7) Furalaxilo, (12.8) Hymexazol, (12.9) Metalaxilo, (12.10) Metalaxil-M (Mefenoxam), (12.11) Ofurace, (12.12) Oxadixilo, (12.13) ácido oxolínico y (12.14) Octilinona.
- (13) Inhibidores de la transducción de señal, como a modo de ejemplo (13.1) Chlozolinato, (13.2) Fencpiclonilo, (13.3) Fludioxonilo, (13.4) Iprodiona, (13.5) Procymidona, (13.6) Quinoxifeno, (13.7) Vinclozolina y (13.8) Proquinazida.
- (14) Desacopladores, como a modo de ejemplo (14.1) Binapacril, (14.2) Dinocap, (14.3) Ferimzon, (14.4) Fluazinam y (14.5) Meptildinocap.
- (15) Otros compuestos, como a modo de ejemplo (15.1) Bentiazol, (15.2) Betoxazina, (15.3) Capsimicina, (15.4) Carvona, (15.5) Chinometionato, (15.6) Pyriofenona (Chlazafenon), (15.7) Cufraneb, (15.8) Cyflufenamida, (15.9) Cymoxanilo, (15.10) Cyprosulfamida, (15.11) Dazomet, (15.12) Debacarb, (15.13) Diclorofeno, (15.14) Diclomezina, (15.15) Difenzoquat, (15.16) Difenzoquat metilsulfato, (15.17) Difenilamina, (15.18) Ecomat, (15.19) Fenpirazamina, (15.20) Flumetover, (15.21) Fluorimida, (15.22) Flusulfamida, (15.23) Flutianilo, (15.24) Fosetil-Aluminio, (15.25) Fosetil-Calcio, (15.26) Fosetil-sodio, (15.27) Hexaclorobenzol, (15.28) Irumamicina, (15.29) Metasulfocarb, (15.30) Metilisotiocianato, (15.31) Metrafenona, (15.32) Mildiomicina, (15.33) Natamicina, (15.34) Dimetiltiociocarbarnato de níquel, (15.35) nitrothal-isopropilo, (15.36) Octilinona, (15.37) Oxamocarb, (15.38) Oxifentiina, (15.39) Pentaclorofenol y sus sales, (15.40) fenotrina, (15.41) ácido fosfórico y sus sales, (15.42) Propamocarb-Fosetilato, (15.43) Propanosin-sodio, (15.44) Pyrimorph, (15.45) (2E)-3-(4-terc-butilfenil)-3-(2-

cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona, (15.46) (2Z)-3-(4-terc-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona, (15.47) Pyrrolnitrina, (15.48) Tebufloquina, (15.49) Tecloftalam, (15.50) Tolnifanida, (15.51) Triazóxido, (15.52) Trichlamida, (15.53) Zarilamida, (15.54) 2-metilpropanoato de (3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[[[3-[[isobutiriloxi]metoxi]-4-metoxipiridin-2-il]-carbonil]amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-ilo, (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-difluoro-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, (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) 1H-imidazol-1-carboxilato de 1-(4-Metoxifenoxi)-3,3-dimetilbutan-2-ilo, (15.59) 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)piridina, (15.60) 2,3-dibutil-6-clorotieno[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona, (15.61) 2,6-dimetil-1H,5H-[1,4]ditiino[2,3-c:5,6-c]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-il]-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il)etanona, (15.64) 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, (15.65) 2-butoxi-6-yodo-3-propil-4H-cromen-4-ona, (15.66) 2-cloro-5-[2-cloro-1-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-4-metil-1H-imidazol-5-il]piridina, (15.67) 2-fenilfenol y sales, (15.68) 3-(4,4,5-trifluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina, (15.69) 3,4,5-tricloropiridin-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)tiófen-2-sulfonohidrazida, (15.74) 5-fluoro-2-[(4-fluorbencil)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) etilo (2Z)-3-amino-2-ciano-3-fenilacrilato, (15.78) N'-(4-[[3-(4-clorobencil)-1,2,4-tiadiazol-5-il]oxi]-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.79) N-(4-clorobencil)-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]propanamida, (15.80) N-[(4-cloro-fenil)(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-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloronicotinamida, (15.83) N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2-fluoro-4-yodonicotinamida, (15.84) N-{{(E)-[[ciclopropilmetoxi]imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-fenil-acetamida, (15.85) N-{{(Z)-[[ciclopropilmetoxi]imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-fenilacetamida, (15.86) N'-4-[[3-(terc-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-[(1R)-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) {6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilene]amino]-oxi]metil]piridin-2-il]carbamato de pentilo, (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)metilene]amino]-oxi]metil]piridin-2-il]carbamato de terc-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, (15.115) (5-brom-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) {6-[[[(Z)-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)-metilene]amino]oxi]metil]piridin-2-il]carbamato de but-3-in-1-ilo, (15.119) 4-amino-5-fluoropirimidin-2-ol (forma tautomérica: 4-amino-5-fluoropirimidin-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)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (15.125) (S)-[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)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.128) tiocianato de 1-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-ilo, (15.129) 5-(alilsulfanil)-1-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (15.130) 2-[1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-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) tiocianato de 1-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-

difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-ilo, (15.134) tiocianato de 1-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-ilo, (15.135) 5-(alilsulfanil)-1-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-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,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-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-trimetilheptan-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-trimetilheptan-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-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.141) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.142) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-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-trimetilheptan-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-trimetilheptan-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-bencilpiridin-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-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina, (15.149) ácido abscisínico, (15.150) 3-(difluorometil)-N-metoxi-1-metil-N-[1-(2,4,6-triclorofenil)propan-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.151) N'-[5-bromo-6-(2,3-dihidro-1H-inden-2-ilo)-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.152) N'-[5-bromo-6-[1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.153) N'-[5-bromo-6-[(1R)-1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.154) N'-[5-bromo-6-[(1S)-1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.155) N'-[5-bromo-6-[(cis-4-isopropilciclohexil)oxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.156) N'-[5-bromo-6-[(trans-4-isopropilciclohexil)oxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.157) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.158) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropilbencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.159) N-(2-terc-butilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.160) N-(5-cloro-2-etilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.161) N-(5-cloro-2-isopropilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.162) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-5-fluorbencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.163) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(5-fluoro-2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.164) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropil-5-fluorbencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.165) N-(2-ciclopentil-5-fluorbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.166) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-fluoro-6-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.167) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-5-metilbencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.168) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropil-5-metilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.169) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropil-5-metilbencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.170) N-(2-terc-butil-5-metilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.171) N-[5-cloro-2-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.172) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-N-[5-metil-2-(trifluorometil)bencil]-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.173) N-[2-cloro-6-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.174) N-[3-cloro-2-fluoro-6-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.175) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-4,5-dimetilbencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.176) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.177) 3-(difluorometil)-N-(7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.178) 3-(difluorometil)-N-[(3R)-7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.179) 3-(difluorometil)-N-[(3S)-7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.180) N'-(2,5-dimetil-4-fenoxifenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.181) N'-[4-[(4,5-dicloro-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilfenil]-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.182) N-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina. Todos los asociados de mezcla indicados de las clases (1) a (15) dado el caso pueden, en caso que debido a sus grupos funcionales tengan la capacidad, formar sales con bases o ácidos adecuados.

50 Agentes biológicos para combatir parásitos de plantas como asociados de mezcla

Los compuestos de la fórmula (I) pueden combinarse con agentes biológicos para combatir parásitos de plantas.

Los agentes biológicos para combatir parásitos de plantas comprenden en particular bacterias, hongos, levaduras, extractos de plantas y aquellos productos que fueron formados por microorganismos, incluyendo proteínas y productos metabólicos secundarios.

Los agentes biológicos para combatir parásitos de plantas comprenden bacterias como bacterias que forman esporas, bacterias que forman poblaciones en las raíces y bacterias que actúan como insecticidas, fungicidas o nematocidas biológicos.

Ejemplos de tales bacterias que se usan o bien pueden usarse como agentes biológicos para combatir parásitos de plantas son los siguientes:

5 *Bacillus amiloliquefaciens*, cepa FZB42 (DSM 231179), o *Bacillus cereus*, en particular *B. cereus* cepa CNCM I-1562 o *Bacillus firmus*, cepa I-1582 (acceso N° CNCM I-1582) o *Bacillus pumilus*, en particular la cepa GB34 (acceso N° ATCC 700814), y cepa QST2808 (acceso N° NRRL B-30087), o *Bacillus subtilis*, en particular la cepa GB03 (acceso N° ATCC SD-1397), o *Bacillus subtilis* cepa QST713 (acceso N° NRRL B-21661) o *Bacillus subtilis* cepa OST 30002
 10 (acceso N° NRRL B-50421) *Bacillus thuringiensis*, en particular *B. thuringiensis* subespecies *israelensis* (serotype H-14), cepa AM65-52 (acceso N° ATCC 1276), o *B. thuringiensis* subsp. *aizawai*, en particular la cepa ABTS-1857 (SD-1372), o *B. thuringiensis* subsp. *kurstaki* cepa HD-1, o *B. thuringiensis* subsp. *tenebrionis* cepa NB 176 (SD-5428), *Pasteuria penetrans*, *Pasteuria* spp. (Rotilenchulus reniformis nematode)-PR3 (acceso N° ATCC SD-5834), *Streptomyces microflavus* cepa AQ6121 (= QRD 31.013, NRRL B-50550), *Streptomyces galbus* cepa AQ 6047 (acceso N° NRRL 30232).

Ejemplos de hongos y levaduras que se usan o bien pueden usarse como agentes biológicos para combatir parásitos de plantas, son los siguientes:

15 *Beauveria bassiana*, en particular la cepa ATCC 74040, *Coniothyrium minitans*, en particular la cepa CON/M/91-8 (acceso N° DSM-9660), *Lecanicillium* spp., en particular la cepa HRO LEC 12, *Lecanicillium lecanii*, (anteriormente conocido como *Verticillium lecanii*), en particular la cepa KV01, *Metarhizium anisopliae*, en particular la cepa F52 (DSM3884/ ATCC 90448), *Metschnikowia fructicola*, en particular la cepa NRRL Y-30752, *Paecilomyces fumosoroseus* (nuevo: *Isaria fumosorosea*), en particular la cepa IFPC 200613, o cepa Apopka 97 (Accesion No. ATCC 20874), *Paecilomyces lilacinus*, en particular *P. lilacinus* cepa 251 (AGAL 89/030550), *Talaromyces flavus*, en particular la cepa V117b, *Trichoderma atroviride*, en particular la cepa SC1 (acceso N° CBS 122089), *Trichoderma harzianum*, en particular *T. harzianum rifai* T39. (acceso N° CNCM I-952).

Ejemplos de virus que se usan o bien pueden usarse como agentes biológicos para combatir parásitos de plantas, son los siguientes:

25 *Adoxophyes orana* (oruga de la cáscara de manzana) virus de granulosa (GV), *Cydia pomonella* (oruga de la manzana) virus de granulosa (GV), *Helicoverpa armigera* (gusano del algodón) virus de polihedrosis nuclear (NPV), *Spodoptera exigua* (gardama o rosquilla verde) mNPV, *Spodoptera frugiperda* (gusano soldado) mNPV, *Spodoptera littoralis* (gusano africano del algodón) NPV.

También están comprendidas las bacterias y los hongos que se añaden como 'inoculantes' a plantas o a partes de plantas u órganos de plantas y los que debido a sus características especiales fomentan el crecimiento y la salud de las plantas. Como ejemplos se mencionan:

30 *Agrobacterium* spp., *Azorhizobium caulinodans*, *Azospirillum* spp., *Azotobacter* spp., *Bradyrhizobium* spp., *Burkholderia* spp., en particular *Burkholderia cepacia* (anteriormente conocida como *Pseudomonas cepacia*), *Gigaspora* spp., o *Gigaspora monosporum*, *Glomus* spp., *Laccaria* spp., *Lactobacillus buchneri*, *Paraglomus* spp., *Pisolithus tinctorius*, *Pseudomonas* spp., *Rhizobium* spp., en particular *Rhizobium trifolii*, *Rhizopogon* spp., *Scleroderma* spp., *Suillus* spp., *Streptomyces* spp..

35 Son ejemplos de extractos vegetales y los productos que se han formado por microorganismos inclusive proteínas y productos metabólicos secundarios que se pueden emplear o usar como plaguicidas biológicos: *Allium sativum*, *Artemisia absinthium*, azadiractina, Biokeeper WP, *Cassia nigricans*, *Celastrus angulatus*, *Chenopodium anthelminticum*, quitina, Armour-Zen, *Dryopteris filix-mas*, *Equisetum arvense*, Fortune Aza, Fungastop, Heads Up (extracto de saponina de *Chenopodium quinoa*), piretrum/piretrinas, *Quassia amara*, *Quercus*, Quillaja, Regalia, "Requiem™ Insecticide", rotenona, *Ryania/rianodina*, *Symphytum officinale*, *Tanacetum vulgare*, timol, Triact 70, TriCon, *Tropaeolum majus*, *Urtica dioica*, veratrina, *Viscum album*, extracto de Brassicaceae, particularmente polvo de colza o mostaza.

Protectores como asociados de mezcla

45 Los compuestos de la fórmula (I) pueden combinarse con protectores, como por ejemplo Benoxacor, Cloquintocet (-mexil), Cyometrinilo, Cyprosulfamida, Dicloromida, Fencloroazol (-etilo), Fenclorim, Flurazol, Fluxofenim, Furilazol, isoxadifen (-etilo), Mefenpir (-dietilo), anhídrido naftálico, oxabetrinilo, 2-metoxi-N-({4-[(metilcarbamoil)amino]fenil}sulfonil)benzamida (CAS 129531-12-0), 4-(dicloroacetil)-1-oxa-4-azaespiro[4.5]decano de (CAS 71526-07-3), 2,2,5-trimetil-3-(dechloroacetil)-1,3-oxazolidina (CAS 52836-31-4).

Plantas y partes de plantas

50 De acuerdo con la invención, pueden tratarse todas las plantas y las partes de las plantas. Se entiende aquí como plantas todas las plantas y poblaciones de plantas, como plantas silvestres tanto deseadas como indeseadas o plantas de cultivo (incluyendo, por supuesto, plantas de cultivo de origen natural), por ejemplo cereales (trigo, arroz, triticale, cebada, centeno, avena), maíz, soja, patatas, remolacha azucarera, caña de azúcar, tomates, arvejas y otros tipos de hortalizas, algodón, tabaco, colza y además
 55 plantas con frutos (con los frutos de manzanas, peras, frutas cítricas y uvas). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que pueden obtenerse por medio de métodos de reproducción y optimización convencionales o mediante procedimientos biotecnológicos y de ingeniería genética o las combinaciones

de estos procedimientos, incluyendo plantas transgénicas e incluyendo variedades de plantas protegibles o no alcanzadas por las reglamentaciones sobre variedades protegibles. Por partes de plantas debe entenderse todas las partes y órganos de plantas subterráneos y ubicados encima la superficie, como brote, hoja, flor y raíz, y en este sentido se citan, a modo de ejemplo, hojas, acículas, tallos, troncos, flores, cuerpos fructíferos, frutos y semilla así como raíces, bulbos y rizoma. También pertenece a partes de plantas la cosecha así como el material de propagación vegetativo y generativo, por ejemplo, esquejes, bulbos, rizoma, acodos y semilla.

El tratamiento de las plantas y las partes de las plantas con los compuestos de la fórmula (I) se efectúa directamente o por la acción en el entorno, hábitat o espacio de almacenamiento mediante los procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo inmersión, pulverización, atomizado, evaporación, espolvoreo, pintura, inyección y, en el caso del material de propagación, especialmente en el caso de semillas, además mediante recubrimiento con uno o más recubridores.

Como ya se mencionó antes, todas las plantas y sus partes pueden tratarse de acuerdo con la invención. En una forma preferida de realización se tratan especies y variedades de plantas y sus partes de origen silvestre u obtenidas mediante métodos biológicos de cultivo convencionales, como hibridación o fusión de protoplastos. En otra realización preferida se tratan plantas transgénicas y variedades de plantas y sus partes que fueron obtenidas mediante métodos de ingeniería genética, en su caso en combinación con métodos convencionales (*Genetically Modified Organisms*). Los términos "partes" o bien "partes de plantas" fueron explicados más arriba. Se prefiere especialmente de acuerdo con la invención tratar respectivamente plantas de las especies de usuales en el mercado o que se encuentran en uso. Se entiende por especie de planta aquellas con nuevas propiedades ("rasgos") que hayan sido cultivadas tanto mediante cultivo convencional, por mutagénesis o por medio de técnicas de ADN recombinantes. Puede tratarse de especies, razas, biotipos o genotipos.

