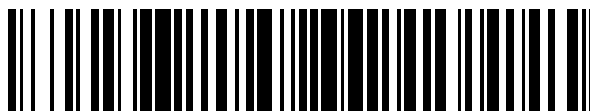


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 688 893**

51 Int. Cl.:

C07D 417/10 (2006.01)

A01N 43/80 (2006.01)

C07D 495/10 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **23.06.2014 PCT/EP2014/063106**

87 Fecha y número de publicación internacional: **31.12.2014 WO14206911**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **23.06.2014 E 14732176 (4)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **15.08.2018 EP 3013819**

54 Título: **Compuestos de isotiazolina para combatir plagas de invertebrados**

30 Prioridad:

24.06.2013 US 201361838370 P

28.10.2013 US 201361896137 P

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
07.11.2018

73 Titular/es:

MERIAL, INC. (100.0%)
3239 Satellite Boulevard, Bldg. 500
Duluth, GA 30096, US

72 Inventor/es:

BINDSCHÄDLER, PASCAL;
VON DEYN, WOLFGANG;
KÖRBER, KARSTEN;
CULBERTSON, DEBORAH L.;
BRAUN, FRANZ JOSEF y
GUNJIMA, KOSHI

74 Agente/Representante:

SALVÀ FERRER, Joan

ES 2 688 893 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 de isotiazolina para combatir plagas de invertebrados

5 ANTECEDENTES DE LA INVENCION

[0001] La presente invención se refiere a compuestos de isotiazolina que son útiles para combatir o controlar plagas de invertebrados, en particular plagas de artrópodos y nematodos. La invención también se refiere a un método no terapéutico para controlar plagas de invertebrados utilizando estos compuestos y a material de propagación de plantas y a una composición agrícola y una composición veterinaria que comprende dichos compuestos.

[0002] La invención está definida solo por las reivindicaciones. La descripción que sigue está sujeta a esta limitación. Todos los aspectos y realizaciones en la descripción que no están abarcados en el alcance de las reivindicaciones no forman parte de la invención.

[0003] Las plagas de invertebrados y en particular los artrópodos y los nematodos destruyen los cultivos en crecimiento y cosechados y atacan las estructuras comerciales y viviendas de madera, causando grandes pérdidas económicas al suministro de alimentos y a la propiedad. Aunque se conoce una gran cantidad de agentes plaguicidas, debido a la capacidad de las plagas objetivo de desarrollar resistencia a dichos agentes, existe una necesidad continua de nuevos agentes para combatir plagas de invertebrados, en particular insectos, arácnidos y nematodos.

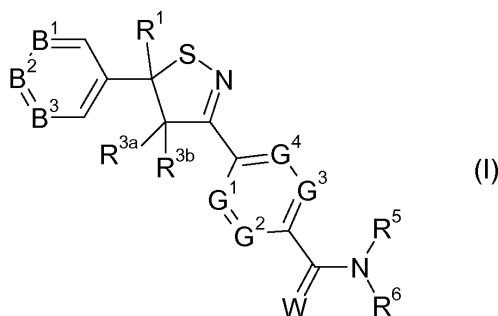
[0004] Se describen compuestos insecticidas de aril isotiazolina relacionados en el documento WO 2013/037626. Sin embargo, este documento no describe compuestos que tienen los sustituyentes y la disposición de sustituyentes característicos que se reivindica en la presente invención.

[0005] Compuestos de aril azolina insecticidas relacionados se describen adicionalmente en los documentos WO 2011/092287, WO 2011/073444, WO 2010/090344, WO 2009/112275 y WO 97/23212. Estos documentos tampoco describen compuestos que tengan los sustituyentes y la disposición de sustituyentes característicos que se reivindica en la presente invención.

[0006] Es un objeto de la presente invención proporcionar compuestos que tienen una buena actividad pesticida, en particular actividad insecticida, y que muestran un amplio espectro de actividad frente a un gran número de plagas de invertebrados diferentes, especialmente contra parásitos y/o nematodos de artrópodos difíciles de controlar.

[0007] Se ha comprobado que estos objetivos se pueden lograr mediante compuestos de isotiazolina de la fórmula I a continuación, por sus estereoisómeros y por sus sales, en particular sus sales agrícola o veterinariamente aceptables.

[0008] Por lo tanto, en un primer aspecto, la presente descripción se refiere a compuestos de isotiazolina de fórmula I



45 donde

B¹, B² y B³ cada uno se selecciona independientemente del grupo que consiste en N y CR², con la condición de

que como máximo dos de B¹, B² y B³ sean N;

G¹, G², G³ y G⁴ cada uno se selecciona independientemente del grupo que consiste en N y CR⁴, con la condición de que como máximo dos de G¹, G², G³ y G⁴ sean N;

W es O S;

- 5 R¹ se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄-, haloalcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄-, alqueno C₂-C₄, haloalqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, haloalquino C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ halocicloalquilo C₃-C₆ y -C(=O)OR¹⁵;
- 10 cada R² se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, azido, nitro, -SCN, -SF₅, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, en los que los cuatro últimos radicales alifáticos y cicloalifáticos pueden estar parcial o completamente halogenados y/o pueden estar sustituidos con uno o más radicales R⁸;
- 15 -Si(R¹²)₃, -OR⁹, -S(O)_nR⁹, -NR^{10a}R^{10b}, fenilo que puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 radicales R¹¹, y un anillo heteromonocíclico o heterobicíclico de 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 o 10 miembros saturado, parcialmente insaturado o completamente insaturado que contiene 1, 2, 3 o 4 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heteromono- o heterobicíclico puede estar sustituido con uno o más radicales R¹¹;
- 20 R^{3a}, R^{3b} cada uno se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, hidroxilo, -CO₂R^{3d}, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alqueno C₂-C₃, alquino C₂-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃, haloalquiltio C₁-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₃ y haloalquilsulfonilo C₁-C₃; o R^{3a} y R^{3b} forman juntos un grupo =O, =C(R^{3c})₂, =NOH o =NOCH₃;
- 25 cada R^{3c} se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, CH₃ y CF₃; R^{3d} se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₆ y alquilo alquilo C₁-C₃;
- 30 cada R⁴ se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, azido, nitro, -SCN, -SF₅, alquilo C₁-C₆ que puede estar parcial o totalmente halogenado y/o puede estar sustituido con uno o más radicales R⁸, cicloalquilo C₃-C₈ que puede estar parcial o totalmente halogenado y/o puede estar sustituido con uno o más radicales R⁸, alqueno C₂-C₆ que puede estar parcial o totalmente halogenado y/o puede estar sustituido con uno o más radicales R⁸, alquino C₂-C₆ que puede estar parcial o completamente halogenado y/o puede estar sustituido con uno o más radicales R⁸,
- 35 -Si(R¹²)₃, -OR⁹, -S(O)_nR⁹, -NR^{10a}R^{10b}, fenilo que puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 radicales R¹¹, y un anillo heteromonocíclico o heterobicíclico de 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 o 10 miembros saturado, parcialmente insaturado o completamente insaturado que contiene 1, 2, 3 o 4 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heteromonocíclico o heterobicíclico puede estar sustituido con uno o más radicales R¹¹;
- 40 R⁵ y R⁶, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un anillo heteromonocíclico o heterobicíclico de 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 o 10 miembros saturado, parcialmente insaturado o completamente insaturado [naturalmente, estando el anillo unido a través de este átomo de nitrógeno al grupo C(=W)], donde el anillo puede contener además 1, 2, 3 o 4 heteroátomos o grupos que contienen heteroátomos seleccionados entre O, S, N, NH, SO, y SO₂, como miembros del anillo, en el que el anillo heterocíclico puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8 sustituyentes R⁷;
- 45 cada R⁷ se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, azido, nitro, -SCN, -SF₅, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, en los que los cuatro radicales alifáticos y cicloalifáticos mencionados anteriormente pueden estar parcial o completamente halogenados y/o pueden estar sustituidos con uno o más radicales R⁸;
- 50 -Si(R¹²)₃, -OR⁹, -OSO₂R⁹, -S(O)_nR⁹, -N(R^{10a})R^{10b}, -C(=O)N(R^{10a})R^{10b}, -C(=S)N(R^{10a})R^{10b}, -C(=O)OR⁹, -C(=O)R⁸, fenilo que puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R¹¹; y un anillo heteromonocíclico o heterobicíclico de 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 o 10 miembros saturado, parcialmente insaturado o completamente insaturado que contiene 1, 2, 3 o 4 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heteromonocíclico o heterobicíclico puede estar sustituido con uno o más radicales R¹¹; y adicional o alternativamente, dos radicales R⁷ presentes sobre el mismo átomo de carbono del anillo heteromonocíclico o heterobicíclico de 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 o 10 miembros saturado, parcialmente insaturado o completamente insaturado puede formar un grupo =O (que también se denomina un sustituyente oxo) o =S;
- 55 cada R⁸ se selecciona independientemente del grupo que consiste en ciano, azido, nitro, -SCN, -SF₅, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, donde los restos cicloalifáticos en los dos últimos radicales mencionados pueden estar sustituidos con uno o más radicales R¹³;
- Si(R¹²)₃, -OR⁹, -OSO₂R⁹, -S(O)_nR⁹, -N(R^{10a})R^{10b}, -C(=O)N(R^{10a})R^{10b}, -C(=S)N(R^{10a})R^{10b}, -C(=O)OR⁹, fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R¹⁶, y un anillo heterocíclico de 3, 4, 5, 6 o 7

miembros, saturado, parcialmente insaturado o completamente insaturado que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R¹⁶,

o

- 5 dos R⁸ presentes sobre el mismo átomo de carbono de un grupo alquilo, alqueno, alquino o cicloalquilo forman juntos un grupo =O, =C(R¹³)₂; =S; =S(O)_m(R¹⁵)₂, =S(O)_mR¹⁵N(R^{14a})R^{14b}, =NR^{10a}, =NOR⁹; o =NN(R^{10a})R^{10b};

o

- 10 dos radicales R⁸, junto con los átomos de carbono de un grupo alquilo, alqueno, alquino o cicloalquilo al que están unidos, forman un anillo carbocíclico o heterocíclico de 3, 4, 5, 6, 7 u 8 miembros saturado, o parcialmente insaturado, donde el anillo heterocíclico comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados independientemente entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, y donde el anillo carbocíclico o heterocíclico está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R¹⁶; y

- 15 R⁸ como un sustituyente sobre un anillo cicloalquilo adicionalmente se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆ y haloalquino C₂-C₆, donde los restos alifáticos en estos seis radicales pueden estar sustituidos con uno o más radicales R¹³; y R⁸ en el grupo -C(=O)R⁹ se selecciona adicionalmente del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆ y haloalquino C₂-C₆, donde los restos alifáticos en los seis últimos radicales mencionados pueden estar sustituidos con uno o más radicales R¹³;

- 20 cada R⁹ se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₈, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, donde los restos alifáticos y cicloalifáticos en los nueve últimos radicales mencionados pueden estar sustituidos con uno o más radicales R¹³,

- 25 -alquilo C₁-C₆-C(=O)OR¹⁵, -alquilo C₁-C₆-C(=O)N(R^{14a})R^{14b},
-alquilo C₁-C₆-C(=S)N(R^{14a})R^{14b}, -alquilo C₁-C₆-C(=NR¹⁴)N(R^{14a})R^{14b},
-Si(R¹²)₃, -S(O)_nR¹⁵, -S(O)_n N(R^{14a})R^{14b}, -N(R^{10a})R^{10b}, -N=C(R¹³)₂, -C(=O)R¹³, -C(=O)N(R^{14a})R^{14b}, -
C(=S)N(R^{14a})R^{14b}, -C(=O)OR¹⁵,

fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R¹⁶; y

- 30 un anillo heterocíclico de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros, saturado, parcialmente insaturado o completamente insaturado que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R¹⁶; y R⁹ en los grupos -S(O)_nR⁹ y -OSO₂ R⁹ se selecciona adicionalmente del grupo que consiste en alcoxi C₁-C₆ y haloalcoxi C₁-C₆;

- 35 R^{10a}, R^{10b} se seleccionan independientemente entre sí del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, donde los radicales alifáticos y cicloalifáticos en los ocho últimos radicales mencionados pueden estar sustituidos con uno o más radicales R¹³;

- 40 -alquilo C₁-C₆-C(=O)OR¹⁵, -alquilo C₁-C₆-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}, -alquilo C₁-C₆-C(=S)N(R^{14a})R^{14b}, -alquilo C₁-C₆-
C(=NR¹⁴)N(R^{14a})R^{14b}, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆,
-S(O)_nR¹⁵, -S(O)_nN(R^{14a})R^{14b}, -C(=O)R¹³, -C(=O)OR¹⁵, -C(=O)N(R^{14a})R^{14b}, -C(=S)R¹³, -C(=S)SR¹⁵, -
C(=S)N(R^{14a})R^{14b}, -C(=NR¹⁴)R¹³;

- 45 fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3 o 4 sustituyentes R¹⁶; y un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o completamente insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R¹⁶;

o

- 50 R^{10a} y R^{10b} forman junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o completamente insaturado de 3, 4, 5, 6, 7 u 8 miembros, en el que el anillo heterocíclico además puede contener uno o dos heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico opcionalmente lleva uno o más sustituyentes seleccionados entre halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R¹⁶, y un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o completamente insaturado de 3, 4, 5, 6, o 7 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico opcionalmente lleva uno o más sustituyentes R¹⁶;

- 55 o R^{10a} y R^{10b} juntos forman un grupo =C(R¹³)₂, =S(O)_m(R¹⁵)₂, =S(O)_mR¹⁵N(R^{14a})R^{14b}, =NR¹⁴ o =NOR¹⁵;
- R¹¹ se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, azido, nitro, -SCN, -SF₅, alquilo C₁-C₁₀, cicloalquilo C₃-C₈, alqueno C₂-C₁₀, alquino C₂-C₁₀, donde los cuatro últimos radicales alifáticos y cicloalifáticos mencionados pueden estar parcial o completamente halogenados y/o pueden estar sustituidos con

uno o más radicales R⁸; -OR⁹, -NR^{10a} R^{10b}, -S(O)_nR⁹, -Si(R¹²)₃;
 fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4, o 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R¹⁶; y
 un anillo heterocíclico aromático saturado, parcialmente insaturado o completamente insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7
 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO,
 SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico está opcionalmente sustituido con uno o más
 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R¹⁶;
 o
 dos R¹¹ presentes sobre el mismo átomo de carbono del anillo de un anillo heterocíclico insaturado o
 parcialmente insaturado juntos pueden formar un grupo =O, =C(R¹³)₂; =S; =S(O)_m(R¹⁵)₂; -S(O)_mR¹⁵N(R^{14a})R^{14b},
 10 =NR¹⁴, =NOR¹⁵, o =NN(R^{14a})R^{14b};
 o
 dos R¹¹ unidos sobre átomos de anillo adyacentes forman, junto con los átomos del anillo a los que están unidos,
 un anillo saturado de 3, 4, 5, 6, 7, 8 o 9 miembros, en el que el anillo puede contener 1 o 2 heteroátomos o
 grupos de heteroátomos seleccionados entre O, S, N, NR¹⁴, NO, SO y SO₂ y/o 1 o 2 grupos seleccionados entre
 15 C=O, C=S y C=NR¹⁴ como miembros del anillo, y en el que el anillo puede estar sustituido con uno o más
 radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆,
 haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, alquenilo C₂-C₆,
 haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, fenilo que puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5
 radicales R¹⁶ y un anillo heterocíclico de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros saturado, parcialmente insaturado o
 20 completamente insaturado que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N,
 O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico puede estar sustituido con uno o
 más radicales R¹⁶;
 cada R¹² se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₆,
 haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆,
 25 haloalquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆-alquilo
 C₁-C₆, y fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4, o 5 sustituyentes R¹⁶;
 cada R¹³ se selecciona independientemente del grupo que consiste en ciano, nitro, -OH, -SH, -SCN, -SF₅, alcoxi
 C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, haloalquilsulfinilo C₁-C₆,
 alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, trimetilsililo, trietilsililo, *terc*-butildimetilsililo, cicloalquilo C₃-C₈ que
 30 pueden estar sin sustituir, parcial o completamente halogenados y/o puede llevar 1 o 2 radicales seleccionados
 entre alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ y oxo; fenilo, bencilo, fenoxi, donde el resto
 fenilo en los tres últimos radicales mencionados puede estar no sustituido o llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R¹⁶;
 y un anillo heterocíclico de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros, saturado, parcialmente insaturado o completamente
 35 insaturado que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y
 SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes R¹⁶;
 o
 dos R¹³ presentes sobre el mismo átomo de carbono de un grupo alquilo, alquenilo, alquinilo o un grupo
 cicloalquilo pueden ser conjuntamente =O, =CH(alquilo C₁-C₄), =C(alquilo C₁-C₄)-alquilo C₁-C₄, =N(alquilo C₁-C₆)
 o =NO(alquilo C₁-C₆);
 40 y
 R¹³ como sustituyente sobre un anillo cicloalquilo se selecciona adicionalmente del grupo que consiste en alquilo
 C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆ y alquinilo C₂-C₆, en los que los tres últimos radicales alifáticos mencionados pueden estar
 sin sustituir, parcial o completamente halogenados y/o pueden llevar 1 o 2 sustituyentes seleccionados entre CN,
 cicloalquilo C₃-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ y oxo;
 45 y
 R¹³ en los grupos =C(R¹³)₂, -N=C(R¹³)₂, -C(=O)R¹³, -C(=S)R¹³ y -C(=NR¹⁴)R¹³ adicionalmente se selecciona del
 grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆ y alquinilo C₂-C₆, en los que los tres
 últimos radicales alifáticos mencionados pueden estar sin sustituir, parcial o completamente halogenados y/o
 puede llevar 1 o 2 radicales seleccionados entre CN, cicloalquilo C₃-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ y oxo;
 50 cada R¹⁴ se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, ciano, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi
 C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, haloalquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆,
 haloalquilsulfonilo C₁-C₆, trimetilsililo, trietilsililo, *terc*-butildimetilsililo, alquilo
 C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, en los que los tres últimos radicales alifáticos mencionados pueden estar
 sin sustituir, parcial o completamente halogenados y/o puede llevar 1 o 2 radicales seleccionados entre CN,
 55 alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfinilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄
 que pueden estar sustituidos con 1 o 2 sustituyentes seleccionados entre halógeno y ciano; y oxo; cicloalquilo C₃-C₈
 que puede estar sin sustituir, parcial o completamente halogenado y/o puede llevar 1 o 2 radicales seleccionados
 entre alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfinilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄,
 cicloalquilo C₃-C₄, cicloalquilo alquilo C₃-C₄ C₁-C₄, donde el resto cicloalquilo en los dos últimos radicales

- mencionados puede estar sustituido con 1 o 2 sustituyentes seleccionados entre halógeno y ciano; y oxo;
 fenilo, bencilo, piridilo, fenoxi, en el que los restos cíclicos en los cuatro últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos o llevar 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados entre halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆,
 5 alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆ y (alcoxi C₁-C₆) carbonilo; y un anillo heterocíclico de 3, 4, 5 o 6 miembros, saturado, parcialmente insaturado o completamente insaturado que comprende 1 o 2 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R¹⁶;
 R^{14a} y R^{14b}, independientemente entre sí, tienen uno de los significados dados para R¹⁴; o
 10 R^{14a} y R^{14b}, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o completamente insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros, en el que el anillo heterocíclico puede contener adicionalmente 1 o 2 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico opcionalmente lleva uno o más sustituyentes seleccionados entre halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;
 o
 15 R^{14a} y R¹⁴ o R^{14b} y R¹⁴, junto con los átomos de nitrógeno a los que están unidos en el grupo -C(=NR^{14a})N(R^{14a})R^{14b}, forman un anillo heterocíclico de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros, parcialmente insaturado o completamente insaturado, en el que el anillo heterocíclico puede contener adicionalmente 1 o 2 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, en el que el anillo heterocíclico lleva opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados entre halógeno, haloalquilo C₁-C₄,
 20 alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;
 cada R¹⁵ se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, ciano, trimetilsililo, trietilsililo, *tert*-butildimetilsililo, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, en los que los tres últimos radicales alifáticos mencionados pueden estar sin sustituir, parcial o completamente halogenados y/o pueden llevar 1 o 2 radicales seleccionados entre cicloalquilo C₃-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄ y oxo;
 25 cicloalquilo C₃-C₈ que puede estar sin sustituir, parcial o completamente halogenado y/o puede llevar 1 o 2 radicales seleccionados entre alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄ y oxo;
 fenilo, bencilo, piridilo y fenoxi, en el que los cuatro últimos radicales mencionados pueden estar sin sustituir, parcial o completamente halogenados y/o llevar 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados entre alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆ y (alcoxi C₁-C₆) carbonilo;
 30 cada R¹⁶ se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, -OH, -SH, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, trimetilsililo, trietilsililo, *tert*-butildimetilsililo; alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, en los que los tres últimos radicales alifáticos mencionados pueden estar sin sustituir, parcial o completamente halogenados y/o pueden llevar 1 o 2 radicales seleccionados entre cicloalquilo C₃-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ y oxo;
 35 cicloalquilo C₃-C₈ que puede estar sin sustituir, parcial o completamente halogenado y/o puede llevar 1 o 2 radicales seleccionados entre alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ y oxo;
 fenilo, bencilo, piridilo y fenoxi, en el que los cuatro últimos radicales mencionados pueden estar sin sustituir, parcial o completamente halogenados y/o llevar 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados entre alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆ y (alcoxi C₁-C₆) carbonilo;
 o
 40 dos R¹⁶ presentes juntos sobre el mismo átomo de un anillo insaturado o parcialmente insaturado pueden ser =O, =S, =N(alquilo C₁-C₆), =NO(alquilo C₁-C₆), =CH(alquilo C₁-C₄) o =C(alquilo C₁-C₄)-alquilo C₁-C₄;
 o
 dos R¹⁶ sobre dos átomos de carbono adyacentes forman junto con los átomos de carbono que están unidos a un anillo de 4, 5, 6, 7 u 8 miembros, saturado, parcialmente insaturado o completamente insaturado, en el que el anillo puede contener 1 o 2 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, y donde el anillo opcionalmente lleva uno o más sustituyentes seleccionados entre halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;
 50 cada n es independientemente 0, 1 o 2; y
 cada m es independientemente 0 o 1;
 y los N-óxidos, estereoisómeros y sales agrícola o veterinariamente aceptables de los mismos;
 55 a excepción de los compuestos I en los que B¹ y B³ son C-Cl, y simultáneamente B² es C-H, G¹, G³ y G⁴ son C-H, G² es C-F, C-Cl, C-CH₃ o C-SCH₃, W es O, R¹ es CF₃, R^{3a} y R^{3b} son H, y R⁵ y R⁶, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un anillo seleccionado entre aziridin-1-ilo, azetidín-1-ilo, pirrolidin-1-ilo, piperidin-1-ilo, tiazolidín-3-ilo, morfolin-4-ilo, tiomorfolin-4-ilo, 1-oxo-1,4-tiazinan-4-ilo y 1,1-dioxo-1,4-tiazinan-4-ilo.

- [0009]** La presente descripción también proporciona una composición agrícola que comprende al menos un compuesto de la fórmula I como se ha definido en el presente documento y/o una sal agrícolamente aceptable del mismo y al menos un vehículo líquido y/o sólido agrícolamente aceptable.
- 5 **[0010]** La presente descripción también proporciona una composición veterinaria que comprende al menos un compuesto de la fórmula I como se ha definido en el presente documento y/o una sal veterinariamente aceptable del mismo y al menos un vehículo líquido y/o sólido veterinariamente aceptable.
- [0011]** La presente descripción también proporciona un método para controlar plagas de invertebrados cuyo
10 método comprende tratar las plagas, su suministro de alimentos, su hábitat o su caldo de cultivo o una planta cultivada, materiales de propagación de plantas (tales como semillas), suelo, área, material o ambiente en que las plagas crecen o pueden crecer, o los materiales, plantas cultivadas, materiales de propagación de plantas (como semillas), suelos, superficies o espacios a proteger del ataque de plagas o infestación con una cantidad eficaz como plaguicida de un compuesto de fórmula I o una sal del mismo como se ha definido en este documento.
- 15 **[0012]** La presente descripción también se refiere a material de propagación de plantas, en particular semillas, que comprende al menos un compuesto de fórmula I y/o una sal agrícolamente aceptable del mismo como se ha definido en el presente documento.
- 20 **[0013]** La presente descripción se refiere además a un método para tratar o proteger un animal de la infestación o infección por parásitos que comprende poner el animal en contacto con una cantidad eficaz como parasiticida de un compuesto de la fórmula I o una sal veterinariamente aceptable del mismo como se ha definido en este documento. Poner al animal en contacto con el compuesto I, su sal o la composición veterinaria de la invención significa aplicarlo o administrarlo al animal.
- 25 **[0014]** El término "esteroisómeros" abarca tanto isómeros ópticos, tales como enantiómeros o diastereómeros, estos últimos que existen debido a más de un centro de quiralidad en la molécula, así como también isómeros geométricos (isómeros cis/trans).
- 30 **[0015]** Dependiendo del patrón de sustitución, los compuestos de la fórmula I pueden tener uno o más centros de quiralidad, en cuyo caso están presentes como mezclas de enantiómeros o diastereómeros. Un centro de quiralidad es el átomo del anillo de carbono del anillo de isotiazolina que lleva el radical R¹. La invención proporciona tanto los enantiómeros como los diastereómeros puros y sus mezclas y el uso de acuerdo con la invención de los enantiómeros o diastereómeros puros del compuesto I o sus mezclas. Los compuestos adecuados de la fórmula I
35 también incluyen todos los posibles estereoisómeros geométricos (isómeros cis/trans) y sus mezclas.
- [0016]** El término N-óxidos se refiere a una forma de compuestos I en la que al menos un átomo de nitrógeno está presente en forma oxidada (como NO). Para ser más precisos, se refiere a cualquier compuesto de la presente invención que tiene al menos un átomo de nitrógeno terciario que se oxida a un resto de N-óxido. Los N-óxidos de
40 compuestos I se pueden preparar en particular mediante la oxidación de, por ejemplo, el átomo de nitrógeno del anillo del resto isotiazolina y/o, si G¹, G², G³ o G⁴ es N, este átomo de nitrógeno, y/o del anillo formado por R⁵ y R⁶ con un agente oxidante adecuado, como ácidos peroxocarbóxicos u otros peróxidos. La persona experta en la materia sabe si y en qué posiciones los compuestos de la presente invención pueden formar N-óxidos.
- 45 **[0017]** Los compuestos de la presente invención pueden ser amorfos o pueden existir en uno o más estados cristalinos diferentes (polimorfos) que pueden tener diferentes propiedades macroscópicas tales como estabilidad o mostrar diferentes propiedades biológicas tales como actividades. La presente invención incluye tanto compuestos amorfos como cristalinos de la fórmula I, mezclas de diferentes estados cristalinos del compuesto I respectivo, así como sales amorfas o cristalinas de los mismos.
- 50 **[0018]** Las sales de los compuestos de la fórmula I son preferiblemente sales agrícola y veterinariamente aceptables. Se pueden formar en un método habitual, por ejemplo, haciendo reaccionar el compuesto con un ácido del anión en cuestión si el compuesto de fórmula I tiene una funcionalidad básica o haciendo reaccionar un compuesto ácido de fórmula I con una base adecuada.
- 55 **[0019]** Sales adecuadas agrícolamente aceptables son especialmente las sales de aquellos cationes o las sales de adición de ácido de aquellos ácidos cuyos cationes y aniones, respectivamente, no tienen ningún efecto adverso sobre la acción de los compuestos de acuerdo con la presente invención. Los cationes adecuados son en particular los iones de los metales alcalinos, preferiblemente litio, sodio y potasio, de los metales alcalinotérreos,

- preferiblemente calcio, magnesio y bario, y de los metales de transición, preferiblemente manganeso, cobre, zinc y hierro, y también amonio (NH_4^+) y amonio sustituido en el que de uno a cuatro de los átomos de hidrógeno están sustituidos con alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, hidroxialquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, hidroxialcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, fenilo o bencilo. Ejemplos de iones de amonio sustituidos comprenden metilamonio, isopropilamonio, 5 dimetilamonio, diisopropilamonio, trimetilamonio, tetrametilamonio, tetraetilamonio, tetrabutilamonio, 2-hidroxiethylamonio, 2-(2-hidroxiethyl) etilamonio, bis (2-hidroxiethyl) amonio, benciltrimetilamonio y benciltriethylamonio, además de iones fosfonio, iones sulfonio, preferiblemente tri (alquil $\text{C}_1\text{-C}_4$) sulfonio, y iones de sulfoxonio, preferiblemente tri (alquil $\text{C}_1\text{-C}_4$) sulfoxonio.
- 10 **[0020]** Los aniones de sales de adición de ácido útiles son principalmente cloruro, bromuro, fluoruro, hidrogenosulfato, sulfato, dihidrogenofosfato, hidrogenofosfato, fosfato, nitrato, hidrogenocarbonato, carbonato, hexafluorosilicato, hexafluorofosfato, benzoato y los aniones de ácidos alcanoicos $\text{C}_1\text{-C}_4$, preferiblemente formiato, acetato, propionato y butirato. Se pueden formar haciendo reaccionar un compuesto de fórmula I con un ácido del anión correspondiente, preferiblemente de ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico o 15 ácido nítrico.
- [0021]** Por el término "sales veterinariamente aceptables" se entiende sales de aquellos cationes o aniones que son conocidos y aceptados en la técnica para la formación de sales para uso veterinario. Sales de adición de ácido adecuadas, por ejemplo, formadas por compuestos de fórmula I que contienen un átomo de nitrógeno básico, 20 por ejemplo, un grupo amino, incluyen sales con ácidos inorgánicos, por ejemplo, clorhidratos, sulfatos, fosfatos y nitratos y sales de ácidos orgánicos, por ejemplo, ácido acético, ácido maleico, ácido dimaleico, ácido fumárico, ácido difumarico, ácido metanosulfénico, ácido metanosulfónico y ácido succínico.
- [0022]** El término "plaga de invertebrados" como se usa en el presente documento abarca poblaciones 25 animales, tales como insectos, arácnidos y nematodos, que pueden atacar plantas, causando de este modo daños sustanciales a las plantas atacadas, así como ectoparásitos que pueden infestar animales, en particular animales de sangre caliente tales como, por ejemplo, mamíferos o aves u otros animales superiores, como reptiles, anfibios o peces, causando así daños sustanciales a los animales infestados.
- 30 **[0023]** El término "material de propagación de plantas" debe entenderse que representa todas las partes generativas de la planta tales como semillas y material de plantas vegetativas tales como esquejes y tubérculos (por ejemplo, patatas), que pueden usarse para la multiplicación de la planta. Esto incluye semillas, raíces, frutas, tubérculos, bulbos, rizomas, brotes, esquejes y otras partes de las plantas, incluyendo plántulas y plantas jóvenes, que se trasplantarán después de la germinación o después de la emergencia del suelo. Los materiales de 35 propagación de la planta pueden tratarse profilácticamente con un compuesto de protección de plantas a la hora de o antes de plantar o trasplantar. Dichas plantas jóvenes también pueden protegerse antes del trasplante mediante un tratamiento total o parcial por inmersión o vertido.
- [0024]** El término "plantas" comprende cualquier tipo de plantas, incluidas las "plantas no cultivadas" y en 40 particular las "plantas cultivadas".
- [0025]** El término "plantas no cultivadas" se refiere a cualquier especie de tipo silvestre o especies relacionadas o géneros relacionados de una planta cultivada.
- 45 **[0026]** El término "plantas cultivadas" debe entenderse que incluye las plantas que han sido modificadas mediante reproducción, mutagénesis o ingeniería genética, incluidos, entre otros, productos biotecnológicos agrícolas disponibles en el mercado o en desarrollo (véase http://www.bio.org/speeches/pubs/er/agri_products.asp). Las plantas genéticamente modificadas son plantas cuyo material genético ha sido modificado de esta manera mediante el uso de técnicas de ADN recombinante que, en circunstancias naturales, no pueden obtenerse 50 fácilmente por cruzamiento, mutaciones o recombinación natural. Normalmente, se han integrado uno o más genes en el material genético de una planta genéticamente modificada con el fin de mejorar ciertas propiedades de la planta. Dichas modificaciones genéticas también incluyen, pero no se limitan a, modificaciones postraduccionales específicas de proteína(s), oligo o polipéptidos, por ejemplo, por glicosilación o adiciones de polímeros tales como restos prenilados, acetilados o farnesilados o restos de PEG.
- 55 **[0027]** Las plantas que han sido modificadas mediante mejora genética, mutagénesis o ingeniería genética, por ejemplo, se han vuelto tolerantes a las aplicaciones de clases específicas de herbicidas, tales como herbicidas de auxina tales como dicamba o 2,4-D; herbicidas blanqueadores tales como inhibidores de hidroxifenilpiruvato dioxigenasa (HPPD) o inhibidores de fitoeno desaturasa (PDS); inhibidores de acetolactato sintasa (ALS) tales como

sulfonilureas o imidazolinonas; inhibidores de enolpiruvilshikimato-3-fosfato sintasa (EPSPS), tales como glifosato; inhibidores de glutamina sintetasa (GS) tales como glufosinato; inhibidores de protoporfirinógeno-IX oxidasa; inhibidores de la biosíntesis de lípidos tales como inhibidores de acetil CoA carboxilasa (ACCase); o herbicidas de oxiclil (es decir, bromoxinil o ioxinil) como resultado de métodos convencionales de mejora genética o ingeniería genética. Además, las plantas se han hecho resistentes a múltiples clases de herbicidas a través de múltiples modificaciones genéticas, como la resistencia tanto al glifosato como al glufosinato o al glifosato y a un herbicida de otra clase como inhibidores de ALS, inhibidores de HPPD, herbicidas de auxina o inhibidores de ACCase. Estas tecnologías de resistencia a herbicidas se describen, por ejemplo, en Pest Managem. Sci. 61, 2005, 246; 61, 2005, 258; 61, 2005, 277; 61, 2005, 269; 61, 2005, 286; 64, 2008, 326; 64, 2008, 332; Weed Sci. 57, 2009, 108; Austral. J. 10 Agricult. Res. 58, 2007, 708; Science 316, 2007, 1185; y las referencias allí citadas. Varias plantas cultivadas se han vuelto tolerantes a los herbicidas mediante métodos convencionales de reproducción (mutagénesis), por ejemplo, la colza Clearfield® (Canola, BASF SE, Alemania) siendo tolerante a imidazolinonas, por ejemplo, Imazamox o girasol ExpressSun® (DuPont, EE. UU.) siendo tolerante a sulfonilureas, por ejemplo, tribenurón. Los métodos de ingeniería genética se han usado para obtener plantas cultivadas tales como soja, algodón, maíz, remolacha y colza, tolerantes a herbicidas tales como glifosato y glufosinato, algunos de los cuales están disponibles en el mercado bajo los nombres comerciales RoundupReady® (tolerantes al glifosato, Monsanto, EE.UU.), Cultivance® (tolerante a imidazolinona, BASF SE, Alemania) y LibertyLink® (tolerante a glufosinato, Bayer CropScience, Alemania).

[0028] Además, también están cubiertas plantas que se preparan mediante el uso de técnicas de ADN recombinante capaces de sintetizar una o más proteínas insecticidas, especialmente las conocidas del género bacteriano *Bacillus*, particularmente de *Bacillus thuringiensis*, tales como δ -endotoxinas, por ejemplo, CryIA (b), CryIA (c), CryIF, CryIF (a2), CryIIA (b), CryIIIA, CryIIIB (b1) o Cry9c; proteínas insecticidas vegetativas (VIP), por ejemplo, VIP1, VIP2, VIP3 o VIP3A; proteínas insecticidas de bacterias que colonizan nematodos, por ejemplo, *Photorhabdus* spp. o *Xenorhabdus* spp.; toxinas producidas por animales, tales como toxinas de escorpiones, 25 toxinas de arácnidos, toxinas de avispas u otras neurotoxinas específicas de insectos; toxinas producidas por hongos, tales como toxinas de Streptomycetes, lectinas de plantas, tales como lectinas de guisantes o de cebada; aglutininas; inhibidores de proteinasas, tales como inhibidores de tripsina, inhibidores de serina proteasa, inhibidores de patatina, cistatina o papaína; proteínas inactivadoras de ribosomas (RIP), tales como ricina, RIP de maíz, abrina, luffina, saporina o briodina; enzimas del metabolismo de esteroides, tales como 3-hidroxiesteroide oxidasa, ecdisteroide-IDP-glicosiltransferasa, colesterol oxidasa, inhibidores de ecdisona o HMG-CoA-reductasa; 30 bloqueadores de canales iónicos, tales como bloqueadores de canales de sodio o calcio; esterasa de la hormona juvenil; receptores de hormonas diuréticas (receptores de helicoquinina); stilben sintasa, bibencil sintasa, quitinasas o glucanasas. En el contexto de la presente invención, estas proteínas o toxinas insecticidas deben entenderse expresamente también como pretoxinas, proteínas híbridas, proteínas truncadas o modificadas de otro modo. Las proteínas híbridas se caracterizan por una nueva combinación de dominios proteicos (ver, por ejemplo, documento WO 02/015701). Se describen más ejemplos de tales toxinas o plantas genéticamente modificadas capaces de sintetizar tales toxinas, por ejemplo, en los documentos EP-A 374 753, WO 93/007278, WO 95/34656, EP-A 427 529, EP-A 451 878, WO 03/18810 y WO 03/52073. Los métodos para producir tales plantas genéticamente modificadas son conocidos en general por los expertos en la materia y se describen, por ejemplo, en las 40 publicaciones mencionadas anteriormente. Estas proteínas insecticidas contenidas en las plantas modificadas genéticamente confieren a las plantas que producen estas proteínas tolerancia a las plagas dañinas de todos los grupos taxonómicos de los artrópodos, especialmente los escarabajos (Coleoptera), los insectos de dos alas (Diptera) y las polillas (Lepidoptera) y los nematodos (Nematoda). Las plantas genéticamente modificadas capaces de sintetizar una o más proteínas insecticidas se describen, por ejemplo, en las publicaciones mencionadas 45 anteriormente, y algunas de las cuales están disponibles en el mercado, tales como YieldGard® (cultivares de maíz que producen la toxina Cry1Ab), YieldGard® Plus (cultivares de maíz que producen toxinas Cry1Ab y Cry3Bb1), Starlink® (cultivares de maíz que producen la toxina Cry9c), Herculex® RW (cultivares de maíz que producen Cry34Ab1, Cry35Ab1 y la enzima fosfinotricin-N-acetiltransferasa [PAT]); NuCOTN® 33B (cultivares de algodón que producen la toxina Cry1Ac), Bollgard® I (cultivares de algodón que producen la toxina Cry1Ac), Bollgard® II (cultivares de algodón que producen las toxinas Cry1Ac y Cry2Ab2); VIPCOT® (cultivares de algodón que producen una toxina VIP); NewLeaf® (cultivares de patata que producen la toxina Cry3A); Bt-Xtra®, NatureGard®, KnockOut®, BiteGard®, Protecta®, Bt11 (por ejemplo, Agrisure® CB) y Bt176 de Syngenta Seeds SAS, Francia (cultivares de maíz que producen la toxina Cry1Ab y la enzima PAT), MIR604 de Syngenta Seeds SAS, Francia (cultivares de maíz que producen una versión modificada de la toxina Cry3A, véase, documento WO 03/018810), MON 863 de Monsanto 50 Europe SA, Bélgica (cultivares de maíz que producen la toxina Cry3Bb1), IPC531 de Monsanto Europe SA, Bélgica (cultivares de algodón que producen una versión modificada de la toxina Cry1Ac) y 1507 de Pioneer Overseas Corporation, Bélgica (cultivares de maíz que producen la toxina Cry1F y la enzima PAT).

[0029] Además, también están cubiertas plantas que se producen mediante el uso de técnicas de ADN

recombinante capaces de sintetizar una o más proteínas para aumentar la resistencia o tolerancia de esas plantas a patógenos bacterianos, víricos o fúngicos. Ejemplos de tales proteínas son las llamadas "proteínas relacionadas con la patogénesis" (proteínas PR, véase, por ejemplo, documento EP-A 392 225), genes de resistencia a enfermedades (por ejemplo, cultivares de patata, que expresan genes de resistencia que actúan contra *Phytophthora infestans* 5 derivados de patata silvestre mexicana *Solanum bulbocastanum*) o T4-lisozima (por ejemplo, cultivares de patata capaces de sintetizar estas proteínas con mayor resistencia contra bacterias como *Erwinia amylovora*). Los métodos para producir tales plantas genéticamente modificadas son conocidos en general por los expertos en la materia y se describen, por ejemplo, en las publicaciones mencionadas anteriormente.