Plantas transgénicas, tratamiento de semillas y eventos de integración

Las plantas transgénicas o bien las especies de plantas (las que se obtienen por ingeniería genética) que se tratarán preferentemente de acuerdo con la presente invención, incluyen todas las plantas que obtuvieron material genético por medio de la ingeniería genética, que les confiere propiedades ("rasgos") ventajosas particularmente útiles a estas plantas. Son ejemplos de estas propiedades un mejor desarrollo de la planta, tolerancia aumentada a temperaturas altas o bajas, tolerancia aumentada a la sequía o al agua o al contenido salobre del suelo, rendimiento aumentado de la floración, cosechas más fáciles, maduración acelerada, rendimientos más altos, mejor calidad y/o un valor nutricional más alto de los productos cosechados, mayor duración en el almacenamiento y/o procesamientos de los productos cosechados. Otros ejemplos que pueden destacar estas propiedades en particular son una defensa mejorada de las plantas contra las plagas animales y microbianas, como ser contra insectos, arácnidos, nematodos, ácaros, caracoles, causada p. ej., por toxinas formadas en las plantas, en particular las que se forman en las plantas por el material genético de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo por los genes CryIA (a), CryIA (b), CryIA (c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF así como sus combinaciones), además una defensa mejorada de las plantas contra los hongos, bacterias y virus fitopatógenos causada por ejemplo, por resistencia adquirida sistémica (RAS), sistemina, fitoalexinas, desencadenantes y además genes de resistencia y proteínas y toxinas, así como también una mayor tolerancia de las plantas a ciertos principios activos herbicidas, por ejemplo, imidazolinonas, sulfonilureas, glifosato o fosfinotricina (por ej., el gen "PAT"). Los genes que proveen en cada caso las propiedades ("rasgos") deseados, también pueden encontrarse combinados entre sí en las plantas transgénicas. Como ejemplos de plantas transgénicas han de mencionarse las plantas de cultivo más importantes, como ser cereales (trigo, arroz, triticale, cebada, centeno, avena), maíz, soja, patatas, remolacha azucarera, caña de azúcar, tomates, arvejas y otros tipos hortalizas, algodón, tabaco, colza y además plantas con frutos (con los frutos de manzanas, peras, frutas cítricas y uvas), siendo de especial importancia maíz, soja, trigo, arroz, patata, algodón, caña de azúcar, tabaco y colza. Las propiedades ("rasgos") que se resaltan en particular son la mayor capacidad de defensa de las plantas contra insectos, arácnidos, nematodos y caracoles.

Protección de plantas – Tipos de tratamiento

El tratamiento de plantas y partes de plantas con los compuestos de la fórmula (I) se puede llevar a cabo directamente o actuando sobre su entorno, su hábitat o lugar de almacenamiento mediante el uso de procedimientos convencionales, tales como impregnación, pulverizado, evaporación, formación de partículas, dispersión, revestimiento e inyección, o para un material de propagación, especialmente para

una semilla, recubriéndola con uno o más de los compuestos etc. También es posible, aplicar los compuestos de la fórmula (I) según el procedimiento de volumen-ultra-bajo o inyectar la forma de uso o el mismo compuesto de la fórmula (I) en el suelo.

5 Un tratamiento directo preferido de las plantas es la aplicación foliar, es decir, los compuestos de la fórmula (I) se aplican sobre el follaje donde ala frecuencia del tratamiento y la cantidad de aplicación debería adecuarse a la intensidad de infestación del parásito respectivo.

10 En el caso de compuestos sistémicamente activos, los compuestos de la fórmula (I) también ingresan a las plantas a través del sistema radicular. El tratamiento de las plantas en ese caso se realiza mediante la acción de los compuestos de la fórmula (I) en el hábitat de la planta. Esto puede realizarse, por ejemplo, por empapado o mezclado en el suelo o el fertilizante líquido, es decir, el sitio de la planta (por ej., en el suelo o sistemas hidropónicos) se embebe con una forma líquida de los compuestos de la fórmula (I), o mediante la aplicación al suelo, es decir compuestos de la fórmula (I) se introducen en forma sólida (por ejemplo en forma de gránulos) en el sitio de las plantas. En el caso de cultivos de arroz con cáscara, esto además puede realizarse midiendo compuestos de la fórmula (I) en una forma de aplicación sólida (p. ej., como gránulos) dentro de un arrozal inundado.

15

Tratamiento de semillas

Desde hace tiempo se conoce la lucha contra los parásitos animales mediante el tratamiento de las semillas de plantas y es objeto de continuas mejoras. Pero a pesar de ello, se producen una serie de dificultades durante el tratamiento de semillas que no siempre pueden ser solucionadas de manera satisfactoria. Así, se pretende de desarrollar procedimientos para la protección de las semillas y de la planta en etapa de germinación que eviten la aplicación adicional de agentes fitoprotectores durante el almacenamiento, después de la siembra o después de la emergencia de las plantas o al menos la reduzcan notoriamente. Además se debe tratar de optimizar la cantidad del principio activo usado de manera tal que las semillas y la planta en etapa de germinación reciban la mejor protección posible de la infestación con parásitos animales, pero sin dañar la planta misma por el principio activo usado. En particular, se debería considerar en los procedimientos para el tratamiento de semillas las propiedades insecticidas o bien nematocidas intrínsecas de plantas resistentes a parásitos o bien plantas transgénicas tolerantes, a fin de lograr una protección óptima de las semillas y de la planta en etapa de germinación con un dispendio mínimo de agentes fitoprotectores.

La presente invención por lo tanto también se refiere a un procedimiento para la protección de semillas y de plantas en etapa de germinación antes de la infestación con parásitos, en el que las semillas se tratan con compuestos de la fórmula (I). El procedimiento de la invención para la protección de semillas y plantas en proceso de germinación ante la infestación de parásitos también incluye un procedimiento en el que las semillas se tratan en forma simultánea o secuencial con un compuesto de la fórmula (I) y los asociados de mezcla. Además comprende un procedimiento en el que las semillas se tratan en momentos diferentes con un compuesto de la fórmula (I) y los asociados de mezcla.

La invención se refiere además al uso de los compuestos de la fórmula (I) para el tratamiento de semillas para la protección de las semillas y de la planta que se forma de ellas, ante parásitos animales.

La invención se refiere además a semillas que se trató para la protección ante parásitos animales con un compuesto de la fórmula (I). La invención también se refiere a semillas que se trataron en forma simultánea con un compuesto de la fórmula (I) y asociados de mezcla. La invención además se refiere a semillas que se trataron en diferentes momentos con un compuesto de la fórmula (I) y asociados de mezcla. En semillas que se trataron en diferentes momentos con un compuesto de la fórmula (I) y asociados de mezcla, las distintas sustancias pueden estar contenidas en diferentes capas sobre las semillas. En ese caso, las capas que contienen un compuesto de la fórmula (I) y asociados de mezcla, dado el caso pueden estar separadas por una capa intermedia. La invención también se refiere a semillas en las que un compuesto de la fórmula (I) y asociados de mezcla se aplicaron como parte de un recubrimiento o como capa adicional o capas ulteriores adicionalmente a un recubrimiento.

Por lo demás, la invención se refiere a semillas las que después de un tratamiento con un compuesto de la fórmula (I) se someten a un procedimiento de recubrimiento con lámina, a fin de evitar la fricción del polvo en las semillas.

Una de las ventajas cuando uno de los compuestos de la fórmula (I) tiene efecto sistémico es que con el tratamiento de las semillas no solamente se protegen las semillas mismas, sino también las plantas que surjan de estas después de la emergencia ante hongos fitopatógenos. De este modo se puede prescindir del tratamiento inmediato del cultivo al momento de la siembra o poco después.

Otra de las ventajas radica en que mediante el tratamiento de las semillas con un compuesto de la fórmula (I) pueden fomentarse la germinación y la emergencia de las semillas tratadas.

Asimismo debe considerarse ventajoso que los compuestos de la fórmula (I) pueden usarse en particular también en semillas transgénicas.

Los compuestos de la fórmula (I) además pueden usarse en combinación con medios de la tecnología de señales, por lo que se produce una mejor colonización con simbiontes, como por ejemplo Rhizobios, Mycorrhiza y/o bacterias endofíticas u hongos y/o se logra una fijación óptima de nitrógeno.

Los compuestos de la fórmula (I) son apropiados para la protección de semillas de cualquier tipo de plantas que se usan en la agricultura, en el invernadero, en bosques o en cultivos de jardines o de vides. Especialmente se trata aquí de semillas de cereales (como trigo, cebada, centeno, triticale, mijo y avena), maíz, algodón, soja, arroz, patatas, girasol, judías, café, rábano (p. ej., remolacha azucarera y remolacha forrajera), cacahuete, colza, amapola, olivo, coco, cacao, caña de azúcar, tabaco, verdura

(como tomate, pepino, cebollas y lechuga), frutales, césped y plantas ornamentales. Especial importancia tiene el tratamiento de las semillas de cereales (como trigo, cebada, centeno y avena), maíz, soja, algodón, canola, colza y arroz.

5 Como ya se mencionó previamente, el tratamiento de semillas transgénicas con un compuesto de la fórmula (I) es de especial importancia. Esto se refiere a semillas de plantas que contienen al menos un gen heterólogo que permite la expresión de un polipéptido o una proteína con propiedades insecticidas. El gen heterólogo en semillas transgénicas puede provenir p. ej., de microorganismos de las especies Bacillus, Rhizobium, Pseudomonas, Serratia, Trichoderma, Clavibacter, Glomus o Gliocladium. La
10 presenta invención es especialmente adecuada para el tratamiento de semillas transgénicas que contiene al menos un gen heterólogo que proviene de Bacillus sp. De preferencia especial, gen heterólogo proviene de Bacillus thuringiensis.

15 En el marco de la presente invención el compuesto de la fórmula (I) se aplica solo en una formulación adecuada sobre las semillas. Preferentemente se trata la semilla en un estado en el cual sea tan estable que no se produzcan daños durante el tratamiento. En general, el tratamiento de la semilla puede realizarse en cualquier momento entre la cosecha y la siembra. Usualmente se usa la semilla que se separa de la planta y que se ha limpiado de mazorca, cáscara, tallo, vaina, lana o pulpa. Así, por ejemplo, puede usarse la semilla cosechada, limpiada y secada hasta un contenido de humedad que sea apto para su almacenamiento. En forma alternativa, también puede usarse la semilla que tras el secado se trató, por ejemplo, con agua y que luego nuevamente se secó, por ejemplo, mediante cebado. En el
20 caso de semillas de arroz también es posible usar semillas que se ha hinchado previamente en agua hasta un determinado estado (estado pigeon breast) lo que produce una mejor germinación y una emergencia más uniforme.

25 En general, en el tratamiento de la semilla debe cuidarse que la cantidad del compuesto de fórmula (I) y/o de otros aditivos aplicados a la semilla se elija de modo que no se perturbe la germinación de la semilla o bien que no se dañe la planta que surja de ella. Esto se debe cuidar sobre todo en los principios activos que en determinadas cantidades de uso pueden exhibir efectos fitotóxicos.

Los compuestos de la fórmula (I) por lo general se aplican en forma de una formulación adecuada sobre las semillas. Las formulaciones y procedimientos adecuados para el tratamiento de las semillas son conocidos por el especialista.

30 Los compuestos de la fórmula (I) pueden trasladarse a las formulaciones habituales de desinfectantes, como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, espumas, dispersiones u otros gránulos para semillas, así como formulaciones de tipo ULV.

35 Estas formulaciones se producen de manera conocida, mezclando los compuestos de la fórmula (I) con los aditivos usuales, como por ejemplo los diluyentes habituales como disolventes o diluyentes, colorantes, agentes tensioactivos, dispersantes, emulsionantes, antiespumantes, conservantes, espesantes secundarios, aglutinantes, giberelinas y también agua.

40 Como colorantes que pueden estar contenidos en las formulaciones aplicables de desinfectantes de acuerdo con la invención, se indican todos los colorantes habituales para el dicho fin. En este sentido son aplicables tanto los pigmentos poco solubles en agua, como así también los colorantes solubles en agua. Como ejemplo se mencionan los colorantes conocidos bajo las denominaciones rodamina B, C.I. pigmento rojo 112 y C.I. disolvente rojo 1.

45 Como agentes tensioactivos que pueden estar contenidos en las formulaciones de agentes tensioactivos aplicables de acuerdo con la invención vienen al caso todas las formulaciones de principios activos agroquímicos usuales que favorecen la humectación. Preferentemente son aplicables los alquilnaftalen sulfonatos, como diisopropilnaftaleno sulfonato o diisobutilnaftaleno sulfonato.

50 Como dispersantes y/o emulsionantes que pueden estar contenidos en las formulaciones de desinfectantes aplicables de acuerdo con la invención, se indican todos los dispersantes para la formulación de principios activos agroquímicos no iónicos, aniónicos y catiónicos habituales. Son preferentemente aplicables los dispersantes no iónicos o aniónicos o mezclas de dispersantes no iónicos o aniónicos. Como dispersantes no iónicos adecuados pueden mencionarse especialmente los polímeros de bloque etilenoóxido-propilenoóxido, éteres alquilfenolpoliglicólico así como éteres trisilfenolpoliglicólicos y sus derivados fosfatados o sulfatados. Son dispersantes aniónicos adecuados especialmente los sulfonatos de lignina, las sales ácidas poliacrílicas y los productos de condensación de

arilsulfonato y formaldehído.

Como antiespumantes las formulaciones de desinfectantes que pueden usarse de acuerdo con la invención pueden contener todas las sustancias inhibidoras de espuma habituales para la formulación de principios activos agroquímicos. Preferentemente son aplicables los antiespumantes de silicona y el estearato de magnesio.

Como conservantes pueden estar presentes en las formulaciones de desinfectantes que pueden usarse de acuerdo con la invención todas las sustancias aplicables en los agentes agroquímicos para tal fin. Como ejemplo se tienen el diclorofeno y el bencilalcohol hemiformal.

Como espesantes secundarios que pueden estar contenidos en las formulaciones de desinfectantes que pueden usarse de acuerdo con la invención, se indican todas las sustancias químicas empleables en agentes agroquímicos para tal fin. Preferentemente entran en consideración los derivados de la celulosa, los derivados del ácido acrílico, xantano, arcillas modificadas y ácidos silícicos altamente dispersos.

Como aglutinantes que pueden estar contenidos en los desinfectantes que pueden usarse de acuerdo con la invención, se indican todas las sustancias aglutinantes usuales empleables en desinfectantes. Preferentemente pueden nombrarse polivinilpirrolidona, acetato de polivinilo, alcohol de polivinilo y tilosa.

Como giberelinas que pueden estar contenidos en las formulaciones de desinfectantes que pueden usarse de acuerdo con la invención, se indican preferentemente las giberelinas A1, A3 (= ácido giberelínico), A4 y A7, se usa preferentemente el ácido giberelínico. Las giberelinas son conocidas (véase R. Wegler "*Chemie der Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmittel*", Tomo 2, Springer Verlag, 1970, páginas 401-412).

Se pueden emplear las formulaciones de desinfectantes que pueden usarse de acuerdo con la invención ya sea en forma directa o luego de la previa dilución con agua para el tratamiento de las semillas de los más variados modos. Así los concentrados o las preparaciones que se obtienen de ellos mediante la dilución con agua puede usarse para la desinfección de semillas de cereales, como trigo, cebada, centeno, avena y triticale, así como de semillas de maíz, arroz, colza, arvejas, judías, algodón, girasol, soja y rábanos o también de semillas de hortalizas de tipos muy diferentes. Las formulaciones de desinfectantes que pueden usarse de acuerdo con la invención o sus formas de uso diluidas también puede usarse para la desinfección de semillas de plantas transgénicas.

Para el tratamiento de semillas con las formulaciones de desinfectantes que pueden usarse de acuerdo con la invención o con los preparados resultantes producidos con adición de agua, entran en consideración todos los dispositivos usuales de mezcla que pueden usarse para la desinfección. En particular, para la desinfección se procede colocando la semilla en un mezclador con las correspondientes cantidades de formulaciones de desinfectante o como tal o luego de la previa dilución con agua y hasta la distribución uniforme de la formulación sobre la semilla. Eventualmente se añade un proceso de secado.