10 **[0030]** Además, las plantas también están cubiertas mediante técnicas de ADN recombinante capaces de sintetizar una o más proteínas para aumentar la productividad (por ejemplo, producción de biomasa, rendimiento de grano, contenido de almidón, contenido de aceite o proteína), tolerancia a la sequía, salinidad u otros factores ambientales limitantes del crecimiento o tolerancia a plagas y patógenos fúngicos, bacterianos o virales de esas plantas.

15

[0031] Además, también se cubren plantas que contienen, mediante técnicas de ADN recombinante, una cantidad modificada de sustancias de contenido o nuevas sustancias de contenido, específicamente para mejorar la nutrición humana o animal, por ejemplo, cultivos oleaginosos que producen ácidos grasos omega-3 o ácidos grasos omega-9 insaturados de cadena larga promotores de la salud (por ejemplo, colza Nexera®, DOW Agro Sciences, 20 Canadá).

[0032] Además, también se cubren plantas que contienen, mediante técnicas de ADN recombinante, una cantidad modificada de sustancias de contenido o nuevas sustancias de contenido, específicamente para mejorar la producción de materias primas, por ejemplo, patatas que producen mayores cantidades de amilopectina (por 25 ejemplo, patata Amflora®, BASF SE, Alemania).

[0033] Las fracciones orgánicas mencionadas en las definiciones anteriores de las variables son, como el término halógeno, términos colectivos para listados individuales de los miembros individuales del grupo. El sufijo C_n-C_m indica en cada caso el número posible de átomos de carbono en el grupo.

30

[0034] El término halógeno representa en cada caso flúor, bromo, cloro o yodo, en particular flúor, cloro o bromo.

[0035] El término "alquilo" como se usa en este documento y en los restos alquilo de alcoxilo, alquiltio, 35 alquilsulfino, alquilsulfonilo, alquilcarbonilo, alcoxicarbonilo y similares se refiere a radicales hidrocarbonados saturados de cadena lineal o ramificada que tienen 1 a 2 ("alquilo C₁-C₂"), de 1 a 3 ("alquilo C₁-C₃"), de 1 a 4 ("alquilo C₁-C₄"), de 1 a 6 ("alquilo C₁-C₆"), de 1 a 8 ("alquilo C₁-C₈") o de 1 a 10 (alquilo C₁-C₁₀) átomos de carbono. Alquilo C₁-C₂ es metilo o etilo. Alquilo C₁-C₃ es, además, propilo e isopropilo. Alquilo C₁-C₄ es, además, butilo, 1-metilpropilo (sec-butilo), 2-metilpropilo (isobutilo) o 1,1-dimetiletilo (terc-butilo). Alquilo C₁-C₆ también es 40 adicionalmente, por ejemplo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, hexilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo o 1-etil-2-metilpropilo. Alquilo C₁-C₈ también es 45 adicionalmente, por ejemplo, heptilo, octilo, 2-etilhexilo y sus isómeros posicionales. Alquilo C₁-C₁₀ también es 45 adicionalmente, por ejemplo, nonilo, decilo e isómeros posicionales de los mismos.

[0036] El término "haloalquilo" tal como se usa en el presente documento, que también se expresa como "alquilo que está parcial o totalmente halogenado", se refiere a grupos alquilo de cadena lineal o ramificada que tienen de 1 a 2 ("haloalquilo C₁-C₂"), de 1 a 3 ("haloalquilo C₁-C₃"), de 1 a 4 ("haloalquilo C₁-C₄"), de 1 a 6 50 ("haloalquilo C₁-C₆"), de 1 a 8 ("haloalquilo C₁-C₈") o de 1 a 10 ("haloalquilo C₁-C₁₀") (como se ha mencionado anteriormente), donde algunos o todos los átomos de hidrógeno en estos grupos se han reemplazado por átomos de halógeno como se ha mencionado anteriormente: en particular haloalquilo C₁-C₂, tal como clorometilo, bromometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorodifluorometilo, 1-cloroetilo, 1-bromoetilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-cloro-2-fluoroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo o pentafluoroetilo. Haloalquilo C₁-C₃ es 55 adicionalmente, por ejemplo, 1-fluoropropilo, 2-fluoropropilo, 3-fluoropropilo, 1,1-difluoropropilo, 2,2-difluoropropilo, 1,2-difluoropropilo, 3,3-difluoropropilo, 3,3,3-trifluoropropilo, heptafluoropropilo, 1,1,1-trifluoroprop-2-ilo, 3-cloropropilo y similares. Ejemplos para haloalquilo C₁-C₄ son, aparte de los mencionados para haloalquilo C₁-C₃, 4-clorobutilo y similares.

[0037] "Halometilo" es metilo en el cual 1, 2 o 3 de los átomos de hidrógeno están sustituidos con átomos de halógeno. Los ejemplos son bromometilo, clorometilo, fluorometilo, diclorometilo, triclorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorodifluorometilo y similares.

5

[0038] El término "alqueno" como se usa en el presente documento se refiere a radicales hidrocarbonados monoinsaturado de cadena lineal o ramificada que tiene de 2 a 3 ("alqueno C₂-C₃"), de 2 a 4 ("alqueno C₂-C₄"), de 2 a 6 ("alqueno C₂-C₆"), de 2 a 8 ("alqueno C₂-C₈") o de 2 a 10 ("alqueno C₂-C₁₀") átomos de carbono y un doble enlace en cualquier posición, por ejemplo, alqueno C₂-C₃, tal como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo o 1-metil-etenilo; alqueno C₂-C₄, como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metiletlenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo o 2-metil-2-propenilo; alqueno C₂-C₆, como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metiletlenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-2-propenilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-metil-1-butenilo, 2-metil-1-butenilo, 3-metil-1-butenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1,2-dimetil-1-propenilo, 1,2-dimetil-2-propenilo, 1-etil-1-propenilo, 1-etil-2-propenilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1-metil-1-pentenilo, 2-metil-1-pentenilo, 3-metil-1-pentenilo, 4-metil-1-pentenilo, 1-metil-2-pentenilo, 2-metil-2-pentenilo, 3-metil-2-pentenilo, 4-metil-2-pentenilo, 1-metil-3-pentenilo, 2-metil-3-pentenilo, 3-metil-3-pentenilo, 4-metil-3-pentenilo, 1-metil-4-pentenilo, 2-metil-4-pentenilo, 3-metil-4-pentenilo, 4-metil-4-pentenilo, 1,1-dimetil-2-butenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, 1,2-dimetil-1-butenilo, 1,2-dimetil-2-butenilo, 1,2-dimetil-3-butenilo, 1,3-dimetil-1-butenilo, 1,3-dimetil-2-butenilo, 1,3-dimetil-3-butenilo, 2,2-dimetil-3-butenilo, 2,3-dimetil-1-butenilo, 2,3-dimetil-2-butenilo, 2,3-dimetil-3-butenilo, 3,3-dimetil-1-butenilo, 3,3-dimetil-2-butenilo, 1-etil-1-butenilo, 1-etil-2-butenilo, 1-etil-3-butenilo, 2-etil-1-butenilo, 2-etil-2-butenilo, 2-etil-3-butenilo, 1,1,2-trimetil-2-propenilo, 1-etil-1-metil-2-propenilo, 1-etil-2-metil-1-propenilo, 1-etil-2-metil-2-propenilo y similares, o alqueno C₂-C₁₀, tales como los radicales mencionados para alqueno C₂-C₆ y, adicionalmente, 1-heptenilo, 2-heptenilo, 3-heptenilo, 1-octenilo, 2-octenilo, 3-octenilo, 4-octenilo, 1-nonenilo, 2-nonenilo, 3-nonenilo, 4-nonenilo, 1-decenilo, 2-decenilo, 3-decenilo, 4-decenilo, 5-decenilo y los isómeros posicionales de los mismos.

[0039] El término "haloalqueno", como se usa en el presente documento, que también se expresa como "alqueno que está parcial o totalmente halogenado", se refiere a restos de hidrocarburo insaturados de cadena lineal o ramificada que tienen de 2 a 3 ("haloalqueno C₂-C₃"), de 2 a 4 ("haloalqueno C₂-C₄"), de 2 a 6 ("haloalqueno C₂-C₆"), de 2 a 8 ("haloalqueno C₂-C₈") o de 2 a 10 ("haloalqueno C₂-C₁₀") átomos de carbono y un doble enlace en cualquier posición (como se ha mencionado anteriormente), donde algunos o todos los átomos de hidrógeno en estos grupos están sustituidos con átomos de halógeno como se ha mencionado anteriormente, en particular flúor, cloro y bromo, por ejemplo, clorovinilo, cloroalilo y similares.

[0040] El término "alquino" como se usa en el presente documento se refiere a grupos de hidrocarburos de cadena lineal o ramificada que tienen de 2 a 3 ("alquino C₂-C₃"), de 2 a 4 ("alquino C₂-C₄"), de 2 a 6 ("alquino C₂-C₆"), de 2 a 8 ("alquino C₂-C₈") o de 2 a 10 ("alquino C₂-C₁₀") átomos de carbono y uno o dos triples enlaces en cualquier posición, por ejemplo, alquino C₂-C₃, tales como etinilo, 1-propinilo o 2-propinilo; alquino C₂-C₄, tal como etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo, 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 1-metil-2-propinilo y similares, alquino C₂-C₆, como etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo, 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 1-metil-2-propinilo, 1-pentinilo, 2-pentinilo, 3-pentinilo, 4-pentinilo, 1-metil-2-butinilo, 1-metil-3-butinilo, 2-metil-3-butinilo, 3-metil-1-butinilo, 1,1-dimetil-2-propinilo, 1-etil-2-propinilo, 1-hexinilo, 2-hexinilo, 3-hexinilo, 4-hexinilo, 5-hexinilo, 1-metil-2-pentinilo, 1-metil-3-pentinilo, 1-metil-4-pentinilo, 2-metil-3-pentinilo, 2-metil-4-pentinilo, 3-metil-1-pentinilo, 3-metil-4-pentinilo, 4-metil-1-pentinilo, 4-metil-2-pentinilo, 1,1-dimetil-2-butinilo, 1,1-dimetil-3-butinilo, 1,2-dimetil-3-butinilo, 2,2-dimetil-3-butinilo, 3,3-dimetil-1-butinilo, 1-etil-2-butinilo, 1-etil-3-butinilo, 2-etil-3-butinilo, 1-etil-1-metil-2-propinilo y similares.

[0041] El término "haloalquino" como se usa en el presente documento, que también se expresa como "alquino que está parcial o totalmente halogenado", se refiere a restos de hidrocarburo insaturados de cadena lineal o ramificada que tienen de 2 a 3 ("haloalquino C₂-C₃"), de 2 a 4 ("haloalquino C₂-C₄"), de 3 a 4 ("haloalquino C₃-C₄"), de 2 a 6 ("haloalquino C₂-C₆"), de 2 a 8 ("haloalquino C₂-C₈") o de 2 a 10 ("haloalquino C₂-C₁₀") átomos de carbono y uno o dos triples enlaces en cualquier posición (como se ha mencionado anteriormente), donde algunos o todos los átomos de hidrógeno en estos grupos se han reemplazado por átomos de halógeno como se ha mencionado anteriormente, en particular flúor, cloro y bromo.

[0042] El término "cicloalquilo" tal como se utiliza en el presente documento se refiere a radicales hidrocarbonados saturados mono- o bi- o policíclicos que tiene de 3 a 8 ("cicloalquilo C₃-C₈"), en particular 3 a 6 ("cicloalquilo C₃-C₆") o de 3 a 5 ("cicloalquilo C₃-C₅") o de 3 a 4 ("cicloalquilo C₃-C₄") átomos de carbono.

[0043] Los ejemplos de radicales monocíclicos que tienen de 3 a 4 átomos de carbono comprenden ciclopropilo y ciclobutilo. Los ejemplos de radicales monocíclicos que tienen de 3 a 5 átomos de carbono comprenden ciclopropilo, ciclobutilo y ciclopentilo. Los ejemplos de radicales monocíclicos que tienen de 3 a 6 átomos de carbono comprenden ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo. Los ejemplos de radicales monocíclicos que tienen de 3 a 8 átomos de carbono comprenden ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo y ciclooctilo. Los ejemplos de radicales bicíclicos que tienen 7 u 8 átomos de carbono comprenden biciclo[2.2.1]heptilo, biciclo[3.1.1]heptilo, biciclo[2.2.2]octilo y biciclo[3.2.1]octilo. Preferiblemente, el término cicloalquilo representa un radical hidrocarbonado saturado monocíclico.

10

[0044] El término "halocicloalquilo" como se usa en este documento, que también se expresa como "cicloalquilo que está parcial o completamente halogenado", se refiere a grupos hidrocarburo saturados mono o bi o policíclicos que tienen de 3 a 8 ("halocicloalquilo C₃-C₈") o preferiblemente de 3 a 6 ("halocicloalquilo C₃-C₆") o de 3 a 5 ("halocicloalquilo C₃-C₅") o de 3 a 4 ("halocicloalquilo C₃-C₄") miembros del anillo de carbono (como se ha mencionado anteriormente) en el que algunos o todos los átomos de hidrógeno están sustituidos con átomos de halógeno como se ha mencionado anteriormente, en particular flúor, cloro y bromo.

[0045] El término "cicloalquil-alquilo C₁-C₄" se refiere a un grupo cicloalquilo C₃-C₈ ("cicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₄"), preferiblemente un grupo cicloalquilo C₃-C₆ ("cicloalquilo C₃-C₆-alquilo C₁-C₄"), más preferiblemente un grupo cicloalquilo C₃-C₄ ("cicloalquilo C₃-C₄-alquilo C₁-C₄") como se ha definido anteriormente (preferiblemente un grupo cicloalquilo monocíclico) que está unido al resto de la molécula a través de un grupo alquilo C₁-C₄, como se ha definido anteriormente. Ejemplos de cicloalquilo C₃-C₄-alquilo C₁-C₄ son ciclopropilmetilo, ciclopropiletilo, ciclopropilpropilo, ciclobutilmetilo, ciclobutiletilo y ciclobutilpropilo. Ejemplos de cicloalquilo C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, aparte de los mencionados para cicloalquilo C₃-C₄-alquilo C₁-C₄, son ciclopentilmetilo, ciclopentiletilo, ciclopentilpropilo, ciclohexilmetilo, ciclohexiletilo y ciclohexilpropilo. Ejemplos de cicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₄, aparte de los mencionados para cicloalquilo C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, son cicloheptilmetilo, cicloheptiletilo, ciclooctilmetilo y similares.

[0046] El término "halocicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₄" se refiere a un grupo halocicloalquilo C₃-C₈ como se ha definido anteriormente que está unido al resto de la molécula a través de un grupo alquilo C₁-C₄, como se ha definido anteriormente.

[0047] El término "cicloalqueno" como se usa en el presente documento se refiere a radicales hidrocarbonados monocíclicos con al menos un doble enlace C-C en el anillo, cuyo anillo, sin embargo, no es aromático, los radicales hidrocarbonados que tienen de 3 a 8 ("cicloalquilo C₃-C₈") átomos de carbono. Ejemplos son ciclopropenilo, como cicloprop-1-enilo y cicloprop-2-ilo, ciclobutenilo, como ciclobut-1-enilo y ciclobut-2-enilo, ciclopentenilo, como ciclopent-1-enilo, ciclopent-2-enilo y ciclopent-3-enilo, ciclopentadienilo, tal como ciclopenta-1,3-dienilo, ciclopenta-1,4-dienilo y ciclopenta-2,4-dienilo, ciclohexenilo, tal como ciclohex-1-enilo, ciclohex-2-enilo y ciclohex-3-enilo, ciclohexadienilo, como ciclohexa-1,3-dienilo, ciclohexa-1,4-dienilo, ciclohexa-1,5-dienilo y ciclohexa-2,5-dienilo, cicloheptenilo, cicloheptadienilo, cicloheptatrienilo, ciclooctenilo, ciclooctadieno, ciclooctatrienilo y ciclooctatetraenilo.

[0048] El término "halocicloalqueno", como se usa en el presente documento, se refiere a radicales hidrocarbonados monocíclicos con al menos un doble enlace C-C en el anillo, cuyo anillo, sin embargo, no es aromático, los radicales hidrocarbonados que tienen de 3 a 8 ("halocicloalqueno C₃-C₈") átomos de carbono, y en el que algunos o todos los átomos de hidrógeno están sustituidos con átomos de halógeno como se ha mencionado anteriormente, en particular flúor, cloro y bromo.

[0049] El término "alcoxi C₁-C₂" es un grupo alquilo C₁-C₂, como se ha definido anteriormente, unido a través de un átomo de oxígeno. El término "alcoxi C₁-C₃" es un grupo alquilo C₁-C₃, como se ha definido anteriormente, unido a través de un átomo de oxígeno. El término "alcoxi C₁-C₄" es un grupo alquilo C₁-C₄, como se ha definido anteriormente, unido a través de un átomo de oxígeno. El término "alcoxi C₁-C₆" es un grupo alquilo C₁-C₆, como se ha definido anteriormente, unido a través de un átomo de oxígeno. El término "alcoxi C₁-C₁₀" es un grupo alquilo C₁-C₁₀, como se ha definido anteriormente, unido a través de un átomo de oxígeno. Alcoxi C₁-C₂ es metoxi o etoxi. Alcoxi C₁-C₃ es adicionalmente, por ejemplo, n-propoxi y 1-metiletoxí (isopropoxi). Alcoxi C₁-C₄ es adicionalmente, por ejemplo, butoxi, 1-metilpropoxi (sec-butoxi), 2-metilpropoxi (isobutoxi) o 1,1-dimetil-etoxi (terc-butoxi). Alcoxi C₁-C₆ es adicionalmente, por ejemplo, pentoxi, 1-metilbutoxi, 2-metilbutoxi, 3-metilbutoxi, 1,1-dimetilpropoxi, 1,2-dimetilpropoxi, 2,2-dimetilpropoxi, 1-etilpropoxi, hexoxi, 1-metilpentoxi, 2-metilpentoxi, 3-metilpentoxi, 4-metilpentoxi, 1,1-dimetilbutoxi, 1,2-dimetilbutoxi, 1,3-dimetilbutoxi, 2,2-dimetilbutoxi, 2,3-dimetilbutoxi, 3,3-dimetilbutoxi, 1-

etilbutoxi, 2-etilbutoxi, 1,1,2-trimetilpropoxi, 1,2,2-trimetilpropoxi, 1-etil-1-metilpropoxi o 1-etil-2-metilpropoxi. Alcoxi C₁-C₈ es adicionalmente, por ejemplo, heptiloxi, octiloxi, 2-etil-hexiloxi e isómeros posicionales de los mismos. Alcoxi C₁-C₁₀ es adicionalmente, por ejemplo, noniloxi, deciloxi e isómeros posicionales de los mismos.

5 **[0050]** El término "haloalcoxi C₁-C₂" es un grupo haloalquilo C₁-C₂, como se ha definido anteriormente, unido a través de un átomo de oxígeno. El término "haloalcoxi C₁-C₃" es un grupo haloalquilo C₁-C₃, como se ha definido anteriormente, unido a través de un átomo de oxígeno. El término "haloalcoxi C₁-C₄" es un grupo haloalquilo C₁-C₄, como se ha definido anteriormente, unido a través de un átomo de oxígeno. El término "haloalcoxi C₁-C₆" es un grupo haloalquilo C₁-C₆, como se ha definido anteriormente, unido a través de un átomo de oxígeno. El término
10 "haloalcoxi C₁-C₁₀" es un grupo haloalquilo C₁-C₁₀, como se ha definido anteriormente, unido mediante un átomo de oxígeno. Haloalcoxi C₁-C₂ es, por ejemplo, OCH₂F, OCHF₂, OCF₃, OCH₂Cl, OCHCl₂, OCCl₃, clorofluorometoxi, diclorofluorometoxi, clorodifluorometoxi, 2-fluoroetoxi, 2-cloroetoxi, 2-bromoetoxi, 2-yodoetoxi, 2,2-difluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2-fluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, 2,2-dicloro-2-fluoroetoxi, 2,2,2-tricloroetoxi o OC₂F₅. Haloalcoxi C₁-C₃ es adicionalmente, por ejemplo, 2-fluoropropoxi, 3-fluoropropoxi, 2,2-difluoropropoxi, 2,3-
15 difluoropropoxi, 2-cloropropoxi, 3-cloropropoxi, 2,3-dicloropropoxi, 2-bromopropoxi, 3-bromopropoxi, 3,3,3-trifluoropropoxi, 3,3,3-tricloropropoxi, OCH₂-C₂F₅, OCF₂-C₂F₅, 1-(CH₂F)-2-fluoroetoxi, 1-(CH₂Cl)-2-cloroetoxi o 1-(CH₂Br)-2-bromoetoxi. Haloalcoxi C₁-C₄ es adicionalmente, por ejemplo, 4-fluorobutoxi, 4-clorobutoxi, 4-bromobutoxi o nonafluorobutoxi. Haloalcoxi C₁-C₆ es adicionalmente, por ejemplo, 5-fluoropentoxi, 5-cloropentoxi, 5-bromopentoxi, 5-yodopentoxi, undecafluoropentoxi, 6-fluorohexoxi, 6-clorohexoxi, 6-bromohexoxi, 6-yodohexoxi o
20 dodecafluorohexoxi.

[0051] El término "alcoxi C₁-C₃-alquilo C₁-C₃" como se usa en el presente documento, se refiere a un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 3 átomos de carbono, como se ha definido anteriormente, en el que se sustituye un átomo de hidrógeno por un grupo alcoxi C₁-C₃, como se ha definido anteriormente. El término
25 "alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄" como se usa en el presente documento, se refiere a un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 4 átomos de carbono, como se ha definido anteriormente, en el que se sustituye un átomo de hidrógeno por un grupo alcoxi C₁-C₄, como se ha definido anteriormente. El término "alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆" como se usa en el presente documento, se refiere a un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, como se ha definido anteriormente, en el que un átomo de hidrógeno es reemplazado
30 por un grupo alcoxi C₁-C₆, como se ha definido anteriormente. Ejemplos son metoximetilo, etoximetilo, propoximetilo, isopropoximetilo, n-butoximetilo, sec-butoximetilo, isobutoximetilo, terc-butoximetilo, 1-metoxietilo, 1-etoxietilo, 1-propoxietilo, 1-isopropoxietilo, 1-n-butoxietilo, 1-sec-butoxietilo, 1-isobutoxietilo, 1-terc-butoxietilo, 2-metoxietilo, 2-etoxietilo, 2-propoxietilo, 2-isopropoxietilo, 2-n-butoxietilo, 2-sec-butoxietilo, 2-isobutoxietilo, 2-terc-butoxietilo, 1-metoxipropilo, 1-etoxipropilo, 1-propoxipropilo, 1-isopropoxipropilo, 1-n-butoxipropilo, 1-sec-butoxipropilo, 1-
35 isobutoxipropilo, 1-terc-butoxipropilo, 2-metoxipropilo, 2-etoxipropilo, 2-propoxipropilo, 2-isopropoxipropilo, 2-n-butoxipropilo, 2-sec-butoxipropilo, 2-isobutoxipropilo, 2-terc-butoxipropilo, 3-metoxipropilo, 3-etoxipropilo, 3-propoxipropilo, 3-isopropoxipropilo, 3-n-butoxipropilo, 3-sec-butoxipropilo, 3-isobutoxipropilo, 3-terc-butoxipropilo y similares.

40 **[0052]** El término "alcoxi C₁-C₄-metilo" como se usa en el presente documento, se refiere a metilo en el que un átomo de hidrógeno es reemplazado por un grupo alcoxi C₁-C₄, como se ha definido anteriormente. El término "alcoxi C₁-C₆-metilo" como se usa en el presente documento, se refiere a metilo en el que un átomo de hidrógeno es reemplazado por un grupo alcoxi C₁-C₆, como se ha definido anteriormente. Ejemplos son metoximetilo, etoximetilo, propoximetilo, isopropoximetilo, n-butoximetilo, sec-butoximetilo, isobutoximetilo, terc-butoximetilo, pentiloximetilo,
45 hexiloximetilo y similares.

[0053] Haloalcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ es un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 6, especialmente 1 a 4 átomos de carbono (=haloalcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₄), en el que uno de los átomos de hidrógeno se ha reemplazado por un grupo alcoxi C₁-C₆ y en el que al menos uno, por ejemplo, 1, 2, 3, 4 o todos los átomos de hidrógeno
50 restantes (ya sea en el resto alcoxi o en el resto alquilo o en ambos) se han reemplazado por átomos de halógeno. Haloalcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ es un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 4 átomos de carbono, en el que uno de los átomos de hidrógeno se ha reemplazado por un grupo alcoxi C₁-C₄ y en el que al menos uno, por ejemplo, 1, 2, 3, 4 o todos los átomos de hidrógeno restantes (en el resto alcoxi o en el resto alquilo o en ambos) se han reemplazado por átomos de halógeno. Ejemplos son difluorometoximetilo (CHF₂OCH₂),
55 trifluorometoximetilo, 1-difluorometoxietilo, 1-trifluorometoxietilo, 2-difluorometoxietilo, 2-trifluorometoxietilo, difluorometoxi-metilo (CH₃OCF₂), 1,1-difluoro-2-metoxietilo, 2,2-difluoro-2-metoxietilo y similares.

[0054] El término "alquiltio C₁-C₂" es un grupo alquilo C₁-C₂, como se ha definido anteriormente, unido a través de un átomo de azufre. El término "alquiltio C₁-C₃" es un grupo alquilo C₁-C₃, como se ha definido

anteriormente, unido a través de un átomo de azufre. El término "alquiltio C₁-C₄" es un grupo alquilo C₁-C₄, como se ha definido anteriormente, unido a través de un átomo de azufre. El término "alquiltio C₁-C₆" es un grupo alquilo C₁-C₆, como se ha definido anteriormente, unido a través de un átomo de azufre. El término "alquiltio C₁-C₁₀" es un grupo alquilo C₁-C₁₀, como se ha definido anteriormente, unido a través de un átomo de azufre. Alquiltio C₁-C₂ es metiltio o etiltio. Alquiltio C₁-C₃ es adicionalmente, por ejemplo, n-propiltio o 1-metiletiltio (isopropiltio). Alquiltio C₁-C₄ es adicionalmente, por ejemplo, butiltio, 1-metilpropiltio (sec-butiltio), 2-metilpropiltio (isobutiltio) o 1,1-dimetiletiltio (terc-butiltio). Alquiltio C₁-C₆ es adicionalmente, por ejemplo, pentiltio, 1-metilbutiltio, 2-metilbutiltio, 3-metilbutiltio, 1,1-dimetilpropiltio, 1,2-dimetilpropiltio, 2,2-dimetilpropiltio, 1-etilpropiltio, hexiltio, 1-metilpentiltio, 2-metilpentiltio, 3-metilpentiltio, 4-metilpentiltio, 1,1-dimetilbutiltio, 1,2-dimetilbutiltio, 1,3-dimetilbutiltio, 2,2-dimetilbutiltio, 2,3-dimetilbutiltio, 3,3-dimetilbutiltio, 1-etilbutiltio, 2-etilbutiltio, 1,1,2-trimetilpropiltio, 1,2,2-trimetilpropiltio, 1-etil-1-metilpropiltio o 1-etil-2-metilpropiltio. Alquiltio C₁-C₈ es adicionalmente, por ejemplo, heptiltio, octiltio, 2-etilhexiltio y los isómeros posicionales de los mismos. Alquiltio C₁-C₁₀ es adicionalmente, por ejemplo, noniltio, deciltio e isómeros posicionales de los mismos.

15 **[0055]** El término "haloalquiltio C₁-C₂" es un grupo haloalquilo C₁-C₂, como se ha definido anteriormente, unido a través de un átomo de azufre. El término "haloalquiltio C₁-C₃" es un grupo haloalquilo C₁-C₃, como se ha definido anteriormente, unido a través de un átomo de azufre. El término "haloalquiltio C₁-C₄" es un grupo haloalquilo C₁-C₄, como se ha definido anteriormente, unido a través de un átomo de azufre. El término "haloalquiltio C₁-C₆" es un grupo haloalquilo C₁-C₆, como se ha definido anteriormente, unido a través de un átomo de azufre. El término "haloalquiltio C₁-C₁₀" es un grupo haloalquilo C₁-C₁₀, como se ha definido anteriormente, unido mediante un átomo de azufre. Haloalquiltio C₁-C₂ es, por ejemplo, SCH₂F, SCHF₂, SCF₃, SCH₂Cl, SCHCl₂, SCCl₃, clorofluorometiltio, diclorofluorometiltio, clorodifluorometiltio, 2-fluoroetiltio, 2-cloroetiltio, 2-bromoetiltio, 2-yodoetiltio, 2,2-difluoroetiltio, 2,2,2-trifluoroetiltio, 2-cloro-2-fluoroetiltio, 2-cloro-2,2-difluoroetiltio, 2,2-dicloro-2-fluoroetiltio, 2,2,2-tricloroetiltio o SC₂F₅. Haloalquiltio C₁-C₃ es adicionalmente, por ejemplo, 2-fluoropropiltio, 3-fluoropropiltio, 2,2-difluoropropiltio, 2,3-difluoropropiltio, 2-cloropropiltio, 3-cloropropiltio, 2,3-dicloropropiltio, 2-bromopropiltio, 3-bromopropiltio, 3,3,3-trifluoropropiltio, 3,3,3-tricloropropiltio, SCH₂-C₂F₅, SCF₂-C₂F₅, 1-(CH₂F)-2-fluoroetiltio, 1-(CH₂Cl)-2-cloroetiltio o 1-(CH₂Br)-2-bromoetiltio. Haloalquiltio C₁-C₄ es adicionalmente, por ejemplo, 4-fluorobutiltio, 4-clorobutiltio, 4-bromobutiltio o nonafluorobutiltio. Haloalquiltio C₁-C₆ es adicionalmente, por ejemplo, 5-fluoropentiltio, 5-cloropentiltio, 5-bromopentiltio, 5-yodopentiltio, undecafluoropentiltio, 6-fluorohexiltio, 6-clorohexiltio, 6-bromohexiltio, 6-yodohexiltio o dodecafluorohexiltio.

[0056] El término "sulfinito C₁-C₂" es un grupo alquilo C₁-C₂, como se ha definido anteriormente, unido a través de un grupo sulfinito [S(O)]. El término "sulfinito C₁-C₃" es un grupo alquilo C₁-C₃, como se ha definido anteriormente, unido a través de un grupo sulfinito [S(O)]. El término "sulfinito C₁-C₄" es un grupo alquilo C₁-C₄, como se ha definido anteriormente, unido a través de un grupo sulfinito [S(O)]. El término "sulfinito C₁-C₆" es un alquilo C₁-C₆, como se ha definido anteriormente, unido a través de un grupo sulfinito [S(O)]. El término "sulfinito C₁-C₁₀" es un grupo alquilo C₁-C₁₀, como se ha definido anteriormente, unido a través de un grupo sulfinito [S(O)]. Sulfinito C₁-C₂ es metilsulfinito o etilsulfinito. Sulfinito C₁-C₃ es adicionalmente, por ejemplo, n-propilsulfinito y 1-metiletilsulfinito (isopropilsulfinito). Sulfinito C₁-C₄ es adicionalmente, por ejemplo, butilsulfinito, 1-metilpropilsulfinito (sec-butilsulfinito), 2-metilpropilsulfinito (isobutilsulfinito) o 1,1-dimetiletilsulfinito (terc-butilsulfinito). Alquilsulfinito C₁-C₆ es adicionalmente, por ejemplo, pentilsulfinito, 1-metilbutilsulfinito, 2-metilbutilsulfinito, 3-metilbutilsulfinito, 1,1-dimetilpropilsulfinito, 1,2-dimetilpropilsulfinito, 2,2-dimetilpropilsulfinito, 1-etilpropilsulfinito, hexilsulfinito, 1-metilpentilsulfinito, 2-metilpentilsulfinito, 3-metilpentilsulfinito, 4-metilpentilsulfinito, 1,1-dimetilbutilsulfinito, 1,2-dimetilbutilsulfinito, 1,3-dimetilbutilsulfinito, 2,2-dimetilbutilsulfinito, 2,3-dimetilbutilsulfinito, 3,3-dimetilbutilsulfinito, 1-etilbutilsulfinito, 2-etilbutilsulfinito, 1,1,2-trimetilpropilsulfinito, 1,2,2-trimetilpropilsulfinito, 1-etil-1-metilpropilsulfinito o 1-etil-2-metilpropilsulfinito. Alquilsulfinito C₁-C₈ es adicionalmente, por ejemplo, heptilsulfinito, octilsulfinito, 2-etilhexilsulfinito y sus isómeros posicionales. Sulfinito C₁-C₁₀ es adicionalmente, por ejemplo, nonilsulfinito, decilsulfinito y los isómeros posicionales de los mismos.

50 **[0057]** El término "haloalquilsulfinito C₁-C₂" es un grupo haloalquilo C₁-C₂, como se ha definido anteriormente, unido a través de un grupo sulfinito [S(O)]. El término "haloalquilsulfinito C₁-C₃" es un grupo haloalquilo C₁-C₃, como se ha definido anteriormente, unido a través de un grupo sulfinito [S(O)]. El término "haloalquilsulfinito C₁-C₄" es un grupo haloalquilo C₁-C₄, como se ha definido anteriormente, unido a través de un grupo sulfinito [S(O)]. El término "haloalquilsulfinito C₁-C₆" es un grupo haloalquilo C₁-C₆, como se ha definido anteriormente, unido a través de un grupo sulfinito [S(O)]. El término "haloalquilsulfinito C₁-C₁₀" es un grupo haloalquilo C₁-C₁₀, como se ha definido anteriormente, unido a través de un grupo sulfinito [S(O)]. Haloalquilsulfinito C₁-C₂ es, por ejemplo, S(O)CH₂F, S(O)CHF₂, S(O)CF₃, S(O)CH₂Cl, S(O)CHCl₂, S(O)CCl₃, clorofluorometilsulfinito, diclorofluorometilsulfinito, clorodifluorometilsulfinito, 2-fluoroetilsulfinito, 2-cloroetilsulfinito, 2-bromoetilsulfinito, 2-yodoetilsulfinito, 2,2-difluoroetilsulfinito, 2,2,2-trifluoroetilsulfinito, 2-cloro-2-fluoroetilsulfinito, 2-cloro-2,2-difluoroetilsulfinito, 2,2-dicloro-2-

fluoroetilsulfonilo, 2,2,2-tricloroetilsulfonilo o $S(O)C_2F_5$. Haloalquilsulfonilo C_1-C_3 es adicionalmente, por ejemplo, 2-fluoropropilsulfonilo, 3-fluoropropilsulfonilo, 2,2-difluoropropilsulfonilo, 2,3-difluoropropilsulfonilo, 2-cloropropilsulfonilo, 3-cloropropilsulfonilo, 2,3-dicloropropilsulfonilo, 2-bromopropilsulfonilo, 3-bromopropilsulfonilo, 3,3,3-trifluoropropilsulfonilo, 3,3,3-tricloropropilsulfonilo, $S(O)CH_2-C_2F_5$, $S(O)CF_2-C_2F_5$, 1-(CH_2F)-2-fluoroetilsulfonilo, 1-(CH_2Cl)-2-cloroetilsulfonilo y 1-(CH_2Br)-2-bromoetilsulfonilo. Haloalquilsulfonilo C_1-C_4 es adicionalmente, por ejemplo, 4-fluorobutilsulfonilo, 4-clorobutilsulfonilo, 4-bromobutilsulfonilo o nonafluorobutilsulfonilo. Haloalquilsulfonilo C_1-C_6 es adicionalmente, por ejemplo, 5-fluoropentilsulfonilo, 5-cloropentilsulfonilo, 5-bromopentilsulfonilo, 5-yodopentilsulfonilo, undecafluoropentilsulfonilo, 6-fluorohexilsulfonilo, 6-clorohexilsulfonilo, 6-bromohexilsulfonilo, 6-yodohexilsulfonilo o dodecafluorohexilsulfonilo.

10

[0058] El término "sulfonilo C_1-C_2 " es un grupo alquilo C_1-C_2 , como se ha definido anteriormente, unido a través de un grupo sulfonilo $[S(O)_2]$. El término "sulfonilo C_1-C_3 " es un grupo alquilo C_1-C_3 , como se ha definido anteriormente, unido a través de un grupo sulfonilo $[S(O)_2]$. El término "sulfonilo C_1-C_4 " es un grupo alquilo C_1-C_4 , como se ha definido anteriormente, unido a través de un grupo sulfonilo $[S(O)_2]$. El término "alquilsulfonilo C_1-C_6 " es un grupo alquilo C_1-C_6 , como se ha definido anteriormente, unido mediante un grupo sulfonilo $[S(O)_2]$. El término "sulfonilo C_1-C_{10} " es un grupo alquilo C_1-C_{10} , como se ha definido anteriormente, unido a través de un grupo sulfonilo $[S(O)_2]$. Alquilsulfonilo C_1-C_2 es metilsulfonilo o etilsulfonilo. Alquilsulfonilo C_1-C_3 es adicionalmente, por ejemplo, n-propilsulfonilo o 1-metiletilsulfonilo (isopropilsulfonilo). Alquilsulfonilo C_1-C_4 es adicionalmente, por ejemplo, butilsulfonilo, 1-metilpropilsulfonilo (sec-butilsulfonilo), 2-metilpropilsulfonilo (isobutilsulfonilo) o 1,1-dimetiletilsulfonilo (terc-butilsulfonilo). Alquilsulfonilo C_1-C_6 es adicionalmente, por ejemplo, pentilsulfonilo, 1-metilbutilsulfonilo, 2-metilbutilsulfonilo, 3-metilbutilsulfonilo, 1,1-dimetilpropilsulfonilo, 1,2-dimetilpropilsulfonilo, 2,2-dimetilpropilsulfonilo, 1-etilpropilsulfonilo, hexilsulfonilo, 1-metilpentilsulfonilo, 2-metilpentilsulfonilo, 3-metilpentilsulfonilo, 4-metilpentilsulfonilo, 1,1-dimetilbutilsulfonilo, 1,2-dimetilbutilsulfonilo, 1,3-dimetilbutilsulfonilo, 2,2-dimetilbutilsulfonilo, 2,3-dimetilbutilsulfonilo, 3,3-dimetilbutilsulfonilo, 1-etilbutilsulfonilo, 2-etilbutilsulfonilo, 1,1,2-trimetilpropilsulfonilo, 1,2,2-trimetilpropilsulfonilo, 1-etil-1-metilpropilsulfonilo o 1-etil-2-metilpropilsulfonilo. Alquilsulfonilo C_1-C_8 es adicionalmente, por ejemplo, heptilsulfonilo, octilsulfonilo, 2-etilhexilsulfonilo e isómeros posicionales de los mismos. Alcoilsulfonilo C_1-C_{10} es adicionalmente, por ejemplo, nonilsulfonilo, decilsulfonilo e isómeros posicionales de los mismos.