La cantidad de aplicación en las formulaciones de decapado que se usan de acuerdo con la invención puede variarse dentro de un intervalo más amplio. Se rige según el contenido respectivo de los compuestos de la fórmula (I) en las formulaciones y por las semillas. Las cantidades de aplicación en el compuesto de la fórmula (I) por lo general se encuentran entre 0,001 y 50 g por kilogramo de semillas, preferentemente entre 0,01 y 15 g por kilogramo de semillas.

Uso en sanidad animal

En el ámbito de la sanidad animal, esto es en el ámbito de la medicina veterinaria, los principios activos de acuerdo a la presente invención producen efectos contra parásitos animales, especialmente ectoparásitos y endoparásitos. El término endoparásitos incluye especialmente helmintos como cestodos, nematodos o trematodos, y protozoos como coccidias. Los ectoparásitos son en forma típica y preferentemente artrópodos, especialmente insectos como moscas (de la clase que pica y de la que succiona), larvas de moscas parasitarias, piojos, malófagos, liendres, pulgas y demás; o ácaros como garrapatas, como por ejemplo, garrapatas de caparazón o garrapatas de piel de cuero, o ácaros como la sarna, ácaros con movimiento, ácaros de cuero y similares así como ectoparásitos acuáticos como copépodos.

Los principios activos de acuerdo con la invención resultan apropiados en el caso de una toxicidad

favorable para animales de sangre caliente, para combatir endoparásitos patógenos que se encuentran en los lugares de manutención y cría de animales, en los animales domesticados, de cría, de zoológico, de laboratorio, de ensayo y en mascotas. Son efectivos en todos o en algunos de los estadios de desarrollo de los parásitos.

- 5 Se incluyen en los animales útiles en la ganadería especialmente los mamíferos, como ovejas, cabras, caballos, asnos, camellos, búfalos, conejos, gamos, renos, y en particular vacas y cerdos; aves como pavos, patos, gansos y en particular gallinas; peces y crustáceos, p. ej. en el cultivo acuático y también insectos como las abejas.

10 En los animales domésticos se incluyen por ejemplo mamíferos como hámster, cobayos, ratas, ratones, chinchillas, hurones y en particular perros, gatos, aves domésticas, reptiles, anfibios y peces de acuario.

De acuerdo con una realización preferida se administran los compuestos de la fórmula (I) a mamíferos.

De acuerdo con otra realización preferida se administran los compuestos de la fórmula (I) a aves, a saber aves domésticas y en particular a aves de corral.

15 Mediante el uso de los compuestos de la fórmula (I) para combatir los parásitos animales se desea reducir o evitar las enfermedades, los casos de muerte y las mermas de rendimientos (en la producción de carne, leche, lana, pieles, huevos, miel, etc.) de modo que mediante el uso de los principios activos es posible una tenencia de animales más económica y sencilla y un mejor bienestar de los animales.

20 Con respecto al área de la sanidad animal, el concepto “combate” o “combatir” significa que mediante los compuestos de la fórmula (I) puede reducirse de manera efectiva la presentación de los parásitos respectivos en un animal que está infestado con tales parásitos en una medida no riesgosa. Más exactamente “combatir” significa en el presente contexto que el compuesto de la fórmula (I) eliminan al parásito respectivo, impiden su crecimiento o puede impedir su multiplicación.

Forman parte de estos parásitos:

25 Del orden de los Anopluros p. ej., *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp., *Solenopotes* spp.; del orden Mallophagida y los subórdenes Amblycerina e Ischnocerina, por ejemplo *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp., *Felicola* spp.; del orden 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.,
30 *Haematopota* spp., *Philipomyia* spp., *Braula* spp., *Musca* spp., hidrotæa spp., *Stomoxis* spp., *Haematobia* spp., *Morellia* spp., *Fannia* spp., *Glossina* spp., *Calliphora* spp., *Lucilia* spp., *Chrysomyia* spp., *Wohlfahrtia* spp., *Sarcophaga* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Gasterophilus* spp., *Hippobosca* spp., *Lipoptena* spp., *Melophagus* spp., *Rhinoestrus* spp., *Tipula* spp.; del orden Siphonapterida, por ejemplo *Pulex* spp., *Ctenocephalides* spp., *Tunga* spp., *Xenopsilla* spp., *Ceratophyllus* spp.;

35 del orden heteroptera, por ejemplo *Cimex* spp., *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongilus* spp.; así como insectos molestos e insectos nocivos para la sanidad del orden de los Blattarida.

Además se incluyen en los artrópodos:

40 De la subclase de los ácaros (Acarina) y los órdenes de los Meta- y Mesostigmata p. ej., *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., *Ixodes* spp., *Amblyomma* spp., *Rhipicephalus* (*Boophilus*) spp., *Dermacentor* spp., *Haemophysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Dermanyssus* spp., *Rhipicephalus* spp. (de la especie originaria de las garrapatas multihospedantes), *Ornithonyssus* spp., *Pneumonyssus* spp., *Raillietia* spp., *Pneumonyssus* spp., *Sternostoma* spp., *Varroa* spp., *Acarapis* spp.; del orden de los Actiniedida (Prostigmata), por ejemplo *Acarapis* spp., *Cheiletiella* spp., *Ornithocheiletiella* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Neotrombicula* spp., *Listrophorus* spp.; y del orden de los Acaridida (Astigmata), por ejemplo *Acarus* spp.,
45 *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp., *Laminosioptes* spp..

Forman parte de los parásitos protozoarios:

50 *Mastigophora* (Flagellata), como por ejemplo *Trypanosomatidae*, por ejemplo *Trypanosoma* b. *brucei*, T.b. *gambiense*, T.b. *rhodesiense*, T. *congolense*, T. *cruzi*, T. *evansi*, T. *equinum*, T. *lewisi*, T. *percae*, T. *simiae*, T. *vivax*, *Leishmania* *brasiliensis*, L. *donovani*, L. *tropica*, como por ejemplo *Trichomonadidae*, por ejemplo *Giardia* *lamblia*, *G. canis*;

Sarcomastigophora (Rhizopoda), como *Entamoebidae*, por ejemplo *Entamoeba* *histolytica*, *Hartmanellidae*, por ejemplo *Acanthamoeba* sp., *Harmanella* sp.;

- Apicomplexa (Sporozoa), como Eimeridae, por ejemplo *Eimeria acervulina*, *E. adenoides*, *E. alabamensis*, *E. anatis*, *E. anserina*, *E. arloingi*, *E. ashata*, *E. auburnensis*, *E. bovis*, *E. brunetti*, *E. canis*, *E. chinchillae*, *E. clupearum*, *E. columbae*, *E. contorta*, *E. crandalis*, *E. deblickei*, *E. dispersa*, *E. ellipsoidales*, *E. falciformis*, *E. faurei*, *E. flavescens*, *E. gallopavonis*, *E. hagani*, *E. intestinalis*, *E. iroquoina*, *E. irresidua*, *E. labbeana*, *E. leucarti*, *E. magna*, *E. maxima*, *E. media*, *E. meleagridis*, *E. meleagrimitis*, *E. mitis*, *E. necatrix*, *E. ninakohlyakimovae*, *E. ovis*, *E. parva*, *E. pavonis*, *E. perforans*, *E. phasani*, *E. piriformis*, *E. praecox*, *E. residua*, *E. scabra*, *E. spec.*, *E. stiedai*, *E. suis*, *E. tenella*, *E. truncata*, *E. truttae*, *E. zuernii*, *Globidium spec.*, *Isospora belli*, *I. canis*, *I. felis*, *I. ohioensis*, *I. rivolta*, *I. spec.*, *I. suis*, *Cystisopora spec.*, *Cryptosporidium spec.*, en particular *C. parvum*; como Toxoplasmodidae, por ejemplo *Toxoplasma gondii*, *Hammondia heydornii*, *Neospora caninum*, *Besnoitia besnoitii*; como Sarcocystidae, por ejemplo *Sarcocystis bovicanis*, *S. bovi hominis*, *S. ovicanis*, *S. ovifelis*, *S. neurona*, *S. spec.*, *S. sui hominis*, como Leucozooidae, por ejemplo *Leucozytozoon simondi*, como Plasmodiidae, por ejemplo *Plasmodium berghei*, *P. falciparum*, *P. malariae*, *P. ovale*, *P. vivax*, *P. spec.*, como Piroplasmae, por ejemplo *Babesia argentina*, *B. bovis*, *B. canis*, *B. spec.*, *Theileria parva*, *Theileria spec.*, como Adeleina, por ejemplo *Hepatozoon canis*, *H. spec.*
- 15 Los endoparásitos patógenos en los que se trata de helmintos, incluyen tenias (p. ej., Monogenea, Cestodes y Trematodes), gusanos, Acanthocephala y Pentastoma. Se incluyen así:
- Monogenea: p. ej., : *Gyrodactylus* spp., *Dactylogyrus* spp., *Polystoma* spp.;
- Cestodes: del orden de los Pseudophyllidea por ejemplo: *Diphilobothrium* spp., *Spirometra* spp., *Schistocephalus* spp., *Ligula* spp., *Bothridium* spp., *Diplogonoporus* spp.;
- 20 del orden de los ciclophyllida por ejemplo: *Mesocestoides* spp., *Anoplocephala* spp., *Paranoplocephala* spp., *Moniezia* spp., *Thysanosoma* spp., *Thysaniezia* spp., *Avitellina* spp., *Stilesia* spp., *Cittotaenia* spp., *Andyra* spp., *Bertiella* spp., *Taenia* spp., *Equinococcus* spp., *Hidatigera* spp., *Davainea* spp., *Raillietina* spp., *Hymenolepis* spp., *Equinolepis* spp., *Equinocotile* spp., *Diorchis* spp., *Dipilidium* spp., *Joyeuxiella* spp., *Diploplidium* spp.;
- Trematodos: de la clase de los Digenea por ejemplo: *Diplostomum* spp., *Posthodiplostomum* spp., *Schistosoma* spp., *Trichobilharzia* spp., *Ornithobilharzia* spp., *Austrobilharzia* spp., *Gigantobilharzia* spp., *Leucochloridium* spp., *Brachilaima* spp., *Equinostoma* spp., *Equinoparyphium* spp., *Equinochasmus* spp., *Hypoderaeum* spp., *Fasciola* spp., *Fascioloides* spp., *Fasciolopsis* spp., *ciclocoelum* spp., *Typhlocoelum* spp., *Paramphistomum* spp., *Calicophoron* spp., *Cotilophoron* spp., *Gigantocotile* spp., *Fischoederius* spp., *Gastrothilacus* spp., *Notocotilus* spp., *Catatropis* spp., *Plagiorchis* spp., *Prosthogonimus* spp., *Dicrocoelium* spp., *Eurytrema* spp., *Troglorema* spp., *Paragonimus* spp., *Collyriclum* spp., *Nanophyetus* spp., *Opisthorchis* spp., *Clonorchis* spp., *Metorchis* spp., *heterophyes* spp., *Metagonimus* spp.;
- 25 Gusanos: Trichinellida por ejemplo: *Trichuris* spp., *Capillaria* spp., *Paracapillaria* spp., *Eucoleus* spp., *Trichomosoides* spp., *Trichinella* spp.;
- del orden de los Tilenchida por ejemplo: *Micronema* spp., *Strongiloides* spp.;
- 35 del orden de los Rhabditida por ejemplo: *Strongilus* spp., *Trypanostomatium* spp., *Oesophagodontus* spp., *Trichonema* spp., *Gyalocephalus* spp., *Cilindropharynx* spp., *Poteriostomum* spp., *ciclocercus* spp., *Cilicostephanus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Chabertia* spp., *Stephanurus* spp., *Ancilostoma* spp., *Uncinaria* spp., *Necator* spp., *Bunostomum* spp., *Globocephalus* spp., *Syngamus* spp., *Cyathostoma* spp., *Metastrongilus* spp., *Dictyocaulus* spp., *Muellerius* spp., *Protostrongilus* spp., *Neoststrongilus* spp., *Cystocaulus* spp., *Pneumostrongilus* spp., *Spicocaulus* spp., *Elaphostrongilus* spp., *Parelaphostrongilus* spp., *Crenosoma* spp., *Paracrenosoma* spp., *Oslerus* spp., *Angiostrongilus* spp., *Aelurostrongilus* spp., *Filaroides* spp., *Parafilaroides* spp., *Trichostrongilus* spp., *Haemonchus* spp., *Ostertagia* spp., *Teladorsagia* spp., *Marshallagia* spp., *Cooperia* spp., *Nippostrongilus* spp., *Heligmosomoides* spp., *Nematodirus* spp., *Hyoststrongilus* spp., *Obeliscoides* spp., *Amidostomum* spp., *Ollulanus* spp.;
- 40 del orden de los Spirurida por ejemplo: *Oxyuris* spp., *Enterobius* spp., *Passalurus* spp., *Syphacia* spp., *Aspicularis* spp., *heterakis* spp.; *Ascaris* spp., *Toxascaris* spp., *Toxocara* spp., *Bailisascaris* spp., *Parascaris* spp., *Anisakis* spp., *Ascaridia* spp.; *Gnathostoma* spp., *Physaloptera* spp., *Thelazia* spp., *Gongylonema* spp., *Habronema* spp., *Parabronema* spp., *Draschia* spp., *Dracunculus* spp.; *Stephanofilaria* spp., *Parafilaria* spp., *Setaria* spp., *Loa* spp., *Dirofilaria* spp., *Litomosoides* spp., *Brugia* spp., *Wuchereria* spp., *Onchocerca* spp., *Spirocerca* spp.;
- 50 Acanthocephala: del orden de los Oligacanthorhynchida p. ej.: *Macracanthorhynchus* spp., *Prosthenorchis* spp.; del orden de los Polymorphida por ejemplo: *Filicollis* spp.; del orden de los Moniliformida por ejemplo: *Moniliformis* spp.;
- del orden de los Equinorhynchida por ejemplo *Acanthocephalus* spp., *Equinorhynchus* spp., *Leptorhynchoides* spp.;
- 55 Pentastoma: del orden de los Porocephalida por ejemplo *Linguatula* spp.

En el área de la medicina veterinaria y la mantención de animales la administración del compuesto de la fórmula (I) se realiza según procedimientos conocidos en general por los especialistas, como por vía enteral, parenteral, dermal o nasal en forma de preparados adecuados. La administración puede ser profiláctica o terapéutica.

Así, una realización de la presente invención se refiere al uso de un compuesto de la fórmula (I) como medicamento.

5 Otro aspecto se refiere al uso de un compuesto de la fórmula (I) como anti-endoparasitario, en particular como un helminticida o un agente contra protozoos. Los compuestos de la fórmula (I) son adecuados para su uso como anti-endoparasitario, en particular como un helminticida o un agente contra protozoos, a modo de ejemplo en la cría de animales, en la mantención de animales, en establos y en el sector sanitario.

10 Otro aspecto se refiere a su vez al uso de un compuesto de la fórmula (I) como antiectoparásito, en particular un artropocida como un insecticida o un acaricida. Otro aspecto se refiere al uso de un compuesto de la fórmula (I) como antiectoparásito, en particular un artropocida como insecticida o acaricida, por ejemplo en la mantención de animales, en la cría de animales, en estables o en el sector sanitario.

Control de vectores

15 Los compuestos de la fórmula (I) pueden también usarse en el control de vectores. Un vector en el sentido de la presente invención es un artrópodo, especialmente un insecto o arácnido que es capaz de transmitir agentes patógenos como por ejemplo virus, gusanos, organismos unicelulares y bacterias de un reservorio (una planta, un animal, un ser humano, etc.) a un hospedante. Los agentes patógenos pueden transmitirse en forma mecánica (por ejemplo, Trachoma mediante moscas no picadoras) a un hospedante, o mediante picadura (por ejemplo, parásitos de malaria mediante mosquitos) a un
20 hospedante.

Son ejemplos de vectores y enfermedades transmitidas por ellos o de agentes patógenos:

1) Moscas

- Anopheles: malaria, filaríose;
- Culex: encefalitis japonesa, filariasis, otras enfermedades virales, transmisión de gusanos;
- 25 - Aedes: fiebre amarilla, fiebre de dengue, filariasis, otras enfermedades virales;
- Simulium: transmisión de gusanos, especialmente onchocerca volvulus

2) Piojos: infecciones de piel, tifus exantemático (tifus epidémica);

3) Pulgas: peste, tifus exantemático endémico;

4) Moscas: Enfermedad del sueño (tripanosomiasis); cólera, otras enfermedades bacterianas.

30 5) Ácaros: Acariosis, tifus exantemático, tifus pustuloso, turalemia, encefalitis de Saint-Louis, meningitis viral (FSME), fiebre de Krim-Kongo, tifus exantemático, borreliosis;

6) Garrapatas: borreliosis tales como borrelia duttoni, meningoencefalitis de principios de verano, fiebre "Q" (coxiella burnetii), babesias (babesia canis canis).

35 Son ejemplos de vectores en el sentido de la presente invención insectos como por ejemplo áfidos, moscas, cigarras o *Trips*, los cuales pueden transmitir a plantas virus de plantas. Otros vectores que pueden transmitir virus de plantas son tetranicos, piojos, escarabajos y nematodos.

40 Otros ejemplos de vectores en el sentido de la presente invención son insectos y arácnidos tales como mosquitos, especialmente de la especie Aedes, Anopheles, por ejemplo, A. gambiae, A. arabiensis, A. funestus, A. dirus (malaria) y Culex, piojos, pulgas, moscas, ácaro y garrapatas que pueden transmitir agentes patógenos a animales y/o humanos.

Es también posible un combate de vectores cuando los compuestos son capaces de romper la resistencia.

45 Los compuestos de la presente invención son adecuados para el uso en la prevención de enfermedades o bien de agentes patógenos que pueden ser transmitidos por vectores. Otro aspecto más de la presente invención es el uso de compuestos de acuerdo con la invención para el combate de vectores, por ejemplo, en la agricultura, en la horticultura, en bosques, en jardines y elementos de ocio, así como en la

protección de materiales y acopios.

Protección de materiales técnicos

5 Los compuestos de la fórmula (I) son adecuados para la protección de materiales técnicos contra la infestación o la destrucción por insectos, p. ej., del orden de los Coleoptera, Hymenoptera, Isoptera, Lepidoptera, Psocoptera y Zygentoma.

Por materiales técnicos debe entenderse en este contexto los materiales inertes en este conjunto como preferentemente plásticos, adhesivos, pegamentos, papeles y cartones, cuero, madera, productos para el tratamiento de madera y barnices. El uso de la invención para la protección de madera es especialmente preferido.

10 En otra realización se usan los compuestos de la fórmula (I) junto con al menos otro insecticida y/o al menos un fungicida.

15 En otra realización los compuestos de la fórmula (I) están disponibles como agentes listos para su uso (ready-to-use) para combatir parásitos de plantas, es decir puede aplicarse sin otra modificación sobre el correspondiente material. Como otros insecticidas o como fungicidas entran en consideración en particular los antes mencionados.

20 Sorprendentemente se encontró también que los compuestos de la fórmula (I) pueden emplearse para la protección de incrustación de objetos, especialmente de cascos de buques, tamices, redes, construcciones, instalaciones de muelles y dispositivos de señalización que entran en contacto con agua de mar o salobre. Los compuestos de fórmula (I) pueden emplearse además solos o en combinación con otros principios activos como agente químico anti-putrefacción.

Control de parásitos animales en el sector de higiene

25 Los compuestos de la fórmula (I) son adecuados también para combatir parásitos animales como protección del hogar, la higiene y los acopios, especialmente contra insectos, arácnidos y ácaros que existen en espacios cerrados, como por ejemplo, viviendas, naves industriales, oficinas y cabinas de vehículos entre otros. Para combatir los parásitos animales se usan los compuestos de la fórmula (I) solos o en combinación con otros principios activos y coadyuvantes. Preferentemente se usan en productos insecticidas domésticos. Los compuestos de la fórmula (I) son efectivos contra formas sensibles y resistentes, así como contra todos los estadios de desarrollo.

30 En estos parásitos se incluyen, por ejemplo, parásitos de la clase de los arácnidos, de los órdenes de los escorpiones, Araneae y opiliones, de las clases quilópodos y diplópodos, de las clases de los insectos el orden de los coleópteros, dermápteros, dípteros, heterópteros, himenópteros, isópteros, lepidópteros, ftirápteros, psocópteros, saltatorios u ortópteros, sifonápteros y cigentoma y de la clase Malacostraca el orden de los isópodos.

35 La aplicación se realiza en aerosoles, pulverizantes sin presión, por ejemplo, rociadores por bombeo y rociadores atomizadores, fumigadores desinfectantes, nebulizadores, espumas, geles, productos vaporizadores con placa vaporizadora de celulosa o plástico, vaporizadores líquidos, vaporizadores de gel y de membrana, vaporizadores propulsados a hélice, sistemas vaporizadores sin energía o pasivos, papeles antipolilla, bolsitas antipolilla y geles antipolilla, como granulados o como polvos, en cebos o en dispositivos con cebos.

40 Los siguientes ejemplos de preparación y uso ilustran la invención sin constituir limitación alguna. Los productos se caracterizaron mediante espectroscopía de RMN de ¹H y/o CL-EM (Liquid Chromatography Mass Spectrometry) y/o CG-EM (Gas Chromatography-Mass Spectrometry).

45 La determinación de los valores logP se efectuó análogamente a la Directiva OECD 117 (directiva CE 92/69/EEC) mediante HPLC (High Performance Liquid Chromatography) en columnas de fase reversa (C 18), de acuerdo con los procedimientos siguientes:

[a] la determinación con la CL-EM en el intervalo ácido se realiza a un valor de pH 2,7 con 0,1 % ácido fórmico acuoso y acetonitrilo (contiene 0,1 % de ácido fórmico) como eluyente; gradiente lineal de 10 % de acetonitrilo a 95 % de acetonitrilo.

50 [b] la determinación con la CL-EM en el intervalo neutral a un valor de pH 7.8 con una solución acuosa 0,001 molar de solución hidrocbonato de amonio y acetonitrilo como eluyente; gradiente lineal de 10 % de acetonitrilo a 95 % de acetonitrilo.

La calibración se realiza con alcan-2-onas no ramificadas (con 3 a 16 átomos de carbono) cuyos valores logP son conocidos (determinación de los valores logP con los tiempos de retención por medio de interpolación lineal entre dos alcanonas sucesivas).

5 Los espectros de RMN se midieron con un Bruker Avance 400, equipado con un cabezal de muestra de flujo de paso (volumen 60 μ l). En casos aislados se determinaron los espectros de RMN con un dispositivo Bruker Avance II 600.

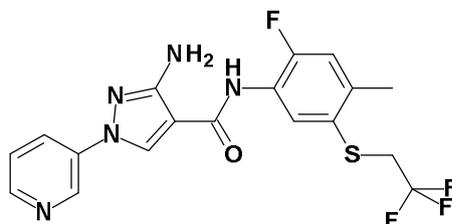
10 Los datos de RMN de ejemplos seleccionados se indican en la forma clásica (valores δ , escisión de multiplete, cantidad de átomos de H). La disociación de las señales se ha descrito como sigue: s (singulete), d (duplete), t (triplete), q (cuarteto), quin (quintuplete), m (multiplete), a (para señales anchas). Como disolventes se usaron CD_3CN , $CDCl_3$ o D_6 -DMSO, donde como referencia se usó tetrametilsilano (0,00 ppm).

Ejemplos de preparación:

Ejemplo 1

5-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoretil)sulfanil]fenil}-2-(piridin-3-il)-2,5-dihidro-4H-pirazolo[3,4-d]pirimidin-4-ona (I-1-1)

15 **Paso 1:** 3-amino-N-{2-fluor-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoretil)sulfanil]fenil}-1-(piridin-3-il)-1H-pirazol-4-carboxamida (II-1)

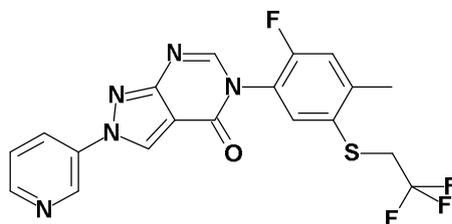


(II-1)

20 Se añadieron a 500 mg (2,09 mmol) de 2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoretil)sulfanil]anilina en 1,3 ml de 1,2-dicloroetano lentamente gota a gota 2,09 ml de una solución de trimetilaluminio 2 M en tolueno y se agitó 1 hora (h) a temperatura ambiente. Se añadieron 562 mg (2,09 mmol) de 3-amino-1-(piridin-3-il)-1H-pirazol-4-carboxilato de etilo (II-1) en 1,3 ml de 1,2-dicloroetano y la mezcla de reacción se calentó durante la noche bajo reflujo. Después del enfriado, se diluyó la mezcla de reacción con agua y cuidadosamente se vertió sobre una solución al 10 % de tartrato de sodio-potasio. La mezcla se hizo precipitar tres veces con cloruro de metileno, se separó la fase orgánica, se secó sobre sulfato de sodio, se filtró y se concentró. El residuo se colocó sobre gel de sílice y se purificó mediante un cartucho de gel de sílice mediante MPLC preparativa (eluyente ciclohexano / éster acético). La fracción aislada dio 551 mg (100 % de pureza después de CL/EM, 62 % d. t.) del compuesto del título.

25 logP[a]: 2,72; logP[b]: 2,63; RMN de 1H (D_6 -DMSO, 400MHz) δ ppm: 9,61 (d,1H), 9,05 (s,1H), 8,95 (d,1H), 8,49-8,48 (m,1H), 8,06-8,02 (m,1H), 7,91 (d,1H), 7,57-7,53 (m,1H), 7,29 (d,1H), 5,89 (s,2H), 3,85 (q,2H), 2,41 (s,3H)

30 **Paso 2:** 5-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoretil)sulfanil]fenil}-2-(piridin-3-il)-2,5-dihidro-4H-pirazolo[3,4-d]pirimidin-4-ona (I-1-1)



(I-1-1)

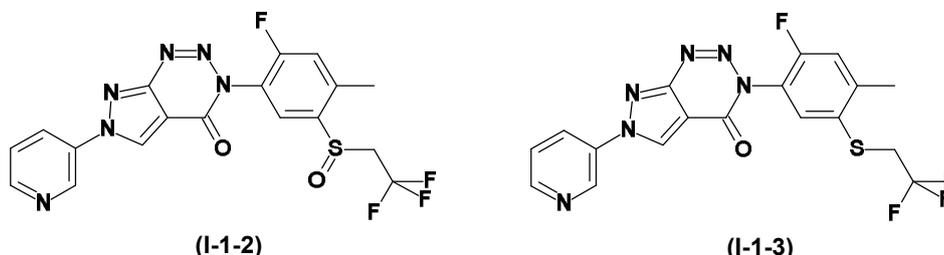
35 Se añadieron a 170 mg (0,40 mmol) de 3-amino-N-{2-fluor-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoretil)sulfanil]fenil}-1-(piridin-3-il)-1H-pirazol-4-carboxamida (II-1) en 2 ml *N,N*-dimetilacetamida, 34,0 mg (0,20 mmol) de ácido *p*-toluensulfónico y 200 μ l (178 mmol, 1,20 mmol) de trietiléster de ácido ortofórmico. La mezcla de reacción se calentó durante 1 h a 200 vatios en un horno a microondas CEM Discover a 130 $^{\circ}C$. Después del enfriado, se mezcló la mezcla de reacción con material RP-18 y se eliminó el disolvente bajo presión reducida. El residuo se purificó usando un cartucho RP-18 mediante MPLC preparativa (eluyente agua / acetonitrilo). La fracción aislada contenía 80,0 mg (96 % de pureza según CL/EM, 44 % d. t.) del compuesto del título.

logP[a]: 2,65; logP[b]: 2,63; RMN de 1H (D_6 -DMSO, 400MHz) δ ppm: 9,59 (d,1H), 9,29 (s,1H), 8,68 (dd,1H), 8,47-

8,44 (m,1H), 8,36 (s,1H), 7,87 (d,1H), 7,68-7,64 (m,1H), 7,46 (d,1H), 4,03 (q,2H), 2,46 (s,3H)

Ejemplo 2

3-[2-fluoro-4-metil-5-(2,2,2-trifluoroetilsulfinil)fenil]-6-(3-piridil)pirazolo[3,4-d]triazin-4-ona (I-1-2) y 3-[2-fluoro-4-metil-5-(2,2,2-trifluoroetilsulfanil)-fenil]-6-(3-piridil)pirazolo[3,4-d]triazin-4-ona (I-1-3)



5

Se añadieron a 180 mg (0,42 mmol) de 3-amino-*N*-[2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoretil)sulfanil]fenil]-1-(piridin-3-il)-1*H*-pirazol-4-carboxamida (II-1) en 5 ml agua y 5 ml de ácido clorhídrico concentrado, gota a gota una solución de 248 mg (3,60 mmol) de nitrito de sodio en 5 ml de agua. La preparación se agitó durante 6 horas a 70 °C. Después del enfriado, se vertió la mezcla de reacción sobre cloruro de metileno y se ajustó el valor de pH a 7 con solución concentrada de bicarbonato de sodio. La mezcla se extrajo tres veces con cloruro de metileno, se lavaron las fases orgánicas combinadas con agua, se secó sobre sulfato de sodio, se filtró y se concentró. El residuo se colocó sobre RP-18 y se purificó usando un cartucho RP-18 mediante MPLC preparativa (eluyente agua / acetonitrilo). Las fracciones aisladas contenían 64,0 mg (100 % de pureza después de CL/EM, 33 % d. t.) de 3-[2-fluoro-4-metil-5-(2,2,2-trifluoroetilsulfinil)fenil]-6-(3-piridil)pirazolo[3,4-d]triazin-4-ona (I-1-2) y 72,0 mg (100 % de pureza después de CL/EM, 39 % d. t.) de 3-[2-fluoro-4-metil-5-(2,2,2-trifluoroetilsulfanil)fenil]-6-(3-piridil)pirazolo[3,4-d]triazin-4-ona (I-1-3).

10

15

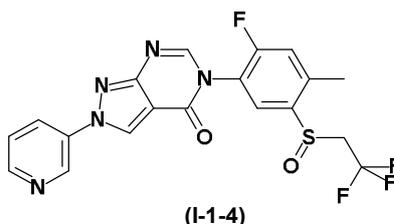
(I-1-2) logP[a]: 2,22; logP[b]: 2,19; RMN de ¹H (D₆-DMSO, 400MHz) δ ppm: 9,84 (s,1H), 9,37 (s,1H), 9,36 (d,1H), 8,78-8,76 (m,1H), 8,20 (d,1H), 7,75-7,71 (m,1H), 7,64 (d,1H), 4,39-4,01 (m,2H), 3H debajo del pico de DMSO.

20

(I-1-3) logP[a]: 3,18; logP[b]: 3,14; RMN de ¹H (D₆-DMSO, 400MHz) δ ppm: 9,84 (s,1H), 9,36 (s,1H), 8,78-8,76 (m,1H), 8,56-8,53 (d,1H), 7,95 (d,1H), 7,75-7,71 (m,1H), 7,52 (d,1H), 3,99 (q,2H), 3H debajo del pico de DMSO.

Ejemplo 3

5-[2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoretil)sulfinil]fenil]-2-(piridin-3-il)-2,5-dihidro-4*H*-pirazolo[3,4-d]pirimidin-4-ona (I-1-4)



25

A una solución de 61,0 mg (0,14 mmol) de 5-[2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoretil)sulfanil]fenil]-2-(piridin-3-il)-2,5-dihidro-4*H*-pirazolo[3,4-d]pirimidin-4-ona (I-1-1) en 3 ml de cloruro de metileno se añadieron a 0 °C 35,4 mg (0,14 mmol) de ácido meta-cloroperbenzoico. La mezcla de reacción se agitó 2 horas a temperatura ambiente, después de diluyó con cloruro de metileno y se mezcló con solución concentrada de bicarbonato de sodio. Después de 10 minutos se separaron las fases, la fase orgánica se mezcló con material RP-18 y se eliminó el disolvente bajo presión reducida. El residuo se purificó usando un cartucho RP-18 mediante MPLC preparativa (eluyente agua / acetonitrilo). La fracción aislada contenía 36,0 mg (98,5 % de pureza según CL/EM, 56 % d. t.) del compuesto del título.