[0059] El término "haloalquilsulfonilo C_1-C_2 " es un grupo haloalquilo C_1-C_2 , como se ha definido anteriormente, unido a través de un grupo sulfonilo $[S(O)_2]$. El término "haloalquilsulfonilo C_1-C_3 " es un grupo haloalquilo C_1-C_3 , como se ha definido anteriormente, unido a través de un grupo sulfonilo $[S(O)_2]$. El término "haloalquilsulfonilo C_1-C_4 " es un grupo haloalquilo C_1-C_4 , como se ha definido anteriormente, unido a través de un grupo sulfonilo $[S(O)_2]$. El término "haloalquilsulfonilo C_1-C_6 " es un grupo haloalquilo C_1-C_6 , como se ha definido anteriormente, unido a través de un grupo sulfonilo $[S(O)_2]$. El término "haloalquilsulfonil C_1-C_{10} " es un grupo haloalquilo C_1-C_{10} , como se ha definido anteriormente, unido a través de un grupo sulfonilo $[S(O)_2]$. Haloalquilsulfonilo C_1-C_2 es, por ejemplo, $S(O)_2CH_2F$, $S(O)_2CHF_2$, $S(O)_2CF_3$, $S(O)_2CH_2Cl$, $S(O)_2CHCl_2$, $S(O)_2CCl_3$, clorofluorometilsulfonilo, diclorofluorometilsulfonilo, clorodifluorometilsulfonilo, 2-fluoroetilsulfonilo, 2-cloroetilsulfonilo, 2-bromoetilsulfonilo, 2-yodoetilsulfonilo, 2,2-difluoroetilsulfonilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfonilo, 2-cloro-2-fluoroetilsulfonilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilsulfonilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilsulfonilo, 2,2,2-tricloroetilsulfonilo o $S(O)_2C_2F_5$. Haloalquilsulfonilo C_1-C_3 es adicionalmente, por ejemplo, 2-fluoropropilsulfonilo, 3-fluoropropilsulfonilo, 2,2-difluoropropilsulfonilo, 2,3-difluoropropilsulfonilo, 2-cloropropilsulfonilo, 3-cloropropilsulfonilo, 2,3-dicloropropilsulfonilo, 2-bromopropilsulfonilo, 3-bromopropilsulfonilo, 3,3,3-trifluoropropilsulfonilo, 3,3,3-tricloropropilsulfonilo, $S(O)_2CH_2-C_2F_5$, $S(O)_2CF_2-C_2F_5$, 1-(CH_2F)-2-fluoroetilsulfonilo, 1-(CH_2Cl)-2-cloroetilsulfonilo o 1-(CH_2Br)-2-bromoetilsulfonilo. Haloalquilsulfonilo C_1-C_4 es adicionalmente, por ejemplo, 4-fluorobutilsulfonilo, 4-clorobutilsulfonilo, 4-bromobutilsulfonilo o nonafluorobutilsulfonilo. Haloalquilsulfonilo C_1-C_6 es adicionalmente, por ejemplo, 5-fluoropentilsulfonilo, 5-cloropentilsulfonilo, 5-bromopentilsulfonilo, 5-yodopentilsulfonilo, undecafluoropentilsulfonilo, 6-fluorohexilsulfonilo, 6-clorohexilsulfonilo, 6-bromohexilsulfonilo, 6-yodohexilsulfonilo o dodecafluorohexilsulfonilo.

50

[0060] El sustituyente "oxo" (o =O) sustituye un grupo CH_2 por un grupo $C(=O)$.

[0061] El sustituyente =S sustituye un grupo CH_2 por un grupo $C(=S)$.

[0062] El término "alquilcarbonilo" es un alquilo C_1-C_6 ("alquilcarbonilo C_1-C_6 "), preferiblemente un grupo alquilo C_1-C_4 ("alquilcarbonilo C_1-C_4 "), como se ha definido anteriormente, unido a través de un grupo carbonilo $[C(=O)]$. Los ejemplos son acetilo (metilcarbonilo), propionilo (etilcarbonilo), propilcarbonilo, isopropilcarbonilo, n-butilcarbonilo y similares.

55

- [0063]** El término "haloalquilcarbonilo" es un haloalquilo C₁-C₆ ("haloalquilcarbonilo C₁-C₆"), preferiblemente un grupo haloalquilo C₁-C₄ ("haloalquilcarbonilo C₁-C₄"), como se ha definido anteriormente, unido a través de un grupo carbonilo [C(=O)]. Los ejemplos son trifluorometilcarbonilo, 2,2,2-trifluoroetilcarbonilo y similares.
- 5 **[0064]** El término "alcoxicarbonilo" es un alcoxi C₁-C₆ ("alcoxicarbonilo C₁-C₆"), preferiblemente un grupo alcoxi C₁-C₄ ("alcoxicarbonilo C₁-C₄"), como se ha definido anteriormente, unido a través de un grupo carbonilo [C(=O)]. Los ejemplos son metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, propoxicarbonilo, isopropoxicarbonilo, n-butoxicarbonilo y similares.
- 10 **[0065]** El término "haloalcoxicarbonilo" es un haloalcoxi C₁-C₆ ("haloalcoxicarbonilo C₁-C₆"), preferiblemente un grupo haloalcoxi C₁-C₄ ("haloalcoxicarbonilo C₁-C₄"), como se ha definido anteriormente, unido a través de un grupo carbonilo [C(=O)]. Los ejemplos son trifluorometoxicarbonilo, 2,2,2-trifluoroetoxicarbonilo y similares.
- [0066]** El término "alquilamino C₁-C₆" es un grupo -N(H)-alquilo C₁-C₆. Los ejemplos son metilamino, 15 etilamino, propilamino, isopropilamino, butilamino y similares.
- [0067]** El término "di-(alquilo C₁-C₆) amino" es un grupo -N(alquilo C₁-C₆)₂. Los ejemplos son dimetilamino, dietilamino, etilmetilamino, dipropilamino, diisopropilamino, metilpropilamino, metilisopropilamino, etilpropilamino, 20 etilisopropilamino, dibutilamino y similares.
- [0068]** El término "aminocarbonilo" es un grupo -C(O)-NH₂.
- [0069]** El término "alquil C₁-C₆-aminocarbonilo" es un grupo -C(O)-N(H)-alquilo C₁-C₆. Ejemplos son 25 metilaminocarbonilo, etilaminocarbonilo, propilaminocarbonilo, isopropilaminocarbonilo, butilaminocarbonilo y similares.
- [0070]** El término "di-(alquilo C₁-C₆) aminocarbonilo" es un grupo -C(O)-N(alquilo C₁-C₆)₂. Los ejemplos son 30 dimetilaminocarbonilo, dietilaminocarbonilo, etilmetilaminocarbonilo, dipropilaminocarbonilo, diisopropilaminocarbonilo, metilpropilaminocarbonilo, metilisopropilaminocarbonilo, etilpropilaminocarbonilo, etilisopropilaminocarbonilo, dibutilaminocarbonilo y similares.
- [0071]** El término "anillo heterocíclico (o anillo heteromonocíclico o heterobícíclico) de 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 o 10 35 miembros saturado, parcialmente insaturado o completamente insaturado que contiene 1, 2 o 3 (o 4) heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo" representa un anillo heteromonocíclico de 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 o 10 miembros saturado, parcialmente insaturado o completamente insaturado o un anillo heterobícíclico de 7, 8, 9 o 10 miembros saturado, parcialmente insaturado o completamente insaturado que contiene 1, 2 o 3 (o 4) heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO 40 y SO₂, como miembros del anillo.
- [0072]** Los anillos insaturados contienen al menos un doble enlace C-C y/o C-N y/o N-N. Los anillos 45 completamente insaturados contienen tantos dobles enlaces conjugados C-C y/o C-N y/o N-N como permita el tamaño del anillo. Los anillos heterocíclicos de 5 o 6 miembros completamente insaturados son aromáticos. Los anillos parcialmente insaturados contienen menos del número máximo de dobles enlaces C-C y/o C-N y/o N-N permitidos por el tamaño del anillo. El anillo heterocíclico se puede unir al resto de la molécula a través de un miembro del anillo de carbono o a través de un miembro del anillo de nitrógeno. Como cuestión de rutina, el anillo heterocíclico contiene al menos un átomo de anillo de carbono. Si el anillo contiene más de un átomo de anillo de O, 50 estos no son adyacentes.
- [0073]** El término "anillo heterocíclico de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros saturado, parcialmente insaturado o 55 completamente insaturado que contiene 1, 2 o 3 (o 4) heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo" [en la que "completamente insaturado" incluye también "aromático"] tal como se utiliza en el presente documento representa radicales monocíclicos, los radicales monocíclicos que son saturados, parcialmente insaturados o completamente insaturados (incluyendo aromáticos). El término "anillo heterocíclico de 3, 4, 5, 6, 7 u 8 miembros saturado, parcialmente insaturado o completamente 60 insaturado que contiene 1, 2 o 3 (o 4) heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo" [en el que "completamente insaturado" también incluye "aromático"] como se usa en el presente documento también abarca radicales heteromonocíclicos de 8 miembros que contienen 1, 2 o 3 (o 4) heteroátomos o grupos heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, los radicales monocíclicos que son saturados, parcialmente insaturados o máximos insaturados (incluidos aromáticos).

Los anillos insaturados contienen al menos un doble enlace C-C y/o C-N y/o N-N. Los anillos completamente insaturados contienen tantos dobles enlaces conjugados C-C y/o C-N y/o N-N como permita el tamaño del anillo. Los anillos heterocíclicos de 5 o 6 miembros insaturados son aromáticos. Los anillos de 7 y 8 miembros no pueden ser aromáticos. Son homoaromáticos (anillo de 7 miembros, 3 dobles enlaces) o tienen 4 dobles enlaces (anillo de 8 miembros). El anillo heterocíclico se puede unir al resto de la molécula a través de un miembro del anillo de carbono o a través de un miembro del anillo de nitrógeno. Como cuestión de rutina, el anillo heterocíclico contiene al menos un átomo de anillo de carbono. Si el anillo contiene más de un átomo de anillo de O, estos no son adyacentes.

[0074] Los ejemplos de un anillo heterocíclico saturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros incluyen: oxirano, tirano, aziridinilo, oxetano, tetano, azetidino, tetrahydrofuran-2-ilo, tetrahydrofuran-3-ilo, tetrahydrotieno-2-ilo, tetrahydrotieno-3-ilo, pirrolidin-1-ilo, pirrolidin-2-ilo, pirrolidin-3-ilo, pirazolidin-1-ilo, pirazolidin-3-ilo, pirazolidin-4-ilo, pirazolidin-5-ilo, imidazolidin-1-ilo, imidazolidin-2-ilo, imidazolidin-3-ilo, oxazolidin-2-ilo, oxazolidin-3-ilo, oxazolidin-4-ilo, oxazolidin-5-ilo, isoxazolidin-2-ilo, isoxazolidin-3-ilo, isoxazolidin-4-ilo, isoxazolidin-5-ilo, tiazolidin-2-ilo, tiazolidin-3-ilo, tiazolidin-4-ilo, tiazolidin-5-ilo, isotiazolidin-2-ilo, isotiazolidin-3-ilo, isotiazolidin-4-ilo, isotiazolidin-5-ilo, 1,2,4-oxadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-oxadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-triazolidin-3-ilo, 1,3,4-oxadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-tiadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-triazolidin-1-ilo, 1,3,4-triazolidin-2-ilo, 2-tetrahydropirano, 4-tetrahydropirano, 1,3-dioxan-5-ilo, 1,4-dioxan-2-ilo, piperidin-1-ilo, piperidin-2-ilo, piperidin-3-ilo, piperidin-4-ilo, hexahidropiridazin-3-ilo, hexahidropiridazin-4-ilo, hexahidropirimidin-2-ilo, hexahidropirimidin-4-ilo, hexahidropirimidin-5-ilo, piperazin-1-ilo, piperazin-2-ilo, 1,3,5-hexahidrotiazin-1-ilo, 1,3,5-hexahidrotiazin-2-ilo y 1,2,4-hexahidrotiazin-3-ilo, morfolin-2-ilo, morfolin-3-ilo, morfolin-4-ilo, tiomorfolin-2-ilo, tiomorfolin-3-ilo, tiomorfolin-4-ilo, 1-oxotiomorfolin-2-ilo, 1-oxotiomorfolin-3-ilo, 1-oxotiomorfolin-4-ilo, 1,1-dioxotiomorfolin-2-ilo, 1,1-dioxotiomorfolin-3-ilo, 1,1-dioxotiomorfolin-4-ilo, azepan-1-, -2-, -3- o -4-ilo, oxepan-2-, -3-, -4- o -5-ilo, hexahidro-1,3-diazepinilo, hexahidro-1,4-diazepinilo, hexahidro-1,3-oxazepinilo, hexahidro-1,4-oxazepinilo, hexahidro-1,3-dioxepinilo, hexahidro-1,4-dioxepinilo y similares.

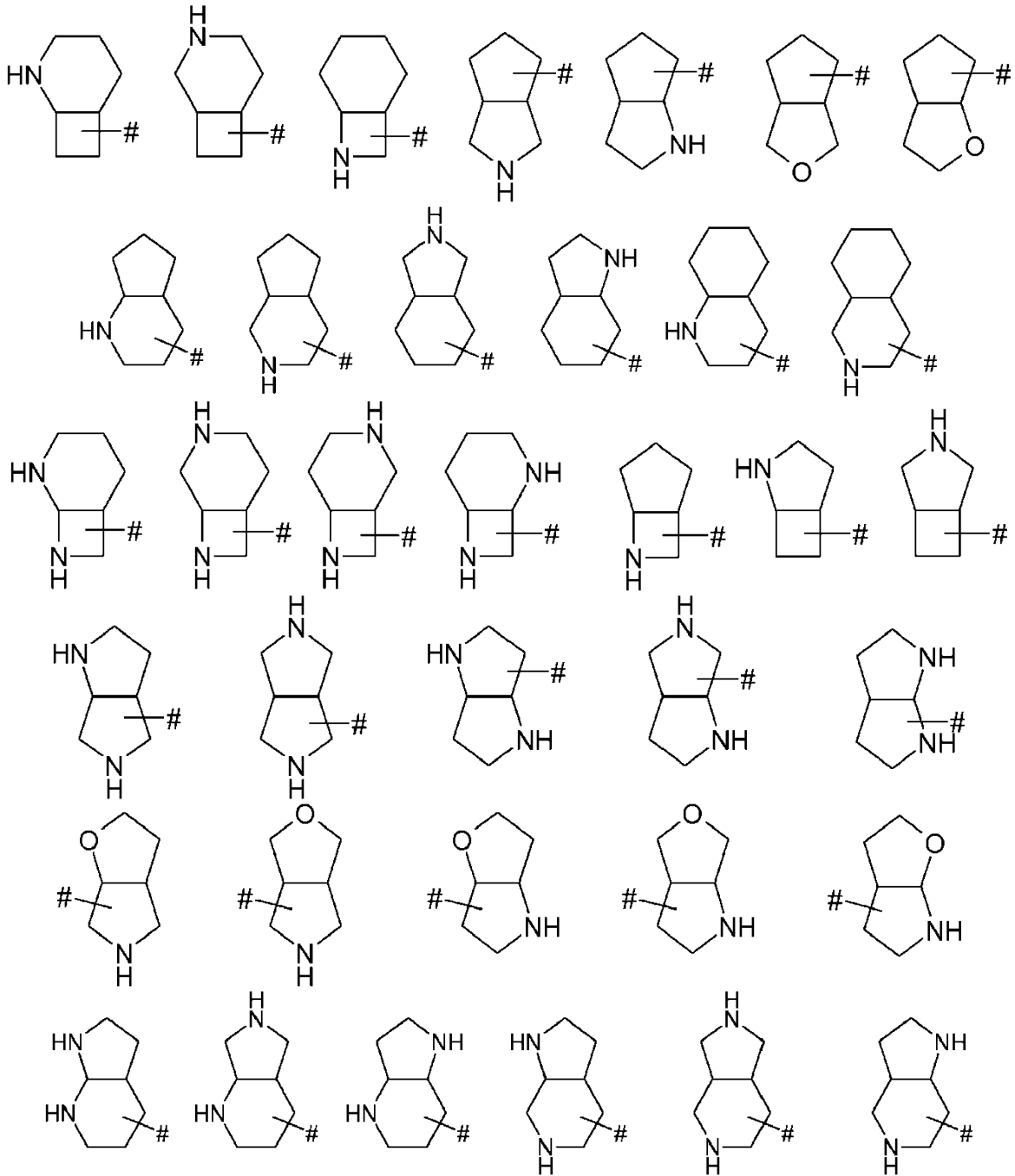
[0075] Los ejemplos de un anillo heterocíclico parcialmente insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros incluyen: 2,3-dihydrofur-2-ilo, 2,3-dihydrofur-3-ilo, 2,4-dihydrofur-2-ilo, 2,4-dihydrofur-3-ilo, 2,3-dihydrotieno-2-ilo, 2,3-dihydrotieno-3-ilo, 2,4-dihydrotieno-2-ilo, 2,4-dihydrotieno-3-ilo, 2-pirrolin-2-ilo, 2-pirrolin-3-ilo, 3-pirrolin-2-ilo, 3-pirrolin-3-ilo, 2-isoxazolin-3-ilo, 3-isoxazolin-3-ilo, 4-isoxazolin-3-ilo, 2-isoxazolin-4-ilo, 3-isoxazolin-4-ilo, 4-isoxazolin-4-ilo, 2-isoxazolin-5-ilo, 3-isoxazolin-5-ilo, 4-isoxazolin-5-ilo, 2-isotiazolin-3-ilo, 3-isotiazolin-3-ilo, 4-isotiazolin-3-ilo, 2-isotiazolin-4-ilo, 3-isotiazolin-4-ilo, 4-isotiazolin-4-ilo, 2-isotiazolin-5-ilo, 3-isotiazolin-5-ilo, 4-isotiazolin-5-ilo, 2,3-dihidropirazol-1-ilo, 2,3-dihidropirazol-2-ilo, 2,3-dihidropirazol-3-ilo, 2,3-dihidropirazol-4-ilo, 2,3-dihidropirazol-5-ilo, 3,4-dihidropirazol-1-ilo, 3,4-dihidropirazol-3-ilo, 3,4-dihidropirazol-4-ilo, 3,4-dihidropirazol-5-ilo, 4,5-dihidropirazol-1-ilo, 4,5-dihidropirazol-3-ilo, 4,5-dihidropirazol-4-ilo, 4,5-dihidropirazol-5-ilo, 2,3-dihidrooxazol-2-ilo, 2,3-dihidrooxazol-3-ilo, 2,3-dihidrooxazol-4-ilo, 2,3-dihidrooxazol-5-ilo, 3,4-dihidrooxazol-2-ilo, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-4-ilo, 3,4-dihidrooxazol-5-ilo, 3,4-dihidrooxazol-2-ilo, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-4-ilo, 2-, 3-, 4-, 5- o 6-di- o tetrahidropiridinilo, 3-di- o tetrahidropiridazinilo, 4-di- o tetrahidropiridazinilo, 2-di- o tetrahidropirimidinilo, 4-di- o tetrahidropirimidinilo, 5-di- o tetrahidropirimidinilo, di- o tetrahidropirazinilo, 1,3,5-di- o tetrahidrotiazin-2-ilo, 1,2,4-di- o tetrahidrotiazin-3-ilo, 2,3,4,5-tetrahidro[1H]azepin-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, 3,4,5,6-tetrahidro[2H]azepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, 2,3,4,7-tetrahidro[1H]azepin-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, 2,3,6,7-tetrahidro[1H]azepin-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, tetrahidrooxepinilo, tales como 2,3,4,5-tetrahidro[1H]oxepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, 2,3,4,7-tetrahidro[1H]oxepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, tetrahidro-1,3-diazepinilo, tetrahidro-1,4-diazepinilo, tetrahidro-1,3-oxazepinilo, tetrahidro-1,4-oxazepinilo, tetrahidro-1,3-dioxepinilo y tetrahidro-1,4-dioxepinilo.

[0076] Los ejemplos de un anillo heterocíclico de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros, completamente insaturado (incluido aromático) son anillos heteroaromáticos de 5 o 6 miembros, tales como 2-furilo, 3-furilo, 2-tienilo, 3-tienilo, 1-pirrolilo, 2-pirrolilo, 3-pirrolilo, 1-pirazolilo, 3-pirazolilo, 4-pirazolilo, 5-pirazolilo, 2-oxazolilo, 4-oxazolilo, 5-oxazolilo, 2-tiazolilo, 4-tiazolilo, 5-tiazolilo, 1-imidazolilo, 2-imidazolilo, 4-imidazolilo, 1,3,4-triazol-1-ilo, 1,3,4-triazol-2-ilo, 2-piridinilo, 3-piridinilo, 4-piridinilo, 1-oxopiridin-2-ilo, 1-oxopiridin-3-ilo, 1-oxopiridin-4-ilo, 3-piridazinilo, 4-piridazinilo, 2-pirimidinilo, 4-pirimidinilo, 5-pirimidinilo y 2-pirazinilo, y también radicales homoaromáticos, tales como 1H-azepina, 1H-[1,3]-diazepina y 1H-[1,4]-diazepina.

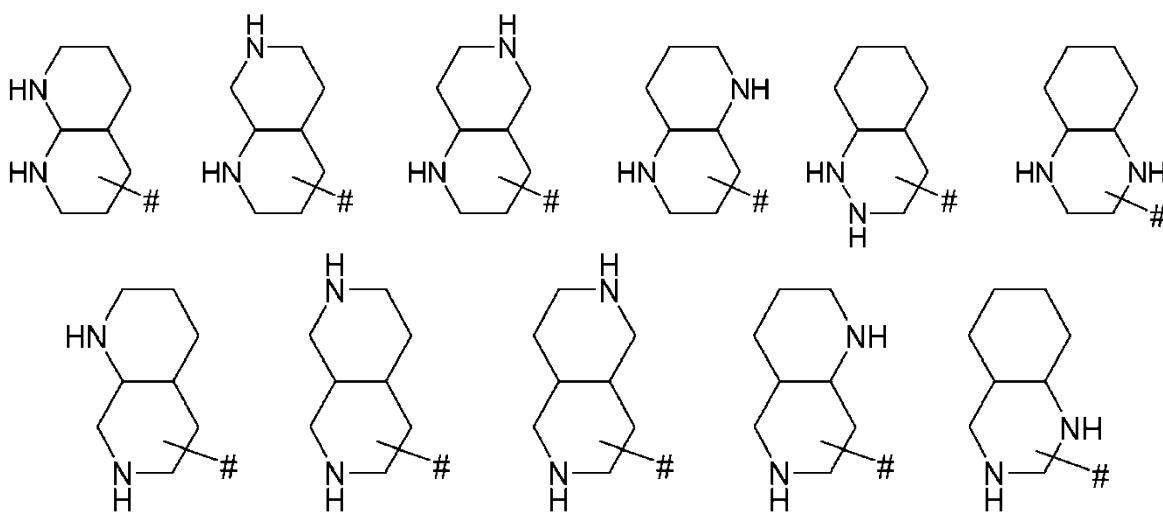
[0077] En la presente invención, los "anillos heterobíclicos" contienen dos anillos que tienen al menos un átomo de anillo en común. Al menos uno de los dos anillos contiene un grupo de heteroátomos o heteroátomo seleccionado entre N, O, S, NO, SO y SO₂ como miembro del anillo. El término comprende sistemas de anillos condensados (fusionados), en los que los dos anillos tienen dos átomos vecinos en el anillo, así como los sistemas espiro, en los que los anillos tienen solo un átomo en común y puentes con al menos tres átomos en el anillo en común.

Ejemplos de sistemas fusionados:

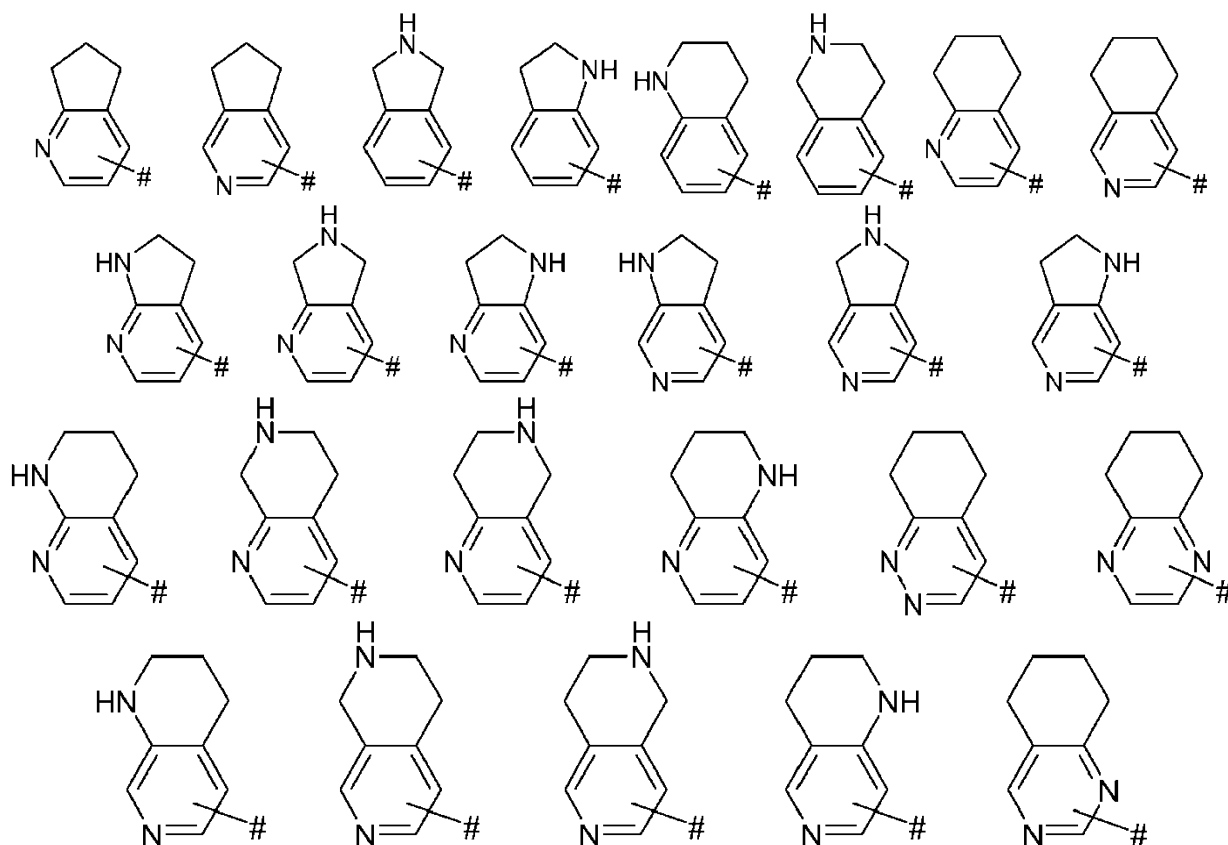
[0078] Ejemplos de un anillo heterobíciclico saturado de 7, 8, 9 o 10 miembros que contiene 1, 2 o 3 (o 4) 5 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂ miembros, como miembros del anillo son:



10

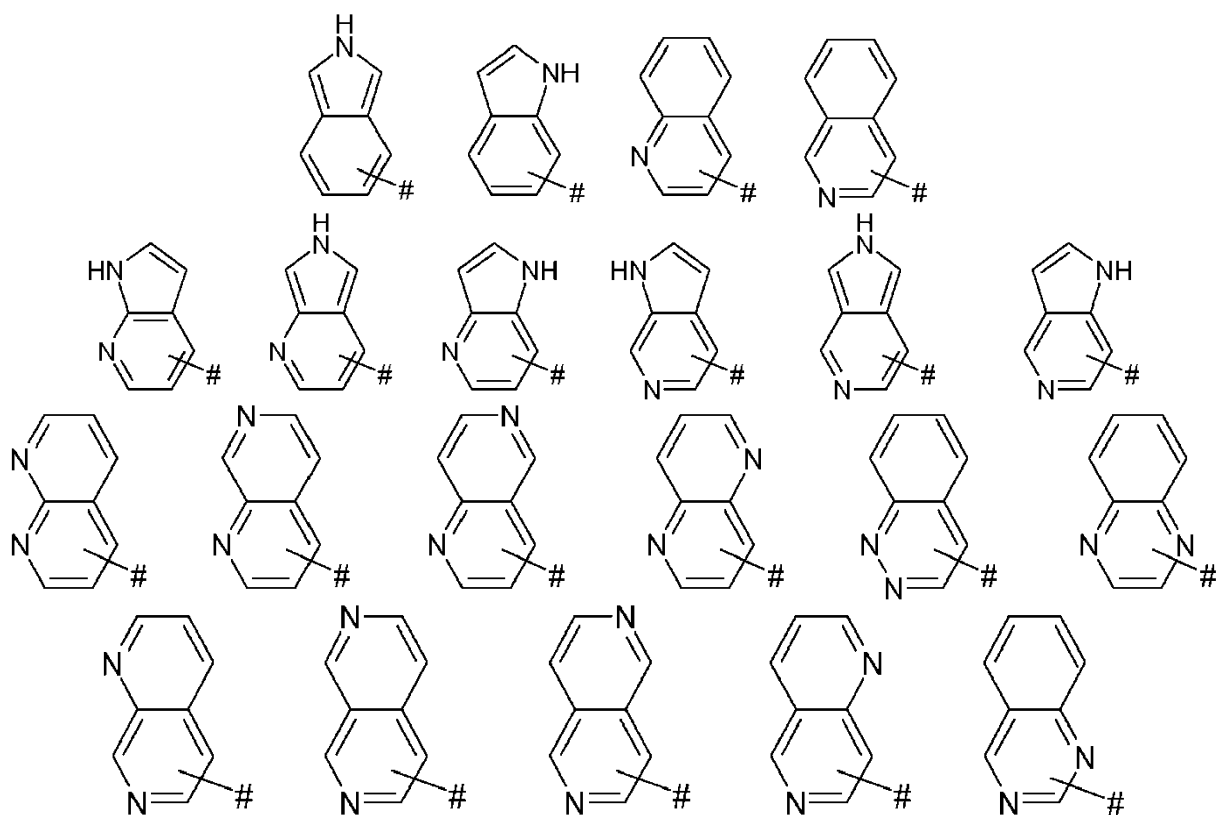


[0079] Ejemplos de un anillo heterobicíclico parcialmente insaturado de 8, 9 o 10 miembros que contiene 1, 2 o 3 (o 4) heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo son:



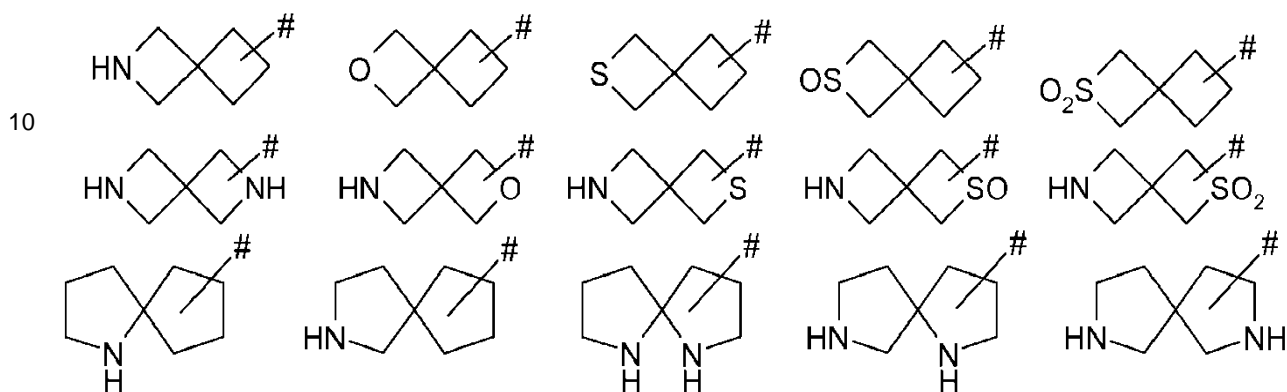
10

[0080] Ejemplos de un anillo heterobicíclico completamente insaturado de 8, 9 o 10 miembros que contiene 1, 2 o 3 (o 4) heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo son:



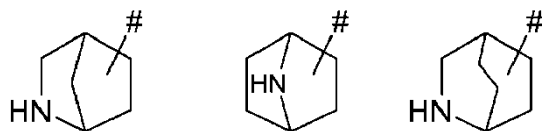
5

[0081] Ejemplos para anillos heterobíciclicos de 7, 8, 9 o 10 miembros unidos en espiro que contienen 1, 2 o 3 (o 4) heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo son



10

[0082] Ejemplos de anillos heterobíciclicos de 7, 8, 9 o 10 miembros puente que contienen 1, 2 o 3 (o 4) heteroátomos o grupos heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo son



y similares.

[0083] En las estructuras anteriores, # representa el punto de unión al resto de la molécula. El punto de unión no está restringido al anillo en el que se muestra, sino que puede estar en cualquiera de los anillos fusionados, y puede estar en un átomo de carbono o en un átomo de nitrógeno. Si los anillos llevan uno o más sustituyentes, estos pueden estar unidos a átomos de carbono y/o nitrógeno en el anillo (si estos últimos no son parte de un doble enlace).

[0084] Si los anillos heteromonocíclicos o heterobicíclicos definidos anteriormente son los formados por R⁵ y R⁶ junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, solo son adecuados aquellos de los anillos anteriormente definidos que contienen al menos un átomo de nitrógeno secundario (es decir, NH) como un miembro del anillo, y en el que el punto de unión al grupo C=W está en este átomo de nitrógeno secundario (véanse también a continuación las realizaciones de R⁵ y R⁶).

[0085] Las observaciones hechas a continuación en relación con las realizaciones preferidas de las variables de los compuestos de fórmula I, especialmente con respecto a sus sustituyentes B¹, B², B³, G¹, G², G³, G⁴, R¹, R², R^{3a}, R^{3b}, R^{3c}, R^{3d}, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R^{10a}, R^{10b}, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴, R^{14a}, R^{14b}, R¹⁵, R¹⁶, m y n, las características del uso y el método de acuerdo con la invención y de la composición de la invención son válidos por sí solos y, en particular, en cada combinación posible entre ellos.

[0086] En una realización preferida de la descripción, el anillo heteromonocíclico formado por R⁵ y R⁶ junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos obligatoriamente lleva al menos un sustituyente R⁷, mientras que el anillo heterobicíclico formado por R⁵ y R⁶ junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos opcionalmente lleva al menos un sustituyente R⁷. Por lo tanto, preferiblemente, R⁵ y R⁶, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un anillo heteromonocíclico o heterobicíclico de 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 o 10 miembros, saturado, parcialmente insaturado o completamente insaturado, donde el anillo puede contener además 1, 2, 3 o 4 heteroátomos o grupos que contienen heteroátomos seleccionados entre O, S, N, NH, SO, y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heteromonocíclico está (obligatoriamente) sustituido con 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8 sustituyentes R⁷, y donde el anillo heterobicíclico puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8 sustituyentes R⁷; donde R⁷ tienen uno de los significados generales anteriores o, en particular, uno de los significados preferidos a continuación.

[0087] En la invención, el anillo heterocíclico formado por R⁵ y R⁶ junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos es monocíclico. Por lo tanto, R⁵ y R⁶, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un anillo heteromonocíclico saturado de 3, 4, 5 o 6 miembros, donde el anillo puede contener además 1 o 2 heteroátomos o grupos que contienen heteroátomos seleccionados entre O, S, NH, SO, y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heteromonocíclico puede estar (y preferiblemente está) sustituido con 1, 2, 3, 4, 5 o 6 sustituyentes R⁷; donde R⁷ tienen uno de los significados generales anteriores o, en particular, uno de los significados preferidos a continuación.

[0088] Más preferiblemente, R⁵ y R⁶, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un anillo heteromonocíclico saturado de 3, 4, 5 o 6 miembros, donde el anillo puede contener además 1 o 2, preferiblemente 1, heteroátomos o grupos que contienen heteroátomos seleccionados entre O y NH como miembros del anillo, en el que el anillo heterocíclico puede llevar (preferiblemente lleva) 1, 2, 3, 4, 5 o 6 sustituyentes R⁷, donde R⁷ tienen uno de los significados anteriores o, en particular, uno de los significados preferidos a continuación.

[0089] Especialmente, R⁵ y R⁶, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un anillo heteromonocíclico saturado de 3, 4, 5 o 6 miembros, donde el anillo puede contener además 1 o 2 grupos NH que contienen heteroátomos como miembros del anillo, en el que el anillo heterocíclico puede llevar (preferiblemente lleva) 1, 2, 3, 4, 5 o 6 sustituyentes R⁷, donde R⁷ tiene uno de los anteriores significados o, en particular, uno de los significados preferidos a continuación.

[0090] Anillos heteromonocíclicos adecuados formados por R⁵ y R⁶ junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos son, por ejemplo: aziridin-1-ilo, diaziridin-1-ilo, azetidín-1-ilo, 1,2-diazetidín-1-ilo, 1,3-diazetidín-1-ilo, pirrolidin-1-ilo, pirazolidín-1-ilo, imidazolidín-1-ilo, 1,2,3-triazolidín-1-ilo, 1,2,3-triazolidín-2-ilo, 1,2,4-triazolidín-1-ilo, 1,2,3-triazolidín-4-ilo, piperidín-1-ilo, hexahidropirimidín-1-ilo, piperazín-1-ilo, azepán-1-ilo, 1,4-diazepán-1-ilo, isotiazolidín-2-ilo, 1-oxo-isotiazolidín-2-ilo, 1,1-dioxo-isotiazolidín-2-ilo, tiazolidín-3-ilo, isoxazolidín-2-ilo, oxazolidín-3-ilo, morfolín-4-ilo (también denominado morfolino), tiomorfolín-4-ilo (también denominado tiomorfolino), 1-oxotiomorfolín-4-ilo, 1,1-dioxotiomorfolín-4-ilo, 1,4-tiazinan-4-ilo, 1-oxo-1,4-tiazinan-4-ilo y 1,1-dioxo-1,4-tiazinan-4-ilo. Entre los anillos monocíclicos anteriores, se da preferencia a aziridin-1-ilo, azetidín-1-ilo, 1,2-diazetidín-1-ilo, 1,3-diazetidín-1-ilo, pirrolidin-1-ilo, imidazolidín-1-ilo, [1,2,4]-triazolidín-1-ilo, piperidín-1-ilo, piperazín-1-ilo,

hexahidropirimidin-1-ilo, morfolin-4-ilo, tiomorfolin-4-ilo, 1-oxo-1,4-tiazinan-4-ilo y 1,1-dioxo-1,4-tiazinan-4-ilo. Se da incluso más preferencia a azetidín-1-ilo, pirrolidín-1-ilo y piperidín-1-ilo.

[0091] Preferiblemente, estos anillos heteromonocíclicos llevan 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8 sustituyentes R^7 . De acuerdo con la invención, estos anillos heteromonocíclicos llevan 1, 2, 3, 4, 5 o 6 sustituyentes R^7 . En estos anillos heteromonocíclicos, R^7 tiene independientemente entre sí uno de los significados anteriores, o en particular, uno de los significados preferidos a continuación.

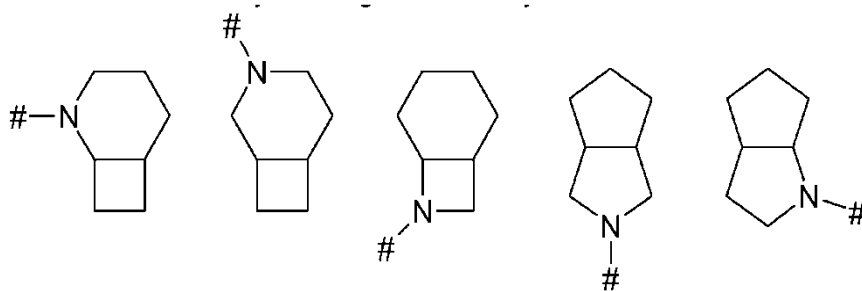
[0092] En otra realización más preferida de la descripción, R^5 y R^6 , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un anillo heterobícíclico de 7, 8, 9 o 10 miembros, saturado, parcialmente insaturado o completamente insaturado, donde el anillo puede contener además 1, 2, 3 o 4 heteroátomos o grupos que contienen heteroátomos seleccionados entre O, S, N, NH, SO, y SO_2 , como miembros del anillo, donde el anillo heterobícíclico puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8 sustituyentes R^7 ; donde R^7 tienen uno de los significados generales anteriores o, en particular, uno de los significados preferidos a continuación.

[0093] En este aspecto de la descripción, R^5 y R^6 , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman preferiblemente un anillo heterobícíclico de 7, 8, 9 o 10 miembros, saturado, parcialmente insaturado o completamente insaturado, donde el anillo puede contener además 1 o 2 heteroátomos o grupos que contienen heteroátomos seleccionados entre O, S, SO, SO_2 , N y NH como miembros del anillo, en el que el anillo heterocíclico puede estar sustituido con 1, 2, 3 o 4 sustituyentes R^7 , donde R^7 tienen uno de los significados generales anteriores o, en particular, uno de los significados preferidos a continuación.

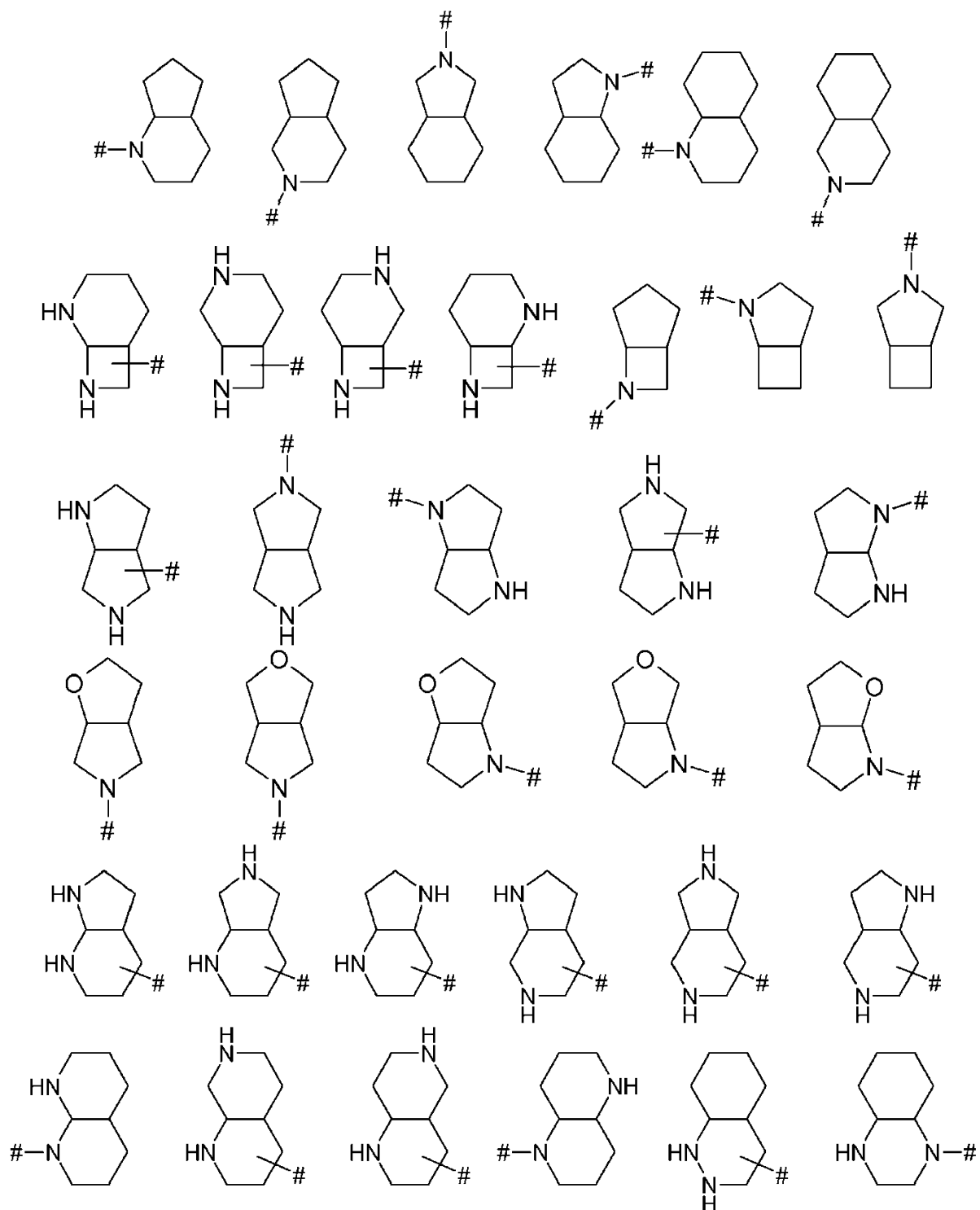
[0094] Incluso más preferiblemente, en la descripción, R^5 y R^6 , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un anillo heterobícíclico de 7, 8, 9 o 10 miembros, saturado o parcialmente insaturado, donde el anillo puede contener adicionalmente 1 o 2 heteroátomos o grupos que contienen heteroátomos seleccionados entre O, S, N y NH como miembros del anillo, en el que el anillo heterocíclico está sin sustituir o sustituido con 1, 2, 3 o 4 sustituyentes R^7 , donde R^7 tienen uno de los significados generales anteriores o, en particular, uno de los significados preferidos a continuación.

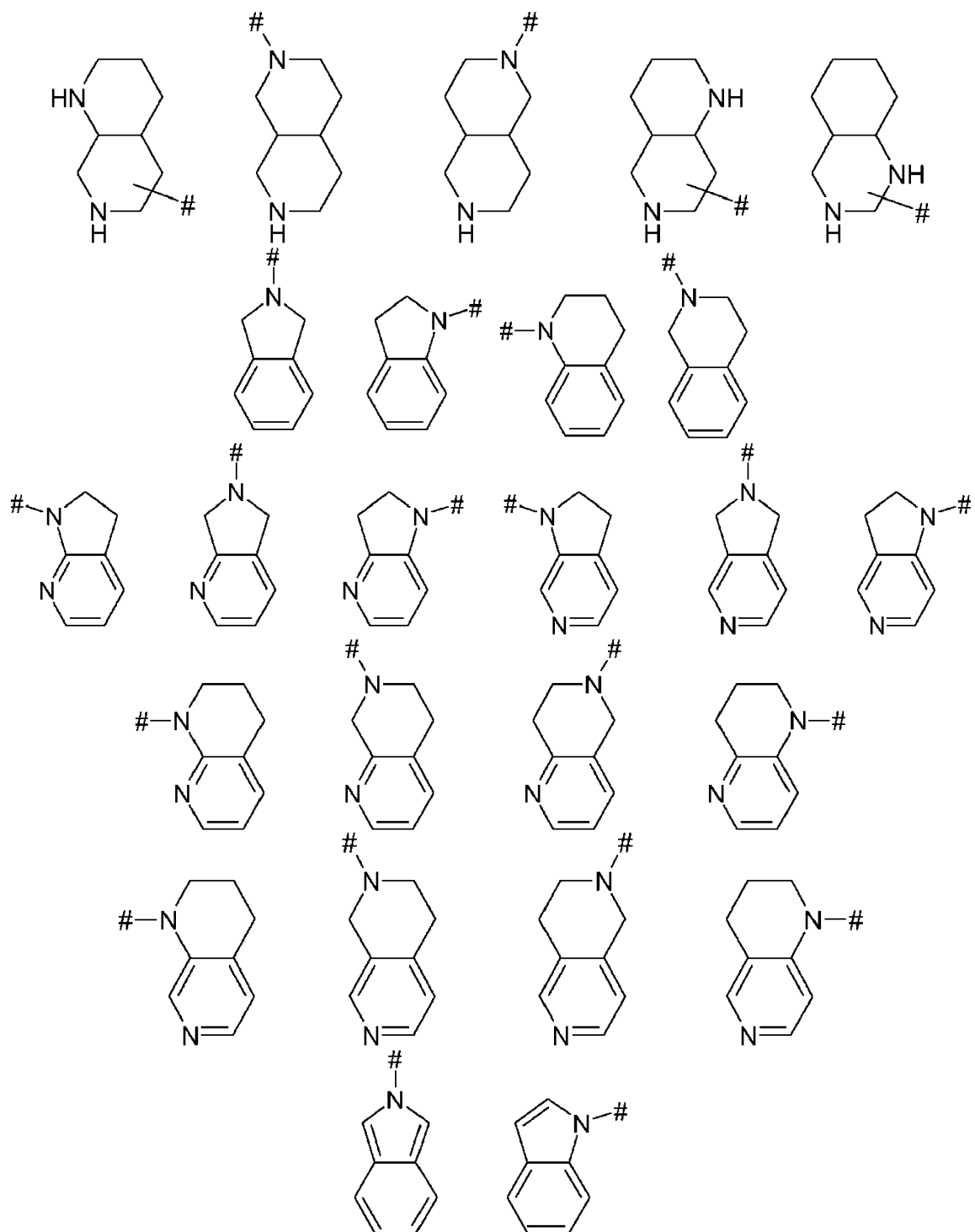
[0095] En un aspecto aún más preferido de la descripción, R^5 y R^6 , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un anillo heterobícíclico saturado de 7, 8, 9 o 10 miembros, donde el anillo puede contener adicionalmente 1 o 2, preferiblemente 1, heteroátomos o grupos que contienen heteroátomos seleccionados entre O, S, SO, SO_2 y NH como miembros del anillo, en el que el anillo heterobícíclico puede estar sustituido con 1, 2, 3 o 4, 5 o 6 sustituyentes R^7 , donde R^7 tienen uno de los significados generales anteriores o, en particular, uno de los significados preferidos a continuación.

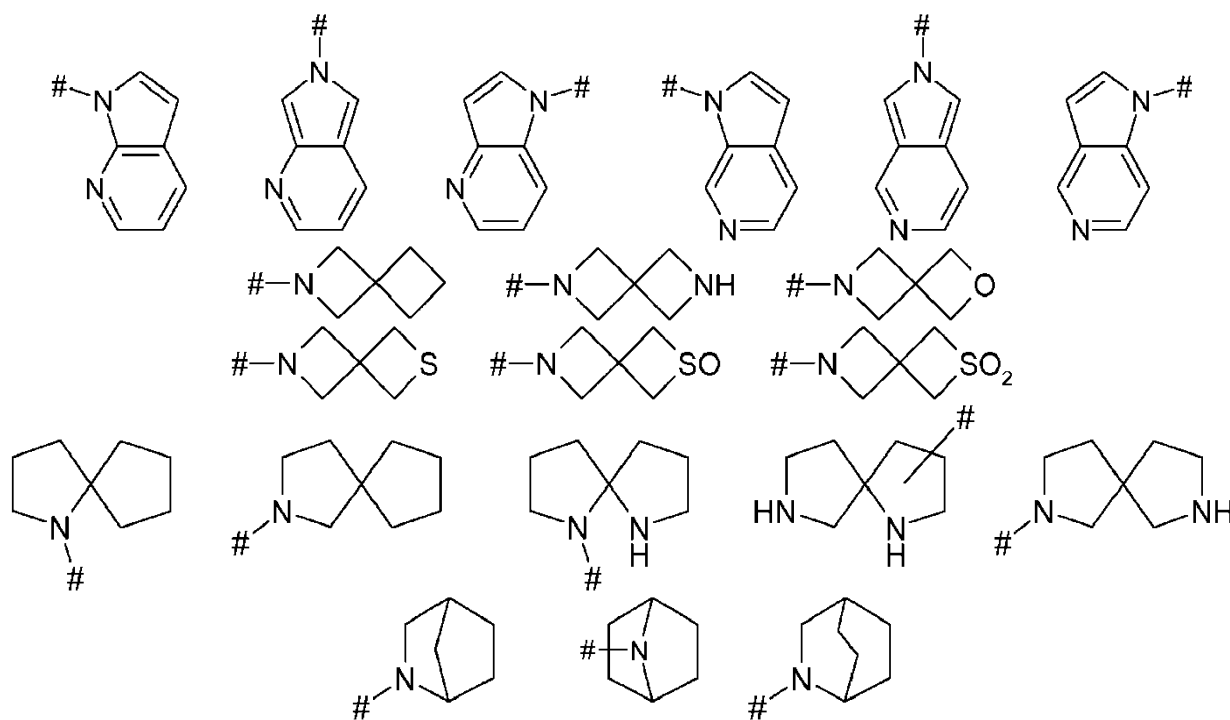
[0096] Los anillos heterobícíclicos adecuados de la descripción formada por N, R^5 y R^6 son, por ejemplo, los siguientes:



40





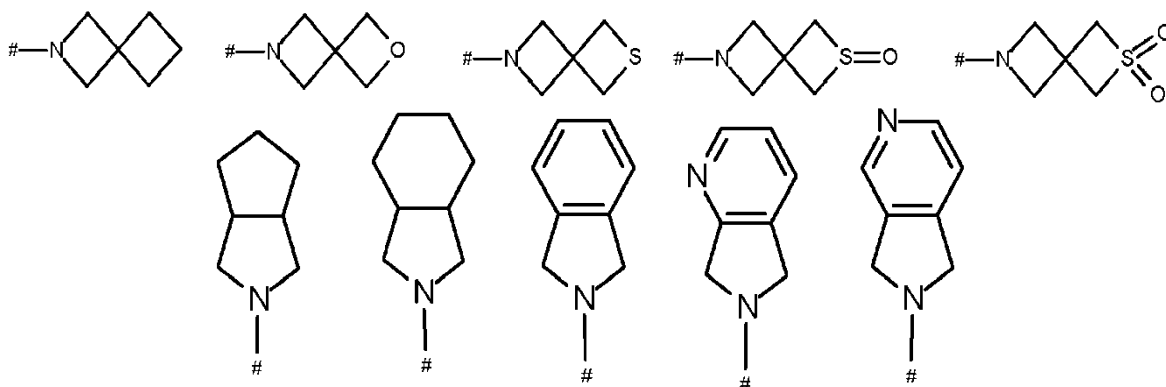


5

donde # representa el punto de unión a C(=W). Algunos de los anillos que contienen dos átomos secundarios del anillo de nitrógeno muestran el punto de unión no localizado. En este caso, el punto de unión se localiza en cualquiera de los dos átomos del anillo de nitrógeno.

10

[0097] Entre los anillos heterobicyclicos anteriores de la descripción, se da preferencia a los siguientes:



15

donde # representa el punto de unión a C(=W).

[0098] Estos anillos heterobicyclicos de la descripción pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5, preferiblemente 1, 2 o 3, más preferiblemente 1 o 2, sustituyentes R^7 , en el que cada R^7 tiene independientemente uno de los significados generales anteriores, o en particular, uno de los significados preferidos a continuación.

[0099] El radical R^7 puede ser un sustituyente en un átomo de anillo de carbono, así como en un átomo de nitrógeno del anillo. En caso de que se trate de un sustituyente en un átomo de nitrógeno, no se selecciona entre halógeno, azido, nitro, -SCN, -SF₅, -Si(R¹²)₃, -OR⁹ y -OSO₂R⁹, y preferiblemente tampoco se selecciona entre -S(O)_nR⁹ y -N(R^{10a})R^{10b}.

25

[0100] Por lo tanto, como un sustituyente de nitrógeno, R^7 se selecciona entre ciano, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , en los que los cuatro últimos radicales alifáticos y cicloalifáticos mencionados pueden estar parcial o completamente halogenados y/o pueden estar sustituidos con uno o más radicales R^8 ;

5

$-OR^9$, $-S(O)_nR^9$, $-N(R^{10a})R^{10b}$, $-C(=O)N(R^{10a})R^{10b}$, $-C(=S)N(R^{10a})R^{10b}$, $-C(=O)OR^9$, $-C(=O)R^8$,

fenilo que pueden estar sustituidos con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R^{11} ; y un anillo heteromonocíclico o heterobícíclico de 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 o 10 miembros saturado, parcialmente insaturado o completamente insaturado que contiene 1, 2, 3 o 4 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO_2 , como miembros del anillo, donde el anillo heteromonocíclico o heterobícíclico puede estar sustituido con uno o más radicales R^{11} ;

10

y preferiblemente entre ciano, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , donde los cuatro últimos radicales alifáticos y cicloalifáticos mencionados pueden estar parcial o completamente halogenados y/o pueden estar sustituidos con uno o más radicales R^8 ; $-C(=O)N(R^{10a})R^{10b}$, $-C(=S)N(R^{10a})R^{10b}$, $-C(=O)OR^9$, $-C(=O)R^8$, fenilo que puede ser sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R^{11} ; y un anillo heteromonocíclico o heterobícíclico de 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 o 10 miembros saturado, parcialmente insaturado o completamente insaturado que contiene 1, 2, 3 o 4 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO_2 , como miembros del anillo, donde el anillo heteromonocíclico o heterobícíclico puede estar sustituido con uno o más radicales R^{11} .

20

[0101] Estas salvedades se aplican en consecuencia a las formas de realización preferidas a continuación de R^7 .

25

[0102] Preferiblemente, cada R^7 se selecciona independientemente entre halógeno, ciano, oxo, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , en los que los cuatro últimos radicales alifáticos y cicloalifáticos mencionados pueden estar parcial o completamente halogenados y/o pueden estar sustituidos con uno o más radicales R^8 ; $-OR^9$, $-S(O)_nR^9$, $-N(R^{10a})R^{10b}$, $-C(=O)N(R^{10a})R^{10b}$, $-C(=S)N(R^{10a})R^{10b}$, $-C(=O)OR^9$, $-C(=O)R^8$, fenilo que pueden estar sustituidos con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R^{11} ; y un anillo heteromonocíclico de 3, 4, 5 o 6 miembros, saturado, parcialmente insaturado o completamente insaturado que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO_2 , como miembros del anillo, donde el anillo heteromonocíclico puede estar sustituido con uno o más radicales R^{11} , en el que n, R^8 , R^9 , R^{10a} , R^{10b} y R^{11} tienen uno de los significados generales anteriores, o en particular, uno de los significados preferidos a continuación.

30

[0103] Es evidente que si R^7 tiene el significado de oxo, 2 radicales R^7 unidos al mismo átomo de carbono forman un radical $=O$. También es evidente que si R^7 tiene el significado $=S$, 2 radicales R^7 unidos al mismo átomo de carbono forman un radical $=S$. De acuerdo con la invención, cada R^7 se selecciona independientemente entre halógeno, ciano, oxo, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , halocicloalquilo C_3-C_8 , alqueno C_2-C_6 , haloalqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , haloalquino C_2-C_6 , en el que los 8 últimos sustituyentes mencionados pueden llevar un radical R^8 ; alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , alquilsulfonilo C_1-C_6 , haloalquilsulfonilo C_1-C_6 , alquilsulfonilo C_1-C_6 , haloalquilsulfonilo C_1-C_6 , $-N(R^{10a})R^{10b}$, $-C(=O)N(R^{10a})R^{10b}$, $-C(=S)N(R^{10a})R^{10b}$, y $-C(=O)R^8$, en el que R^8 , R^{10a} y R^{10b} tienen uno de los significados generales anteriores, o en particular, uno de los significados preferidos a continuación.

40

[0104] En R^7 , el radical R^8 como sustituyente en un grupo alifático o cicloalifático, tal como un grupo alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , halocicloalquilo C_3-C_8 , alqueno C_2-C_6 , haloalqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 o haloalquino C_2-C_6 , se selecciona preferiblemente entre ciano; cicloalquilo C_3-C_8 que pueden estar sustituidos con 1 o 2 sustituyentes seleccionados entre CN, metilo y oxo; halocicloalquilo C_3-C_8 ; $-OR^9$; $-S(O)_nR^9$; $-N(R^{10a})R^{10b}$; $-C(=O)N(R^{10a})R^{10b}$; $-C(=O)OR^9$; fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R^{16} ; y un anillo heterocíclico de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros, saturado, parcialmente insaturado o completamente insaturado que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO_2 , como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R^{16} , en el que n, R^9 , R^{10a} , R^{10b} y R^{16} tienen uno de los significados generales anteriores, o en particular, uno de los significados preferidos a continuación.

50

[0105] Según la invención, R^8 se selecciona entre ciano, cicloalquilo C_3-C_6 que puede estar sustituido con 1 o 2 sustituyentes seleccionados entre CN, metilo y oxo; halocicloalquilo C_3-C_6 , y $-OR^9$.

55

[0106] En el grupo $-C(=O)R^8$ como significado preferido para R^7 , el radical R^8 se selecciona preferiblemente entre hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alquilo C_1-C_6 que lleva un grupo CN; cicloalquilo C_3-C_8 ,

halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₄-, halocicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₄-, donde los restos cicloalquilo en los 4 últimos radicales mencionados pueden llevar un grupo CN; alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, -OR⁹ y -N(R^{10a})R^{10b}; en el que R⁹, R^{10a}, R^{10b} y R¹⁶ tienen uno de los significados generales anteriores, o en particular, uno de los significados preferidos a continuación.

5

[0107] Según la invención, en esta realización, R⁸ se selecciona más preferiblemente de hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquilo C₁-C₆ que lleva un grupo CN; cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₄, donde los restos cicloalquilo en los 4 últimos radicales mencionados pueden llevar un grupo CN; alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, -OR⁹ y -N(R^{10a})R^{10b}; en la que R⁹, R^{10a}, R^{10b} y R¹⁶ tienen uno de los significados generales anteriores, o en particular, uno de los significados preferidos a continuación. Incluso más preferiblemente, R⁸ se selecciona entre alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquilo C₁-C₆ que lleva un grupo CN; cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₂-, especialmente cicloalquilo C₃-C₈-CH₂ -, halocicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₂-, especialmente halocicloalquilo C₃-C₈-CH₂ -, donde los restos cicloalquilo en los 6 últimos radicales mencionados pueden llevar un grupo CN; alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, -OR⁹ y -N(R^{10a})R^{10b}, en el que R⁹, R^{10a} y R^{10b} tienen una de las general anterior, o en particular, uno de los significados preferidos a continuación. En particular, R⁸ se selecciona entre alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, -OR⁹ y -N(R^{10a})R^{10b}, en el que R⁹, R^{10a} y R^{10b} tienen uno de los significados generales anteriores, o en particular, uno de los significados preferidos a continuación.

[0108] En -OR⁹, -S(O)_nR⁹, o -C(=O)OR⁹ como significado preferido para R⁷, el radical R⁹ se selecciona preferiblemente entre hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₄-, halocicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₄-, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R¹⁶, y un anillo heterocíclico de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros saturado, parcialmente insaturado o completamente insaturado que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R¹⁶; y preferiblemente entre hidrógeno, alquilo C₁-C₆ y haloalquilo C₁-C₆; en el que cada R¹⁶ se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₄, haloalqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄ y haloalquino C₂-C₄; o dos R¹⁶ presentes sobre el mismo átomo de carbono de un anillo saturado puede formar juntos =O =S.

[0109] Según la invención, R⁹ se selecciona entre hidrógeno, alquilo C₁-C₆ y haloalquilo C₁-C₆, y es específicamente alquilo C₁-C₆.

35

[0110] En -NR^{10a}R^{10b}, -C(=O)N(R^{10a})R^{10b} o en-C(=S)N(R^{10a})R^{10b} como significado preferido de R⁷, los radicales R^{10a} y R^{10b}, independientemente entre sí, se seleccionan preferiblemente entre hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquilo C₁-C₆ que lleva un grupo CN; cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₄-, halocicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₄-, donde los restos cicloalquilo en los 4 últimos radicales mencionados pueden llevar un grupo CN; alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, -C(=O)R¹³, -C(=O)N(R^{14a})R^{14b}, fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R¹⁶ y un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o completamente insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R¹⁶, donde R¹³, R^{14a}, R^{14b} y R¹⁶ tienen uno de los significados generales anteriores, o en particular, uno de los significados preferidos.

[0111] Más preferiblemente:

50

R^{10a} es hidrógeno o metilo; y

R^{10b} se selecciona entre hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquilo C₁-C₆ que lleva un grupo CN; cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₄-, halocicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₄-, donde los restos cicloalquilo en los 4 últimos radicales mencionados pueden llevar un grupo CN; alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, -C(=O)R¹³, -C(=O)N(R^{14a})R^{14b}, fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R¹⁶; y un anillo heterocíclico de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros saturado, parcialmente insaturado o completamente insaturado que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R¹⁶,

55

en el que R¹³, R^{14a}, R^{14b} y R¹⁶ tienen uno de los significados generales anteriores, o, en particular, R¹⁶ tiene uno de los significados preferidos anteriores y R¹³, R^{14a} y R^{14b} tienen uno de los significados preferidos a continuación.

5 **[0112]** Aún más preferiblemente:

R^{10a} es hidrógeno; y

10 R^{10b} se selecciona entre alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquilo C₁-C₆ que lleva un grupo CN; cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₄⁻, halocicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₄⁻, donde los restos cicloalquilo en los 4 últimos radicales mencionados pueden llevar un grupo CN; alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, -C(=O)R¹³ y -C(=O)N(R^{14a})R^{14b}; en el que R¹³, R^{14a} y R^{14b} tienen uno de los significados generales anteriores, o, en particular, uno de los significados preferidos a continuación.

15 **[0113]** Particularmente:

R^{10a} es hidrógeno; y

20 R^{10b} se selecciona entre alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquilo C₁-C₆ que lleva un grupo CN; cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₄⁻, halocicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₄⁻, donde los restos cicloalquilo en los 4 últimos radicales mencionados pueden llevar un grupo CN; alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆ y haloalquino C₂-C₆.

[0114] En particular,

R^{10a} es hidrógeno; y

25 R^{10b} se selecciona entre -C(=O)R¹³ y -C(=O)N(R^{14a})R^{14b}; donde R¹³, R^{14a} y R^{14b} tienen uno de los significados generales anteriores, o, en particular, uno de los significados preferidos a continuación. De acuerdo con la invención:

R^{10a} es hidrógeno o metilo, preferiblemente hidrógeno; y

30 R^{10b} se selecciona entre hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, -C(=O)R¹³ y -C(=O)N(R^{14a})R^{14b}; donde R¹³, R^{14a} y R^{14b} tienen uno de los significados generales anteriores, o, en particular, uno de los significados preferidos a continuación.

[0115] En el radical R^{10a} y R^{10b} anteriormente mencionado

35 R¹³ se selecciona preferiblemente entre hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆-alquilo C₁-C₄⁻, donde los restos cicloalquilo en los tres últimos grupos mencionados pueden estar sustituidos con un grupo ciano; alquilo C₁-C₆ sustituido con un grupo CN, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄.

Específicamente, en el radical R^{10a} y R^{10b} anteriormente mencionado

40 R¹³ se selecciona entre hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆-alquilo C₁-C₄⁻, donde los restos cicloalquilo en la tres últimos grupos mencionados pueden ser sustituidos con un grupo ciano; y alquilo C₁-C₆ sustituido con un grupo CN.

45 **[0116]** En la invención, en el radical R^{10a} y R^{10b} anteriormente mencionado, R¹³ se selecciona entre alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, donde los restos cicloalquilo en los dos últimos grupos mencionados pueden estar sustituidos con un grupo ciano; alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄.

50 **[0117]** En los radicales anteriores R^{10a} y R^{10b}

R^{14a} se selecciona preferiblemente entre hidrógeno y alquilo C₁-C₆; y

55 R^{14b} se selecciona preferiblemente entre hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆-alquilo C₁-C₄⁻, donde los restos cicloalquilo en los tres últimos grupos mencionados pueden estar sustituidos con un grupo ciano; y alquilo C₁-C₆ sustituido con un grupo CN.

[0118] En la invención, en los radicales anteriores R^{10a} y R^{10b}

R^{14a} se selecciona preferiblemente entre hidrógeno y alquilo C₁-C₆; y
R^{14b} se selecciona preferiblemente entre hidrógeno, alquilo C₁-C₆ y haloalquilo C₁-C₆.

[0119] Más preferiblemente, R⁷ se selecciona entre halógeno, ciano, oxo, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆,
5 alquilo C₁-C₆ que lleva un grupo CN; cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₄-,
halocicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₄-, donde los restos cicloalquilo en los 4 últimos radicales mencionados pueden
llevar un grupo CN, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, -NR^{10a} NR^{10b}, -
C(=O)N(R^{10a})R^{10b}, y -C(=O)R⁸, en el que R⁸, R^{10b} y R^{10b} tienen uno de los significados generales anteriores, o, en
particular, tienen uno de los significados preferidos anteriores. Incluso más preferiblemente, R⁷ se selecciona entre
10 halógeno, ciano, oxo, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, -N(R^{10a})R^{10b}, -C(=O)N(R^{10a})R^{10b}, y -C(=O)R⁸, en el que R⁸,
R^{10b} y R^{10b} tienen uno de los significados generales anteriores, o, en particular, tienen uno de los significados
preferidos anteriores.

[0120] En particular, R⁷ se selecciona entre flúor, ciano, oxo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, butilo,
15 isobutilo, CF₃, CH₂ CHF₂, CH₂ CHF₂, CH₂CF₃, alquilo C₁-C₄ sustituido con un grupo ciano; ciclopropilo, ciclobutilo,
ciclopropilo sustituido con un grupo ciano; ciclobutilo sustituido con un grupo ciano, halocicloalquilo C₃-C₆,
cicloalquilo C₃-C₆-alquilo C₁-C₂-, halocicloalquilo C₃-C₆-alquilo C₁-C₂-, donde el resto cicloalquilo en los 3 últimos
radicales mencionados pueden llevar un grupo CN; alilo, propargilo, -NHC(=O)R¹³, -NHC(=O)N(R^{14a})R^{14b}, -
C(=O)NHR^{10b} y -C(=O)R⁸, en el que

20 R⁸ es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquilo C₁-C₆ que lleva un grupo CN; cicloalquilo C₃-C₈,
halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₂-, halocicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₂-, donde los restos
cicloalquilo en los 4 últimos radicales mencionados pueden llevar un grupo CN; alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-
C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, -OR⁹ y -N(R^{10a})R^{10b}, donde R⁹, R^{10a} y R^{10b} tienen uno de los significados
preferidos;

25 R¹³ es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆,
haloalquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆-alquilo C₁-C₄-, donde los restos
cicloalquilo en los tres últimos grupos mencionados pueden estar sustituidos con un grupo ciano; alquilo C₁-C₆
sustituido con un grupo CN, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄; y

30 R^{10b} se selecciona entre alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquilo C₁-C₆ que lleva un grupo CN; cicloalquilo C₃-C₈,
halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₄-, halocicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₄-, donde los restos
cicloalquilo en los 4 últimos radicales mencionados pueden llevar un grupo CN; alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-
C₆, alquino C₂-C₆ y haloalquino C₂-C₆.

35 **[0121]** Especialmente, R⁷ se selecciona entre flúor, ciano, oxo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, butilo,
isobutilo, CF₃, CH₂ CHF₂, CH₂ CHF₂, CH₂CF₃, alquilo C₁-C₄ sustituido con un grupo ciano; ciclopropilo, ciclobutilo,
ciclopropilo sustituido con un grupo ciano; ciclobutilo sustituido con un grupo ciano, halocicloalquilo C₃-C₆,
cicloalquilo C₃-C₆-alquilo C₁-C₂-, halocicloalquilo C₃-C₆-alquilo C₁-C₂-, donde el resto cicloalquilo en los 3 últimos
radicales mencionados puede llevar un grupo CN; alilo, propargilo, -NHC(=O)R¹³, -C(=O)NHR^{10b} y -C(=O)R⁸, en el
40 que

R⁸ es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquilo C₁-C₆ que lleva un grupo CN; cicloalquilo C₃-C₈,
halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₂-, halocicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₂-, donde los restos
45 cicloalquilo en los 4 últimos radicales mencionados pueden llevar un grupo CN; alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-
C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, -OR⁹ y -N(R^{10a})R^{10b}, donde R⁹, R^{10a} y R^{10b} tienen uno de los significados
preferidos;

R¹³ es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆,
haloalquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆-alquilo C₁-C₄-, donde los restos
50 cicloalquilo en los tres últimos grupos mencionados pueden estar sustituidos con un grupo ciano; y alquilo C₁-C₆
sustituido con un grupo CN y

R^{10b} se selecciona entre alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquilo C₁-C₆ que lleva un grupo CN; cicloalquilo C₃-C₈,
halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₄-, halocicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₄-, donde los restos
cicloalquilo en los 4 últimos radicales mencionados pueden llevar un grupo CN; alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-
C₆, alquino C₂-C₆ y haloalquino C₂-C₆.

55 **[0122]** En una realización específica alternativa, R⁷ se selecciona entre flúor, ciano, oxo, metilo, etilo, n-
propilo, isopropilo, butilo, isobutilo, CF₃, CH₂ CHF₂, CH₂ CHF₂, CH₂ CF₃, -NHC(=O)R¹³, -NHC(=O)N(R^{14a})R^{14b}, -
C(=O)NHR^{10b} y -C(=O)R⁸, en el que

R⁸ es alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, o -OR⁹ y -N(R^{10a})R^{10b}, donde R⁹ tienen uno de los significados preferidos anteriores, y es en particular alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆;

R¹³ es alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, donde los restos cicloalquilo en los dos últimos grupos mencionados pueden estar sustituidos con un grupo ciano grupo; alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

R^{10b} se selecciona entre alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquilo C₁-C₆ que lleva un grupo CN; cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₄, donde los restos cicloalquilo en los 4 últimos radicales mencionados pueden llevar un grupo CN; alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆ y haloalquino C₂-C₆;

R^{14a} se selecciona entre hidrógeno y alquilo C₁-C₆; y

R^{14b} se selecciona entre hidrógeno, alquilo C₁-C₆ y haloalquilo C₁-C₆.

[0123] En la invención, W es O. En la invención, B¹, B² y B³ son CR². Más preferiblemente, B¹ y B³ son CR², donde R² no es hidrógeno, y B² es CR², donde R² tienen uno de los significados dados anteriormente.

[0124] Preferiblemente, R² se selecciona entre hidrógeno, halógeno, ciano, azido, nitro, -SCN, -SF₅, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, donde los cuatro últimos radicales alifáticos y cicloalifáticos mencionados pueden estar parcial o totalmente halogenados y/o pueden estar sustituidos con uno o más radicales R⁸, -OR⁹, -S(O)_nR⁹ y -NR^{10a}R^{10b}, en la que n, R⁸, R⁹, R^{10a} y R^{10b} tienen uno de los significados generales anteriores, o, en particular, uno de los significados preferidos a continuación. Según la invención, R² se selecciona entre hidrógeno, halógeno y haloalquilo C₁-C₂, preferiblemente de hidrógeno, F, Cl, Br y CF₃.

[0125] En una realización particular, B¹ y B³ son C-Cl y B² es C-F. En una realización particular adicional, B¹ y B³ son C-CF₃ y B² es C-H. En una realización particular adicional B¹ y B³ son C-Br y B² es C-F. En una realización particular adicional, B¹, B² y B³ son C-Cl. En una realización particular adicional, B¹ es C-Cl, B² es C-H y B³ es C-CF₃. En una realización particular adicional, B¹ es C-Br, B² es C-H y B³ es C-CF₃. Específicamente, B¹ y B³ son C-Cl y B² es C-F.

[0126] Preferiblemente, G¹, G², G³ y G⁴ son CR⁴, donde R⁴ tiene uno de los significados dados anteriormente o a continuación. Asimismo preferiblemente, G¹, G³ y G⁴ son CR⁴ y G² es N, donde R⁴ tiene uno de los significados dados anteriormente o a continuación. Asimismo preferiblemente, G², G³ y G⁴ son CR⁴ y G¹ es N, donde R⁴ tiene uno de los significados dados anteriormente o a continuación.

[0127] Según la invención, G¹, G³ y G⁴ son CH y G² es CR⁴, donde R⁴ tiene uno de los significados anteriores generales o, en particular, uno de los significados preferidos a continuación.

[0128] Preferiblemente, R⁴ se selecciona entre hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₅, alqueno C₂-C₄, haloalqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, haloalquino C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄; y en la invención, R⁴ se selecciona entre hidrógeno, halógeno y metilo.

[0129] Preferiblemente, R¹ se selecciona entre alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y -C(=O)OR¹⁵, y en particular preferiblemente entre haloalquilo C₁-C₄ y -C(=O)OR¹⁵, en el que R¹⁵ es preferiblemente alquilo C₁-C₄. En particular, R¹ es haloalquilo C₁-C₄, específicamente haloalquilo C₁-C₂ o -C(=O)OR¹⁵, en el que R¹⁵ es alquilo C₁-C₄. Más específicamente R¹ es halometilo, en particular fluorometilo, tal como fluorometilo, difluorometilo y trifluorometilo.

[0130] En la invención, R¹ es trifluorometilo.

[0131] Preferiblemente, R^{3a} y R^{3b} se seleccionan, independientemente entre sí, entre hidrógeno, halógeno, hidroxilo, alquilo C₁-C₃, alqueno C₂-C₃, alquino C₂-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, alquilo C₁-C₃ y sulfonilo C₁-C₃.

[0132] De acuerdo con la invención, R^{3a} y R^{3b} se seleccionan, independientemente entre sí, entre hidrógeno y halógeno, preferiblemente hidrógeno y flúor, y son en particular hidrógeno.

[0133] Si no se especifica de otro modo anteriormente, R⁸, R⁹, R^{10a}, R^{10b}, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁵ y R¹⁶ tienen los siguientes significados preferidos:

En caso de que R⁸ sea un sustituyente en un grupo alquilo, alqueno o alquino, éste se selecciona preferiblemente

del grupo que consiste en ciano, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, -OR⁹, -SR⁹, -C(=O)N(R^{10a})R^{10b}, -C(=S)N(R^{10a})R^{10b}, -C(=O)OR⁹, fenilo que puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 radicales R¹⁶ y un anillo heterocíclico de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros, saturado, parcialmente insaturado o aromático que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico puede estar sustituido con uno o más radicales R¹⁶; donde R⁹, R^{10a}, R^{10b} y R¹⁶ tienen uno de los significados dados anteriormente o en particular uno de los significados preferidos dados a continuación.

[0134] En caso de que R⁸ sea un sustituyente en un grupo alquilo, alqueno o alquino, que incluso más preferiblemente se selecciona del grupo que consiste en ciano, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, -C(=O)N(R^{10a})R^{10b}, -C(=S)N(R^{10a})R^{10b}, -C(=O)OR⁹, fenilo que puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 radicales R¹⁶ y un anillo heterocíclico de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico puede estar sustituido con uno o más radicales R¹⁶; donde R⁹, R^{10a}, R^{10b} y R¹⁶ tienen uno de los significados dados anteriormente o en particular uno de los significados preferidos dados a continuación. En particular, se selecciona del grupo que consiste en ciano, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, -C(=O)N(R^{10a})R^{10b}, -C(=S)N(R^{10a})R^{10b}, -C(=O)OR⁹, fenilo que puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 radicales R¹⁶ y un anillo heterocíclico de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico puede estar sustituido con uno o más radicales R¹⁶; donde R⁹, R^{10a}, R^{10b} y R¹⁶ tienen uno de los significados dados anteriormente o en particular uno de los significados preferidos dados a continuación.

[0135] En caso de que R⁸ sea un sustituyente en un grupo cicloalquilo, éste se selecciona preferiblemente del grupo que consiste en ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, -OR⁹, -OSO₂R⁹, -SR⁹, -N(R^{10a})R^{10b}, -C(=O)N(R^{10a})R^{10b}, -C(=S)N(R^{10a})R^{10b}, -C(=O)OR⁹, fenilo que puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 radicales R¹⁶, y un anillo heterocíclico de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico puede estar sustituido con uno o más radicales R¹⁶; donde R⁹, R^{10a}, R^{10b} y R¹⁶ tienen uno de los significados dados anteriormente o en particular uno de los significados preferidos dados a continuación.

[0136] En caso de que R⁸ sea un sustituyente en un grupo cicloalquilo, se selecciona aún más preferiblemente del grupo que consiste en ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₃. En particular, R⁸ como sustituyente en un grupo cicloalquilo se selecciona entre ciano, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₃.

[0137] En el caso de R⁸ en un grupo -C(=O)R⁸, =C(R⁸)₂ o -C(=NR⁶)R⁸, R⁸ se selecciona preferiblemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, -OR⁹, -SR⁹, -N(R^{10a})R^{10b}, fenilo que puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 radicales R¹⁶ y un anillo heterocíclico de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico puede estar sustituido con uno o más radicales R¹⁶; donde R⁹, R^{10a}, R^{10b} y R¹⁶ tienen uno de los significados dados anteriormente o, en particular, uno de los significados preferidos que se indican a continuación.

[0138] En el caso de R⁸ en un grupo -C(=O)R⁸, =C(R⁸)₂ o -C(=NR⁶)R⁸, R⁸ se selecciona más preferiblemente del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, -N(R^{10a})R^{10b}, fenilo que puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 radicales R¹⁶, y un anillo heterocíclico de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico puede estar sustituido con uno o más radicales R¹⁶; donde R^{10a}, R^{10b} y R¹⁶ tienen uno de los significados dados anteriormente o en particular uno de los significados preferidos dados a continuación.

[0139] Preferiblemente, cada R⁹ se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₄, fenilo que puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 radicales R¹⁶; y un anillo heterocíclico de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros, saturado, parcialmente insaturado o aromático que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico puede estar sustituido con uno o más, por ejemplo, 1, 2, 3 o 4, preferiblemente 1 o 2, más preferiblemente 1, radicales R¹⁶, donde R¹⁶ tienen uno de los significados dados anteriormente o en particular uno de los significados preferidos dados a continuación.

[0140] Más preferiblemente, cada R^9 se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , fenilo que puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 radicales R^{16} ; y un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados entre N, O y S, como miembros del anillo, donde el anillo heteroaromático puede estar sustituido con uno o más radicales R^{16} ; donde R^{16} tiene uno de los significados dados anteriormente o en particular uno de los significados preferidos dados a continuación.