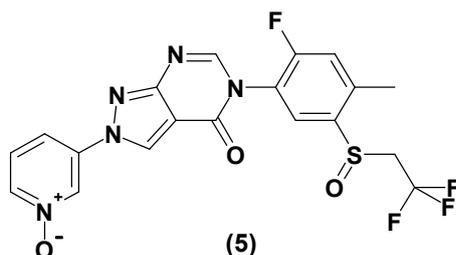
30

logP[a]: 1,79; logP[b]: 1,78; RMN de ¹H (D₆-DMSO, 400MHz) δ ppm: 9,60 (s,1H), 9,30 (d,1H), 8,68 (d,1H), 8,47-8,42 (m,2H), 8,11 (d,1H), 7,67-7,65 (m,1H), 7,58 (d,1H), 4,35-4,05 (m,2H), 3H debajo del pico de DMSO

35

Ejemplo 4

5-[2-fluoro-4-metil-5-(2,2,2-trifluoroetilsulfinil)fenil]-2-(1-oxidopiridin-1-ium-3-il)pirazolo[3,4-d]pirimidin-4-ona (I-1-5)

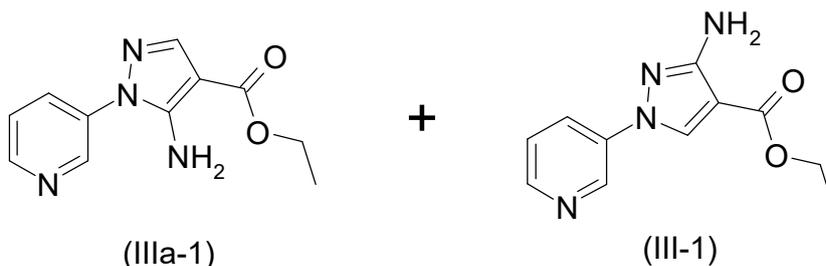


A una solución de 100 mg (0,23 mmol) de 5-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoretil)sulfanil]fenil}-2-(piridin-3-il)-2,5-dihidro-4*H*-pirazolo[3,4-*d*]pirimidin-4-ona (I-1-1) en 3 ml cloruro de metileno se añadieron a 0 °C 119 mg (0,48 mmol) de ácido meta-cloroperbenzoico. La mezcla de reacción se agitó durante la noche a temperatura ambiente y a continuación se mezcló con 28,0 mg (0,12 mmol) de ácido meta-cloroperbenzoico. Después de otra noche a temperatura ambiente, se diluyó la mezcla de reacción con cloruro de metileno y se mezcló con solución concentrada de bicarbonato de sodio. Después de 10 minutos se separó el sólido por filtración con succión, el que se lavó con agua y diclorometano y se secó. Este contenía 43,0 mg (78 % de pureza según CL/EM, 31 % d. t.) del compuesto del título.

logP[a]: 1,39; logP[b]: 1,33; RMN de 1H (D6-DMSO, 400MHz) δ ppm: 9,60 (s,1H), 9,02 (s,1H), 8,44 (s,1H), 8,31 (d,1H), 8,11 (d,1H), 8,03 (d,1H), 7,65-7,57 (m,2H), 4,32-4,05 (m,2H), 3H debajo del pico de DMSO

Síntesis de intermedios

5-amino-1-(piridin-3-il)-1*H*-pirazol-4-carboxilato de etilo (IIIa-1) y 3-amino-1-(piridin-3-il)-1*H*-pirazol-4-carboxilato de etilo (III-1) según el procedimiento B



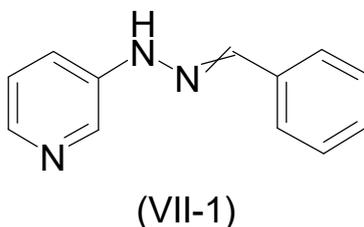
Se dispusieron 82,3 g (0,59 mol) de carbonato de potasio en un matraz de tres bocas. Este se calentó bajo argón y sucesivamente se añadieron 2,70 g (0,014 mol) de yoduro de cobre(I) 44,0 g (0,28 mol) de 3-amino-4-pirazolcarboxilato de etilo y 440 ml de *N,N*-dimetilacetamida. La suspensión se agitó durante 10 minutos y a continuación se añadieron 7,18 g (0,056 mol) de *trans*-1,2-diaminociclohexano y 53,77 g (0,34 mol) de 3-bromopiridina. La mezcla de reacción se llevó a temperatura de reflujo y se agitó durante la noche a 145 °C. Después del enfriado, se aspiró la mezcla de reacción, se concentró la lejía madre y el residuo se purificó mediante MPLC por medio de una columna de RP(C-18) con acetonitrilo / agua / 0,1 % de ácido clorofórmico. Una primera fracción contenía 39 g de una mezcla de 70 % de 5-amino-1-(piridin-3-il)-1*H*-pirazol-4-carboxilato de etilo (IIIa-1) y 30 % de 3-amino-1-(piridin-3-il)-1*H*-pirazol-4-carboxilato de etilo (III-1), según CL/EM. Una segunda fracción contenía 10 g que se compone de 83 % de 3-amino-1-(piridin-3-il)-1*H*-pirazol-4-carboxilato de etilo (IIIb-1) según CL/EM. Una separación de (IIIa-1) y (III-1) de la primera fracción mediante HPLC preparativa dio otros 24,5 g (96 % de pureza) de 5-amino-1-(piridin-3-il)-1*H*-pirazol-4-carboxilato de etilo como formiato (IIIa-1) y 11,5 g (99 % de pureza) de 3-amino-1-(piridin-3-il)-1*H*-pirazol-4-carboxilato de etilo (III-1).

(IIIa-1).HCOOH logP[a]: 1,18; logP[b]: 1,27; RMN de 1H (D6-DMSO, 400MHz) δ ppm: 12,8 (bs,1H), 8,78 (d,1H), 8,62 (dd,1H), 8,14 (s,1H), 7,99-7,96 (m,1H), 7,76 (s,1H), 7,58 (dd,1H), 6,51 (bs,2H), 4,23 (q,2H), 1,28 (t,3H)

(III-1) logP[a]: 1,12; logP[b]: 1,32; RMN de 1H (D6-DMSO, 400MHz) δ ppm: 9,06 (d,1H), 8,86 (s,1H), 8,47 (d,1H), 8,19 (bd,1H), 7,49 (dd,1H), 5,78 (bs,2H), 4,26 (q,2H), 1,30 (t,3H)

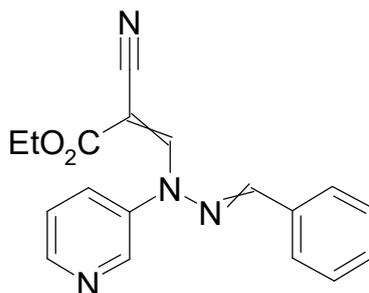
3-amino-1-(piridin-3-il)-1*H*-pirazol-4-carboxilato de etilo (III-1) según el procedimiento C

Paso 1: Benzaldehidpiridin-3-ilhidrazona (VII-1)



Se añadieron a 15,00 g (103,0 mol) de clorhidrato de 3-hidrazinopiridina (1:1) y 9,49 g (68,7 mmol) de carbonato de potasio en 150 ml de tolueno, lentamente 7 ml (68,7 mmol) de benzaldehído disueltos en 100 ml de tolueno. La mezcla de reacción se agitó durante la noche bajo reflujo (con separador de agua). Después del enfriado se separaron por filtración con succión las partículas insolubles. El residuo sólido se mezcló agitando varias veces en éster acético. El sólido se separó por filtración con succión y se agitó varias veces en caliente en isopropanol. Las proporciones insolubles se eliminaron por filtración con succión y se desecharon, el filtrado se concentró. Los 5,50 g (98 % de pureza, 40 % d. t.) obtenidos del compuesto del título se usaron directamente en la próxima reacción.
logP[a]: 0,86; logP[b]: 2,22

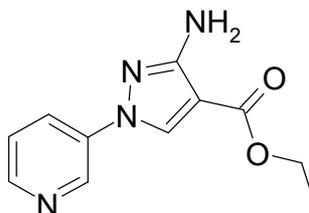
Paso 2: 3-[2-benciliden-1-(piridin-3-il)hidrazino]-2-cianoacrilato de etilo (VIII-1)



(VIII-1)

Se añadieron a 5,50 g (27,9 mmol) de benzaldehídpiridin-3-ilhidrazona en 14 ml de tolueno, 4,72 g (27,9 mmol) de 2-ciano-3-etoxiacrilato de etilo. La mezcla de reacción en primer lugar se calentó durante 2 h y después de la adición de una punta de espátula de ácido *para*-toluensulfónico durante otras 2 h bajo reflujo. Después del enfriado, se separó por filtración con succión el sólido precipitado y se desechó la fase orgánica. El sólido se dispuso nuevamente en 15 ml de tolueno y se mezcló con 1,69 g (10,0 mmol) de 2-ciano-3-etoxiacrilato de etilo. La mezcla de reacción se calentó durante la noche bajo reflujo, se dejó reposar para su enfriamiento y a continuación se diluyó con tolueno. Después de la adición de aprox. 0,5 ml de acetonitrilo se separó por filtración con succión el residuo insoluble y se secó al vacío. Se aislaron 3,11 g (90 % de pureza, 31 % d. t.) del compuesto del título.
logP[a]: 2,54; logP[b]: 2,48

Paso 3: 3-amino-1-(piridin-3-il)-1H-pirazol-4-carboxilato de etilo (III-1)



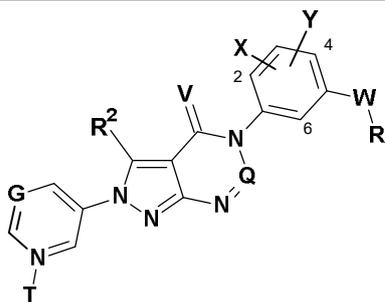
(IIIb-1)

Se dispusieron 3,00 g (9,37 mmol) de 3-[2-benciliden-1-(piridin-3-il)hidrazino]-2-cianoacrilato de etilo en 11 ml de etanol y se mezclaron con 1,1 ml (13,11 mmol) de una solución de ácido clorhídrico al 37 %. La mezcla de reacción se calentó 1 h bajo reflujo y se concentró después del enfriado. El residuo se agitó dos veces en tolueno tibio. El sólido se separó por filtración con succión y se secó al vacío. Se aislaron 2,64 g (92 % de pureza, 97 % d. t.) del compuesto del título.

Otros compuestos de la fórmula (I) se indicaron en la siguiente tabla.

Tabla 1

Compuestos de la fórmula (I-1)



(I-1)

en la que V representa oxígeno, R² representa hidrógeno y las demás variables tienen el significado indicado en la tabla

Ej. N°	G	Q	R	X	Y	W	T
I-1-1	CH	CH	CF ₃ CH ₂	2-F	4-CH ₃	S	-
I-1-2	CH	N	CF ₃ CH ₂	2-F	4-CH ₃	SO	-
I-1-3	CH	N	CF ₃ CH ₂	2-F	4-CH ₃	S	-
I-1-4	CH	CH	CF ₃ CH ₂	2-F	4-CH ₃	SO	-
I-1-5	CH	CH	CF ₃ CH ₂	2-F	4-CH ₃	SO	O
I-1-6	CH	CH	CH ₃	H	H	S	-
I-1-7	CH	CH	CF ₃ CH ₂	H	4-CH ₃	S	-
I-1-8	CH	CH	CF ₃ CH ₂	H	4-CH ₃	SO	-
I-1-9	CH	CH	CF ₃ CH ₂	2-F	H	S	-
I-1-10	CH	CH	CF ₃ CH ₂	2-F	H	SO	-
I-1-11	CH	CH	cPrCH ₂	H	H	S	-
I-1-12	CH	CH	CF ₃ CH ₂	H	H	S	-
I-1-13	CH	CH	CF ₃ CH ₂	2-F	4-Cl	S	-
I-1-14	CH	CH	CF ₃ CH ₂	2-Cl	4-Cl	S	-
I-1-15	CH	CH	CF ₃ CH ₂	2-Cl	4-Cl	SO	O
I-1-16	CH	CH	CF ₃ CH ₂	H	H	SO	-
I-1-17	CH	CH	CF ₃ CH ₂	2-CH ₃	4-CH ₃	S	-
I-1-18	CH	CH	CF ₃ CH ₂	2-F	4-Cl	SO	-
I-1-19	CH	CH	CF ₃ CH ₂	2-Cl	4-Cl	SO	-
I-1-20	CH	CH	CF ₃ CH ₂	2-CH ₃	4-CH ₃	SO	-
I-1-21	CH	CH	cPrCH ₂	H	H	SO	-
I-1-22	CH	C-CH ₃	CF ₃ CH ₂	2-F	4-CH ₃	S	-

Tabla 2

Datos analíticos de los compuestos indicados			
Ej. N°	logP[a]	logP[b]	RMN de 1H (D6-DMSO, 400 MHz) σ (ppm)

I-1-6	1,82	1,78	9,58(s,1H), 9,30(d,1H), 8,67(d,1H), 8,46(d,1H), 8,34(s,1H), 7,67-7,64(m,1H), 7,51-7,38 (m,3H), 7,27(d,1H), 3H debajo del pico de DMSO
I-1-7	2,51	2,56	9,58(s,1H), 9,30(s,1H), 8,68-8,67(m,1H), 8,46(d,1H), 8,31(s,1H), 7,70-7,64(m,2H), 7,43(d,1H), 7,33(d,1H), 4,08(q,2H), 2,42 (s,3H)
I-1-8	1,65	1,67	9,59(s,1H), 9,31(d,1H), 8,67(d,1H), 8,45 (dd,1H), 8,41(s,1H), 7,96(d,1H), 7,69-7,64(m,2H), 7,56(d,1H), 4,26-4,10(m,2H), 2,47(s,3H)
I-1-9	2,32	2,35	9,61(s,1H), 9,30(d,1H), 8,68(dd,1H), 8,48-8,44(m,1H), 8,39(s,1H), 7,88(dd,1H), 7,74-7,71(m,1H), 7,68-7,64(m,1H), 7,51(t,1H), 4,10(q,2H)
I-1-10	1,53	1,55	9,63(s,1H), 9,30(d,1H), 8,68(dd,1H), 8,48-8,43(m,2H), 8,15-8,14(m,1H), 8,05-8,01(m,1H), 7,80(t,1H), 7,68-7,65(m,1H), 4,35-4,10 (m,2H)

Tabla 3

Compuestos de la fórmula (I-2)							
(I-2)							
en la que V representa oxígeno, R ² representa hidrógeno y las demás variables tienen el significado indicado en la tabla:							
Ej. N°	G	Q	R	X	Y	W	T
I-2-23	CH	CH	CH ₃	H	H	S	-

Datos RMN de ejemplos seleccionados

5 Procedimiento de lista de picos de RMN

Los datos RMN de ¹H de ejemplos seleccionados se registraron en forma de listas de picos RMN de ¹H. Para cada pico de señal se indicó el valor δ en ppm y la intensidad de señal en paréntesis. El valor δ - pares de números de intensidad de señal para diferentes picos de señal se indican con la separación uno de otro por punto y coma.

10 La lista de picos de un ejemplo por lo tanto presenta la forma:
 δ₁ (intensidad₁); δ₂ (intensidad₂);.....; δ_i (intensidad_i);.....; δ_n (intensidad_n)

La intensidad de las señales fuertes es correlativa 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 señal. Puede mostrarse las señales anchas de varios picos o el centro de la señal y su intensidad relativa en comparación con la señal más intensiva en el espectro.

15

Para calibrar el desplazamiento químico para espectros RMN de ¹H usamos tetrametilsilano y/o el desplazamiento químico del disolvente usado, especialmente en el caso de espectros medidos en DMSO. Por lo tanto, en listas de picos de RMN puede presentarse un pico de tetrametilsilano, pero no se produce en todos los casos.

- 5 Las listas de picos de RMN de ¹H son similares a las impresiones clásicas de RMN de ¹H y por lo tanto, incluyen en general todos los picos que están enumerados en la interpretación clásica de RMN.

Por lo demás, pueden mostrar al igual que las impresiones clásicas de RMN de ¹H señales de disolventes, estereoisómeros de los compuestos blanco que también son objeto de la invención y/o picos de impurezas.

- 10 Para mostrar señales de compuestos en el intervalo delta de disolventes y/o agua, los picos usuales de disolventes, por ejemplo, los picos de DMSO en DMSO-D₆ y el pico de agua se muestran en nuestras listas de picos de RMN de ¹H y por lo general presentan en promedio una intensidad elevada.