[0141] R^{10a} y R^{10b} preferiblemente se seleccionan, independientemente entre sí, entre hidrógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alqueno C_2-C_4 , haloalqueno C_2-C_4 , alquino C_2-C_4 , haloalquino C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , alquilcarbonilo C_1-C_4 , haloalquilcarbonilo C_1-C_4 , alquilaminocarbonilo C_1-C_4 , haloalquilaminocarbonilo C_1-C_4 , cicloalquilaminocarbonilo C_3-C_6 , halocicloalquiloaminocarbonilo C_3-C_6 , y un anillo heterocíclico de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros, saturado, parcialmente insaturado o completamente insaturado que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO_2 , como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico está opcionalmente sustituido con uno o más, preferiblemente 1, 2 o 3, en particular 1, sustituyentes seleccionados entre halógeno, CN, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alqueno C_2-C_4 , haloalqueno C_2-C_4 , alquino C_2-C_4 , haloalquino C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 y haloalquiltio C_1-C_4 ; o, R^{10a} y R^{10b} , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o aromático de 5 o 6 miembros, que adicionalmente puede contener 1 o 2 heteroátomos o grupos de heteroátomos adicionales seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO_2 , como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico puede llevar 1 o 2, en particular 1, sustituyentes seleccionados entre halógeno, CN, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alqueno C_2-C_4 , haloalqueno C_2-C_4 , alquino C_2-C_4 , haloalquino C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 y haloalquiltio C_1-C_4 .

[0142] Más preferiblemente, R^{10a} y R^{10b} se seleccionan, independientemente entre sí, entre hidrógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 y un anillo heterocíclico saturado de 3 o 4 miembros que comprende 1 heteroátomo o grupo de heteroátomos seleccionado entre N, O, S, NO, SO y SO_2 , como miembro del anillo, donde el anillo heterocíclico está opcionalmente sustituido con uno o más, preferiblemente 1, 2 o 3, en particular 1, sustituyentes seleccionados entre halógeno, CN, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 y haloalcoxi C_1-C_4 ; y específicamente se seleccionan, independientemente entre sí, entre hidrógeno, alquilo C_1-C_4 y haloalquilo C_1-C_4 .

[0143] Cada R^{11} y cada R^{16} se seleccionan independientemente en cada caso e independientemente entre sí preferiblemente entre halógeno, CN, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , haloalquiltio C_1-C_4 , alquilsulfino C_1-C_4 , haloalquilsulfino C_1-C_4 , alquilsulfonilo C_1-C_4 y haloalquilsulfonilo C_1-C_4 , y más preferiblemente entre halógeno, CN, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 y haloalcoxi C_1-C_4 .

[0144] Cada R^{12} se selecciona preferiblemente entre alquilo C_1-C_4 y es en particular metilo.

[0145] En caso de que R^{13} sea un sustituyente en un grupo alquilo, alqueno o alquino, se selecciona preferiblemente del grupo que consiste en ciano, cicloalquilo C_3-C_8 , halocicloalquilo C_3-C_8 , -OH, -SH, alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , haloalquiltio C_1-C_4 , alquilsulfino C_1-C_4 , haloalquilsulfino C_1-C_4 , alquilsulfonilo C_1-C_4 , haloalquilsulfonilo C_1-C_4 y fenilo que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 radicales seleccionados entre halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 y haloalcoxi C_1-C_4 .

[0146] En caso de que R^{13} sea un sustituyente en un grupo cicloalquilo, éste se selecciona preferiblemente del grupo que consiste en ciano, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , halocicloalquilo C_3-C_8 , -OH, -SH, alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , haloalquiltio C_1-C_4 , alquilsulfino C_1-C_4 , haloalquilsulfino C_1-C_4 , alquilsulfonilo C_1-C_4 , haloalquilsulfonilo C_1-C_4 y fenilo que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 radicales seleccionados entre halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 y haloalcoxi C_1-C_4 .

[0147] En caso de que R^{13} sea un sustituyente en un grupo cicloalquilo, se selecciona aún más preferiblemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_4 y haloalcoxi C_1-C_3 . En particular, R^{13} como sustituyente en un grupo cicloalquilo se selecciona entre halógeno, alquilo C_1-C_4 y haloalquilo C_1-C_3 .

[0148] En el caso de R^{13} en un grupo $-C(=O)R^{13}$, $-C(=S)R^{13}$, $=C(R^{13})_2$ o $-C(=NR^{14})R^{13}$, R^8 se selecciona preferiblemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 ,

halocicloalquilo C₃-C₆, -OH, -SH, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆ y fenilo que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 radicales seleccionados entre halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄.

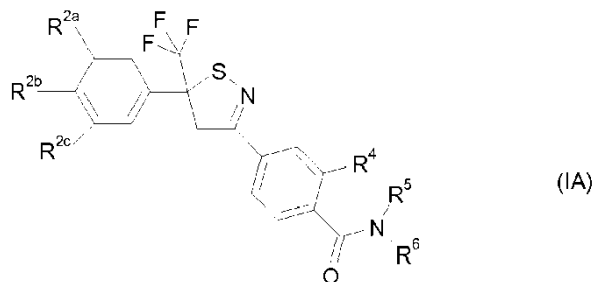
[0149] R¹⁴, R^{14a} y R^{14b} preferiblemente se seleccionan, independientemente entre sí, entre hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alquenoilo C₂-C₄, haloalquenoilo C₂-C₄, alquinoilo C₂-C₄, haloalquinoilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆ y bencilo, donde el anillo fenilo en el bencilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3, en particular 1, sustituyentes seleccionados entre halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄; o, R^{14a} y R^{14b}, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o aromático de 5 o 6 miembros, que adicionalmente puede contener 1 o 2 heteroátomos o grupos de heteroátomos adicionales seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico puede llevar 1 o 2, en particular 1, sustituyentes seleccionados entre halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄.

[0150] Más preferiblemente, R¹⁴, R^{14a} y R^{14b} se seleccionan, independientemente entre sí, entre hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆ y bencilo, donde el anillo fenilo en el bencilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3, en particular 1, sustituyentes seleccionados entre halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

o, R^{14a} y R^{14b}, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o aromático de 5 o 6 miembros, que adicionalmente puede contener 1 o 2 heteroátomos o grupos de heteroátomos adicionales seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico puede llevar 1 o 2, en particular 1, sustituyentes seleccionados entre halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄.

[0151] Cada R¹⁵ se selecciona preferiblemente entre hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, fenilo, bencilo, piridilo y fenoxi, en el que los cuatro últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos y/o llevar 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados entre alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ y haloalcoxi C₁-C₆.

[0152] En un aspecto particular de la descripción, el compuesto I es un compuesto de fórmula IA, es decir, un compuesto de fórmula I, en la que B¹ es CR^{2a}, B² es CR^{2b}, B³ es CR^{2c}, R¹ es CF₃, R^{3a} y R^{3b} son cada uno hidrógeno, G¹ es C-H, G³ es C-H, G⁴ es CH y G² es CR⁴,

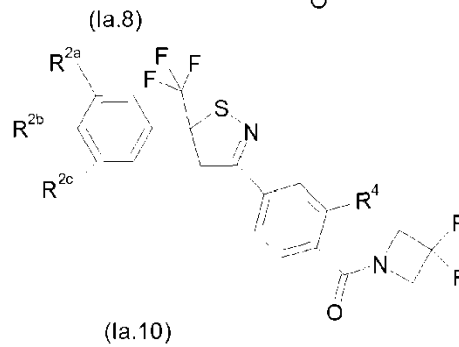
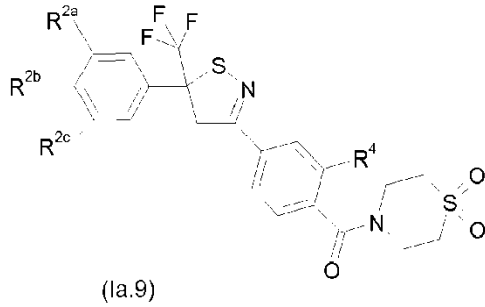
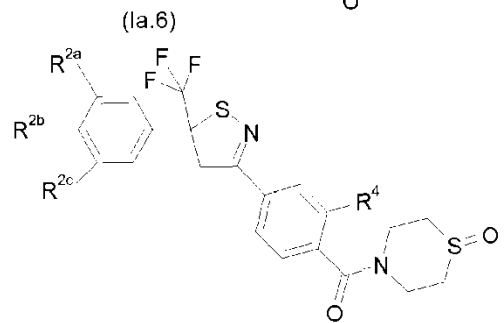
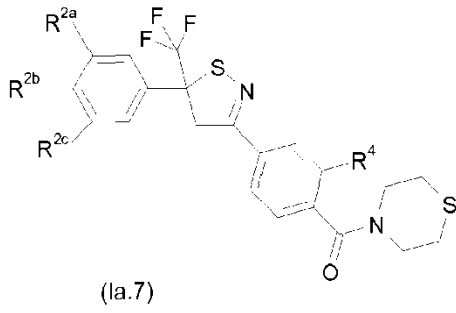
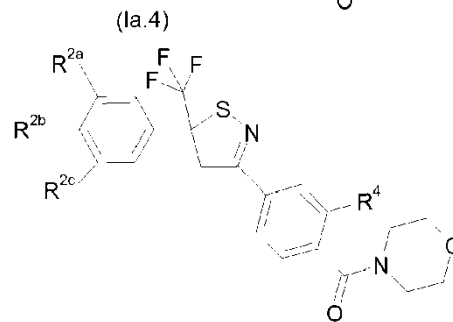
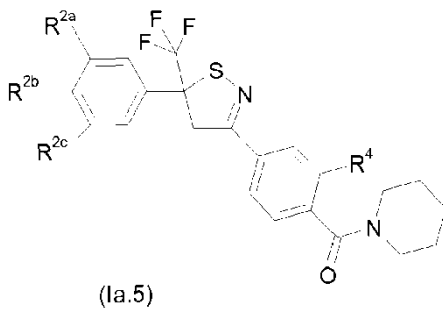
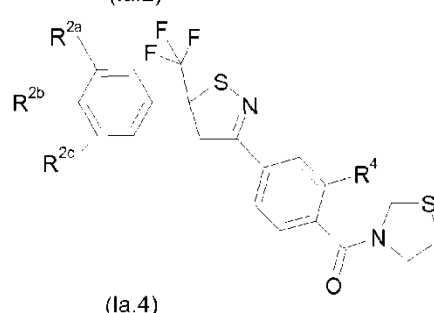
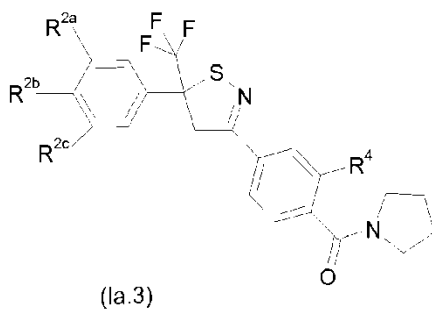
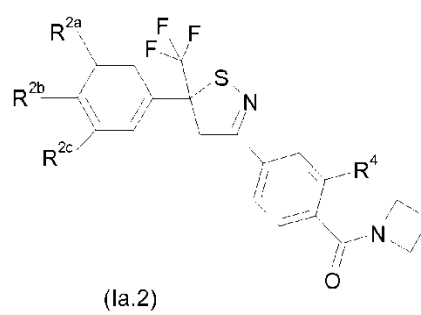
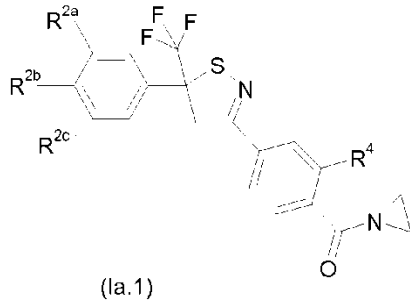


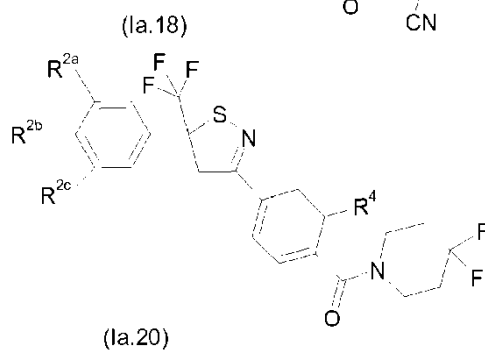
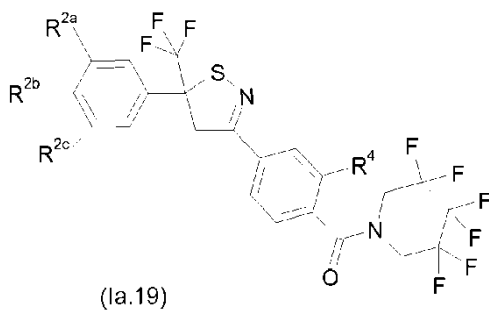
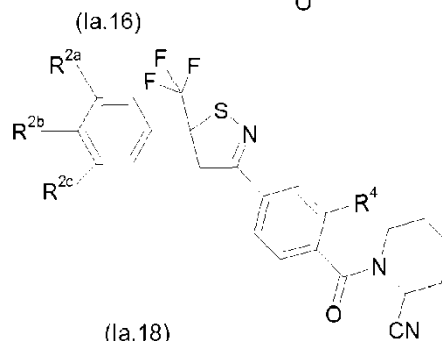
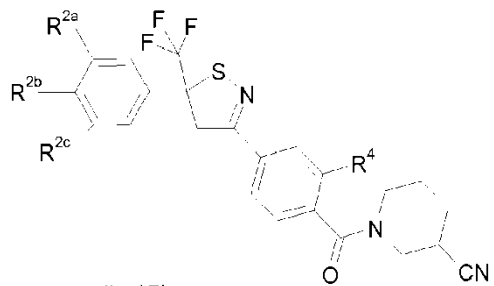
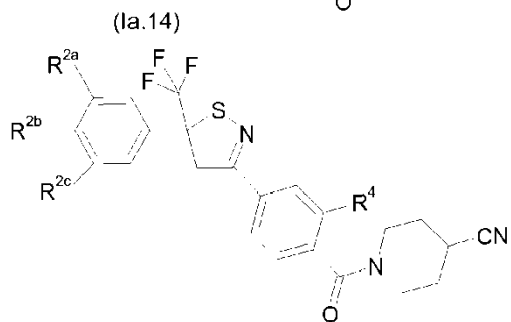
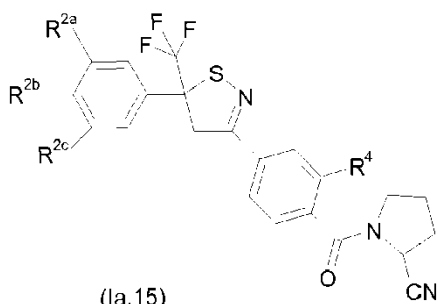
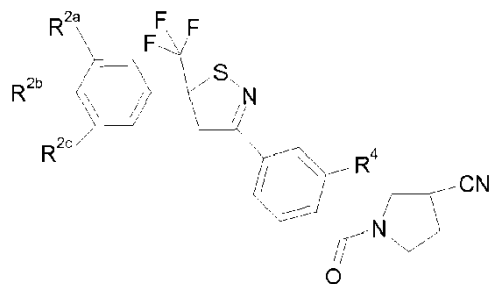
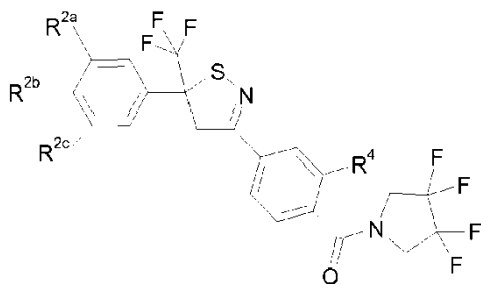
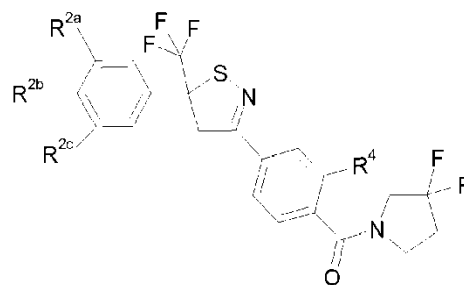
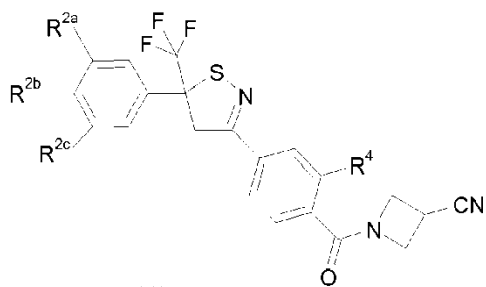
donde R⁴, R⁵ y R⁶ tienen uno de los significados preferidos dados anteriormente o, en particular, uno de los significados preferidos dados anteriormente, y R^{2a}, R^{2b} y R^{2c}, independientemente entre sí, tienen uno de los significados generales o, en particular, uno de los significados preferidos dados anteriormente para R², excepto para los compuestos IA en el que R^{2a} y R^{2c} son Cl, y simultáneamente R^{2b} es H, R⁴ es F, Cl, CH₃ o SCH₃, y R⁵ y R⁶, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un anillo seleccionado entre aziridin-1-ilo sin sustituir, azetidín-1-ilo sin sustituir, pirrolidin-1-ilo sin sustituir, piperidin-1-ilo sin sustituir, tiazolidín-3-ilo sin sustituir, morfolín-4-ilo sin sustituir, tiomorfolín-4-ilo sin sustituir, 1-oxo-1,4-tiazinan-4-ilo sin sustituir y 1,1-dioxo-1,4-tiazinan-4-ilo sin sustituir.

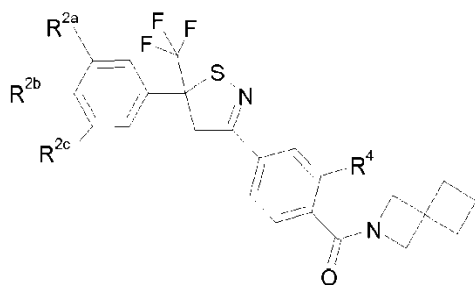
[0153] Los ejemplos de compuestos preferidos de la descripción son compuestos de las siguientes fórmulas Ia.1 a Ia.52, donde las variables tienen uno de los significados generales o preferidos dados anteriormente.

[0154] Ejemplos de compuestos preferidos de la descripción son los compuestos individuales compilados en las tablas 1 a 265 a continuación. Además, los significados mencionados a continuación para las variables individuales en las tablas son por sí mismos, independientemente de la combinación en la que se mencionen, una

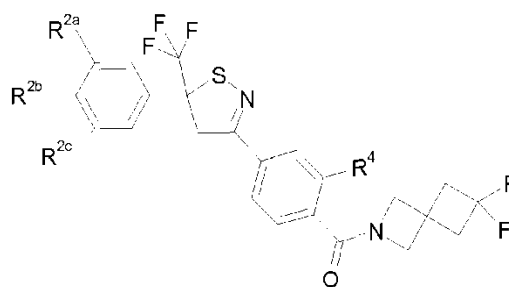
realización particularmente preferida de los sustituyentes en cuestión.



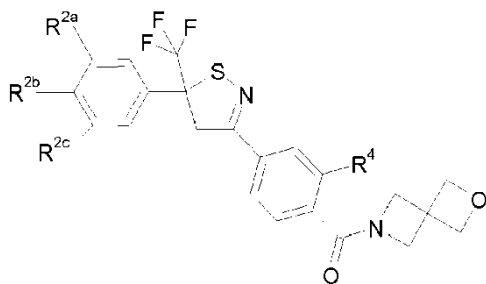




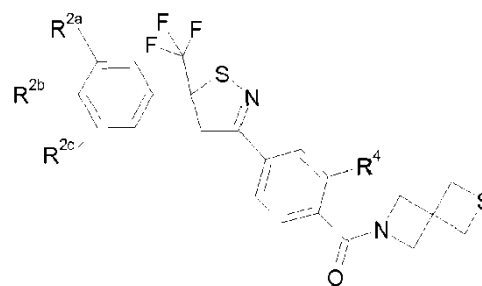
(Ia.21)



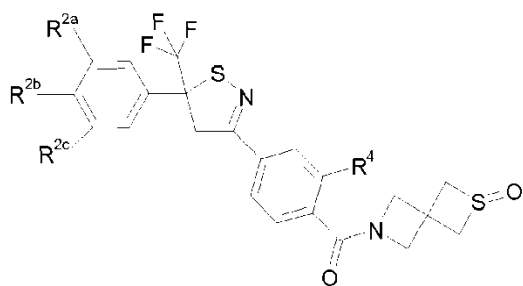
(Ia.22)



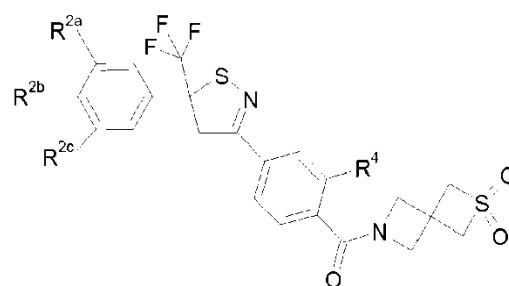
(Ia.23)



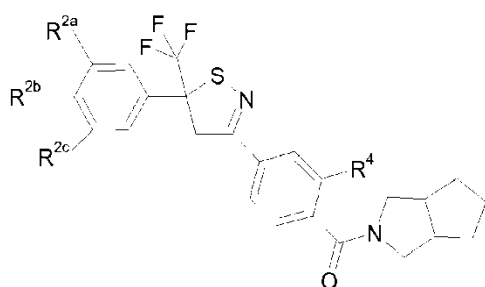
(Ia.24)



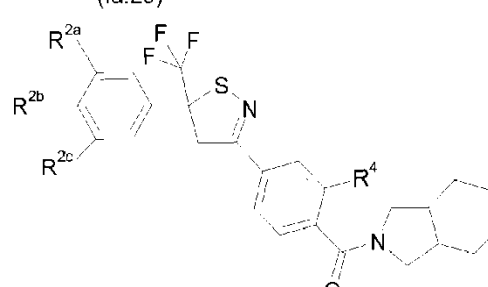
(Ia.25)



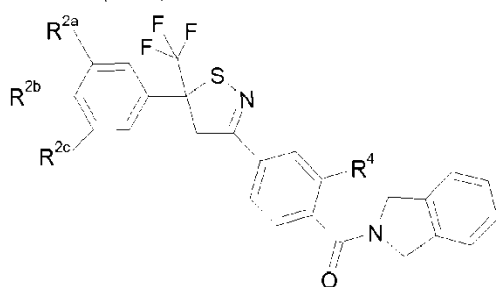
(Ia.26)



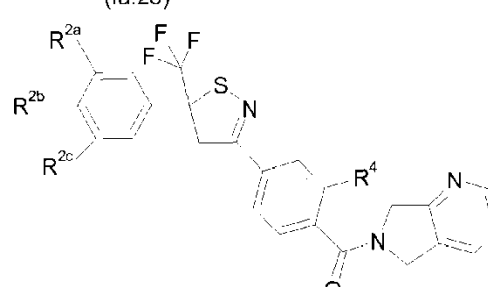
(Ia.27)



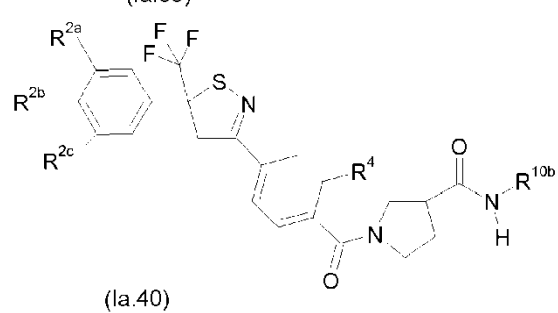
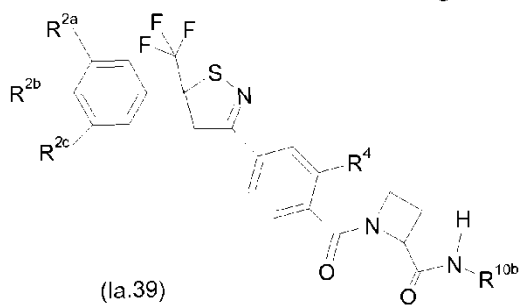
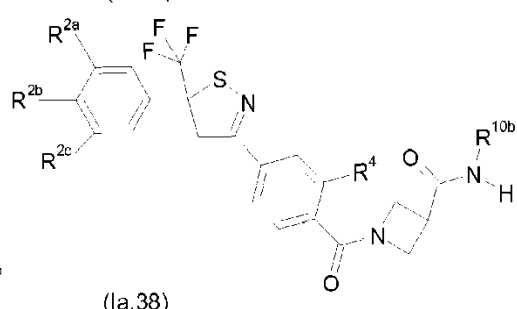
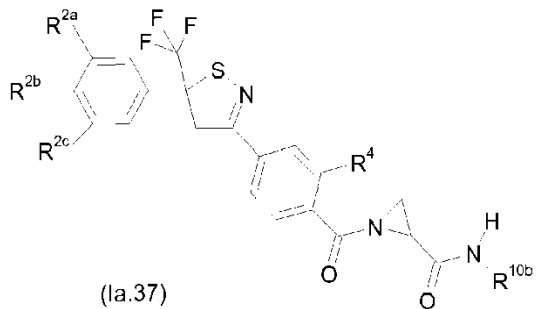
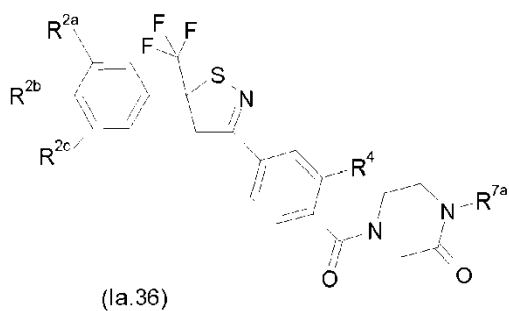
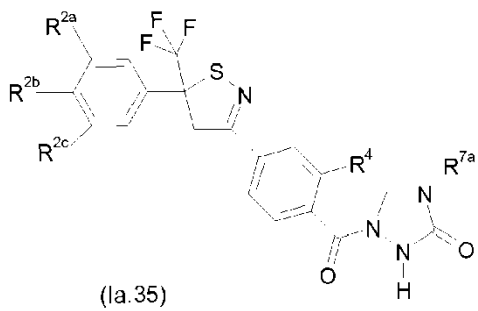
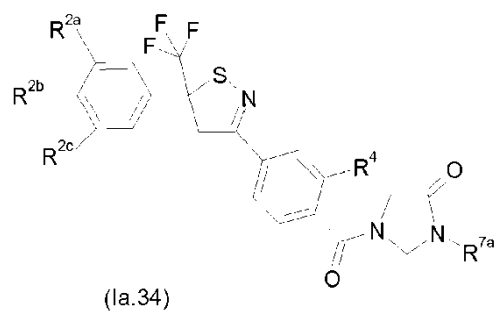
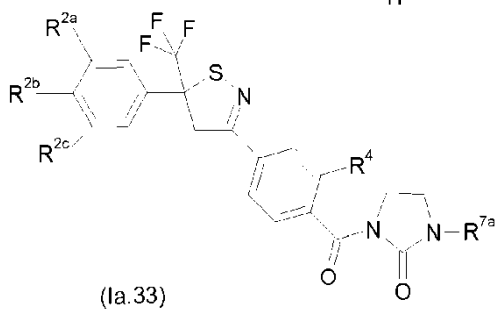
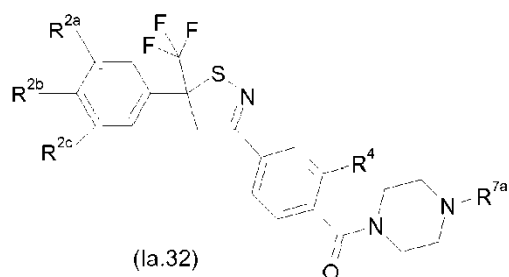
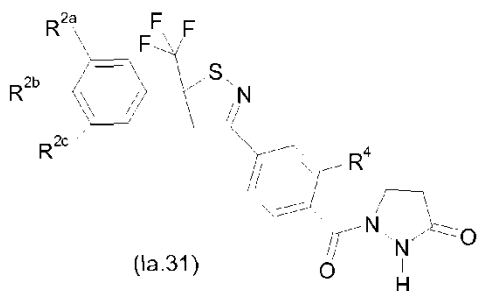
(Ia.28)

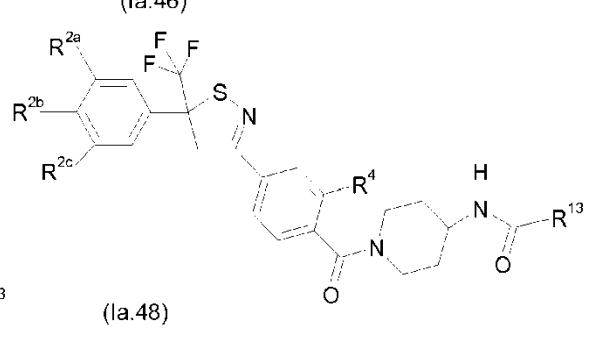
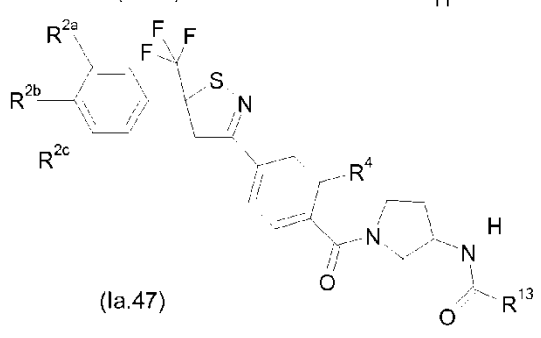
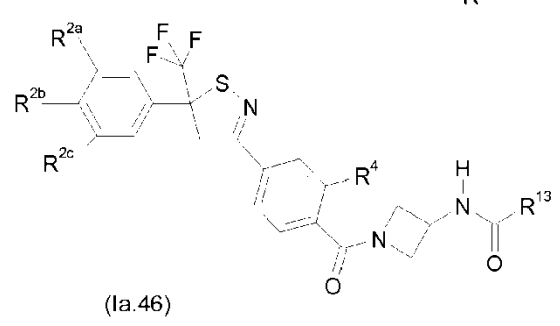
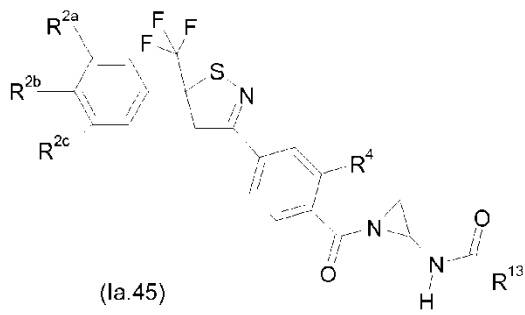
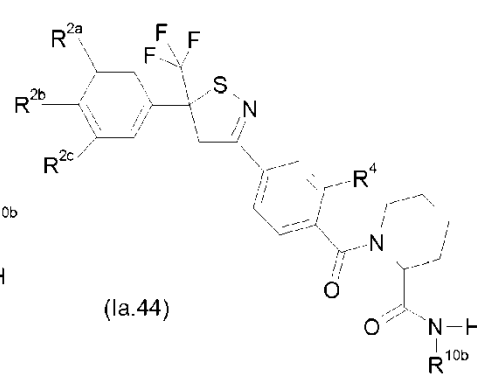
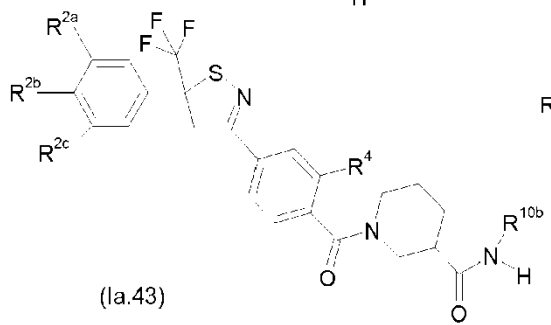
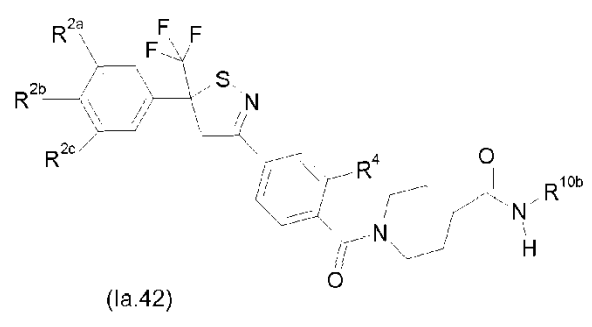
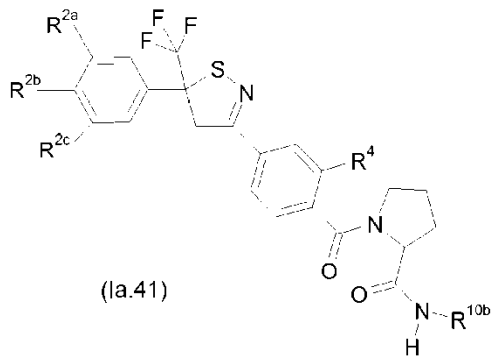


(Ia.29)



(Ia.30)





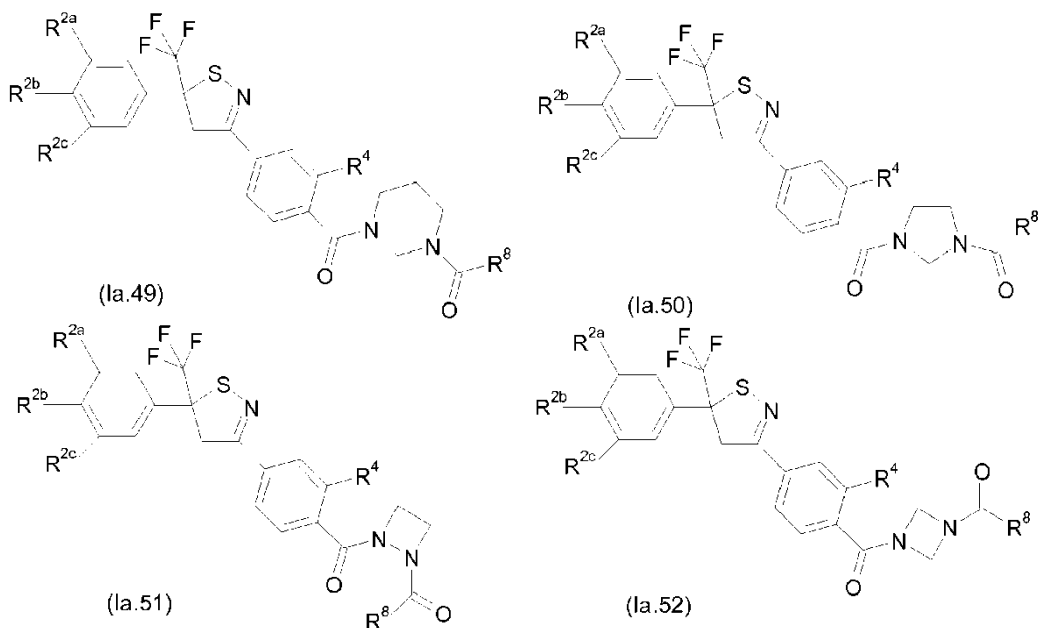


Tabla 1

5

[0155] Los compuestos de la fórmula Ia.1, en los que la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A, excepto en las filas A-37, A-307, A-337 y A-667.

Tabla 2

10

[0156] Los compuestos de la fórmula Ia.2 en los que la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A, excepto en las filas A-37, A-307, A-337 y A-667.

Tabla 3

15

[0157] Los compuestos de la fórmula Ia.3 en los que la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A, excepto en las filas A-37, A-307, A-337 y A-667.

Tabla 4

20

[0158] Los compuestos de la fórmula Ia.4 en los que la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A, excepto en las filas A-37, A-307, A-337 y A-667.

Tabla 5

25

[0159] Los compuestos de la fórmula Ia.5 en los que la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A, excepto en las filas A-37, A-307, A-337 y A-667.

Tabla 6

30

[0160] Los compuestos de la fórmula Ia.6 en los que la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A, excepto en las filas A-37, A-307, A-337 y A-667.

Tabla 7

35

[0161] Los compuestos de la fórmula Ia.7 en los que la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A, excepto en las filas A-37, A-307, A-337 y A-667.

Tabla 8

[0162] Los compuestos de la fórmula Ia.8 en los que la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A, excepto en las filas A-37, A-307, A-337 y A-667.

5

Tabla 9

[0163] Los compuestos de la fórmula Ia.9 en los que la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A, excepto en las filas A-37, A-307, A-337 y A-667.

10

Tabla 10

[0164] Los compuestos de la fórmula Ia.10 en los que la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

15

Tabla 11

[0165] Los compuestos de la fórmula Ia.11 en los que la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

20

Tabla 12

[0166] Los compuestos de la fórmula Ia.12 en los que la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

25

Tabla 13

[0167] Los compuestos de la fórmula Ia.13 en los que la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

30

Tabla 14

[0168] Los compuestos de la fórmula Ia.14 en los que la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

35

Tabla 15

[0169] Los compuestos de la fórmula Ia.15 en los que la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

40

Tabla 16

[0170] Los compuestos de la fórmula Ia.16 en los que la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

45

Tabla 17

[0171] Los compuestos de la fórmula Ia.17 en los que la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

50

Tabla 18

[0172] Los compuestos de la fórmula Ia.18 en los que la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

55

Tabla 19

[0173] Los compuestos de la fórmula Ia.19 en los que la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

Tabla 20

[0174] Los compuestos de la fórmula Ia.20 en los que la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un 5 compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

Tabla 21

[0175] Los compuestos de la fórmula Ia.21 en los que la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un 10 compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

Tabla 22

[0176] Los compuestos de la fórmula Ia.22 en los que la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un 15 compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

Tabla 23

[0177] Los compuestos de la fórmula Ia.23 en los que la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un 20 compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

Tabla 24

[0178] Los compuestos de la fórmula Ia.24 en los que la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un 25 compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

Tabla 25

[0179] Los compuestos de la fórmula Ia.25 en los que la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un 30 compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

Tabla 26

[0180] Los compuestos de la fórmula Ia.26 en los que la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un 35 compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

Tabla 27

[0181] Los compuestos de la fórmula Ia.27 en los que la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un 40 compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

Tabla 28

[0182] Los compuestos de la fórmula Ia.28 en los que la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un 45 compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

Tabla 29

[0183] Los compuestos de la fórmula Ia.29 en los que la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un 50 compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

Tabla 30

[0184] Los compuestos de la fórmula Ia.30 en los que la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un 55 compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

Tabla 31

[0185] Los compuestos de la fórmula Ia.31 en los que la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un

compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

Tabla 32

- 5 **[0186]** Los compuestos de la fórmula Ia.32 en la que R^{7a} es hidrógeno y la combinación de R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y R⁴ para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

Tabla 33

- 10 **[0187]** Los compuestos de la fórmula Ia.32 en la que R^{7a} es metilo y la combinación de R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y R⁴ para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

Tabla 34

- 15 **[0188]** Los compuestos de la fórmula Ia.32 en la que R^{7a} es etilo y la combinación de R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y R⁴ para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

Tabla 35

- 20 **[0189]** Los compuestos de la fórmula Ia.32 en la que R^{7a} es isopropilo (-CH(CH₃)₂) y la combinación de R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y R⁴ para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

Tabla 36

- 25 **[0190]** Los compuestos de la fórmula Ia.32 en la que R^{7a} es 2,2-difluoroetilo y la combinación de R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y R⁴ para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

Tabla 37

- 30 **[0191]** Los compuestos de la fórmula Ia.32 en la que R^{7a} es 2,2,2-trifluoroetilo y la combinación de R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y R⁴ para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

Tabla 38

- 35 **[0192]** Los compuestos de la fórmula Ia.32 en la que R^{7a} es ciclopropilo y la combinación de R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y R⁴ para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

Tabla 39

- 40 **[0193]** Los compuestos de la fórmula Ia.32 en la que R^{7a} es ciclopropilmetilo y la combinación de R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y R⁴ para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

Tabla 40

- 45 **[0194]** Los compuestos de la fórmula Ia.32 en la que R^{7a} es alilo y la combinación de R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y R⁴ para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

Tabla 41

- 50 **[0195]** Los compuestos de la fórmula Ia.32 en la que R^{7a} es prop-2-inilo (propargilo) y la combinación de R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y R⁴ para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

Tablas 42 a 51

- 55 **[0196]** Los compuestos de la fórmula Ia.33 en la que R^{7a} es como se ha definido en cualquiera de las tablas 32 a 41 y la combinación de R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y R⁴ para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

Tablas 52 a 61

[0197] Los compuestos de la fórmula Ia.34 en la que R^{7a} es como se ha definido en cualquiera de las tablas 32 a 41 y la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

Tablas 62 a 71

5

[0198] Los compuestos de la fórmula Ia.35 en la que R^{7a} es como se ha definido en cualquiera de las tablas 32 a 41 y la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

Tablas 72 a 81

10

[0199] Los compuestos de la fórmula Ia.36 en la que R^{7a} es como se ha definido en cualquiera de las tablas 32 a 41 y la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

Tablas 82 a 91

15

[0200] Los compuestos de la fórmula Ia.37 en la que R^{10b} es como se ha definido para R^{7a} en cualquiera de las tablas 32 a 41 y la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

20 Tablas 92 a 101

[0201] Los compuestos de la fórmula Ia.38 en la que R^{10b} es como se ha definido para R^{7a} en cualquiera de las tablas 32 a 41 y la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

25

Tablas 102 a 111

[0202] Los compuestos de la fórmula Ia.39 en la que R^{10b} es como se ha definido para R^{7a} en cualquiera de las tablas 32 a 41 y la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

30

Tablas 112 a 121

[0203] Los compuestos de la fórmula Ia.40 en la que R^{10b} es como se ha definido para R^{7a} en cualquiera de las tablas 32 a 41 y la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

35

Tablas 122 a 131

[0204] Los compuestos de la fórmula Ia.41 en la que R^{10b} es como se ha definido para R^{7a} en cualquiera de las tablas 32 a 41 y la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

40

Tablas 132 a 141

45

[0205] Los compuestos de la fórmula Ia.42 en la que R^{10b} es como se ha definido para R^{7a} en cualquiera de las tablas 32 a 41 y la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

50 Tablas 142 a 151

[0206] Los compuestos de la fórmula Ia.43 en la que R^{10b} es como se ha definido para R^{7a} en cualquiera de las tablas 32 a 41 y la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

55

Tablas 152 a 161

[0207] Los compuestos de la fórmula Ia.44 en la que R^{10b} es como se ha definido para R^{7a} en cualquiera de las tablas 32 a 41 y la combinación de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^4 para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de

la Tabla A.

Tablas 162 a 171

- 5 **[0208]** Los compuestos de la fórmula Ia.45 en la que R¹³ es como se ha definido para R^{7a} en cualquiera de las tablas 32 a 41 y la combinación de R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y R⁴ para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

Tabla 172

- 10 **[0209]** Los compuestos de la fórmula Ia.45 en la que R¹³ es CF₃ y la combinación de R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y R⁴ para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

Tabla 173

- 15 **[0210]** Los compuestos de la fórmula Ia.45 en la que R¹³ es vinilo y la combinación de R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y R⁴ para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

Tabla 174

- 20 **[0211]** Los compuestos de la fórmula Ia.45 en la que R¹³ es etinilo y la combinación de R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y R⁴ para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

Tabla 175

- 25 **[0212]** Los compuestos de la fórmula Ia.45 en la que R¹³ es -NH(CH₃) y la combinación de R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y R⁴ para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

Tabla 176

- 30 **[0213]** Los compuestos de la fórmula Ia.45 en la que R¹³ es -NH(CH₂CH₃) y la combinación de R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y R⁴ para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

Tabla 177

- 35 **[0214]** Los compuestos de la fórmula Ia.45 en la que R¹³ es -NH(CH₂CF₃) y la combinación de R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y R⁴ para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

Tablas 178 a 193

- 40 **[0215]** Los compuestos de la fórmula Ia.46 en la que R¹³ es como se ha definido en cualquiera de las tablas 162 a 177 y la combinación de R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y R⁴ para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

45 Tablas 194 a 209

- [0216]** Los compuestos de la fórmula Ia.47 en la que R¹³ es como se ha definido en cualquiera de las tablas 162 a 177 y la combinación de R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y R⁴ para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

50

Tablas 210 a 225

- [0217]** Los compuestos de la fórmula Ia.48 en la que R¹³ es como se ha definido en cualquiera de las tablas 162 a 177 y la combinación de R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y R⁴ para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

55

Tablas 226 a 235

- [0218]** Los compuestos de la fórmula Ia.49 en la que R⁸ es como se ha definido para R^{7a} en cualquiera de las

tablas 32 a 41 y la combinación de R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y R⁴ para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

Tablas 236 a 245

5

[0219] Los compuestos de la fórmula Ia.50 en la que R⁸ es como se ha definido para R^{7a} en cualquiera de las tablas 32 a 41 y la combinación de R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y R⁴ para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

10 Tablas 246 a 255

[0220] Los compuestos de la fórmula Ia.51 en la que R⁸ es como se ha definido para R^{7a} en cualquiera de las tablas 32 a 41 y la combinación de R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y R⁴ para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A.

15

Tablas 256 a 265

[0221] Los compuestos de la fórmula Ia.52 en la que R⁸ es como se ha definido para R^{7a} en cualquiera de las tablas 32 a 41 y la combinación de R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y R⁴ para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la

20 Tabla A.

Tabla A

N. ^o	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ⁴
A-1	F	H	F	H
A-2	F	F	F	H
A-3	F	Cl	F	H
A-4	F	Br	F	H
A-5	F	H	Cl	H
A-6	F	H	Br	H
A-7	Cl	H	Cl	H
A-8	Cl	Cl	Cl	H
A-9	Cl	F	Cl	H
A-10	Cl	Br	Cl	H
A-11	Cl	H	Br	H
A-12	Br	H	Br	H
A-13	Br	F	Br	H
A-14	Br	Cl	Br	H
A-15	CF ₃	H	F	H
A-16	CF ₃	H	Cl	H
A-17	CF ₃	H	Br	H
A-18	CF ₃	H	CF ₃	H
A-19	CF ₃	F	F	H
A-20	CF ₃	Cl	Cl	H
A-21	CF ₃	Br	Br	H
A-22	SF ₅	H	F	H
A-23	SF ₅	H	Cl	H
A-24	SF ₅	H	Br	H
A-25	SF ₅	H	CF ₃	H
A-26	SF ₅	H	H	H
A-27	CF ₃	H	H	H
A-28	Br	H	H	H
A-29	Cl	H	H	H
A-30	F	H	H	H
A-31	F	H	F	CH ₃
A-32	F	F	F	CH ₃
A-33	F	Cl	F	CH ₃
A-34	F	Br	F	CH ₃

A-35	F	H	Cl	CH ₃
A-36	F	H	Br	CH ₃
A-37	Cl	H	Cl	CH ₃
A-38	Cl	Cl	Cl	CH ₃
A-39	Cl	F	Cl	CH ₃
A-40	Cl	Br	Cl	CH ₃
A-41	Cl	H	Br	CH ₃
A-42	Br	H	Br	CH ₃
A-43	Br	F	Br	CH ₃
A-44	Br	Cl	Br	CH ₃
A-45	CF ₃	H	F	CH ₃
A-46	CF ₃	H	Cl	CH ₃
A-47	CF ₃	H	Br	CH ₃
A-48	CF ₃	H	CF ₃	CH ₃
A-49	CF ₃	F	F	CH ₃
A-50	CF ₃	Cl	Cl	CH ₃
A-51	CF ₃	Br	Br	CH ₃
A-52	SF ₅	H	F	CH ₃
A-53	SF ₅	H	Cl	CH ₃
A-54	SF ₅	H	Br	CH ₃
A-55	SF ₅	H	CF ₃	CH ₃
A-56	SF ₅	H	H	CH ₃
A-57	CF ₃	H	H	CH ₃
A-58	Br	H	H	CH ₃
A-59	Cl	H	H	CH ₃
A-60	F	H	H	CH ₃
A-61	F	H	F	CH ₂ CH ₃
A-62	F	F	F	CH ₂ CH ₃
A-63	F	Cl	F	CH ₂ CH ₃
A-64	F	Br	F	CH ₂ CH ₃
A-65	F	H	Cl	CH ₂ CH ₃
A-66	F	H	Br	CH ₂ CH ₃
A-67	Cl	H	Cl	CH ₂ CH ₃
A-68	Cl	Cl	Cl	CH ₂ CH ₃
A-69	Cl	F	Cl	CH ₂ CH ₃
A-70	Cl	Br	Cl	CH ₂ CH ₃
A-71	Cl	H	Br	CH ₂ CH ₃
A-72	Br	H	Br	CH ₂ CH ₃
A-73	Br	F	Br	CH ₂ CH ₃
A-74	Br	Cl	Br	CH ₂ CH ₃
A-75	CF ₃	H	F	CH ₂ CH ₃
A-76	CF ₃	H	Cl	CH ₂ CH ₃
A-77	CF ₃	H	Br	CH ₂ CH ₃
A-78	CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-79	CF ₃	F	F	CH ₂ CH ₃
A-80	CF ₃	Cl	Cl	CH ₂ CH ₃
A-81	CF ₃	Br	Br	CH ₂ CH ₃
A-82	SF ₅	H	F	CH ₂ CH ₃
A-83	SF ₅	H	Cl	CH ₂ CH ₃
A-84	SF ₅	H	Br	CH ₂ CH ₃
A-85	SF ₅	H	CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-86	SF ₅	H	H	CH ₂ CH ₃
A-87	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₃
A-88	Br	H	H	CH ₂ CH ₃
A-89	Cl	H	H	CH ₂ CH ₃
A-90	F	H	H	CH ₂ CH ₃

ES 2 688 893 T3

A-91	F	H	F	CH(CH ₃) ₂
A-92	F	F	F	CH(CH ₃) ₂
A-93	F	Cl	F	CH(CH ₃) ₂
A-94	F	Br	F	CH(CH ₃) ₂
A-95	F	H	Cl	CH(CH ₃) ₂
A-96	F	H	Br	CH(CH ₃) ₂
A-97	Cl	H	Cl	CH(CH ₃) ₂
A-98	Cl	Cl	Cl	CH(CH ₃) ₂
A-99	Cl	F	Cl	CH(CH ₃) ₂
A-100	Cl	Br	Cl	CH(CH ₃) ₂
A-101	Cl	H	Br	CH(CH ₃) ₂
A-102	Br	H	Br	CH(CH ₃) ₂
A-103	Br	F	Br	CH(CH ₃) ₂
A-104	Br	Cl	Br	CH(CH ₃) ₂
A-105	CF ₃	H	F	CH(CH ₃) ₂
A-106	CF ₃	H	Cl	CH(CH ₃) ₂
A-107	CF ₃	H	Br	CH(CH ₃) ₂
A-108	CF ₃	H	CF ₃	CH(CH ₃) ₂
A-109	CF ₃	F	F	CH(CH ₃) ₂
A-110	CF ₃	Cl	Cl	CH(CH ₃) ₂
A-111	CF ₃	Br	Br	CH(CH ₃) ₂
A-112	SF ₅	H	F	CH(CH ₃) ₂
A-113	SF ₅	H	Cl	CH(CH ₃) ₂
A-114	SF ₅	H	Br	CH(CH ₃) ₂
A-115	SF ₅	H	CF ₃	CH(CH ₃) ₂
A-116	SF ₅	H	H	CH(CH ₃) ₂
A-117	CF ₃	H	H	CH(CH ₃) ₂
A-118	Br	H	H	CH(CH ₃) ₂
A-119	Cl	H	H	CH(CH ₃) ₂
A-120	F	H	H	CH(CH ₃) ₂
A-121	F	H	F	CHF ₂
A-122	F	F	F	CHF ₂
A-123	F	Cl	F	CHF ₂
A-124	F	Br	F	CHF ₂
A-125	F	H	Cl	CHF ₂
A-126	F	H	Br	CHF ₂
A-127	Cl	H	Cl	CHF ₂
A-128	Cl	Cl	Cl	CHF ₂
A-129	Cl	F	Cl	CHF ₂
A-130	Cl	Br	Cl	CHF ₂
A-131	Cl	H	Br	CHF ₂
A-132	Br	H	Br	CHF ₂
A-133	Br	F	Br	CHF ₂
A-134	Br	Cl	Br	CHF ₂
A-135	CF ₃	H	F	CHF ₂
A-136	CF ₃	H	Cl	CHF ₂
A-137	CF ₃	H	Br	CHF ₂
A-138	CF ₃	H	CF ₃	CHF ₂
A-139	CF ₃	F	F	CHF ₂
A-140	CF ₃	Cl	Cl	CHF ₂
A-141	CF ₃	Br	Br	CHF ₂
A-142	SF ₅	H	F	CHF ₂
A-143	SF ₅	H	Cl	CHF ₂
A-144	SF ₅	H	Br	CHF ₂
A-145	SF ₅	H	CF ₃	CHF ₂
A-146	SF ₅	H	H	CHF ₂

A-147	CF ₃	H	H	CHF ₂
A-148	Br	H	H	CHF ₂
A-149	Cl	H	H	CHF ₂
A-150	F	H	H	CHF ₂
A-151	F	H	F	CF ₃
A-152	F	F	F	CF ₃
A-153	F	Cl	F	CF ₃
A-154	F	Br	F	CF ₃
A-155	F	H	Cl	CF ₃
A-156	F	H	Br	CF ₃
A-157	Cl	H	Cl	CF ₃
A-158	Cl	Cl	Cl	CF ₃
A-159	Cl	F	Cl	CF ₃
A-160	Cl	Br	Cl	CF ₃
A-161	Cl	H	Br	CF ₃
A-162	Br	H	Br	CF ₃
A-163	Br	F	Br	CF ₃
A-164	Br	Cl	Br	CF ₃
A-165	CF ₃	H	F	CF ₃
A-166	CF ₃	H	Cl	CF ₃
A-167	CF ₃	H	Br	CF ₃
A-168	CF ₃	H	CF ₃	CF ₃
A-169	CF ₃	F	F	CF ₃
A-170	CF ₃	Cl	Cl	CF ₃
A-171	CF ₃	Br	Br	CF ₃
A-172	SF ₅	H	F	CF ₃
A-173	SF ₅	H	Cl	CF ₃
A-174	SF ₅	H	Br	CF ₃
A-175	SF ₃	H	CF ₃	CF ₃
A-176	SF ₅	H	H	CF ₃
A-177	CF ₃	H	H	CF ₃
A-178	Br	H	H	CF ₃
A-179	Cl	H	H	CF ₃
A-180	F	H	H	CF ₃
A-181	F	H	F	CH ₂ -CH=CH ₂
A-182	F	F	F	CH ₂ -CH=CH ₂
A-183	F	Cl	F	CH ₂ -CH=CH ₂
A-184	F	Br	F	CH ₂ -CH=CH ₂
A-185	F	H	Cl	CH ₂ -CH=CH ₂
A-186	F	H	Br	CH ₂ -CH=CH ₂
A-187	Cl	H	Cl	CH ₂ -CH=CH ₂
A-188	Cl	Cl	Cl	CH ₂ -CH=CH ₂
A-189	Cl	F	Cl	CH ₂ -CH=CH ₂
A-190	Cl	Br	Cl	CH ₂ -CH=CH ₂
A-191	Cl	H	Br	CH ₂ -CH=CH ₂
A-192	Br	H	Br	CH ₂ -CH=CH ₂
A-193	Br	F	Br	CH ₂ -CH=CH ₂
A-194	Br	Cl	Br	CH ₂ -CH=CH ₂
A-195	CF ₃	H	F	CH ₂ -CH=CH ₂
A-196	CF ₃	H	Cl	CH ₂ -CH=CH ₂
A-197	CF ₃	H	Br	CH ₂ -CH=CH ₂
A-198	CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ -CH=CH ₂
A-199	CF ₃	F	F	CH ₂ -CH=CH ₂
A-200	CF ₃	Cl	Cl	CH ₂ -CH=CH ₂
A-201	CF ₃	Br	Br	CH ₂ -CH=CH ₂
A-202	SF ₅	H	F	CH ₂ -CH=CH ₂

ES 2 688 893 T3

A-203	SF ₅	H	Cl	CH ₂ -CH=CH ₂
A-204	SF ₅	H	Br	CH ₂ -CH=CH ₂
A-205	SF ₅	H	CF ₃	CH ₂ -CH=CH ₂
A-206	SF ₅	H	H	CH ₂ -CH=CH ₂
A-207	CF ₃	H	H	CH ₂ -CH=CH ₂
A-208	Br	H	H	CH ₂ -CH=CH ₂
A-209	Cl	H	H	CH ₂ -CH=CH ₂
A-210	F	H	H	CH ₂ -CH=CH ₂
A-211	F	H	F	CH=CH ₂
A-212	F	F	F	CH=CH ₂
A-213	F	Cl	F	CH=CH ₂
A-214	F	Br	F	CH=CH ₂
A-215	F	H	Cl	CH=CH ₂
A-216	F	H	Br	CH=CH ₂
A-217	Cl	H	Cl	CH=CH ₂
A-218	Cl	Cl	Cl	CH=CH ₂
A-219	Cl	F	Cl	CH=CH ₂
A-220	Cl	Br	Cl	CH=CH ₂
A-221	Cl	H	Br	CH=CH ₂
A-222	Br	H	Br	CH=CH ₂
A-223	Br	F	Br	CH=CH ₂
A-224	Br	Cl	Br	CH=CH ₂
A-225	CF ₃	H	F	CH=CH ₂
A-226	CF ₃	H	Cl	CH=CH ₂
A-227	CF ₃	H	Br	CH=CH ₂
A-228	CF ₃	H	CF ₃	CH=CH ₂
A-229	CF ₃	F	F	CH=CH ₂
A-230	CF ₃	Cl	Cl	CH=CH ₂
A-231	CF ₃	Br	Br	CH=CH ₂
A-232	SF ₅	H	F	CH=CH ₂
A-233	SF ₅	H	Cl	CH=CH ₂
A-234	SF ₅	H	Br	CH=CH ₂
A-235	SF ₅	H	CF ₃	CH=CH ₂
A-236	SF ₅	H	H	CH=CH ₂
A-237	CF ₃	H	H	CH=CH ₂
A-238	Br	H	H	CH=CH ₂
A-239	Cl	H	H	CH=CH ₂
A-240	F	H	H	CH=CH ₂
A-241	F	H	F	C≡CH
A-242	F	F	F	C≡CH
A-243	F	Cl	F	C≡CH
A-244	F	Br	F	C≡CH
A-245	F	H	Cl	C≡CH
A-246	F	H	Br	C≡CH
A-247	Cl	H	Cl	C≡CH
A-248	Cl	Cl	Cl	C≡CH
A-249	Cl	F	Cl	C≡CH
A-250	Cl	Br	Cl	C≡CH
A-251	Cl	H	Br	C≡CH
A-252	Br	H	Br	C≡CH
A-253	Br	F	Br	C≡CH
A-254	Br	Cl	Br	C≡CH
A-255	CF ₃	H	F	C≡CH
A-256	CF ₃	H	Cl	C≡CH
A-257	CF ₃	H	Br	C≡CH
A-258	CF ₃	H	CF ₃	C≡CH

A-259	CF ₃	F	F	C≡CH
A-260	CF ₃	Cl	Cl	C≡CH
A-261	CF ₃	Br	Br	C≡CH
A-262	SF ₅	H	F	C≡CH
A-263	SF ₅	H	Cl	C≡CH
A-264	SF ₅	H	Br	C≡CH
A-265	SF ₅	H	CF ₃	C≡CH
A-266	SF ₅	H	H	C≡CH
A-267	CF ₃	H	H	C≡CH
A-268	Br	H	H	C≡CH
A-269	Cl	H	H	C≡CH
A-270	F	H	H	C≡CH
A-271	F	H	F	^c C ₃ H ₅ *
A-272	F	F	F	^c C ₃ H ₅ *
A-273	F	Cl	F	^c C ₃ H ₅ *
A-274	F	Br	F	^c C ₃ H ₅ *
A-275	F	H	Cl	^c C ₃ H ₅ *
A-276	F	H	Br	^c C ₃ H ₅ *
A-277	Cl	H	Cl	^c C ₃ H ₅ *
A-278	Cl	Cl	Cl	^c C ₃ H ₅ *
A-279	Cl	F	Cl	^c C ₃ H ₅ *
A-280	Cl	Br	Cl	^c C ₃ H ₅ *
A-281	Cl	H	Br	^c C ₃ H ₅ *
A-282	Br	H	Br	^c C ₃ H ₅ *
A-283	Br	F	Br	^c C ₃ H ₅ *
A-284	Br	Cl	Br	^c C ₃ H ₅ *
A-285	CF ₃	H	F	^c C ₃ H ₅ *
A-286	CF ₃	H	Cl	^c C ₃ H ₅ *
A-287	CF ₃	H	Br	^c C ₃ H ₅ *
A-288	CF ₃	H	CF ₃	^c C ₃ H ₅ *
A-289	CF ₃	F	F	^c C ₃ H ₅ *
A-290	CF ₃	Cl	Cl	^c C ₃ H ₅ *
A-291	CF ₃	Br	Br	^c C ₃ H ₅ *
A-292	SF ₅	H	F	^c C ₃ H ₅ *
A-293	SF ₅	H	Cl	^c C ₃ H ₅ *
A-294	SF ₅	H	Br	^c C ₃ H ₅ *
A-295	SF ₅	H	CF ₃	^c C ₃ H ₅ *
A-296	SF ₅	H	H	^c C ₃ H ₅ *
A-297	CF ₃	H	H	^c C ₃ H ₅ *
A-298	Br	H	H	^c C ₃ H ₅ *
A-299	Cl	H	H	^c C ₃ H ₅ *
A-300	F	H	H	^c C ₃ H ₅ *
A-301	F	H	F	F
A-302	F	F	F	F
A-303	F	Cl	F	F
A-304	F	Br	F	F
A-305	F	H	Cl	F
A-306	F	H	Br	F
A-307	Cl	H	Cl	F
A-308	Cl	Cl	Cl	F
A-309	Cl	F	Cl	F
A-310	Cl	Br	Cl	F
A-311	Cl	H	Br	F
A-312	Br	H	Br	F
A-313	Br	F	Br	F
A-314	Br	Cl	Br	F

ES 2 688 893 T3

A-315	CF ₃	H	F	F
A-316	CF ₃	H	Cl	F
A-317	CF ₃	H	Br	F
A-318	CF ₃	H	CF ₃	F
A-319	CF ₃	F	F	F
A-320	CF ₃	Cl	Cl	F
A-321	CF ₃	Br	Br	F
A-322	SF ₅	H	F	F
A-323	SF ₅	H	Cl	F
A-324	SF ₅	H	Br	F
A-325	SF ₅	H	CF ₃	F
A-326	SF ₅	H	H	F
A-327	CF ₃	H	H	F
A-328	Br	H	H	F
A-329	Cl	H	H	F
A-330	F	H	H	F
A-331	F	H	F	Cl
A-332	F	F	F	Cl
A-333	F	Cl	F	Cl
A-334	F	Br	F	Cl
A-335	F	H	Cl	Cl
A-336	F	H	Br	Cl
A-337	Cl	H	Cl	Cl
A-338	Cl	Cl	Cl	Cl
A-339	Cl	F	Cl	Cl
A-340	Cl	Br	Cl	Cl
A-341	Cl	H	Br	Cl
A-342	Br	H	Br	Cl
A-343	Br	F	Br	Cl
A-344	Br	Cl	Br	Cl
A-345	CF ₃	H	F	Cl
A-346	CF ₃	H	Cl	Cl
A-347	CF ₃	H	Br	Cl
A-348	CF ₃	H	CF ₃	Cl
A-349	CF ₃	F	F	Cl
A-350	CF ₃	Cl	Cl	Cl
A-351	CF ₃	Br	Br	Cl
A-352	SF ₅	H	F	Cl
A-353	SF ₅	H	Cl	Cl
A-354	SF ₅	H	Br	Cl
A-355	SF ₅	H	CF ₃	Cl
A-356	SF ₅	H	H	Cl
A-357	CF ₃	H	H	Cl
A-358	Br	H	H	Cl
A-359	Cl	H	H	Cl
A-360	F	H	H	Cl
A-361	F	H	F	Br
A-362	F	F	F	Br
A-363	F	Cl	F	Br
A-364	F	Br	F	Br
A-365	F	H	Cl	Br
A-366	F	H	Br	Br
A-367	Cl	H	Cl	Br
A-368	Cl	Cl	Cl	Br
A-369	Cl	F	Cl	Br
A-370	Cl	Br	Cl	Br

ES 2 688 893 T3

A-371	Cl	H	Br	Br
A-372	Br	H	Br	Br
A-373	Br	F	Br	Br
A-374	Br	Cl	Br	Br
A-375	CF ₃	H	F	Br
A-376	CF ₃	H	Cl	Br
A-377	CF ₃	H	Br	Br
A-378	CF ₃	H	CF ₃	Br
A-379	CF ₃	F	F	Br
A-380	CF ₃	Cl	Cl	Br
A-381	CF ₃	Br	Br	Br
A-382	SF ₅	H	F	Br
A-383	SF ₅	H	Cl	Br
A-384	SF ₅	H	Br	Br
A-385	SF ₅	H	CF ₃	Br
A-386	SF ₅	H	H	Br
A-387	CF ₃	H	H	Br
A-388	Br	H	H	Br
A-389	Cl	H	H	Br
A-390	F	H	H	Br
A-391	F	H	F	CN
A-392	F	F	F	CN
A-393	F	Cl	F	CN
A-394	F	Br	F	CN
A-395	F	H	Cl	CN
A-396	F	H	Br	CN
A-397	Cl	H	Cl	CN
A-398	Cl	Cl	Cl	CN
A-399	Cl	F	Cl	CN
A-400	Cl	Br	Cl	CN
A-401	Cl	H	Br	CN
A-402	Br	H	Br	CN
A-403	Br	F	Br	CN
A-404	Br	Cl	Br	CN
A-405	CF ₃	H	F	CN
A-406	CF ₃	H	Cl	CN
A-407	CF ₃	H	Br	CN
A-408	CF ₃	H	CF ₃	CN
A-409	CF ₃	F	F	CN
A-410	CF ₃	Cl	Cl	CN
A-411	CF ₃	Br	Br	CN
A-412	SF ₅	H	F	CN
A-413	SF ₅	H	Cl	CN
A-414	SF ₅	H	Br	CN
A-415	SF ₅	H	CF ₃	CN
A-416	SF ₅	H	H	CN
A-417	CF ₃	H	H	CN
A-418	Br	H	H	CN
A-419	Cl	H	H	CN
A-420	F	H	H	CN
A-421	F	H	F	OCH ₃
A-422	F	F	F	OCH ₃
A-423	F	Cl	F	OCH ₃
A-424	F	Br	F	OCH ₃
A-425	F	H	Cl	OCH ₃
A-426	F	H	Br	OCH ₃

A-427	Cl	H	Cl	OCH ₃
A-428	Cl	Cl	Cl	OCH ₃
A-429	Cl	F	Cl	OCH ₃
A-430	Cl	Br	Cl	OCH ₃
A-431	Cl	H	Br	OCH ₃
A-432	Br	H	Br	OCH ₃
A-433	Br	F	Br	OCH ₃
A-434	Br	Cl	Br	OCH ₃
A-435	CF ₃	H	F	OCH ₃
A-436	CF ₃	H	Cl	OCH ₃
A-437	CF ₃	H	Br	OCH ₃
A-438	CF ₃	H	CF ₃	OCH ₃
A-439	CF ₃	F	F	OCH ₃
A-440	CF ₃	Cl	Cl	OCH ₃
A-441	CF ₃	Br	Br	OCH ₃
A-442	SF ₅	H	F	OCH ₃
A-443	SF ₅	H	Cl	OCH ₃
A-444	SF ₅	H	Br	OCH ₃
A-445	SF ₅	H	CF ₃	OCH ₃
A-446	SF ₅	H	H	OCH ₃
A-447	CF ₃	H	H	OCH ₃
A-448	Br	H	H	OCH ₃
A-449	Cl	H	H	OCH ₃
A-450	F	H	H	OCH ₃
A-451	F	H	F	OCH ₂ CH ₃
A-452	F	F	F	OCH ₂ CH ₃
A-453	F	Cl	F	OCH ₂ CH ₃
A-454	F	Br	F	OCH ₂ CH ₃
A-455	F	H	Cl	OCH ₂ CH ₃
A-456	F	H	Br	OCH ₂ CH ₃
A-457	Cl	H	Cl	OCH ₂ CH ₃
A-458	Cl	Cl	Cl	OCH ₂ CH ₃
A-459	Cl	F	Cl	OCH ₂ CH ₃
A-460	Cl	Br	Cl	OCH ₂ CH ₃
A-461	Cl	H	Br	OCH ₂ CH ₃
A-462	Br	H	Br	OCH ₂ CH ₃
A-463	Br	F	Br	OCH ₂ CH ₃
A-464	Br	Cl	Br	OCH ₂ CH ₃
A-465	CF ₃	H	F	OCH ₂ CH ₃
A-466	CF ₃	H	Cl	OCH ₂ CH ₃
A-467	CF ₃	H	Br	OCH ₂ CH ₃
A-468	CF ₃	H	CF ₃	OCH ₂ CH ₃
A-469	CF ₃	F	F	OCH ₂ CH ₃
A-470	CF ₃	Cl	Cl	OCH ₂ CH ₃
A-471	CF ₃	Br	Br	OCH ₂ CH ₃
A-472	SF ₅	H	F	OCH ₂ CH ₃
A-473	SF ₅	H	Cl	OCH ₂ CH ₃
A-474	SF ₅	H	Br	OCH ₂ CH ₃
A-475	SF ₅	H	CF ₃	OCH ₂ CH ₃
A-476	SF ₅	H	H	OCH ₂ CH ₃
A-477	CF ₃	H	H	OCH ₂ CH ₃
A-478	Br	H	H	OCH ₂ CH ₃
A-479	Cl	H	H	OCH ₂ CH ₃
A-480	F	H	H	OCH ₂ CH ₃
A-481	F	H	F	OCH(CH ₃) ₂
A-482	F	F	F	OCH(CH ₃) ₂

ES 2 688 893 T3

A-483	F	Cl	F	OCH(CH ₃) ₂
A-484	F	Br	F	OCH(CH ₃) ₂
A-485	F	H	Cl	OCH(CH ₃) ₂
A-486	F	H	Br	OCH(CH ₃) ₂
A-487	Cl	H	Cl	OCH(CH ₃) ₂
A-488	Cl	Cl	Cl	OCH(CH ₃) ₂
A-489	Cl	F	Cl	OCH(CH ₃) ₂
A-490	Cl	Br	Cl	OCH(CH ₃) ₂
A-491	Cl	H	Br	OCH(CH ₃) ₂
A-492	Br	H	Br	OCH(CH ₃) ₂
A-493	Br	F	Br	OCH(CH ₃) ₂
A-494	Br	Cl	Br	OCH(CH ₃) ₂
A-495	CF ₃	H	F	OCH(CH ₃) ₂
A-496	CF ₃	H	Cl	OCH(CH ₃) ₂
A-497	CF ₃	H	Br	OCH(CH ₃) ₂
A-498	CF ₃	H	CF ₃	OCH(CH ₃) ₂
A-499	CF ₃	F	F	OCH(CH ₃) ₂
A-500	CF ₃	Cl	Cl	OCH(CH ₃) ₂
A-501	CF ₃	Br	Br	OCH(CH ₃) ₂
A-502	SF ₅	H	F	OCH(CH ₃) ₂
A-503	SF ₅	H	Cl	OCH(CH ₃) ₂
A-504	SF ₅	H	Br	OCH(CH ₃) ₂
A-505	SF ₅	H	CF ₃	OCH(CH ₃) ₂
A-506	SF ₅	H	H	OCH(CH ₃) ₂
A-507	CF ₃	H	H	OCH(CH ₃) ₂
A-508	Br	H	H	OCH(CH ₃) ₂
A-509	Cl	H	H	OCH(CH ₃) ₂
A-510	F	H	H	OCH(CH ₃) ₂
A-511	F	H	F	OCH ₂ CH=CH ₂
A-512	F	F	F	OCH ₂ CH=CH ₂
A-513	F	Cl	F	OCH ₂ CH=CH ₂
A-514	F	Br	F	OCH ₂ CH=CH ₂
A-515	F	H	Cl	OCH ₂ CH=CH ₂
A-516	F	H	Br	OCH ₂ CH=CH ₂
A-517	Cl	H	Cl	OCH ₂ CH=CH ₂
A-518	Cl	Cl	Cl	OCH ₂ CH=CH ₂
A-519	Cl	F	Cl	OCH ₂ CH=CH ₂
A-520	Cl	Br	Cl	OCH ₂ CH=CH ₂
A-521	Cl	H	Br	OCH ₂ CH=CH ₂
A-522	Br	H	Br	OCH ₂ CH=CH ₂
A-523	Br	F	Br	OCH ₂ CH=CH ₂
A-524	Br	Cl	Br	OCH ₂ CH=CH ₂
A-525	CF ₃	H	F	OCH ₂ CH=CH ₂
A-526	CF ₃	H	Cl	OCH ₂ CH=CH ₂
A-527	CF ₃	H	Br	OCH ₂ CH=CH ₂
A-528	CF ₃	H	CF ₃	OCH ₂ CH=CH ₂
A-529	CF ₃	F	F	OCH ₂ CH=CH ₂
A-530	CF ₃	Cl	Cl	OCH ₂ CH=CH ₂
A-531	CF ₃	Br	Br	OCH ₂ CH=CH ₂
A-532	SF ₅	H	F	OCH ₂ CH=CH ₂
A-533	SF ₅	H	Cl	OCH ₂ CH=CH ₂
A-534	SF ₅	H	Br	OCH ₂ CH=CH ₂
A-535	SF ₅	H	CF ₃	OCH ₂ CH=CH ₂
A-536	SF ₅	H	H	OCH ₂ CH=CH ₂
A-537	CF ₃	H	H	OCH ₂ CH=CH ₂
A-538	Br	H	H	OCH ₂ CH=CH ₂

A-539	Cl	H	H	OCH ₂ CH=CH ₂
A-540	F	H	H	OCH ₂ CH=CH ₂
A-541	F	H	F	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-542	F	F	F	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-543	F	Cl	F	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-544	F	Br	F	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-545	F	H	Cl	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-546	F	H	Br	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-547	Cl	H	Cl	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-548	Cl	Cl	Cl	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-549	Cl	F	Cl	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-550	Cl	Br	Cl	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-551	Cl	H	Br	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-552	Br	H	Br	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-553	Br	F	Br	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-554	Br	Cl	Br	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-555	CF ₃	H	F	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-556	CF ₃	H	Cl	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-557	CF ₃	H	Br	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-558	CF ₃	H	CF ₃	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-559	CF ₃	F	F	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-560	CF ₃	Cl	Cl	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-561	CF ₃	Br	Br	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-562	SF ₅	H	F	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-563	SF ₅	H	Cl	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-564	SF ₅	H	Br	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-565	SF ₅	H	CF ₃	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-566	SF ₅	H	H	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-567	CF ₃	H	H	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-568	Br	H	H	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-569	Cl	H	H	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-570	F	H	H	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-571	F	H	F	OCHF ₂
A-572	F	F	F	OCHF ₂
A-573	F	Cl	F	OCHF ₂
A-574	F	Br	F	OCHF ₂
A-575	F	H	Cl	OCHF ₂
A-576	F	H	Br	OCHF ₂
A-577	Cl	H	Cl	OCHF ₂
A-578	Cl	Cl	Cl	OCHF ₂
A-579	Cl	F	Cl	OCHF ₂
A-580	Cl	Br	Cl	OCHF ₂
A-581	Cl	H	Br	OCHF ₂
A-582	Br	H	Br	OCHF ₂
A-583	Br	F	Br	OCHF ₂
A-584	Br	Cl	Br	OCHF ₂
A-585	CF ₃	H	F	OCHF ₂
A-586	CF ₃	H	Cl	OCHF ₂
A-587	CF ₃	H	Br	OCHF ₂
A-588	CF ₃	H	CF ₃	OCHF ₂
A-589	CF ₃	F	F	OCHF ₂
A-590	CF ₃	Cl	Cl	OCHF ₂
A-591	CF ₃	Br	Br	OCHF ₂
A-592	SF ₅	H	F	OCHF ₂
A-593	SF ₅	H	Cl	OCHF ₂
A-594	SF ₅	H	Br	OCHF ₂

A-595	SF ₅	H	CF ₃	OCHF ₂
A-596	SF ₅	H	H	OCHF ₂
A-597	CF ₃	H	H	OCHF ₂
A-598	Br	H	H	OCHF ₂
A-599	Cl	H	H	OCHF ₂
A-600	F	H	H	OCHF ₂
A-601	F	H	F	OCF ₃
A-602	F	F	F	OCF ₃
A-603	F	Cl	F	OCF ₃
A-604	F	Br	F	OCF ₃
A-605	F	H	Cl	OCF ₃
A-606	F	H	Br	OCF ₃
A-607	Cl	H	Cl	OCF ₃
A-608	Cl	Cl	Cl	OCF ₃
A-609	Cl	F	Cl	OCF ₃
A-610	Cl	Br	Cl	OCF ₃
A-611	Cl	H	Br	OCF ₃
A-612	Br	H	Br	OCF ₃
A-613	Br	F	Br	OCF ₃
A-614	Br	Cl	Br	OCF ₃
A-615	CF ₃	H	F	OCF ₃
A-616	CF ₃	H	Cl	OCF ₃
A-617	CF ₃	H	Br	OCF ₃
A-618	CF ₃	H	CF ₃	OCF ₃
A-619	CF ₃	F	F	OCF ₃
A-620	CF ₃	Cl	Cl	OCF ₃
A-621	CF ₃	Br	Br	OCF ₃
A-622	SF ₅	H	F	OCF ₃
A-623	SF ₅	H	Cl	OCF ₃
A-624	SF ₅	H	Br	OCF ₃
A-625	SF ₅	H	CF ₃	OCF ₃
A-626	SF ₅	H	H	OCF ₃
A-627	CF ₃	H	H	OCF ₃
A-628	Br	H	H	OCF ₃
A-629	Cl	H	H	OCF ₃
A-630	F	H	H	OCF ₃
A-631	F	H	F	OCH ₂ CF ₃
A-632	F	F	F	OCH ₂ CF ₃
A-633	F	Cl	F	OCH ₂ CF ₃
A-634	F	Br	F	OCH ₂ CF ₃
A-635	F	H	Cl	OCH ₂ CF ₃
A-636	F	H	Br	OCH ₂ CF ₃
A-637	Cl	H	Cl	OCH ₂ CF ₃
A-638	Cl	Cl	Cl	OCH ₂ CF ₃
A-639	Cl	F	Cl	OCH ₂ CF ₃
A-640	Cl	Br	Cl	OCH ₂ CF ₃
A-641	Cl	H	Br	OCH ₂ CF ₃
A-642	Br	H	Br	OCH ₂ CF ₃
A-643	Br	F	Br	OCH ₂ CF ₃
A-644	Br	Cl	Br	OCH ₂ CF ₃
A-645	CF ₃	H	F	OCH ₂ CF ₃
A-646	CF ₃	H	Cl	OCH ₂ CF ₃
A-647	CF ₃	H	Br	OCH ₂ CF ₃
A-648	CF ₃	H	CF ₃	OCH ₂ CF ₃
A-649	CF ₃	F	F	OCH ₂ CF ₃
A-650	CF ₃	Cl	Cl	OCH ₂ CF ₃

A-651	CF ₃	Br	Br	OCH ₂ CF ₃
A-652	SF ₅	H	F	OCH ₂ CF ₃
A-653	SF ₅	H	Cl	OCH ₂ CF ₃
A-654	SF ₅	H	Br	OCH ₂ CF ₃
A-655	SF ₅	H	CF ₃	OCH ₂ CF ₃
A-656	SF ₅	H	H	OCH ₂ CF ₃
A-657	CF ₃	H	H	OCH ₂ CF ₃
A-658	Br	H	H	OCH ₂ CF ₃
A-659	Cl	H	H	OCH ₂ CF ₃
A-660	F	H	H	OCH ₂ CF ₃
A-661	F	H	F	SCH ₃
A-662	F	F	F	SCH ₃
A-663	F	Cl	F	SCH ₃
A-664	F	Br	F	SCH ₃
A-665	F	H	Cl	SCH ₃
A-666	F	H	Br	SCH ₃
A-667	Cl	H	Cl	SCH ₃
A-668	Cl	Cl	Cl	SCH ₃
A-669	Cl	F	Cl	SCH ₃
A-670	Cl	Br	Cl	SCH ₃
A-671	Cl	H	Br	SCH ₃
A-672	Br	H	Br	SCH ₃
A-673	Br	F	Br	SCH ₃
A-674	Br	Cl	Br	SCH ₃
A-675	CF ₃	H	F	SCH ₃
A-676	CF ₃	H	Cl	SCH ₃
A-677	CF ₃	H	Br	SCH ₃
A-678	CF ₃	H	CF ₃	SCH ₃
A-679	CF ₃	F	F	SCH ₃
A-680	CF ₃	Cl	Cl	SCH ₃
A-681	CF ₃	Br	Br	SCH ₃
A-682	SF ₅	H	F	SCH ₃
A-683	SF ₅	H	Cl	SCH ₃
A-684	SF ₅	H	Br	SCH ₃
A-685	SF ₅	H	CF ₃	SCH ₃
A-686	SF ₅	H	H	SCH ₃
A-687	CF ₃	H	H	SCH ₃
A-688	Br	H	H	SCH ₃
A-689	Cl	H	H	SCH ₃
A-690	F	H	H	SCH ₃
A-691	F	H	F	SCH ₂ CH ₃
A-692	F	F	F	SCH ₂ CH ₃
A-693	F	Cl	F	SCH ₂ CH ₃
A-694	F	Br	F	SCH ₂ CH ₃
A-695	F	H	Cl	SCH ₂ CH ₃
A-696	F	H	Br	SCH ₂ CH ₃
A-697	Cl	H	Cl	SCH ₂ CH ₃
A-698	Cl	Cl	Cl	SCH ₂ CH ₃
A-699	Cl	F	Cl	SCH ₂ CH ₃
A-700	Cl	Br	Cl	SCH ₂ CH ₃
A-701	Cl	H	Br	SCH ₂ CH ₃
A-702	Br	H	Br	SCH ₂ CH ₃
A-703	Br	F	Br	SCH ₂ CH ₃
A-704	Br	Cl	Br	SCH ₂ CH ₃
A-705	CF ₃	H	F	SCH ₂ CH ₃
A-706	CF ₃	H	Cl	SCH ₂ CH ₃