- 15 Los picos de estereoisómeros de los compuestos blanco y/o los picos de impurezas usualmente en promedio tienen menor intensidad que los picos de los compuestos blanco (por ejemplo con una pureza >90%).

Tales estereoisómeros y/o impurezas pueden ser típicas para el proceso de preparación específico. Por lo tanto, sus picos pueden ayudar a reconocer la reproducción de nuestro proceso de preparación mediante las impresiones de productos secundarios “side-products-fingerprints”.

- 20 Un especialista que calcula los picos de los compuesto blanco por medio de procedimientos conocidos (MestreC, simulación ACD, pero también con valores esperados evaluados de manera empírica) puede aislar los picos de los compuestos blanco según necesidad usando filtros de intensidad adicionales. Esta aislación sería similar a la elección de picos relevantes en la interpretación clásica de RMN de ¹H.

Otros detalles de las listas de picos de RMN de ¹H pueden extraerse de la base de datos Research Disclosure Database Number 564025.

Ej. N°	logP [b]	logP [a]	
I-1-11	2,41	2,50	RMN de ¹ H(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,574(15,4); 9,300(5,3); 9,294(5,4); 8,677(3,7); 8,674(4,0); 8,665(3,9); 8,662(4,0); 8,475(2,3); 8,472(2,7); 8,468(2,6); 8,465(2,3); 8,454(2,5); 8,451(2,7); 8,448(2,9); 8,444(2,4); 8,330(16,0); 7,670(3,2); 7,658(3,1); 7,649(3,1); 7,637(3,0); 7,501(2,2); 7,493(4,4); 7,489(7,9); 7,482(10,1); 7,462(8,9); 7,453(3,9); 7,450(6,3); 7,446(3,9); 7,434(1,6); 7,430(2,2); 7,306(2,7); 7,302(4,1); 7,298(2,8); 7,288(2,4); 7,283(3,3); 7,279(2,3); 7,120(2,8); 7,100(2,5); 3,332(56,6); 3,331(57,8); 3,008(12,4); 2,990(12,6); 2,676(0,5); 2,672(0,7); 2,667(0,5); 2,525(2,5); 2,507(84,9); 2,503(110,7); 2,498(82,7); 2,334(0,6); 2,329(0,8); 2,325(0,6); 2,288(10,6); 1,103(0,6); 1,096(0,7); 1,091(0,5); 1,084(1,4); 1,077(1,3); 1,073(1,1); 1,065(2,3); 1,057(1,1); 1,053(1,4); 1,046(1,5); 1,034(0,8); 1,027(0,6); 0,571(1,9); 0,560(5,8); 0,556(6,2); 0,546(3,0); 0,540(6,0); 0,536(5,7); 0,526(2,2); 0,302(2,3); 0,292(6,7); 0,288(6,7); 0,280(6,1); 0,276(7,0); 0,265(1,9); 0,008(2,3); 0,000(57,8); -0,008(2,5)
I-1-12	2,18	2,25	RMN de ¹ H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,826(1,1); 9,587(15,8); 9,306(6,6); 9,300(6,8); 9,006(1,9); 8,958(0,9); 8,952(0,9); 8,677(5,0); 8,668(4,8); 8,666(5,0); 8,499(0,8); 8,479(3,2); 8,476(3,2); 8,473(2,9); 8,461(2,8); 8,458(3,3); 8,455(3,4); 8,452(2,9); 8,344(16,0); 8,065(0,4); 8,043(0,5); 7,861(1,1); 7,696(8,2); 7,675(3,7); 7,663(3,7); 7,654(3,6); 7,642(3,6); 7,630(3,4); 7,610(5,7); 7,594(0,9); 7,573(0,8); 7,562(4,3); 7,552(1,0); 7,543(6,9); 7,523(3,4); 7,482(0,9); 7,462(1,0); 7,439(4,6); 7,418(3,4); 7,381(0,6); 7,361(1,0); 7,342(0,6); 7,260(0,7); 7,240(0,5); 7,119(0,8); 7,099(0,7); 4,172(2,6); 4,146(8,0); 4,120(8,3); 4,094(2,9); 4,027(0,4); 4,001(1,3); 3,975(1,3); 3,950(0,5); 3,437(3,4); 3,387(4,5); 2,944(0,8); 2,784(0,7); 2,672(0,8); 2,565(0,7); 2,551(1,5); 2,537(1,4); 2,507(98,1); 2,503(126,9); 2,499(102,5); 2,330(0,9); 2,287(2,9); 2,076(0,9); 1,958(0,8); 0,000(13,4)

ES 2 685 970 T3

(continuación)

Ej. Nº	logP [b]	logP [a]	
I-1-13	2,65	2,70	RMN de 1H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,798(0,4); 9,619(16,0); 9,299(6,6); 9,292(6,7); 8,688(4,5); 8,686(4,8); 8,676(4,7); 8,674(4,8); 8,474(2,5); 8,471(2,9); 8,468(2,8); 8,465(2,6); 8,454(2,8); 8,450(3,0); 8,448(3,1); 8,444(2,6); 8,378(15,3); 8,071(6,0); 8,053(5,9); 7,918(6,7); 7,894(6,7); 7,678(3,7); 7,667(3,6); 7,658(3,6); 7,646(3,5); 4,214(1,8); 4,189(5,5); 4,163(5,7); 4,138(2,0); 3,330(72,0); 2,945(1,7); 2,785(1,5); 2,672(0,9); 2,507(101,2); 2,503(131,6); 2,499(99,0); 2,334(0,6); 2,330(0,9); 2,288(0,8); 1,958(1,6); 1,630(0,5); 0,146(0,4); 0,007(3,8); 0,000(88,1); -0,008(4,5); -0,060(0,5); -0,150(0,5)
I-1-14	2,83	2,91	RMN de 1H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,609(16,0); 9,293(9,4); 8,689(7,2); 8,678(7,2); 8,466(5,1); 8,446(5,3); 8,321(16,0); 8,078(14,9); 8,045(15,1); 7,680(4,6); 7,669(4,9); 7,659(4,8); 7,648(4,3); 7,482(1,1); 7,464(1,2); 7,122(1,2); 7,102(1,1); 4,308(0,4); 4,282(1,1); 4,266(1,9); 4,242(4,9); 4,226(5,4); 4,216(5,5); 4,201(5,0); 4,176(1,8); 4,162(1,1); 4,137(0,4); 3,524(0,3); 3,498(0,4); 3,473(0,6); 3,346(468,3); 3,229(0,7); 2,945(1,7); 2,786(1,7); 2,674(1,3); 2,504(198,5); 2,400(0,5); 2,374(0,4); 2,331(1,4); 2,289(3,3); 2,075(5,2); 1,959(1,7); 0,146(0,4); 0,000(79,6); -0,149(0,5)
I-1-15	1,67	1,66	RMN de 1H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,621(12,4); 9,602(10,7); 9,346(0,3); 9,025(7,3); 9,021(8,4); 9,017(7,9); 8,509(2,0); 8,443(0,3); 8,413(1,9); 8,361(10,9); 8,344(2,5); 8,318(16,0); 8,307(8,0); 8,273(9,6); 8,256(11,5); 8,231(12,9); 8,212(10,7); 8,045(6,2); 8,023(6,8); 7,903(1,8); 7,898(1,5); 7,894(1,1); 7,887(1,1); 7,720(0,6); 7,699(0,8); 7,656(6,2); 7,640(6,7); 7,635(6,5); 7,619(5,3); 7,568(0,9); 7,548(1,4); 7,528(0,6); 5,187(0,3); 5,163(1,0); 5,139(1,0); 5,114(0,4); 4,556(0,4); 4,529(1,3); 4,518(0,6); 4,502(1,5); 4,492(1,7); 4,475(0,7); 4,465(1,6); 4,437(0,5); 4,343(0,4); 4,316(1,1); 4,306(1,0); 4,289(1,3); 4,280(2,7); 4,268(1,1); 4,263(1,0); 4,253(2,8); 4,242(2,6); 4,226(1,2); 4,214(2,7); 4,204(1,5); 4,187(1,2); 4,176(2,3); 4,165(0,7); 4,149(2,0); 4,138(1,5); 4,122(0,8); 4,112(1,4); 4,085(0,5); 3,327(160,1); 2,945(0,7); 2,785(0,7); 2,671(1,9); 2,506(232,5); 2,502(287,1); 2,329(1,9); 1,958(0,7); 1,235(0,8); 0,000(32,0); -0,062(0,4)
I-1-16	1,41	1,46	RMN de 1H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,613(15,2); 9,312(5,4); 9,306(5,4); 9,072(0,5); 8,682(3,7); 8,679(4,0); 8,671(3,9); 8,667(4,1); 8,612(0,4); 8,603(0,4); 8,487(2,1); 8,484(2,4); 8,480(2,3); 8,477(2,1); 8,466(2,3); 8,463(2,4); 8,459(2,6); 8,456(2,2); 8,431(16,0); 8,191(0,4); 7,967(3,4); 7,963(6,4); 7,959(4,1); 7,932(2,0); 7,928(3,3); 7,924(1,8); 7,914(2,7); 7,910(4,7); 7,906(2,6); 7,854(2,2); 7,834(5,5); 7,815(4,6); 7,808(5,7); 7,804(3,3); 7,793(1,2); 7,789(1,7); 7,784(0,9); 7,676(2,9); 7,664(2,8); 7,655(2,8); 7,643(3,0); 7,628(0,4); 7,622(0,6); 7,618(0,4); 7,603(0,4); 7,491(0,4); 4,307(1,0); 4,298(0,8); 4,280(1,3); 4,271(2,6); 4,253(1,0); 4,244(2,7); 4,229(2,5); 4,217(1,2); 4,202(2,8); 4,193(1,3); 4,176(1,1); 4,166(1,2); 4,139(0,4); 3,355(0,3); 3,331(124,0); 2,676(0,6); 2,672(0,8); 2,667(0,6); 2,525(1,9); 2,512(47,3); 2,507(96,4); 2,503(126,6); 2,498(92,1); 2,494(45,1); 2,334(0,6); 2,329(0,8); 2,325(0,6); 0,146(1,0); 0,024(0,4); 0,008(7,4); 0,000(205,8); -0,009(7,8); -0,150(1,0)
I-1-17	2,72	2,75	RMN de 1H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,568(5,9); 9,291(4,2); 8,680(3,2); 8,670(3,2); 8,464(2,4); 8,446(2,5); 8,220(5,7); 7,674(2,2); 7,662(2,5); 7,655(2,5); 7,643(2,2); 7,609(5,6); 7,333(5,1); 4,044(1,7); 4,019(4,1); 3,993(4,1); 3,967(1,6); 3,334(29,9); 2,670(0,6); 2,503(62,1); 2,398(15,5); 2,330(0,8); 2,288(0,4); 2,061(16,0); 0,000(10,6)

ES 2 685 970 T3

(continuación)

Ej. Nº	logP [b]	logP [a]	
I-1-18	1,94	2,02	RMN de 1H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,626(16,0); 9,302(6,0); 9,296(6,2); 8,689(4,3); 8,686(4,5); 8,677(4,5); 8,674(4,5); 8,478(2,3); 8,474(2,7); 8,471(2,6); 8,468(2,3); 8,457(2,5); 8,453(2,8); 8,450(2,9); 8,447(2,4); 8,420(14,4); 8,226(5,6); 8,207(5,6); 8,107(4,8); 8,084(4,8); 7,681(3,2); 7,669(3,1); 7,660(3,1); 7,648(3,1); 5,758(0,5); 4,350(0,6); 4,342(0,6); 4,244(0,8); 4,217(0,9); 3,331(66,1); 2,677(0,5); 2,672(0,7); 2,668(0,5); 2,526(1,6); 2,512(39,6); 2,508(79,2); 2,503(103,5); 2,499(76,3); 2,334(0,5); 2,330(0,7); 2,325(0,5); 1,233(0,4); 0,008(1,0); 0,000(30,7); -0,008(1,3)
I-1-19	2,09	2,17	RMN de 1H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,629(16,0); 9,609(13,3); 9,300(11,0); 9,293(11,2); 8,690(7,5); 8,687(7,8); 8,678(7,8); 8,675(7,8); 8,472(4,6); 8,470(4,4); 8,466(3,9); 8,455(4,2); 8,451(4,7); 8,449(4,8); 8,446(4,0); 8,350(13,0); 8,318(0,6); 8,307(16,0); 8,276(11,5); 8,259(13,8); 8,240(0,3); 8,228(15,6); 8,207(12,9); 7,681(5,9); 7,669(5,7); 7,660(5,7); 7,648(5,6); 5,758(7,1); 4,559(0,4); 4,532(1,3); 4,522(0,6); 4,504(1,6); 4,494(1,8); 4,477(0,7); 4,467(1,8); 4,440(0,6); 4,321(1,0); 4,311(0,9); 4,294(1,2); 4,284(2,9); 4,267(0,7); 4,257(3,2); 4,251(3,0); 4,224(3,0); 4,214(1,6); 4,197(1,2); 4,188(2,6); 4,177(0,6); 4,161(2,2); 4,151(1,5); 4,134(0,8); 4,124(1,5); 4,098(0,5); 3,331(128,7); 2,677(0,9); 2,672(1,2); 2,668(0,9); 2,526(3,5); 2,508(135,1); 2,503(174,8); 2,499(128,7); 2,335(0,8); 2,330(1,1); 2,326(0,8); 1,234(0,9); 0,008(2,1); 0,000(52,5)
I-1-20	1,79	1,84	RMN de 1H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,595(7,7); 9,579(4,9); 9,303(4,9); 9,297(5,0); 8,683(3,5); 8,671(3,6); 8,478(1,9); 8,474(2,3); 8,471(2,2); 8,468(1,9); 8,457(2,1); 8,453(2,3); 8,451(2,3); 8,447(1,9); 8,296(8,1); 8,278(5,1); 8,144(0,6); 7,862(5,8); 7,849(3,7); 7,677(2,6); 7,665(2,5); 7,656(2,6); 7,644(2,5); 7,470(2,8); 7,447(4,3); 5,757(0,9); 4,306(0,5); 4,278(0,6); 4,269(0,7); 4,241(0,7); 4,177(0,9); 4,150(2,9); 4,123(3,0); 4,095(1,1); 4,012(0,6); 3,985(0,7); 3,975(0,6); 3,948(0,6); 3,328(25,6); 2,676(0,5); 2,672(0,6); 2,507(71,2); 2,503(89,7); 2,499(67,4); 2,445(10,4); 2,438(14,4); 2,399(0,4); 2,339(0,6); 2,334(0,6); 2,330(0,7); 2,325(0,6); 2,294(0,8); 2,276(0,3); 2,262(0,7); 2,167(16,0); 2,061(0,4); 0,146(0,4); 0,008(4,4); 0,000(85,5); -0,008(4,5); -0,149(0,4)
I-1-21	1,32	1,27	RMN de 1H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,600(6,6); 9,594(16,0); 9,308(7,3); 9,302(7,6); 9,081(0,3); 9,067(0,3); 8,680(5,5); 8,677(5,0); 8,668(5,7); 8,666(5,1); 8,482(3,1); 8,479(3,5); 8,476(3,3); 8,461(3,2); 8,458(3,6); 8,455(3,5); 8,424(5,8); 8,405(15,9); 8,317(0,5); 8,088(1,5); 8,084(2,6); 8,080(1,8); 8,034(1,3); 8,014(1,5); 7,940(0,9); 7,935(0,7); 7,923(1,2); 7,918(1,5); 7,873(1,8); 7,854(2,3); 7,833(7,2); 7,829(5,1); 7,823(2,1); 7,819(2,6); 7,803(3,8); 7,800(6,1); 7,796(3,5); 7,786(3,8); 7,767(5,9); 7,748(2,8); 7,714(3,0); 7,710(4,4); 7,705(2,8); 7,695(1,9); 7,691(2,7); 7,687(1,7); 7,674(3,8); 7,662(3,8); 7,653(3,8); 7,641(3,8); 7,577(0,3); 3,360(3,6); 3,342(4,6); 3,329(133,8); 3,269(0,4); 3,251(0,3); 2,948(0,4); 2,930(0,6); 2,914(5,6); 2,910(5,7); 2,897(5,3); 2,891(5,5); 2,877(0,6); 2,858(0,6); 2,676(1,0); 2,672(1,4); 2,667(1,0); 2,525(3,6); 2,507(152,2); 2,503(199,4); 2,498(149,5); 2,447(0,4); 2,438(0,3); 2,334(1,0); 2,329(1,4); 2,325(1,0); 1,514(0,5); 1,299(1,6); 1,259(2,3); 1,234(4,5); 1,216(0,6); 1,209(0,7); 1,022(0,4); 1,016(0,7); 1,004(1,3); 0,997(1,2); 0,985(2,0); 0,973(1,3); 0,966(1,4); 0,954(0,9); 0,947(0,6); 0,935(0,5); 0,917(0,6); 0,910(0,5); 0,899(0,8); 0,887(0,6); 0,879(0,7); 0,868(0,6); 0,861(0,6); 0,853(0,8); 0,842(0,5); 0,836(0,5); 0,609(0,3); 0,586(1,6); 0,575(5,7); 0,566(3,2); 0,555(5,7); 0,546(1,9); 0,533(0,5); 0,523(0,5); 0,507(0,7); 0,496(1,8); 0,491(2,0); 0,476(2,0); 0,471(2,0); 0,460(0,8); 0,371(0,7); 0,365(1,0); 0,360(1,2); 0,353(1,3); 0,340(2,8); 0,328(2,6); 0,313(0,7); 0,300(0,5); 0,286(2,6); 0,273(2,8); 0,265(1,1); 0,260(1,4); 0,253(1,3); 0,249(1,0); 0,242(0,6); 0,162(0,7); 0,151(2,2); 0,148(2,2); 0,136(2,5); 0,124(0,8); 0,008(1,1); 0,000(31,6); -0,008(1,4)