A-707	CF ₃	H	Br	SCH ₂ CH ₃
A-708	CF ₃	H	CF ₃	SCH ₂ CH ₃
A-709	CF ₃	F	F	SCH ₂ CH ₃
A-710	CF ₃	Cl	Cl	SCH ₂ CH ₃
A-711	CF ₃	Br	Br	SCH ₂ CH ₃
A-712	SF ₅	H	F	SCH ₂ CH ₃
A-713	SF ₅	H	Cl	SCH ₂ CH ₃
A-714	SF ₅	H	Br	SCH ₂ CH ₃
A-715	SF ₅	H	CF ₃	SCH ₂ CH ₃
A-716	SF ₅	H	H	SCH ₂ CH ₃
A-717	CF ₃	H	H	SCH ₂ CH ₃
A-718	Br	H	H	SCH ₂ CH ₃
A-719	Cl	H	H	SCH ₂ CH ₃
A-720	F	H	H	SCH ₂ CH ₃
A-721	F	H	F	SCH(CH ₃) ₂
A-722	F	F	F	SCH(CH ₃) ₂
A-723	F	Cl	F	SCH(CH ₃) ₂
A-724	F	Br	F	SCH(CH ₃) ₂
A-725	F	H	Cl	SCH(CH ₃) ₂
A-726	F	H	Br	SCH(CH ₃) ₂
A-727	Cl	H	Cl	SCH(CH ₃) ₂
A-728	Cl	Cl	Cl	SCH(CH ₃) ₂
A-729	Cl	F	Cl	SCH(CH ₃) ₂
A-730	Cl	Br	Cl	SCH(CH ₃) ₂
A-731	Cl	H	Br	SCH(CH ₃) ₂
A-732	Br	H	Br	SCH(CH ₃) ₂
A-733	Br	F	Br	SCH(CH ₃) ₂
A-734	Br	Cl	Br	SCH(CH ₃) ₂
A-735	CF ₃	H	F	SCH(CH ₃) ₂
A-736	CF ₃	H	Cl	SCH(CH ₃) ₂
A-737	CF ₃	H	Br	SCH(CH ₃) ₂
A-738	CF ₃	H	CF ₃	SCH(CH ₃) ₂
A-739	CF ₃	F	F	SCH(CH ₃) ₂
A-740	CF ₃	Cl	Cl	SCH(CH ₃) ₂
A-741	CF ₃	Br	Br	SCH(CH ₃) ₂
A-742	SF ₅	H	F	SCH(CH ₃) ₂
A-743	SF ₅	H	Cl	SCH(CH ₃) ₂
A-744	SF ₅	H	Br	SCH(CH ₃) ₂
A-745	SF ₅	H	CF ₃	SCH(CH ₃) ₂
A-746	SF ₅	H	H	SCH(CH ₃) ₂
A-747	CF ₃	H	H	SCH(CH ₃) ₂
A-748	Br	H	H	SCH(CH ₃) ₂
A-749	Cl	H	H	SCH(CH ₃) ₂
A-750	F	H	H	SCH(CH ₃) ₂
A-751	F	H	F	SCH ₂ CH=CH ₂
A-752	F	F	F	SCH ₂ CH=CH ₂
A-753	F	Cl	F	SCH ₂ CH=CH ₂
A-754	F	Br	F	SCH ₂ CH=CH ₂
A-755	F	H	Cl	SCH ₂ CH=CH ₂
A-756	F	H	Br	SCH ₂ CH=CH ₂
A-757	Cl	H	Cl	SCH ₂ CH=CH ₂
A-758	Cl	Cl	Cl	SCH ₂ CH=CH ₂
A-759	Cl	F	Cl	SCH ₂ CH=CH ₂
A-760	Cl	Br	Cl	SCH ₂ CH=CH ₂
A-761	Cl	H	Br	SCH ₂ CH=CH ₂
A-762	Br	H	Br	SCH ₂ CH=CH ₂

A-763	Br	F	Br	SCH ₂ CH=CH ₂
A-764	Br	Cl	Br	SCH ₂ CH=CH ₂
A-765	CF ₃	H	F	SCH ₂ CH=CH ₂
A-766	CF ₃	H	Cl	SCH ₂ CH=CH ₂
A-767	CF ₃	H	Br	SCH ₂ CH=CH ₂
A-768	CF ₃	H	CF ₃	SCH ₂ CH=CH ₂
A-769	CF ₃	F	F	SCH ₂ CH=CH ₂
A-770	CF ₃	Cl	Cl	SCH ₂ CH=CH ₂
A-771	CF ₃	Br	Br	SCH ₂ CH=CH ₂
A-772	SF ₅	H	F	SCH ₂ CH=CH ₂
A-773	SF ₅	H	Cl	SCH ₂ CH=CH ₂
A-774	SF ₅	H	Br	SCH ₂ CH=CH ₂
A-775	SF ₅	H	CF ₃	SCH ₂ CH=CH ₂
A-776	SF ₅	H	H	SCH ₂ CH=CH ₂
A-777	CF ₃	H	H	SCH ₂ CH=CH ₂
A-778	Br	H	H	SCH ₂ CH=CH ₂
A-779	Cl	H	H	SCH ₂ CH=CH ₂
A-780	F	H	H	SCH ₂ CH=CH ₂
A-781	F	H	F	S- ^c C ₃ H ₅ *
A-782	F	F	F	S- ^c C ₃ H ₅ *
A-783	F	Cl	F	S- ^c C ₃ H ₅ *
A-784	F	Br	F	S- ^c C ₃ H ₅ *
A-785	F	H	Cl	S- ^c C ₃ H ₅ *
A-786	F	H	Br	S- ^c C ₃ H ₅ *
A-787	Cl	H	Cl	S- ^c C ₃ H ₅ *
A-788	Cl	Cl	Cl	S- ^c C ₃ H ₅ *
A-789	Cl	F	Cl	S- ^c C ₃ H ₅ *
A-790	Cl	Br	Cl	S- ^c C ₃ H ₅ *
A-791	Cl	H	Br	S- ^c C ₃ H ₅ *
A-792	Br	H	Br	S- ^c C ₃ H ₅ *
A-793	Br	F	Br	S- ^c C ₃ H ₅ *
A-794	Br	Cl	Br	S- ^c C ₃ H ₅ *
A-795	CF ₃	H	F	S- ^c C ₃ H ₅ *
A-796	CF ₃	H	Cl	S- ^c C ₃ H ₅ *
A-797	CF ₃	H	Br	S- ^c C ₃ H ₅ *
A-798	CF ₃	H	CF ₃	S- ^c C ₃ H ₅ *
A-799	CF ₃	F	F	S- ^c C ₃ H ₅ *
A-800	CF ₃	Cl	Cl	S- ^c C ₃ H ₅ *
A-801	CF ₃	Br	Br	S- ^c C ₃ H ₅ *
A-802	SF ₅	H	F	S- ^c C ₃ H ₅ *
A-803	SF ₅	H	Cl	S- ^c C ₃ H ₅ *
A-804	SF ₅	H	Br	S- ^c C ₃ H ₅ *
A-805	SF ₅	H	CF ₃	S- ^c C ₃ H ₅ *
A-806	SF ₅	H	H	S- ^c C ₃ H ₅ *
A-807	CF ₃	H	H	S- ^c C ₃ H ₅ *
A-808	Br	H	H	S- ^c C ₃ H ₅ *
A-809	Cl	H	H	S- ^c C ₃ H ₅ *
A-810	F	H	H	S- ^c C ₃ H ₅ *
A-811	F	H	F	SCF ₃
A-812	F	F	F	SCF ₃
A-813	F	Cl	F	SCF ₃
A-814	F	Br	F	SCF ₃
A-815	F	H	Cl	SCF ₃
A-816	F	H	Br	SCF ₃
A-817	Cl	H	Cl	SCF ₃
A-818	Cl	Cl	Cl	SCF ₃

A-819	Cl	F	Cl	SCF ₃
A-820	Cl	Br	Cl	SCF ₃
A-821	Cl	H	Br	SCF ₃
A-822	Br	H	Br	SCF ₃
A-823	Br	F	Br	SCF ₃
A-824	Br	Cl	Br	SCF ₃
A-825	CF ₃	H	F	SCF ₃
A-826	CF ₃	H	Cl	SCF ₃
A-827	CF ₃	H	Br	SCF ₃
A-828	CF ₃	H	CF ₃	SCF ₃
A-829	CF ₃	F	F	SCF ₃
A-830	CF ₃	Cl	Cl	SCF ₃
A-831	CF ₃	Br	Br	SCF ₃
A-832	SF ₅	H	F	SCF ₃
A-833	SF ₅	H	Cl	SCF ₃
A-834	SF ₅	H	Br	SCF ₃
A-835	SF ₅	H	CF ₃	SCF ₃
A-836	SF ₅	H	H	SCF ₃
A-837	CF ₃	H	H	SCF ₃
A-838	Br	H	H	SCF ₃
A-839	Cl	H	H	SCF ₃
A-840	F	H	H	SCF ₃
A-841	F	H	F	SCH ₂ CF ₃
A-842	F	F	F	SCH ₂ CF ₃
A-843	F	Cl	F	SCH ₂ CF ₃
A-844	F	Br	F	SCH ₂ CF ₃
A-845	F	H	Cl	SCH ₂ CF ₃
A-846	F	H	Br	SCH ₂ CF ₃
A-847	Cl	H	Cl	SCH ₂ CF ₃
A-848	Cl	Cl	Cl	SCH ₂ CF ₃
A-849	Cl	F	Cl	SCH ₂ CF ₃
A-850	Cl	Br	Cl	SCH ₂ CF ₃
A-851	Cl	H	Br	SCH ₂ CF ₃
A-852	Br	H	Br	SCH ₂ CF ₃
A-853	Br	F	Br	SCH ₂ CF ₃
A-854	Br	Cl	Br	SCH ₂ CF ₃
A-855	CF ₃	H	F	SCH ₂ CF ₃
A-856	CF ₃	H	Cl	SCH ₂ CF ₃
A-857	CF ₃	H	Br	SCH ₂ CF ₃
A-858	CF ₃	H	CF ₃	SCH ₂ CF ₃
A-859	CF ₃	F	F	SCH ₂ CF ₃
A-860	CF ₃	Cl	Cl	SCH ₂ CF ₃
A-861	CF ₃	Br	Br	SCH ₂ CF ₃
A-862	SF ₅	H	F	SCH ₂ CF ₃
A-863	SF ₅	H	Cl	SCH ₂ CF ₃
A-864	SF ₅	H	Br	SCH ₂ CF ₃
A-865	SF ₅	H	CF ₃	SCH ₂ CF ₃
A-866	SF ₅	H	H	SCH ₂ CF ₃
A-867	CF ₃	H	H	SCH ₂ CF ₃
A-868	Br	H	H	SCH ₂ CF ₃
A-869	Cl	H	H	SCH ₂ CF ₃
A-870	F	H	H	SCH ₂ CF ₃

* ^c C₃H₅ = ciclopropilo

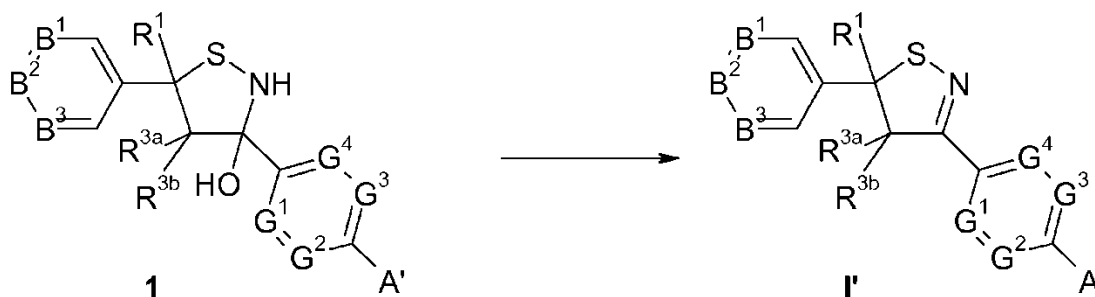
[0222] Entre los compuestos anteriores, se da preferencia a los compuestos de fórmula la.2, la.3, la.10, la.11, la.12, la.13 y la.14.

[0223] Los compuestos de la fórmula I se pueden preparar mediante los métodos que se describen en los esquemas siguientes o en las descripciones de síntesis o en las descripciones de síntesis de los ejemplos de trabajo o mediante métodos convencionales de química orgánica. Los sustituyentes, las variables y los índices son como se han definido anteriormente para la fórmula I, si no se especifica lo contrario.

[0224] Los compuestos de fórmula I se pueden preparar deshidratando un compuesto de fórmula 1 como se muestra en el esquema 1 a continuación. A' es A o un precursor de A, en el que A es un grupo C(=W)N(R⁵R⁶) y W, R⁵ y R⁶ son como se han definido anteriormente. Precursores típicos de A son un átomo de halógeno, CN, carboxi, 10 terc-butoxicarbonilo, un grupo acetal, un grupo aldehído protegido o -OSO₂-R^{z1}, donde R^{z1} es alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ o fenilo que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 radicales seleccionados entre alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄. Los compuestos I corresponden a los compuestos I cuando A' es A. La deshidratación se produce espontáneamente o con la ayuda de agentes deshidratantes, como tamices moleculares, tamices moleculares lavados con ácido, sulfato de magnesio, sulfato de sodio, gel de sílice, SOCl₂, 15 POCl₃, reactivo de Burgess, anhídrido trifluoroacético, ácido p-toluenosulfónico, HCl anhidro o ácido sulfúrico. Preferiblemente, se usan el ácido p-toluenosulfónico o tamices moleculares lavados con ácido. El agua formada como alternativa puede eliminarse, por ejemplo, por destilación azeotrópica, por ejemplo, con benceno/tolueno como agente de arrastre, por ejemplo, usando una trampa Dean Stark. Si es necesario (es decir, si A' es un precursor de A), A' se convierte en un grupo A.

20

Esquema 1



[0225] Los compuestos 1 en los que R^{3b} es hidrógeno pueden prepararse haciendo reaccionar un compuesto 25 3 con un agente de aminación para dar un compuesto de fórmula 2, que reacciona espontáneamente al compuesto 1, como se muestra en el esquema 2. Dependiendo de los agentes de aminación utilizados, la aminación se puede llevar a cabo en una reacción de una etapa, donde el compuesto 3 reacciona directamente al compuesto 2, o como una reacción de dos etapas, donde el grupo SH del compuesto 3 se oxida primero a un grupo S-Cl, que a continuación reacciona a un grupo S-NH₂, dando así el compuesto 2.

30

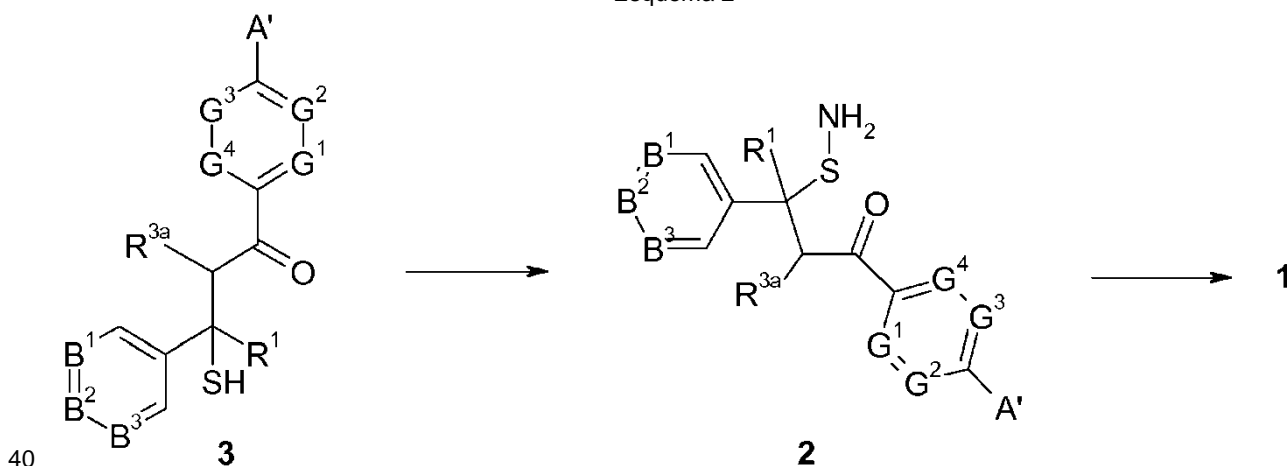
[0226] Agentes de aminación adecuados para la reacción de una etapa son, por ejemplo, HOSA (ácido hidroxilamina-O-sulfónico), que se usa generalmente en presencia de una base (bases adecuadas que son, por ejemplo, hidrogenofosfato de sodio, hidrogenofosfato de potasio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, metanolato de sodio, trietilamina y similares), O-(difenilfosforil) hidroxilamina, que 35 generalmente también se usa en presencia de una base (bases adecuadas que son, por ejemplo, hidrogenofosfato de sodio, hidrogenofosfato de potasio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, metanolato de sodio, trietilamina y similares), 2,4-dinitrofenilhidroxilamina, O-mesitilensulfonilhidroxilamina y 2-oxa-1-azaespiro[2.5]octano, entre los que el HOSA y la O-(difenilfosforil) hidroxilamina son los preferidos. La aminación se lleva a cabo generalmente en un disolvente, siendo los disolventes adecuados, por ejemplo, alcanos 40 clorados, tales como cloruro de metileno o cloroformo, disolventes aromáticos, tales como benceno, tolueno, xilenos, clorobenceno o diclorobenceno, y éteres, tales como dietiléter, dipropiléter, metil terc-butil éter, metil isobutil éter, etilenglicol dimetil éter, tetrahidrofurano (THF) o dioxano y similares. La reacción se lleva a cabo adecuadamente a baja temperatura, por ejemplo, a -100 a 0 °C o -78 a 0 °C. En general, el compuesto 3 se dispersa en un disolvente y se enfría a la temperatura deseada y se añade la base seguido por el agente de aminación, o el agente de 45 aminación se añade seguido de la base, o la base y el agente de aminación se añaden simultáneamente. El HOSA se usa adecuadamente en combinación con una base de amina, tal como trietilamina. En este caso, se prefiere enfriar el compuesto 3 a -30 a 0 °C, preferiblemente a -20 a -10 °C, para añadir la base de amina a esta temperatura

y a continuación el HOSA y mantener la reacción a aproximadamente -10 a 0 °C.

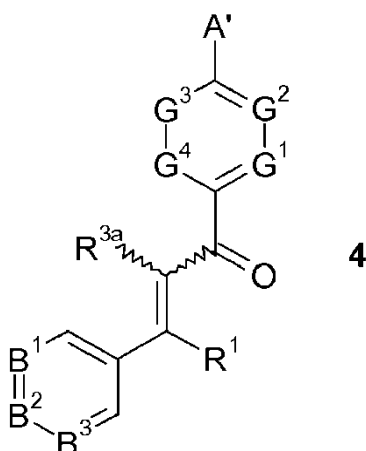
- [0227]** Como alternativa, puede usarse O-(difenilfosforil) hidroxilamina en combinación con una base, por ejemplo, con una base inorgánica, como hidrogenofosfato de sodio, hidrogenofosfato de potasio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio o carbonato de potasio y específicamente hidrogenofosfato de sodio. En este caso, es conveniente enfriar el compuesto **3** a -80 a -30 °C, especialmente -80 a -70 °C, para añadir la base a esta temperatura y a continuación O-(difenilfosforil) hidroxilamina y mantener la reacción de aproximadamente 0 °C a temperatura ambiente.
- 10 **[0228]** En la reacción de dos etapas, el compuesto **3** se hace reaccionar primero con un agente de cloración que convierte el grupo SH en un grupo S-Cl. Agentes de cloración adecuados son por ejemplo, cloruro de sulfurilo, N-cloro succinimida (NCS), hipoclorito de sodio, monocloraamina (NH₂Cl) o cloro, que se utiliza preferentemente en presencia de FeCl₃. La cloración puede llevarse a cabo de manera análoga al método descrito en Synthesis 1987, 1987, 683-688, Tetrahedron 66 (36), 2010, 7279-7287, J. Org. Chem. 59 (4), 1994, 914-921, J. Org. Chem. 63, 1998, 15 4878-4888 o J. Chem Soc. 1938, 2114-2117. La cloración generalmente se lleva a cabo en un disolvente. Los disolventes adecuados son, por ejemplo, éteres, tales como dietiléter, dipropiléter, metil terc-butiléter, metilisobutiléter, etilenglicol dimetiléter, tetrahidrofurano o dioxano. La temperatura de reacción puede variar en amplios intervalos y generalmente es de 0 °C al punto de ebullición de la mezcla de reacción (si se usa un disolvente). El compuesto clorado se hace reaccionar entonces sin aislamiento con amoniaco o hidróxido de amonio.
- 20 Si se usa amoniaco anhidro, la reacción generalmente se lleva a cabo a una temperatura de -78 a -33 °C. Si se usa amoniaco acuoso o hidróxido de amonio, la reacción también se puede llevar a cabo a temperaturas más altas, tales como de 0 a 25 °C. La reacción generalmente se lleva a cabo en un disolvente. Los disolventes adecuados son, por ejemplo, los éteres mencionados anteriormente, entre los cuales los éteres miscibles en agua, tales como THF y dioxano, son los preferidos. En general, el compuesto clorado se disuelve en un disolvente al que se añade
- 25 amoniaco o hidróxido de amonio. La reacción puede llevarse a cabo como se describe, por ejemplo, en Synthesis, 1987, 8, 683-688. La cloración/aminación también se puede llevar a cabo como una reacción de un solo recipiente. Por ejemplo, el tiol **3** se hace reaccionar simultáneamente con un agente de cloración (tal como NCS o hipoclorito de sodio acuoso) y amoniaco anhidro o acuoso en disolventes etéreos (tales como THF o Et₂O) o agua. Se prefiere la reacción con NCS en una mezcla de THF y amoniaco líquido anhidro a -33 °C. Por ejemplo, una solución de tiol **3** en
- 30 THF se añade a una solución de NCS (N-clorosuccinimida) en THF/amoniaco líquido a -78 °C. La solución se calienta a -30 °C y se agita hasta que el amoniaco se haya evaporado. Como alternativa, a 0 °C, se añade una solución del tiolato de sodio (NaSR) en agua a una mezcla de amoniaco acuoso (25 %) e hipoclorito de sodio acuoso (1 N). La reacción de cloración/aminación en un recipiente puede llevarse a cabo como se describe, por ejemplo, en Tetrahedron 2010, 66, 7279-7287 o en J. Org. Chem. 1994, 59, 914-921.

- 35 **[0229]** El compuesto **2** virtualmente no se puede aislar ya que generalmente reacciona espontáneamente en una reacción de cierre de anillo al compuesto **1**.

Esquema 2



- [0230]** El compuesto de fórmula **3** puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de fórmula **4**

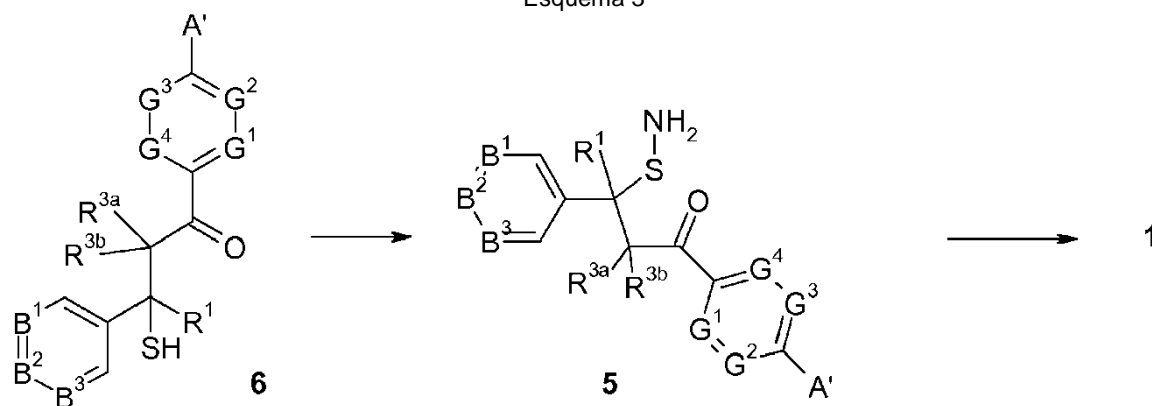


con una fuente de azufre. Fuentes de azufre adecuadas son, por ejemplo, H₂S, sulfuros de hidrógeno metálicos, como NaSH o KSH, sulfuros metálicos, como Na₂S, K₂S, Li₂S, Cu₂S, MgS, CaS, CuS, FeS y similares, sulfuro de amonio [(NH₄)₂S], sulfuros de tetraalquilamonio (R₄NSH), tales como sulfuro de tetrametilamonio, sulfuro de tetraetilamonio, sulfuro de tetrapropilamonio y similares, o sulfuro de bistrimetilsililo. El H₂S como fuente de azufre se usa generalmente en presencia de una base, como Na₂CO₃, K₂CO₃, C₂CO₃, acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de cesio, aminas, tales como dietilamina, dipropilamina, trietilamina, diisopropilamina y similares, o heterociclos básicos que contienen nitrógeno, tales como pirrolidina, piperidina, piperazina, piridina, lutidina y similares. Como alternativa, el H₂S como fuente de azufre se puede utilizar en presencia de un ácido de Lewis, tal como AlCl₃ o FeCl₃. La reacción del compuesto **4** con una fuente de azufre generalmente se lleva a cabo en un disolvente, siendo los disolventes adecuados, por ejemplo, alcanos clorados, tales como cloruro de metileno o cloroformo, y disolventes aromáticos, tales como benceno, tolueno, xilenos, clorobenceno o diclorobenceno. La temperatura de reacción puede variar en un amplio intervalo, como desde -78 °C hasta la temperatura ambiente. En general, el compuesto **4** se disuelve en un disolvente, opcionalmente enfriado, a continuación se añade la base (si se usa) y posteriormente se añade la fuente de azufre. El compuesto **4** puede reaccionar como alternativa con una fuente de azufre que proporciona un compuesto **3** que está protegido en el grupo tiol SH por un grupo protector (S-PG). Esto es ventajoso si el compuesto **3** se somete, por ejemplo, a condiciones de purificación más duras o se derivatiza, por ejemplo, para convertir el grupo precursor A' en un grupo A o para modificar el grupo A' en esta etapa. Además, la purificación del producto protegido es más fácil. Reactivos de sulfuración adecuados que dan tales tioles protegidos son, por ejemplo, tiourea (NH₂-C(=S)-NH₂), benciltioles opcionalmente sustituidos, tales como benciltiol, o- o p-metoxi-benciltiol, o- o p-hidroxibenciltiol, o- o p-acetoxibenciltiol, o- o p-nitrobenciltiol o 2,4,6-trimetilbenciltiol, piridin-4-il-metiltiol, quinolin-2-il-metiltiol, sulfuros metálicos de bencilo, tales como bencilsulfuro de sodio, feniltioliol, 2,4-dinitrofeniltioliol, tritiltioliol, terc-butiltioliol, compuestos de la fórmula R-C(=O)-NH-CH₃-SH, en la que R es metilo, terc-butilo, alilo, fenilo o bencilo, 2-trimetilsilanilo-etanotioliol, 2-(2,4-dinitrofenil)-etanotioliol, 2-fenilsulfonil-etanotioliol, tioles acilados, como metilcarboniltioliol o fenilcarboniltioliol y tiocarbamatos R-NH-C(=O)-SH, en la que R es, por ejemplo, metilo o etilo. Los bencil y alquil tioles se usan generalmente en presencia de una base, como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, fosfato de sodio, fosfato de potasio, hidrogenofosfato de sodio, hidrogenofosfato de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio, hidruro de sodio, hidruro de potasio, diisopropilamida de litio (LDA), metanolato de sodio, etanolato de sodio, terc-butóxido de potasio, tetraborato de sodio acuoso, n-butillitio, terc-butillitio, fluoruro de tetrabutilamonio (TBAF), NaHMDS y similares, o en presencia de un ácido de Lewis o Bronsted, como FeCl₃, Zn(ClO₄)₂, Cu(BF₄)₂, HBF₄ o HClO₄. La reacción se lleva a cabo generalmente en un disolvente, siendo los disolventes adecuados, por ejemplo, alcanos clorados, tales como cloruro de metileno o cloroformo, y éteres, tales como dietiléter, dipropiléter, metil terc-butiléter, metilisobutiléter, etilenglicol dimetiléter, tetrahidrofurano (THF) o dioxano y similares. La temperatura de reacción puede variar en un amplio intervalo, tal como desde -25 °C hasta el punto de ebullición de la mezcla de reacción. Los tioles acilados pueden hacerse reaccionar puros o en un disolvente, siendo los disolventes adecuados, por ejemplo, alcanos clorados, tales como cloruro de metileno o cloroformo, y éteres, tales como dietiléter, dipropiléter, metil terc-butiléter, metilisobutiléter, etilenglicol dimetiléter, tetrahidrofurano (THF) o dioxano y similares. Se pueden usar con o sin base. El compuesto **3** S-protegido puede desprotegerse a continuación al tiol **3** libre en condiciones generalmente conocidas para el grupo protector respectivo, tal como se describe, por ejemplo, en Peter GM Wuts, Theodora Greene, Protective Groups in Organic Synthesis, 4ª edición, John Wiley&Sons, Inc., 2007, Capítulo 6.

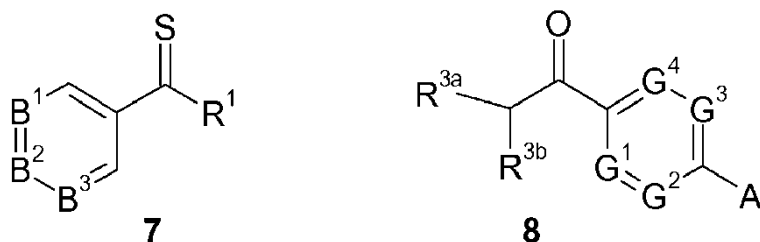
[0231] El compuesto **4** puede prepararse de forma análoga al método descrito en la patente EP-A-2172462.

[0232] Los compuestos **1** (en los que R^{3b} no es necesariamente hidrógeno) se pueden preparar como alternativa haciendo reaccionar un compuesto de fórmula **6** con un agente de aminación para dar un compuesto de fórmula **5**, que reacciona espontáneamente al compuesto **1**, como se muestra en el esquema 3. La reacción puede llevarse a cabo de forma análoga a la de los compuestos **3** y **2**.

Esquema 3

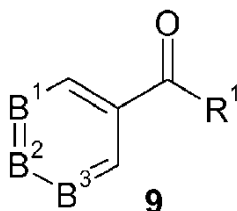


[0233] El compuesto de fórmula 6 puede obtenerse haciendo reaccionar un compuesto de fórmula 7 con un compuesto de fórmula 8.



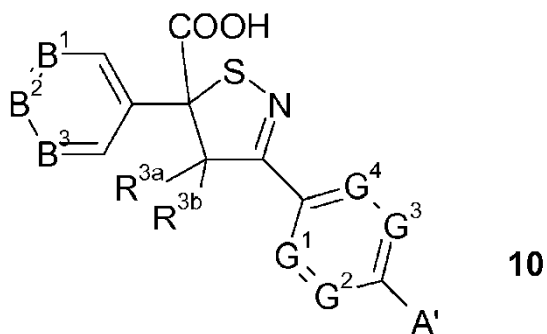
[0234] La reacción se lleva a cabo preferiblemente como una reacción aldólica de Mukaiyama. Para este fin, el derivado de trialquilsilil-enolato de 8 se hace reaccionar con 7 en presencia de un ácido de Lewis, como TiCl₄ o BF₃[O(C₂H₅)₂]. Como alternativa, la reacción puede llevarse a cabo en presencia de una base fuerte, tal como diisopropilamida de litio (LDA), bistrimetilsililamida sódica (hexametildisilazida sódica; NaHMDS) y aminas, tales como trietilamina, tripropilamina o diisopropiletilamina. La reacción generalmente se lleva a cabo en un disolvente. Si se usa una base de litio o sodio, el disolvente es adecuadamente un éter, tal como dietiléter, dipropiléter, metil terc-butiléter, metil isobutil éter, etilenglicol dimetil éter, tetrahydrofurano (THF) o dioxano y similares. Las temperaturas de reacción adecuadas oscilan entre -78 y 25 °C. Si se usa una base de amina, el disolvente es adecuadamente un éter, tal como dietiléter, dipropiléter, metil terc-butiléter, metil isobutiléter, etilenglicol dimetiléter, tetrahydrofurano (THF) o dioxano, o un alcano, tal como pentano, hexano o heptano. Las temperaturas de reacción adecuadas oscilan entre 25 y 100 °C.

[0235] El compuesto de fórmula 7 se puede obtener por reacción de un compuesto de fórmula 9 con un agente de sulfuración, tal como el reactivo de Lawesson o P₂S₅.



[0236] La reacción se lleva a cabo generalmente en un disolvente, siendo los disolventes adecuados, por ejemplo, disolventes aromáticos, tales como benceno, tolueno, xilenos, clorobenceno o diclorobenceno, éteres, tales como dietiléter, dipropiléter, metil terc-butiléter, metil isobutiléter, etilenglicol dimetiléter, tetrahydrofurano (THF) o dioxano, y triamida de ácido hexametil fosfórico (HMPA). La reacción se lleva a cabo generalmente a una temperatura desde 25 °C hasta el punto de ebullición de la mezcla de reacción.

[0237] Los compuestos de fórmula I en la que R¹ es CF₃ por otra parte se pueden preparar por reacción de un compuesto de fórmula **10** con un agente de fluoración y, si es necesario (es decir, si A' es un precursor de A), la conversión del grupo A' en un grupo A.



5

[0238] Agentes de fluoración adecuados son, por ejemplo, SF₄, preferiblemente en combinación con HF o BF₃[O(C₂H₅)₂], trifluoruro de fenilazufre (Ph-SF₃), preferiblemente en combinación con HF y piridina, trifluoruro de 4-terc-butil-2,6-dimetilfenilazufre ("Fluoled"), y trifluoruro de bis (2-metoxietil) aminoazufre [(CH₃OCH₂CH₂)₂NSF₃].

10 Entre estos, se da preferencia a SF₄ en combinación con HF. Si se usa SF₄ en combinación con HF, la reacción se lleva a cabo pura, es decir, sin ningún otro disolvente. La reacción se lleva a cabo generalmente bajo presión elevada procedente de los reactivos, por ejemplo, a una presión de 2 a 10 bar, preferiblemente de 5 a 8 bar. La temperatura de reacción puede variar en amplios intervalos, tales como de 25 a 120 °C, preferiblemente de 60 a 100 °C.

15

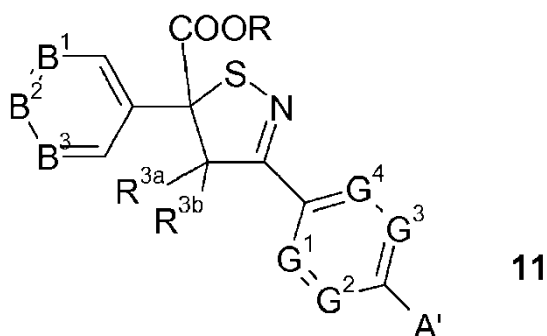
[0239] Como alternativa, la fluoración se puede llevar a cabo mediante un método de dos etapas, en el que el grupo carboxilo en el anillo isotiazolina se convierte primero en un grupo CCl₃, y esto posteriormente se flaura al grupo CF₃. La conversión del grupo COOH al grupo CCl₃ se lleva a cabo preferiblemente haciendo reaccionar el compuesto VI con PCl₅ y dicloruro de fenil-fosforoxi (Ph-P(=O)Cl₂). La reacción puede llevarse a cabo pura, es decir, sin ningún otro disolvente. Adecuadamente, la reacción se lleva a cabo a temperaturas elevadas, por ejemplo, de 50 °C a reflujo y preferiblemente a reflujo. Agentes de fluoración para convertir el grupo CCl₃ en un grupo CF₃ son los mencionados anteriormente, y HF adicional y HF en combinación con SbCl₅ y HF en combinación con Cl₂ y SbF₃. La reacción puede llevarse a cabo pura, es decir, sin ningún otro disolvente. La temperatura de reacción puede variar en amplios intervalos, por ejemplo, de 25 a 300 °C, preferiblemente de 50 a 200 °C y en particular de 80 a 120 °C. Si

20

25 el agente de fluoración es HF o HF en combinación con un agente adicional, la reacción generalmente tiene lugar a la presión que proviene de HF y que varía generalmente de 2 a 10 bar, preferiblemente de 5 a 8 bar.

[0240] El compuesto de fórmula **10** se obtiene preferentemente por hidrólisis de un compuesto de fórmula **11**, en el que R es alquilo C₁-C₄.

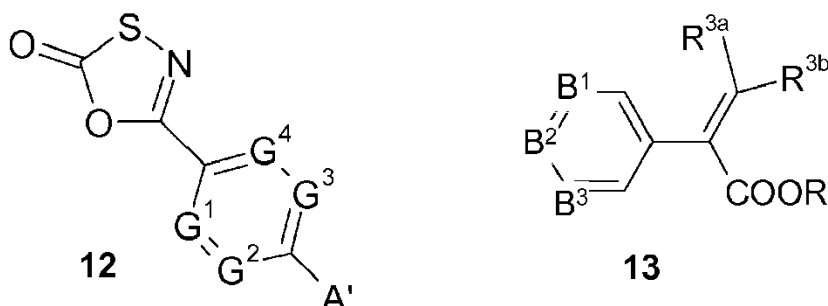
30



[0241] La hidrólisis se puede llevar a cabo por cualquier medio adecuado conocido para hidrolizar grupos éster, tales como condiciones ácidas, por ejemplo, usando ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido sulfúrico, ácido trifluoroacético, etc., o por condiciones básicas, por ejemplo, usando un hidróxido de metal alcalino, tal como LiOH, NaOH o KOH, o un carbonato de metal alcalino, tal como carbonato de sodio o potasio.

35

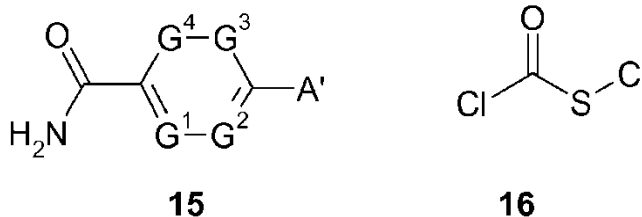
[0242] El compuesto de fórmula **11** a su vez puede obtenerse haciendo reaccionar un compuesto **12** con un compuesto **13**



5

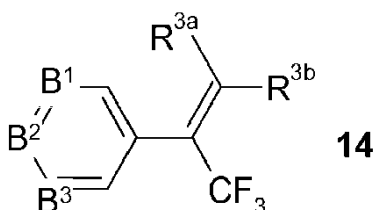
[0243] La reacción se lleva a cabo a temperatura elevada, por ejemplo, de 90 a 200 °C, preferiblemente de 100 a 180 °C y en particular de 120 a 160 °C, por ejemplo, a aproximadamente 140 °C.