(continuación)

Ej. Nº	logP [b]	logP [a]	
I-1-22	2,69	2,74	RMN de 1H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,532(7,3); 9,278(3,0); 9,272(3,1); 8,671(2,2); 8,668(2,2); 8,659(2,3); 8,657(2,2); 8,445(1,2); 8,442(1,4); 8,439(1,3); 8,424(1,3); 8,421(1,4); 8,418(1,5); 8,155(1,7); 7,876(2,6); 7,857(2,7); 7,668(1,6); 7,656(1,6); 7,647(1,7); 7,635(1,6); 7,494(2,4); 7,468(2,3); 4,100(0,5); 4,086(0,5); 4,074(0,7); 4,060(1,3); 4,035(1,5); 4,015(1,4); 3,989(1,4); 3,976(0,7); 3,963(0,6); 3,950(0,6); 3,326(70,9); 2,671(2,1); 2,506(252,6); 2,502(322,0); 2,498(247,4); 2,457(14,9); 2,416(0,7); 2,328(2,2); 2,242(0,4); 2,205(0,3); 2,178(16,0); 2,150(0,4); 2,075(5,3); 0,146(1,3); 0,008(12,9); 0,000(279,4); -0,034(0,4); -0,150(1,3)
I-2-23	1,67	1,65	RMN de 1H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,571(6,2); 9,293(2,2); 9,287(2,2); 8,681(1,6); 8,678(1,6); 8,670(1,7); 8,666(1,6); 8,469(0,9); 8,465(1,0); 8,462(1,0); 8,458(0,9); 8,448(1,0); 8,444(1,0); 8,441(1,1); 8,438(0,9); 8,170(6,5); 7,673(1,2); 7,661(1,2); 7,652(1,2); 7,640(1,1); 7,585(0,5); 7,582(0,6); 7,565(1,4); 7,562(1,3); 7,547(1,3); 7,544(1,4); 7,527(1,9); 7,524(2,1); 7,507(1,0); 7,504(0,8); 7,496(1,4); 7,493(1,4); 7,477(2,0); 7,474(1,7); 7,392(1,1); 7,388(1,0); 7,373(1,3); 7,370(1,3); 7,355(0,7); 7,351(0,6); 3,332(15,7); 2,944(1,1); 2,785(0,9); 2,511(13,3); 2,507(25,8); 2,503(33,0); 2,498(23,5); 2,494(11,2); 2,442(16,0); 2,075(0,5); 1,958(0,9); 0,008(2,0); 0,000(45,7); -0,009(1,7)

Ejemplos biológicos**Ensayo con *Musca domestica* (MUSCDO)**

Disolvente: dimetilsulfóxido

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

En recipientes que contenían una esponja con solución azucarada y tratada con el preparado de principio activo en la concentración deseada se colocaron 10 ejemplares adultos de la mosca doméstica (*Musca domestica*).

- 10 Después de 2 días se determinó la mortandad en %. Allí 100 % significa que se eliminaron todas las moscas o mostraban un comportamiento de derribo (*knock-down*); 0 % significa que no se eliminó ninguna de las moscas o que no mostraban un comportamiento de derribo.

En este ensayo, p. ej., los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran un efecto de 80 % con una cantidad de aplicación de 100 ppm: I-1-2, I-1-3.

- 15 **Myzus persicae - ensayo de rociado (MYZUPE)**

Disolvente: 78 partes en peso de acetona

1,5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: alquilarilpoliglicoléter

- 20 Para obtener una preparación adecuada de principio activo se disuelve una parte en peso del principio activo con las partes en peso indicadas de disolvente y se completa con agua, que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm, hasta alcanzar la concentración deseada. Para preparar otras concentraciones de ensayo se diluye con agua que contiene emulsionante.

- 25 Hojas de col de china (*Brassica pekinensis*) que están infestadas con todos los estadios del pulgón verde de hoja de duraznero (*Myzus persicae*), se rocían con una preparación de principio activo en la concentración deseada.

Al cabo de 6 días se determina el efecto en %. Allí 100 % significa que se eliminaron todos los pulgones; 0 % significa que no se eliminó ningún pulgón.

En este ensayo, p. ej., los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran un efecto de 100 % con una cantidad de aplicación de 500 g/ha: I-1-2, I-1-3, I-1-4, I-1-5, I-1-10, I-1-11

- 5 En este ensayo, p. ej., los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran un efecto de 90 % con una cantidad de aplicación de 500 g/ha: I-1-6, I-1-7, I-1-8, I-1-12, I-1-14, I-1-15, I-1-16, I-1-17, I-1-18, I-1-19, I-1-21, I-1-22, I-2-23

En este ensayo, p. ej., los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran un efecto de 90 % con una cantidad de aplicación de 100 g/ha: I-1-9.

- 10 En este ensayo, p. ej., los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran un efecto de 90 % con una cantidad de aplicación de 20 g/ha: I-1-20.

Tetranychus urticae – ensayo de rociado, resistente a OP (TETRUR)

Disolvente: 78,0 partes en peso de acetona
1,5 partes en peso de dimetilformamida

- 15 Emulsionante: alquilarilpoliglicoléter

Para preparar una preparación adecuada de principio activo se disuelve una parte en peso del principio activo con las partes en peso indicadas de disolvente y se completa con agua, que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm, hasta alcanzar la concentración deseada. Para preparar otras concentraciones de ensayo se diluye con agua que contiene emulsionante.

- 20 Se rocían hojas de alubias (*Phaseolus vulgaris*), afectadas por ácaros comunes (*Tetranychus urticae*) en todos sus estadios, se rocían con una preparación de principio activo en la concentración deseada.

Al cabo de 6 días se determina el efecto en %. Allí 100 % significa que se eliminaron todos los ácaros; 0 % significa que no se eliminó ningún ácaro.

- 25 En este ensayo, p. ej., los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran un efecto de 100 % con una cantidad de aplicación de 500 g/ha: I-1-4.

En este ensayo, p. ej., los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran un efecto de 90 % con una cantidad de aplicación de 500 g/ha: I-1-20.

Myzus persicae - ensayo de rociado (MYZUPE)

Disolvente: 7 partes en peso de dimetilformamida

- 30 Emulsionante: alquilarilpoliglicoléter

Para obtener una preparación adecuada de principio activo se disuelve una parte en peso del principio activo con las partes en peso indicadas de disolvente y se completa con agua, que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm, hasta alcanzar la concentración deseada. Para preparar otras concentraciones de ensayo se diluye con agua que contiene emulsionante. En caso de requerir la adición de sales de amonio y/o de agentes de penetración, estos se añaden respectivamente en una concentración de 1000 ppm de la solución del preparado.

- 35 Las plantas de paprika (*Capsicum annuum*) que están muy infestadas con el pulgón verde de hoja de duraznero (*Myzus persicae*), se rocían con una preparación de principio activo en la concentración deseada.

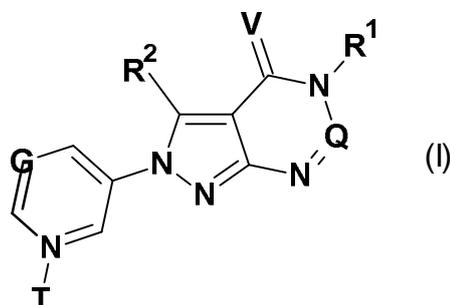
- 40 Al cabo de 6 días se determina el efecto en %. Allí 100 % significa que se eliminaron todos los pulgones; 0 % significa que no se eliminó ningún pulgón.

En este ensayo, p. ej., los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran un efecto de 100 % con una cantidad de aplicación de 20 g/ha: I-1-1

- 45 En este ensayo, p. ej., los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran un efecto de 100 % con una cantidad de aplicación de 4 g/ha: I-1-13

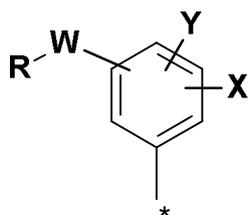
REIVINDICACIONES

1. Compuestos de la fórmula (I)



en la que

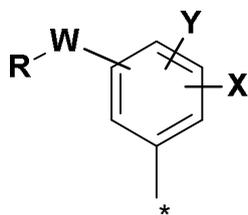
- 5 G representa N o C-A¹,
 A¹ representa hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi o cicloalquilo o cicloalqueno en cada caso eventualmente sustituidos,
 T representa un par de electrones o representa oxígeno,
 R¹ representa el resto de la fórmula



- 10 en donde la unión al átomo de nitrógeno en el grupo C(=V)-N-Q en la fórmula (I) está marcado con el asterisco (*),
- 15 R representa NR⁷R⁸ o representa un resto en cada caso eventualmente sustituido de la serie alquilo, alqueno, alquino, alcoxilalquilo, alquilo-S(O)_m-alquilo, R⁷-CO-alquilo, NR⁷R⁸-CO-alquilo, cicloalquilo, cicloalqueno, cicloalquilalquilo, cicloalquenalquilo, heterociclo, heterociclilalquilo, fenilo, fenilalquilo, hetarilo y hetarilalquilo,
 W representa un resto de la serie O, S, SO y SO₂,
 X representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi y cicloalquilo,
 20 Y representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, cicloalquilo y NR⁵R⁶,
 R² representa hidrógeno o alquilo,
 Q representa nitrógeno o C-R³ en el que
 25 R³ representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, cicloalquilalquilo, alcoxilalquilo, haloalcoxilalquilo, SH, alquilsulfanilo, alquilsulfino, alquilsulfonilo, haloalquilsulfanilo, haloalquilsulfino, haloalquilsulfonilo, NH₂, alquilamino y dialquilamino,
 V representa un resto de la serie oxígeno, azufre y NR⁴ y
 30 R⁴ representa un resto de la serie hidrógeno, ciano, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, nitro, carbonilalquilo, carbonilhaloalquilo y carbonilalcoxi,
 R⁵ representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo y haloalquilo,
 R⁶ representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo y haloalquilo,
 o
 35 R⁵ y R⁶ junto con el nitrógeno, al que están unidos, representan un anillo saturado o insaturado de 3 a 6 miembros que dado el caso está sustituido y dado el caso contiene otros heteroátomos,
 R⁷ representa hidrógeno, hidroxilo o un resto en cada caso eventualmente sustituido de la serie alquilo, alcoxi, alcoxilalquilo, alquilo-S(O)_m-alquilo, alquilcarbonilo, alcoxycarbonilo, cicloalquilo, cicloalqueno, cicloalquilalquilo, cicloalquenalquilo, heterociclo, heterociclilalquilo, fenilo, fenilalquilo, hetarilo y hetarilalquilo,
 40 R⁸ representa hidrógeno, un ión metálico, un ión de amonio dado el caso sustituido o un resto en cada caso eventualmente sustituido de la serie alquilo, alcoxi, alcoxilalquilo, alquilo-S(O)_m-alquilo y
 m representa un número de la serie 0, 1 y 2.

2. Compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 en la que

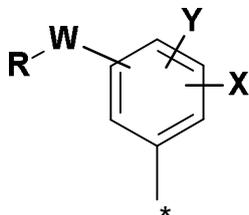
- G representa N o C-A¹,
 A¹ representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ y cicloalquilo C₃-C₆,
 5 T representa un par de electrones o representa oxígeno,
 R¹ representa el resto de la fórmula



- en el que la unión al átomo de nitrógeno en el grupo C(=V)-N-Q en la fórmula (I) está marcado con el asterisco (*),
- 10 R representa NR⁷R⁸ o representa alquilo C₁-C₆, alqueno C₃-C₆, alquino C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₄, alquilo C₁-C₆-S(O)_m-alquilo C₁-C₄ en cada caso eventualmente sustituidos con halógeno o ciano, representa R⁷-CO-alquilo C₁-C₄, representa NR⁷R⁸-CO-alquilo C₁-C₄, representa cicloalquilo C₃-C₈ en cada caso eventualmente mono o disustituido con oxígeno (lleva a C=O), halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄, representa cicloalqueno C₃-C₈ en cada caso eventualmente mono o disustituido con oxígeno (lleva a C=O), alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄, representa cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ dado el caso mono o disustituido con oxígeno (lleva a C=O), halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄, representa cicloalqueno C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ dado el caso mono o disustituido con oxígeno (lleva a C=O), alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄, representa heterociclilo dado el caso mono o disustituido con oxígeno (lleva a C=O), alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄, representa heterociclil-alquilo C₁-C₄ dado el caso mono o disustituido con oxígeno (lleva a C=O), alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄ o representa fenilo, fenil-alquilo C₁-C₄, hetarilo y hetaril-alquilo C₁-C₄ en cada caso eventualmente mono a trisustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄,
- 15 m representa un número de la serie 0, 1 y 2,
 20 W representa un resto de la serie O, S, SO y SO₂,
 X representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆ y cicloalquilo C₃-C₆,
 Y representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ y NR⁵R⁶,
 30 R² representa hidrógeno o alquilo C₁-C₆,
 Q representa nitrógeno o C-R³,
 R³ representa un resto de la serie hidrógeno, hidroxilo, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₄, SH, alquilsulfanilo C₁-C₆, alquilsulfinito C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, NH₂, alquilamino C₁-C₆ y di-(alquil C₁-C₆)-amino,
 35 V representa un resto de la serie oxígeno, azufre y NR⁴,
 R⁴ representa un resto de la serie hidrógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₂-C₆ y cicloalquilo C₃-C₆,
 R⁵ representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo C₁-C₆ y haloalquilo C₂-C₆,
 R⁶ representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo C₁-C₆ y haloalquilo C₂-C₆,
 40 R⁵ y R⁶ también junto con el átomo de nitrógeno, al que están unidos, pueden representar un anillo saturado hasta insaturado tres veces, de 3 a 6 miembros, dado el caso sustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄,
 R⁷ representa un resto de la serie hidrógeno, hidroxilo, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₄, alquilo C₁-C₆-S(O)_m-alquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalqueno C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₃, cicloalqueno C₃-C₆-alquilo C₁-C₃, heterociclilo, heterociclil-alquilo C₁-C₃ en cada caso eventualmente mono o polisustituidos con halógeno o mono o disustituido con ciano, y fenilo, fenil-alquilo C₁-C₃, hetarilo y hetaril-alquilo C₁-C₃ en cada caso eventualmente mono a tetrasustituidos con alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halógeno o ciano y
 45 R⁸ representa hidrógeno, un ión metálico o representa un ión de amonio dado el caso mono- a tetrasustituido con alquilo C₁-C₄ o representa un resto de la serie alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ y alquilo C₁-C₄-S(O)_m-alquilo en cada caso eventualmente mono o polisustituidos con halógeno o mono o disustituidos con ciano.

3. Compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 en la que

- G representa N o C-A¹,
 A¹ representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄,
 T representa un par de electrones o representa oxígeno,
 R¹ representa el resto de la fórmula



5

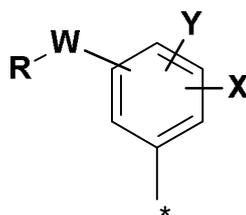
en el que la unión al átomo de nitrógeno en el grupo C(=V)-N-Q en la fórmula (I) está marcado con el asterisco (*),

- R representa NR⁷R⁸ o representa alquilo C₁-C₆, alqueno C₃-C₆, alquino C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₃, alquilo C₁-C₄-S(O)_m-alquilo C₁-C₃ en cada caso eventualmente mono a heptasustituidos con halógeno, mono o disustituido con oxígeno (lleva a C=O) o mono o disustituido con ciano, representa R⁷-CO-alquilo C₁-C₂, representa NR⁷R⁸-CO-alquilo C₁-C₂, representa cicloalquilo C₃-C₈ dado el caso mono o disustituido con oxígeno (lleva a C=O), halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄, representa cicloalqueno C₃-C₈ dado el caso mono o disustituido con oxígeno (lleva a C=O), alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄, representa cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ dado el caso mono o disustituido con oxígeno (lleva a C=O), halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄, representa cicloalqueno C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ saturado o insaturado dado el caso mono o disustituido con oxígeno (lleva a C=O), alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄, representa heterociclilo dado el caso mono o disustituido con oxígeno (lleva a C=O), alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄, representa heterocicil-alquilo C₁-C₄ dado el caso mono o disustituido con oxígeno (lleva a C=O), alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄ o representa fenilo, fenil-alquilo C₁-C₃, hetarilo y hetaril-alquilo C₁-C₃ en cada caso eventualmente mono a trisustituidos con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄,
- W representa un resto de la serie S, SO y SO₂,
 X representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄,
 Y representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄,
 R² representa hidrógeno o alquilo C₁-C₄,
 Q representa nitrógeno o C-R³,
 R³ representa un resto de la serie hidrógeno, hidroxilo, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₃, SH, alquilsulfanilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, NH₂, alquilamino C₁-C₄ y di-(alquil C₁-C₄)-amino,
 V representa oxígeno,
 R⁷ representa hidrógeno, hidroxilo o representa un resto de la serie alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquilo C₁-C₄-S(O)_m-alquilo C₁-C₃, alquilo C₁-C₄-carbonilo, alcoxi C₁-C₄-carbonilo, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₃, heterociclilo, heterocicil-alquilo C₁-C₃ cada uno dado el caso mono o polisustituidos con halógeno o mono o disustituidos con ciano y representa fenilo, bencilo, piridilo, pirimidilo, tiazolilo, oxazolilo, pirazolilo, tienilo, furanilo, piridinil-metilo y tiazolilmetilo en cada caso eventualmente mono a trisustituidos con alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, ciclopropilo, flúor, cloro, bromo o ciano y
 R⁸ representa hidrógeno, representa un ión metálico o representa un ión de amonio dado el caso mono- a tetrasustituido con alquilo C₁-C₄ o representa un resto de la serie alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₂ y alquilo C₁-C₄-S(O)_m-alquilo C₁-C₂ cada uno dado el caso mono o polisustituido con halógeno o mono o disustituido con ciano.
 m representa un número de la serie 0, 1 y 2.

4. Compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 en la que

- G representa N o C-A¹,
 A¹ representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, isopropilo, *terc*-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, 2,2,2-trifluoroetilo y 2,2-difluoroetilo,
 T representa un par de electrones o representa oxígeno,
 R¹ representa el resto de la fórmula

50

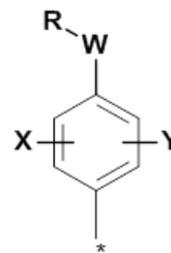
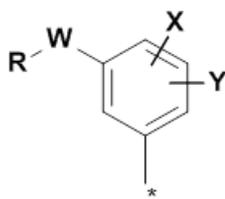
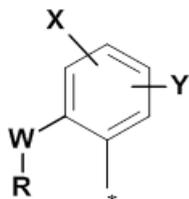


en el que la unión al átomo de nitrógeno en el grupo C(=V)-N-Q en la fórmula (I) está marcado con el asterisco (*),

- 5 R representa NR^7R^8 o representa un resto de la serie alquilo C_1-C_4 , alqueno C_3-C_4 , alquino C_3-C_4 , alcoxí C_1-C_2 -alquilo C_1-C_2 y alquil $C_1-C_2-S(O)_m$ -alquilo C_1-C_2 en cada caso eventualmente sustituidos una, dos, tres, cuatro o cinco veces con flúor, cloro o disustituido con ciano, representa R^7-CO -alquilo C_1-C_2 , representa NR^7R^8-CO -alquilo C_1-C_2 , representa cicloalquilo C_3-C_6 dado el caso mono o disustituido con halógeno, ciano, alquilo C_1-C_2 , alcoxí C_1-C_2 o haloalquilo C_1-C_2 o sustituido con un átomo de oxígeno (lleva a $C=O$), representa cicloalqueno C_3-C_6 dado el caso mono o disustituido con alquilo C_1-C_2 , alcoxí C_1-C_2 o haloalquilo C_1-C_2 o sustituido con un átomo de oxígeno (lleva a $C=O$), representa cicloalquil C_3-C_6 -alquilo C_1-C_2 dado el caso mono o disustituido con halógeno, ciano, alquilo C_1-C_2 , alcoxí C_1-C_2 o haloalquilo C_1-C_2 , representa cicloalquénil C_3-C_6 -alquilo C_1-C_2 dado el caso mono o disustituido con alquilo C_1-C_2 , alcoxí C_1-C_2 o haloalquilo C_1-C_2 , representa heterociclilo dado el caso mono o disustituido con alquilo C_1-C_2 , alcoxí C_1-C_2 o haloalquilo C_1-C_2 , representa heterociclil-alquilo C_1-C_2 dado el caso mono o disustituido con alquilo C_1-C_2 , alcoxí C_1-C_2 o haloalquilo C_1-C_2 o representa fenilo, bencilo, piridilo, pirimidilo, tiazolilo, oxazolilo, pirazolilo, tienilo, furanilo, piridinilmetilo o tiazolilmetilo en cada caso eventualmente mono o disustituidos con flúor, cloro, bromo, ciano, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxí C_1-C_4 o haloalcoxí C_1-C_4 ,
- 10 W representa un resto de la serie S, SO y SO_2 ,
- 15 X representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi,
- 20 Y representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi,
- 25 R^2 representa hidrógeno o metilo,
- 30 Q representa nitrógeno o $C-R^3$,
- R^3 representa un resto de la serie hidrógeno, metilo, trifluorometilo y ciclopropilo,
- V representa oxígeno,
- R^7 representa un resto de la serie hidrógeno, hidroxí, alquilo C_1-C_4 , alcoxí C_1-C_4 , alcoxí C_1-C_4 -alquilo C_1-C_4 , alquilo $C_1-C_4-S(O)_m$ -alquilo C_1-C_2 , alquilcarbonilo C_1-C_4 , alcoxícarbonilo C_1-C_4 y cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquil C_3-C_6 -alquilo C_1-C_3 , heterociclilo y heterociclil-alquilo C_1-C_3 dado el caso sustituidos una, dos, tres, cuatro o cinco veces con flúor, cloro o mono o disustituido con ciano o representa fenilo, bencilo, piridilo, pirimidilo, tiazolilo, oxazolilo, pirazolilo, tienilo, furanilo, piridinilmetilo y tiazolilmetilo en cada caso eventualmente mono a trisustituido con alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_3 , alcoxí C_1-C_3 , haloalcoxí C_1-C_3 , ciclopropilo, flúor, cloro, bromo o ciano,
- 35 R^8 representa hidrógeno, un ión alcalino o alcalinotérreo, representa un ión de amonio dado el caso mono- a tetrasustituido con alquilo C_1-C_4 o representa un resto de la serie alquilo C_1-C_4 , alcoxí C_1-C_4 , alcoxí C_1-C_4 -alquilo C_1-C_2 y alquilo $C_1-C_4-S(O)_m$ -alquilo C_1-C_2 en cada caso eventualmente mono- a polisustituido con flúor, cloro o mono o disustituido con ciano y m representa un número de la serie 0, 1 y 2.

40 5. Compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 en la que

- G representa N o $C-A^1$,
- A^1 representa un resto de la serie hidrógeno y flúor,
- T representa un par de electrones o representa oxígeno,
- R^1 representa el resto de la serie



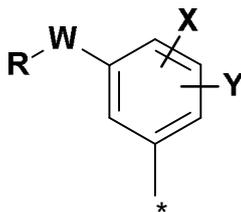
45

en el que la unión al átomo de nitrógeno en el grupo C(=V)-N-Q en la fórmula (I) está marcado con el asterisco (*),

- R representa metilo, etilo, propilo, iso-propilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, terc-butilo, alilo, 2-butenilo, propargilo, 2-butinilo en cada caso eventualmente sustituidos una, dos o tres veces con flúor o monosustituidos con ciano, representa cicloalquilo C₃-C₆ dado el caso monosustituido con flúor, cloro, ciano, metilo, etilo, metoxi, etoxi o trifluorometilo, representa cicloalquilmetilo C₃-C₆ dado el caso monosustituido con flúor, cloro, ciano, metilo, etilo, metoxi o trifluorometilo o representa fenilo, bencilo, piridilo, pirimidilo, tiazolilo y piridinilmetilo en cada caso eventualmente mono o disustituidos con flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, iso-propilo, terc-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi o trifluorometoxi,
- W representa un resto de la serie S, SO y SO₂,
- X representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi,
- Y representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi,
- R² representa hidrógeno o metilo,
- Q representa nitrógeno o C-R³,
- R³ representa un resto de la serie hidrógeno, metilo, trifluorometilo y ciclopropilo,
- V representa oxígeno.

6. Compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 en la que

- G representa N o C-A¹,
- A¹ representa un resto de la serie hidrógeno y flúor,
- T representa un par de electrones,
- R¹ representa el resto de la fórmula

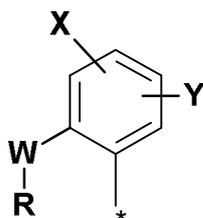


en el que la unión al átomo de nitrógeno en el grupo C(=V)-N-Q en la fórmula (I) está marcado con el asterisco (*),

- R representa metilo, etilo, propilo, iso-propilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, terc-butilo, alilo, 2-butenilo, propargilo, 2-butinilo en cada caso eventualmente sustituidos una, dos o tres veces con flúor o monosustituidos con ciano, representa cicloalquilo C₃-C₆ dado el caso monosustituido con flúor, cloro, ciano, metilo, etilo, metoxi, etoxi o trifluorometilo, representa cicloalquilmetilo C₃-C₆ dado el caso monosustituido con flúor, cloro, ciano, metilo, etilo, metoxi o trifluorometilo o representa fenilo, bencilo, piridilo, pirimidilo, tiazolilo y piridinilmetilo en cada caso eventualmente mono o disustituidos con flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, iso-propilo, terc-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi o trifluorometoxi,
- W representa un resto de la serie S, SO y SO₂,
- X representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo y trifluorometilo,
- Y representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo y trifluorometilo,
- R² representa hidrógeno o metilo,
- Q representa nitrógeno o C-R³,
- R³ representa un resto de la serie hidrógeno y metilo,
- V representa oxígeno.

7. Compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 en la que

- G representa N o C-A¹,
- A¹ representa un resto de la serie hidrógeno o flúor,
- T representa un par de electrones,
- R¹ representa el resto de la fórmula

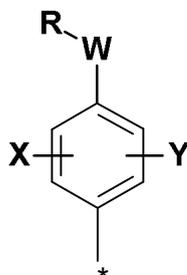


en el que la unión al átomo de nitrógeno en el grupo C(=V)-N-Q en la fórmula (I) está marcado con el asterisco (*),

- 5 R representa metilo, etilo, propilo, iso-propilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, terc-butilo, alilo, 2-butenilo, propargilo, 2-butenilo en cada caso eventualmente sustituidos una, dos o tres veces con flúor o monosustituido con ciano, representa cicloalquilo C₃-C₆ dado el caso monosustituido con flúor, cloro, ciano, metilo, etilo, metoxi, etoxi o trifluorometilo, representa cicloalquilmetilo C₃-C₆ dado el caso monosustituido con flúor, cloro, ciano, metilo, etilo, metoxi o trifluorometilo o representa fenilo, bencilo, piridilo, pirimidilo, tiazolilo y piridinilmetilo en cada caso eventualmente mono o disustituidos con flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, iso-propilo, terc-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi o trifluorometoxi,
- 10 W representa un resto de la serie S, SO y SO₂,
 X representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo y trifluorometilo,
 Y representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo y trifluorometilo,
 15 R² representa hidrógeno o metilo,
 Q representa nitrógeno o C-R³,
 R³ representa un resto de la serie hidrógeno y metilo,
 V representa oxígeno.

8. Compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 en la que

- 20 G representa N o C-A¹,
 A¹ representa un resto de la serie hidrógeno o flúor,
 T representa un par de electrones,
 R¹ representa el resto de la fórmula

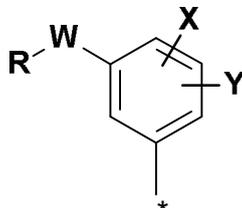


25 en el que la unión al átomo de nitrógeno en el grupo C(=V)-N-Q en la fórmula (I) está marcado con el asterisco (*),

- R representa metilo, etilo, propilo, iso-propilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, terc-butilo, alilo, 2-butenilo, propargilo, 2-butenilo en cada caso eventualmente sustituidos una, dos o tres veces con flúor o monosustituido con ciano, representa cicloalquilo C₃-C₆ dado el caso monosustituido con flúor, cloro, ciano, metilo, etilo, metoxi, etoxi o trifluorometilo, representa cicloalquilmetilo C₃-C₆ dado el caso monosustituido con flúor, cloro, ciano, metilo, etilo, metoxi o trifluorometilo o representa fenilo, bencilo, piridilo, pirimidilo, tiazolilo y piridinilmetilo en cada caso eventualmente mono o disustituidos con flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, iso-propilo, terc-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi o trifluorometoxi,
- 30 W representa un resto de la serie S, SO y SO₂,
 X representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo y trifluorometilo,
 Y representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo y trifluorometilo,
 35 R² representa hidrógeno o metilo,
 Q representa nitrógeno o C-R³,
 40 R³ representa un resto de la serie hidrógeno y metilo,
 V representa oxígeno.

9. Compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 en la que

G representa C-A¹,
 A¹ representa hidrógeno,
 T representa un par de electrones o representa oxígeno,
 R¹ representa el resto de la fórmula



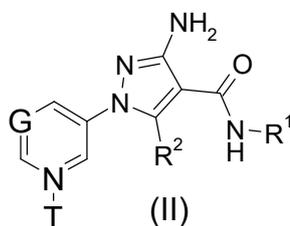
5
 en el que la unión al átomo de nitrógeno en el grupo C(=V)-N-Q en la fórmula (I) está marcado con el asterisco (*),

R representa un resto de la serie metilo, trifluoroetilo y ciclopropilmetilo,
 W representa un resto de la serie S y SO,
 10 X representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro y metilo,
 Y representa un resto de la serie hidrógeno, cloro y metilo,
 R² representa hidrógeno,
 Q representa nitrógeno o C-R³,
 R³ representa hidrógeno o metilo y
 15 V representa oxígeno.

10. Agentes caracterizados por un contenido de al menos un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 9 y diluyentes usuales, seleccionados de agua y líquidos químicos orgánicos polares y no polares, y/o sustancias tensioactivas.

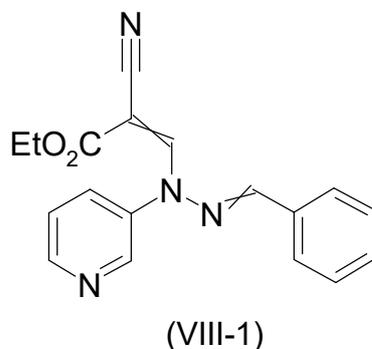
20 11. Uso de compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 9 o de agentes de acuerdo con la reivindicación 10 para combatir plagas.

12. Compuestos de la fórmula (II)



en la que G, T, R¹ y R² tienen los significados indicados en la reivindicación 1.

13. Compuesto de la fórmula (VIII-1)



25