[0244] El compuesto de fórmula **12** a su vez puede obtenerse haciendo reaccionar un compuesto **15** con un compuesto **16**.



[0245] La reacción se lleva a cabo generalmente en un disolvente, siendo los disolventes adecuados, por ejemplo, disolventes aromáticos, tales como benceno, tolueno, xilenos, clorobenceno y diclorobenceno. La temperatura de reacción es preferiblemente de 80 a 140 °C, más preferiblemente de 100 a 120 °C.

[0246] Los compuestos de fórmula I en la que sin embargo R¹ es CF₃ por otra parte se pueden preparar por reacción de un compuesto de fórmula **12** como se ha definido anteriormente con un compuesto de fórmula **14** y, si es necesario, convirtiendo el grupo A' en un grupo A.

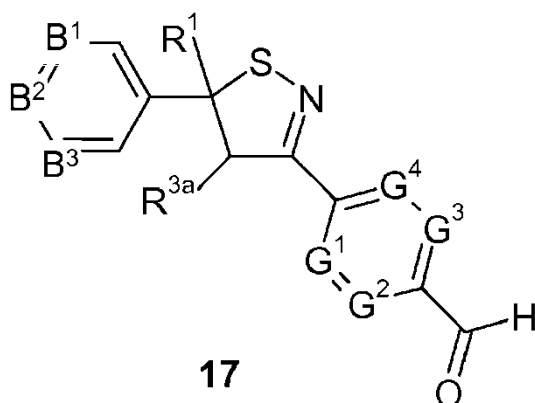


[0247] La reacción se lleva a cabo a temperatura elevada, por ejemplo, de 90 a 200 °C, preferiblemente de 100 a 180 °C y en particular de 120 a 160 °C, por ejemplo, a aproximadamente 140 °C.

[0248] Los compuestos I', en los que A' es un precursor de A, se pueden convertir como se muestra a continuación.

[0249] Los compuestos I', en los que A' es Cl, Br, I o -OSO₂-R^{z1}, donde R^{z1} es como se ha definido anteriormente, se pueden convertir en compuestos I en los que A es un grupo C(=W)N(R⁵R⁶), por reacción con monóxido de carbono y una fuente de hidruro, tal como trietilsilano, en presencia de un catalizador complejo de metal de transición, preferiblemente un catalizador de paladio, a un compuesto de carbonilo **17**. Esta reacción convierte el grupo de partida A' en un grupo carbonilo -C(=O)H.

35



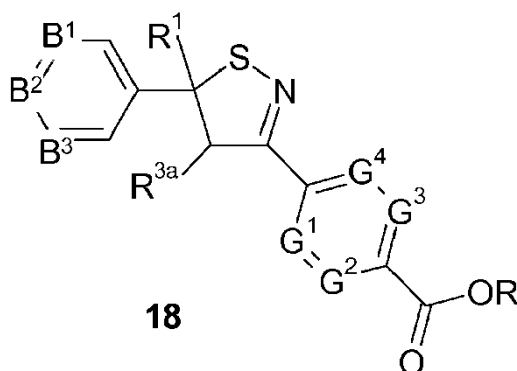
[0250] El aldehído **17** se puede obtener también mediante la reducción del éster **18** (ver más abajo; R = alquilo C₁-C₄) con hidruro de diisobutilaluminio (DIBAL-H), ya sea directamente en el aldehído **17** o mediante el 5 correspondiente alcohol, que se oxida a continuación, al aldehído.

[0251] Para la obtención de compuestos I, dichos compuestos carbonílicos **17** se hacen reaccionar a continuación con una amina cíclica (derivado) NH(R⁵)R⁶. Como alternativa, el compuesto I', en el que A' es Cl, Br, I o -OSO₂-R^{z1}, donde R^{z1} es como se ha definido anteriormente, se puede hacer reaccionar en una reacción en un 10 recipiente con monóxido de carbono e hidrógeno en presencia de un catalizador de complejo de metal de transición y la amina cíclica NH(R⁵)R⁶.

[0252] Como alternativa, los compuestos I', en los cuales A' es Br o Cl pueden convertirse en los compuestos I en los que A es un grupo C(=W)N(R⁵)R⁶, mediante aminocarbonilación catalizada por Pd en el sentido de una 15 carbonilación de Heck. El compuesto haluro de arilo I' se hace reaccionar con monóxido de carbono y la amina cíclica NH(R⁵)R⁶ en presencia de un catalizador de Pd, tal como acetato de paladio (II) en presencia de un ligando de fosfina tal como Xanthos (4,5-bis (difenilfosfino)-9,9-dimetilxanteno). Habitualmente, la reacción se realiza en presencia de una base. Las bases adecuadas son carbonatos de metal alcalino tales como carbonato de sodio o carbonato de potasio o fosfatos de metal alcalino tales como fosfato de potasio o fenóxido de sodio.

[0253] Los compuestos I, en los que W es O se pueden preparar haciendo reaccionar un compuesto I' donde A' es Cl, Br, I o triflato con monóxido de carbono en presencia de un catalizador de paladio y un alcohol ROH, donde R es alquilo C₁-C₄, a un compuesto de fórmula **18**. Los catalizadores de paladio adecuados son, por ejemplo, los 20 descritos en el documento PCT/EP 2011/060388.

25



[0254] Este éster se hidroliza a continuación en el ácido carboxílico respectivo, que reacciona en condiciones de amidación convencionales con una amina cíclica NHR⁵R⁶. La hidrolización puede llevarse a cabo en condiciones 30 convencionales, por ejemplo, en condiciones ácidas usando, por ejemplo, ácido clorhídrico, ácido sulfúrico o ácido trifluoroacético, o en condiciones básicas usando, por ejemplo, un hidróxido de metal alcalino, tal como LiOH, NaOH o KOH. La amidación se lleva a cabo preferiblemente por la activación de los ácidos carboxílicos con cloruro de oxalilo [(COCl)₂] o cloruro de tionilo (SOCl₂) para los cloruros de ácido respectivos, seguido de reacción con una

amina NHR⁵R⁶. Como alternativa, la amidación se lleva a cabo en presencia de un reactivo de acoplamiento. Los reactivos de acoplamiento adecuados (activadores) son bien conocidos y se seleccionan, por ejemplo, entre carbodiimidas, tales como DCC (diciclohexilcarbodiimida) y DCI (diisopropilcarbodiimida), derivados de benzotriazol, tales como HATU (hexafluorofosfato de O-(7-azabenzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio), HBTU (hexafluorofosfato de (O-benzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio) y HCTU (tetrafluoroborato de 1H-benzotriazol-1-[bis (dimetilamino)) metilen]-5-cloro) y activadores derivados de fosfonio, como BOP (hexafluorofosfato de (benzotriazol-1-iloxi)-tris (dimetilamino) fosfonio), Py-BOP (hexafluorofosfato de benzotriazol-1-iloxi)-tripirrolidinofosfonio) y Py-BrOP (hexafluorofosfato de bromotripirrolidinofosfonio). En general, el activador se usa en exceso. Los reactivos de acoplamiento de benzotriazol y fosfonio se usan generalmente en un medio básico.

10

[0255] Los compuestos I, en los que W es S, pueden prepararse haciendo reaccionar el compuesto oxo correspondiente (W es O) con reactivo de Lawesson (CAS 19172-47-5), véase, por ejemplo, Jesberger et al., Synthesis, 2003, 1929-1958 y referencias allí citadas. Se pueden usar disolventes tales como HMPA o THF a una temperatura elevada tal como 60 °C a 100 °C. Las condiciones de reacción preferidas son THF a 65 °C.

15

[0256] Como norma, los compuestos de fórmula (I) que incluyen sus estereoisómeros, sales y N-óxidos, y sus precursores en el proceso de síntesis, se pueden preparar mediante los métodos descritos anteriormente. Si los compuestos individuales no pueden prepararse a través de las rutas descritas anteriormente, pueden prepararse por derivación de otros compuestos (I) o el precursor respectivo o por modificaciones habituales de las rutas de síntesis descritas. Por ejemplo, en casos individuales, ciertos compuestos de fórmula (I) pueden prepararse ventajosamente a partir de otros compuestos de fórmula (I) mediante derivatización, por ejemplo, por hidrólisis de éster, amidación, esterificación, escisión de éter, olefinación, reducción, oxidación y similares, o mediante modificaciones habituales de las rutas de síntesis descritas.

25

[0257] Las mezclas de reacción se elaboran de la manera habitual, por ejemplo, mezclando con agua, separando las fases y, si es apropiado, purificando los productos en bruto mediante cromatografía, por ejemplo, sobre alúmina o sobre gel de sílice. Algunos de los intermedios y productos finales se pueden obtener en forma de aceites viscosos incoloros o de color marrón pálido que se liberan o purifican a partir de componentes volátiles a presión reducida y a temperatura moderadamente elevada. Si los intermedios y los productos finales se obtienen como sólidos, se pueden purificar por recristalización o trituración.

30

[0258] Debido a su excelente actividad, los compuestos de la presente invención se pueden usar para controlar plagas de invertebrados.

35

[0259] Por consiguiente, la presente invención también proporciona un método no terapéutico para controlar plagas de invertebrados, cuyo método comprende tratar las plagas, su suministro de alimentos, su hábitat o su caldo de cultivo o una planta cultivada, materiales de propagación de plantas (tales como semillas), suelo, superficie, material o ambiente en el cual las plagas crecen o pueden crecer, o los materiales, plantas cultivadas, materiales de propagación de plantas (tales como semillas), suelos, superficies o espacios a proteger del ataque o infestación de plagas con una cantidad eficaz como plaguicida de un compuesto de la presente invención o una composición como se ha definido anteriormente. La invención también se refiere a un compuesto de la invención, un estereoisómero y/o una sal agrícola o veterinariamente aceptable del mismo para su uso en la lucha contra plagas de invertebrados.

40

[0260] Preferiblemente, el método de la invención sirve para proteger el material de propagación de plantas (tal como semilla) y la planta que crece del ataque o infestación de plagas de invertebrados y comprende tratar el material de propagación de la planta (tal como semilla) con una cantidad pesticidamente efectiva de un compuesto de la presente invención como se ha definido anteriormente o con una cantidad eficaz como plaguicida de una composición agrícola como se ha definido anteriormente y a continuación. El método de la invención no se limita a la protección del "sustrato" (planta, materiales de propagación de plantas, material de suelo, etc.) que se ha tratado de acuerdo con la invención, sino que también tiene un efecto preventivo, por lo tanto, por ejemplo, según la protección a una planta que crece a partir de un material de propagación de plantas tratadas (como semillas), sin que la propia planta haya sido tratada.

50

[0261] Como alternativa preferiblemente, el método de la invención sirve para proteger plantas del ataque o infestación por plagas de invertebrados, método que comprende tratar las plantas con una cantidad eficaz como plaguicida de al menos un compuesto de la invención, un estereoisómero del mismo y/o al menos una sal agrícolamente aceptable de los mismos.

55

[0262] En el sentido de la presente invención, las "plagas de invertebrados" se seleccionan preferiblemente

entre artrópodos y nematodos, más preferiblemente entre insectos dañinos, arácnidos y nematodos, e incluso más preferiblemente entre insectos, ácaros y nematodos. En el sentido de la presente invención, las "plagas de invertebrados" son muy preferiblemente insectos.

- 5 **[0263]** La invención proporciona además una composición agrícola para combatir plagas de invertebrados, que comprende una cantidad tal de al menos un compuesto de acuerdo con la invención y al menos un vehículo líquido y/o sólido inerte agrónomicamente aceptable que tiene una acción plaguicida y, si se desea, al menos un tensioactivo.
- 10 **[0264]** Dicha composición puede comprender un único compuesto activo de la presente invención o una mezcla de varios compuestos activos de la presente invención. La composición según la presente invención puede comprender un isómero individual o mezclas de isómeros o una sal, así como tautómeros individuales o mezclas de tautómeros.
- 15 **[0265]** Los compuestos de la presente invención, que incluyen sus sales, estereoisómeros y tautómeros, son en particular adecuados para controlar eficazmente plagas de artrópodos tales como arácnidos, miriápodos e insectos, así como también nematodos. Son especialmente adecuados para combatir o controlar eficazmente las siguientes plagas:
- 20 insectos del orden de los lepidópteros (Lepidoptera), por ejemplo, *Acronicta major*, *Adoxophyes orana*, *Aedia leucomelas*, *Agrotis* spp. tales como *Agrotis fucosa*, *Agrotis segetum*, *Agrotis ypsilon*; *Alabama argillacea*, *Anticarsia gemmatalis*, *Anticarsia* spp., *Argyresthia conjugella*, *Autographa gamma*, *Barathra brassicae*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia murinana*, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Carpocapsa pomonella*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo* spp. como *Chilo suppressalis*; *Choristoneura fumiferana*, *Choristoneura occidentalis*, *Cirphis unipuncta*, *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocerus* spp., *Cydia pomonella*, *Dendrolimus pini*, *Diaphania nitidalis*, *Diatraea grandiosella*, *Earias insulana*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Ephestia cautella*, *Ephestia kuehniella*, *Eupoecilia ambiguella*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Euxoa* spp., *Evetria bouliana*, *Feltia* spp. como *Feltia subterranea*; *Galleria mellonella*, *Grapholitha funebrana*, *Grapholitha molesta*, *Helicoverpa* spp. tales como *Helicoverpa armigera*, *Helicoverpa zea*; *Heliothis* spp. tales como *Heliothis armigera*, *Heliothis virescens*, *Heliothis zea*; *Hellula undalis*, *Hibernia defoliaria*, *Hofmannophila pseudospretella*, *Homona magnanima*, *Hyphantria cunea*, *Hyponomeuta padella*, *Hyponomeuta malinellus*, *Keiferia lycopersicella*, *Lambdina fiscellaria*, *Laphygma* spp. como *Laphygma exigua*; *Leucoptera coffeella*, *Leucoptera scitella*, *Lithocolletis blancardella*, *Lithophane antennata*, *Lobesia botrana*, *Loxagrotis albicosta*, *Loxostege sticticalis*, *Lymantria* spp. como *Lymantria dispar*, *Lymantria monacha*; *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*, *Mamestra* spp. como *Mamestra brassicae*; *Mocis repanda*, *Mythimna separata*, *Orgyia pseudotsugata*, *Oria* spp., *Ostrinia* spp. como *Ostrinia nubilalis*; *Oulema oryzae*, *Panolis flammea*, *Pectinophora* spp. como *Pectinophora gossypiella*; *Peridroma saucia*, *Phalera bucephala*, *Phthorimaea* spp. tales como *Phthorimaea operculella*; *Philocnistis citrella*, *Pieris* spp. tales como *Pieris brassicae*, *Pieris rapae*; *Plathypena scabra*, *Plutella maculipennis*, *Plutella xilostella*, *Prodenia* spp., *Pseudaletia* spp., *Pseudoplusia includens*, *Pyrausta nubilalis*, *Rhyacionia frustrana*, *Scrobipalpula absoluta*, *Sitotroga cerealella*, *Sparganothis pilleriana*, *Spodoptera* spp. tales como *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera littoralis*, *Spodoptera litura*; *Thaumatopoea ptyocampa*, *Thermesia gemmatalis*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia* spp. tales como *Trichoplusia ni*; *Tuta absoluta* y *Zeiraphera canadensis*, escarabajos (Coleoptera), por ejemplo, *Acanthoscehdes protegida*, *Adoretus* spp., *Agelastica alni*, *Agrilus sinuatus*, *Agriotes* spp. tales como *Agriotes fuscicollis*, *Agriotes lineatus*, *Agriotes obscurus*; *Amphimallus solstitialis*, *Anisandrus dispar*, *Anobium punctatum*, *Anomala rufocuprea*, *Anoplophora* spp. tales como *Anoplophora glabripennis*; *Anthonomus* spp. tales como *Anthonomus grandis*, *Anthonomus pomorum*; *Anthrenus* spp., *Aphthona euphoridae*, *Apogonia* spp., *Athous haemorrhoidalis*, *Atomaria* spp. tales como *Atomaria linearis*; *Attagenus* spp., *Aulacophora femoralis*, *Blastophagus piniperda*, *Blitophaga undata*, *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp. tales como *Bruchus lentis*, *Bruchus pisorum*, *Bruchus rufimanus*; *Byctiscus betulae*, *Callosobruchus chinensis*, *Cassida nebulosa*, *Cerotoma trifurcata*, *Cetonia aurata*, *Ceuthorrhynchus* spp. tales como *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Ceuthorrhynchus napi*; *Chaetocnema tibialis*, *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp. tales como *Conoderus vespertinus*; *Cosmopolites* spp., *Costelytra zealandica*, *Crioceris asparagi*, *Cryptorhynchus lapathi*, *Ctenicera* ssp. tales como *Ctenicera destructor*; *Curculio* spp., *Dectes texanus*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp. tales como *Diabrotica 12-punctata*, *Diabrotica speciosa*, *Diabrotica longicornis*, *Diabrotica semipunctata*, *Diabrotica virgifera*; *Epilachna* spp. tales como *Epilachna varivestis*, *Epilachna vigintioctomaculata*; *Epitrix* spp. tales como *Epitrix hirtipennis*; *Eutinobothrus brasiliensis*, *Faustinus cubae*, *Gibbium psylloides*, *Heteronychus arator*, *Hylamorpha elegans*, *Hylobius abietis*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera brunneipennis*, *Hypera postica*, *Hypothenemus* spp., *Ips typographus*, *Lachnosterna consanguinea*, *Lema bilineata*, *Lema melanopus*, *Leptinotarsa* spp. tales como *Leptinotarsa decemlineata*; *Limonium californicus*,

Lissorhoptrus oryzophilus, Lissorhoptrus oryzophilus, Lixus spp., Lyctus spp. tales como Lyctus bruneus; Melanotus communis, Meligethes spp. tales como Meligethes aeneus; Melolontha hippocastani, Melolontha melolontha, Migdolus spp., Monochamus spp. tales como Monochamus alternatus; Naupactus xanthographus, Niptus hololeucus, Oryctes rhinoceros, Oryzaephilus surinamensis, Otiorrhynchus sulcatus, Otiorrhynchus ovatus, Otiorrhynchus sulcatus, Oulema oryzae, Oxycetonia jucunda, Phaedon cochleariae, Phyllobius piri, Phyllopertha horticola, Phyllophaga spp., Phyllotreta spp. tales como Phyllotreta chrysocephala, Phyllotreta nemorum, Phyllotreta striolata; Phyllophaga spp., Phyllopertha horticola, Popillia japonica, Premnotrypes spp., Psylliodes chrysocephala, Ptinus spp., Rhizobius ventralis, Rhizopertha dominica, Sitona lineatus, Sitophilus spp. tales como Sitophilus granaria, Sitophilus zeamais; Sphenophorus spp. tales como Sphenophorus levis; Sternechus spp. tales como Sternechus subsignatus; Symphyletes spp., Tenebrio molitor, Tribolium spp. tales como Tribolium castaneum; Trogoderma spp., Tychius spp., Xylotrechus spp., and Zabrus spp. tales como Zabrus tenebrioides,

moscas, mosquitos (Diptera), por ejemplo, Aedes spp. tales como Aedes aegypti, Aedes albopictus, Aedes vexans; Anastrepha ludens, Anopheles spp. tales como Anopheles albimanus, Anopheles crucians, Anopheles freeborni, Anopheles gambiae, Anopheles leucosphyrus, Anopheles maculipennis, Anopheles minimus, Anopheles quadrimaculatus, Anopheles sinensis; Bibio hortulanus, Calliphora erythrocephala, Calliphora vicina, Ceratitis capitata, Ceratitis capitata, Chrysomyia spp. tales como Chrysomya bezziana, Chrysomya hominivorax, Chrysomya macellaria; Chrysops atlanticus, Chrysops discalis, Chrysops silacea, Cochliomyia spp. tales como Cochliomyia hominivorax; Contarinia spp. tales como Contarinia sorghicola; Cordylobia anthropophaga, Culex spp. tales como Culex nigripalpus, Culex pipiens, Culex quinquefasciatus, Culex tarsalis, Culex tritaeniorhynchus; Culicoides furens, Culiseta inornata, Culiseta melanura, Cuterebra spp., Dacus cucurbitae, Dacus oleae, Dasineura brassicae, Delia spp. tales como Delia antique, Delia coarctata, Delia platura, Delia radicum; Dermatobia hominis, Drosophila spp., Fannia spp. tales como Fannia canicularis; Gastraphilus spp. tales como Gasterophilus intestinalis; Geomyza Tripunctata, Glossina fuscipes, Glossina morsitans, Glossina palpalis, Glossina tachinoides, Haematobia irritans, Haplodiplosis equestris, Hippelates spp., Hylemyia spp. tales como Hylemyia platura; Hypoderma spp. tales como Hypoderma lineata; Hyppobosca spp., Leptoconops torrens, Liriomyza spp. tales como Liriomyza sativae, Liriomyza trifolii; Lucilia spp. tales como Lucilia caprina, Lucilia cuprina, Lucilia sericata; Lycoria pectoralis, Mansonia titillanus, Mayetiola spp. tales como Mayetiola destructor; Musca spp. tales como Musca autumnalis, Musca domestica; Muscina stabulans, Oestrus spp. tales como Oestrus ovis; Opomyza florum, Oscinella spp. tales como Oscinella frit; Pegomya hysocymi, Phlebotomus argentipes, Phorbia spp. tales como Phorbia antiqua, Phorbia brassicae, Phorbia coarctata; Prosimulium mixtum, Psila rosae, Psorophora columbiae, Psorophora discolor, Rhagoletis cerasi, Rhagoletis pomonella, Sarcophaga spp. tales como Sarcophaga haemorrhoidalis; Simulium vittatum, Stomoxys spp. tales como Stomoxys calcitrans; Tabanus spp. tales como Tabanus atratus, Tabanus bovinus, Tabanus lineola, Tabanus similis; Tannia spp., Tipula oleracea, Tipula paludosa, y Wohlfahrtia spp.,

arañuelas (Thysanoptera), por ejemplo, Baliothrips biformis, Dichromothrips corbetti, Dichromothrips spp., Enneothrips flavens, Frankliniella spp. tales como Frankliniella fusca, Frankliniella occidentalis, Frankliniella tritici; Heliothrips spp., Hercinothrips femoralis, Kakothrips spp., Rhipiphorothers cruentatus, Scirtothrips spp. como Scirtothrips citri; Taeniothrips cardamoni, Thrips spp. tales como Thrips oryzae, Thrips palmi, Thrips tabaci;

termitas (Isoptera), por ejemplo, Caloterms flavicollis, Coptotermes formosanus, Heterotermes aureus, Heterotermes longiceps, Heterotermes tenuis, Leucotermes flavipes, Odontotermes spp., Reticulitermes spp. tales como Reticulitermes speratus, Reticulitermes flavipes, Reticulitermes grassei, Reticulitermes lucifugus, Reticulitermes santonensis, Reticulitermes virginicus; Termes natalensis,

cucarachas (Blattaria-Blattodea), por ejemplo, Acheta domesticus, Blatta orientalis, Blattella asahinae, Blattella germanica, Grillotalpa spp, Leucophaea maderae, Locusta spp, Melanoplus spp, Periplaneta americana, Periplaneta australasiae, Periplaneta brunnea, hollín Periplaneta, Periplaneta japonica,

insectos, áfidos, chicharritas, moscas blancas, insectos de escala, cigarras (Hemiptera), por ejemplo, Acrosternum spp. como Acrosternum hilare; Acyrthosiphon spp. tales como Acyrthosiphon onobrychis, Acyrthosiphon pisum; Adelges laricis, Aeneolamia spp., Agonosceca spp., Aleurodes spp., Aleurolobus barodensis, Aleurothrixus spp., Amrasca spp., Anasa tristis, Antestiopsis spp., Anuraphis cardui, Aonidiella spp., Aphanostigma piri, Aphidula nasturtii, Aphis spp. tales como Aphis fabae, Aphis forbesi, Aphis gossypii, Aphis grossulariae, Aphis pomi, Aphis sambuci, Aphis schneideri, Aphis spiraeola; Arboridia apicalis, Arilus critatus, Aspidiella spp., Aspidiotus spp., Atanus spp., Aulacorthum solani, Bemisia spp. tales como Bemisia argentifolii, Bemisia tabaci; Blissus spp. como Blissus leucopterus; Brachycaudus cardui, Brachycaudus helichrysi, Brachycaudus persicae, Brachycaudus prunicola, Brachycolus spp., Brevicoryne brassicae, Calligypona marginata, Calocoris spp., Campylomma livida, Capitophorus horni, Carnecephala fulgida, Cavalerius spp., Ceraplastes spp., Ceratovacuna lanigera, Cercopidae, Cerosipha gossypii, Chaetosiphon fragaefolii, Chionaspis tegalensis, Chlorita onukii, Chromaphis juglandicola, Chrysomphalus ficus, Cicadulina mbila, Cimex spp. tales como Cimex hemipterus, Cimex lectularius; Cocomytilus halli, Coccus spp., Creontiades dilutus, Cryptomyzus

ribis, *Cryptomyzus ribis*, *Cyrtopeltis notatus*, *Dalbulus* spp., *Dasynus piperis*, *Dialeurades* spp., *Diaphorina* spp., *Diaspis* spp., *Dichelops furcatus*, *Diconocoris hewetti*, *Doralis* spp., *Dreyfusia nordmannianae*, *Dreyfusia piceae*, *Drosicha* spp., *Dysaphis* spp. tales como *Dysaphis plantaginea*, *Dysaphis piri*, *Dysaphis radicola*; *Dysaulacorthum pseudosolani*, *Dysdercus* spp. tales como *Dysdercus cingulatus*, *Dysdercus intermedius*;

5 *Dysmicoccus* spp., *Empoasca* spp. tales como *Empoasca fabae*, *Empoasca solana*; *Eriosoma* spp., *Erythroneura* spp., *Eurygaster* spp. tales como *Eurygaster integriceps*; *Euscelis bilobatus*, *Euschistus* spp. tales como *Euschistus heros*, *Euschistus impictiventris*, *Euschistus servus*; *Geococcus coffeae*, *Halyomorpha* spp. tales como *Halyomorpha halys*; *Heliopeltis* spp., *Homalodisca coagulata*, *Horcias nobiellus*, *Hyalopterus pruni*, *Hyperomyzus lactucae*, *Icerya* spp., *Idiocerus* spp., *Idioscopus* spp., *Laodelphax striatellus*, *Lecanium* spp.,

10 *Lepidosaphes* spp., *Leptocorisa* spp., *Leptoglossus phyllopus*, *Lipaphis erysimi*, *Lygus* spp. tales como *Lygus hesperus*, *Lygus lineolaris*, *Lygus pratensis*; *Macropes excavatus*, *Macrosiphum* spp. tales como *Macrosiphum rosae*, *Macrosiphum avenae*, *Macrosiphum euphorbiae*; *Mahanarva fimbriolata*, *Megacopta cribraria*, *Megoura viciae*, *Melanaphis pirarius*, *Melanaphis sacchari*, *Metcalfella* spp., *Metopolophium dirhodum*, *Miridae* spp.,

15 *Monellia costalis*, *Monelliopsis pecanis*, *Myzus* spp. tales como *Myzus ascalonicus*, *Myzus cerasi*, *Myzus persicae*, *Myzus varians*; *Nasonovia ribis-nigri*, *Nephotettix* spp. tales como *Nephotettix malayanus*, *Nephotettix nigropictus*, *Nephotettix parvus*, *Nephotettix virescens*; *Nezara* spp. tales como *Nezara viridula*; *Nilaparvata lugens*, *Oebalus* spp., *Oncometopia* spp., *Orthezia praelonga*, *Parabemisia myricae*, *Paratrioza* spp., *Parlatoria* spp., *Pemphigus* spp. tales como *Pemphigus bursarius*; *Pentomidae*, *Peregrinus maidis*, *Perkinsiella saccharicida*, *Phenacoccus* spp., *Phloeomyzus passerinii*, *Phorodon humuli*, *Phylloxera* spp., *Piesma quadrata*,

20 *Piezodorus* spp. tales como *Piezodorus guildinii*, *Pinnaspis aspidistrae*, *Planococcus* spp., *Protospulvinaria piriformis*, *Psallus seriatus*, *Pseudacysta perseae*, *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pseudococcus* spp. tales como *Pseudococcus comstocki*; *Psylla* spp. tales como *Psylla mali*, *Psylla piri*; *Pteromalus* spp., *Pyrilla* spp., *Quadraspidotus* spp., *Quesada gigas*, *Rastrococcus* spp., *Reduvius senilis*, *Rhodnius* spp., *Rhopalomyzus ascalonicus*, *Rhopalosiphum* spp. tales como *Rhopalosiphum pseudobrassicarum*, *Rhopalosiphum insertum*,

25 *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum padi*; *Sagatodes* spp., *Sahlbergella singularis*, *Saissetia* spp., *Sappaphis mala*, *Sappaphis mali*, *Scaphoides titanus*, *Schizaphis graminum*, *Schizoneura lanuginosa*, *Scotinophora* spp., *Selenaspis articulatus*, *Sitobion avenae*, *Sogata* spp., *Sogatella furcifera*, *Solubea insularis*, *Stephanitis nashi*, *Stictocephala festina*, *Tenalaphara malayensis*, *Thyanta* spp. tales como *Thyanta perditor*; *Tibraca* spp.,

30 *Tinocallis caryaefoliae*, *Tomaspis* spp., *Toxoptera* spp. tales como *Toxoptera aurantii*; *Trialeurodes* spp. tales como *Trialeurodes vaporariorum*; *Triatoma* spp., *Trioza* spp., *Typhlocyba* spp., *Unaspis* spp. tales como *Unaspis yanonensis*; y *Viteus vitifolii*,

hormigas, abejas, avispas, moscas de sierra (Hymenoptera), por ejemplo, *Athalia rosae*, *Atta capiguara*, *Atta cephalotes*, *Atta cephalotes*, *Atta laevigata*, *Atta robusta*, *Atta sexdens*, *Atta texana*, *Bombus* spp., *Camponotus floridanus*, *Crematogaster* spp., *Dasymutilla occidentalis*, *Diprion* spp., *Dolichovespula maculata*, *Hoplocampa* spp. como *Hoplocampa minuta*, *Hoplocampa testudinea*; *Lasius* spp. tales como *Lasius niger*, *Linepithema humile*, *Monomorium pharaonis*, *Paravespula germanica*, *Paravespula pennsylvanica*, *Paravespula vulgaris*, *Pheidole megacephala*, *Pogonomyrmex barbatus*, *Pogonomyrmex californicus*, *Polistes rubiginosa*, *Solenopsis geminata*, *Solenopsis invicta*, *Solenopsis richteri*, *Solenopsis xiloni*, *Vespa* spp. como *Vespa crabro* y *Vespa squamosa*,

40 grillos, saltamontes, langostas (Orthoptera), por ejemplo, *Acheta domestica*, *Calliptamus italicus*, *Chortoicetes terminifera*, *Dociostaurus maroccanus*, *Grillotalpa africana*, *Grillotalpa* *Grillotalpa*, *Hieroglyphus daganensis*, *Kraussaria angulifera*, *Locusta migratoria*, *Locustana pardalina*, *Melanoplus bivittatus*, *Melanoplus femurrubrum*, *Melanoplus mexicanus*, *Melanoplus sanguinipes*, *Melanoplus spretus*, *Nomadacris septemfasciata*, *Oedaleus senegalensis*, *Schistocerca americana*, *Schistocerca gregaria*, *asynamor* *Tachycines* y *Zonozelus variegatus*,

45 arácnidos (Arachnida), tales como ácaros, por ejemplo, de las familias *Argasidae*, *Ixodidae* y *Sarcoptidae*, tales como *Amblyomma* spp. (por ejemplo, *Amblyomma americanum*, *Amblyomma variegatum*, *Amblyomma maculatum*), *Argas* spp. (por ejemplo, *Argas persicus*), *Boophilus* spp. (por ejemplo, *Boophilus annulatus*, *Boophilus decoloratus*, *Boophilus microplus*), *Dermacentor silvarum*, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor variabilis*, *Hyalomma* spp. (por ejemplo, *Hyalomma truncatum*), *Ixodes* spp. (por ejemplo, *Ixodes ricinus*, *Ixodes rubicundus*, *Ixodes scapularis*, *Ixodes holocyclus*, *Ixodes pacificus*), *Ornithodoros* spp. (por ejemplo, *Ornithodoros moubata*, *Ornithodoros hermsi*, *Ornithodoros turicata*), *Ornithonyssus bacoti*, *Otobius megnini*, *Dermanyssus gallinae*, *Psoroptes* spp. (por ejemplo, *Psoroptes ovis*), *Rhipicephalus* spp. (por ejemplo, *Rhipicephalus sanguineus*, *Rhipicephalus appendiculatus*, *Rhipicephalus evertsi*), *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp. (por ejemplo, *Sarcoptes scabiei*) y *Eriophyidae* spp. como *Acaria sheldoni*, *Aculops* spp. (por ejemplo, *Aculops pelekassi*) *Aculops* spp. (por ejemplo, *Aculops schlehtendali*), *Epitrimerus piri*, *Philocoprotruta oleivora* y *Eriophyes* spp. (por ejemplo, *Eriophyes sheldoni*); *Tarsonemidae* spp. tales como *Hemitarsonemus* spp., *Phytonemus pallidus* y *Polyphagotarsonemus latus*, *Stenotarsonemus* spp.; *Tenuipalpidae* spp. como *Brevipalpus* spp. (por ejemplo, *Brevipalpus phoenicis*); *Tetranychidae* spp. tales como *Eotetranychus* spp., *Eutetranychus* spp., *Oligonychus* spp., *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus kanzawai*, *Tetranychus pacificus*, *Tetranychus telarius*

y *Tetranychus urticae*; *Bryobia praetiosa*, *Panonychus* spp. (por ejemplo, *Panonychus ulmi*, *Panonychus citri*), *Metatetranychus* spp. y *Oligonychus* spp. (por ejemplo, *Oligonychus pratensis*), *Vasates lycopersici*; Araneida, por ejemplo, *Latrodectus mactans*, y *Loxosceles reclusa*. Y *Acarus siro*, *Chorioptes* spp., Pulgas *Scorpio maurus* (*Siphonaptera*), por ejemplo, *Ceratophyllus* spp., *Ctenocephalides felis*, *Ctenocephalides canis*, *Xenopsilla cheopis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, y *Nosopsillus fasciatus*,
 5 pececillo de plata, firebrat (*Thysanura*), por ejemplo, *Lepisma saccharina* y *Thermobia domestica*, ciempiés (*Chilopoda*), por ejemplo, *Geophilus* spp., *Scutigera* spp. tal como *Scutigera coleoptrata*; milpiés (*Diplopoda*), por ejemplo, *Blaniulus guttulatus*, *Narceus* spp.,
 10 tijeretas (*Dermaptera*), por ejemplo, *forficula auricularia*, piojos (*Phthiraptera*), por ejemplo, *Damalinia* spp., *Pediculus* spp. tales como *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*; *Pthirus pubis*, *Haematopinus* spp. tales como *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus suis*; *Linognathus* spp. tales como *Linognathus vituli*; *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*, *Menacanthus stramineus* y *Solenopotes capillatus*, *Trichodectes* spp.,
 15 colémbolos (*Collembola*), por ejemplo, *Onychiurus* ssp. tales como *Onychiurus armatus*.

[0266] También son adecuados para el control de nematodos: nematodos fitoparásitos tales como nematodos del nudo de la raíz, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica* y otras especies de *Meloidogyne*; nematodos formadores de quistes, *Globodera rostochiensis* y otras especies de *Globodera*; *Heterodera avenae*, *Heterodera glycines*, *Heterodera schachtii*, *Heterodera trifolii* y otras especies de *Heterodera*; nematodos de la vesícula biliar, especies de *Anguina*; nematodos del tallo y las hojas, especies de *Aphelenchoides* tales como *Aphelenchoides besseyi*; nematodos Sting, *Belonolaimus longicaudatus* y otras especies de *Belonolaimus*; nematodos del pino, *Bursaphelenchus lignicolus* Mamiya et Kiyohara, *Bursaphelenchus xilophilus* y otras especies de *Bursaphelenchus*; Nematodos de anillo, especies de *Criconema*, especies de *Criconemella*, especies de *Criconemoides*, especies de *Mesocriconema*; nematodos del tallo y del bulbo, *Ditilenchus destructor*,
 25 *Ditilenchus dipsaci* y otras especies de *Ditilenchus*; nematodos Awl, especies de *Dolichodorus*; nematodos espirales, *Helicocotilenchus multicinctus* y otras especies de *Helicocotilenchus*; nematodos de la vaina y vainoides, especies de *Hemicyclophora* y especies de *Hemicriconemoides*; especie de *Hirshmanniella*; nematodos de lanza, especie de *Hoploaimus*; falsos nematodos del nudo de la raíz, especies de *Nacobbus*; nematodos de aguja, *Longidorus elongatus* y otras especies de *Longidorus*; nematodos de lesiones, *Pratilenchus brachyurus*, *Pratilenchus neglectus*,
 30 *Pratilenchus penetrans*, *Pratilenchus curvatus*, *Pratilenchus goodeyi* y otras especies de *Pratilenchus*; nematodos barrenadores, *Radopholus similis* y otras especies de *Radopholus*; nematodos reniformes, *Rotilenchus robustus*, *Rotilenchus reniformis* y otras especies de *Rotilenchus*; especies de *Scutellonema*; nematodos de raíz gruesa, *Trichodorus primitivus* y otras especies de *Trichodorus*, especies de *Paratrachodorus*; nematodos Stunt, *Tilenchorhynchus claytoni*, *Tilenchorhynchus dubius* y otras especies de *Tilenchorhynchus*; nematodos de los cítricos, especies de *Tilenchulus* tales como *Tilenchulus semipenetrans*; nematodos Dagger, especie de *Xiphinema*; y otras especies de nematodos fitoparásitos.

[0267] Los ejemplos de otras especies de plagas que pueden controlarse mediante compuestos de fórmula (I) incluyen: de la clase de Bivalva, por ejemplo, *Dreissena* spp.; de la clase de los *Gastropoda*, por ejemplo, *Arion* spp., *Biomphalaria* spp., *Bulinus* spp., *Derocheras* spp., *Galba* spp., *Lymnaea* spp., *Oncomelania* spp., *Succinea* spp.; de la clase de los helmintos, por ejemplo, *Ancilostoma duodenale*, *Ancilostoma ceilanicum*, *Ancilostoma braziliense*, *Ancilostoma* spp., *Ascaris lubricoides*, *Ascaris* spp., *Brugia malayi*, *Brugia timori*, *Bunostomum* spp., *Chabertia* spp., *Clonorchis* spp., *Cooperia* spp., *Dicrocoelium* spp., *Dictyocaulus filaria*, *Diphilobothrium latum*, *Dracunculus medinensis*, *Echinococcus granulosus*, *Echinococcus multilocularis*, *Enterobius vermicularis*, *Faciola* spp.,
 45 *Haemonchus* spp. como *Haemonchus contortus*; *Heterakis* spp., *Hymenolepis nana*, *Hyostrongylus* spp., *Loa Loa*, *Nematodirus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Opisthorchis* spp., *Onchocerca volvulus*, *Ostertagia* spp., *Paragonimus* spp., *Schistosomen* spp., *Strongiloides fuelleborni*, *Strongiloides stercora lis*, *Stroniloides* spp., *Taenia saginata*, *Taenia solium*, *Trichinella spiralis*, *Trichinella nativa*, *Trichinella britovi*, *Trichinella nelsoni*, *Trichinella pseudospiralis*, *Trichostrongylus* spp., *Trichuris trichuria*, *Wuchereria bancrofti*; del orden de los *Isopoda*, por ejemplo, *Armadillidium vulgare*, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*; del orden de los *Symphyla*, por ejemplo, *Scutigera inmaculata*;

[0268] Otros ejemplos de especies de plagas que pueden ser controladas por los compuestos de fórmula (I) incluyen: *Anisoplia austriaca*, *Apamea* spp., *Austroasca viridigrisea*, *Baliothrips biformis*, *Caenorhabditis elegans*, *Cephus* spp., *Ceutorhynchus napi*, *Chaetocnema aridula*, *Chilo auricilius*, *Chilo indicus*, *Chilo polychrysus*,
 55 *Chortiocetes terminifera*, *Cnaphalocroci medinalis*, *Cnaphalocrosis* spp., *Colias eurytheme*, *Collops* spp., *Cornitermes cumulans*, *Creontiades* spp., *Cyclocephala* spp., *Dalbulus maidis*, *Deraceras reticulatum*, *Diatrea saccharalis*, *Dichelops furcatus*, *Dicladispa armigera*, *Diloboderus* spp. tales como *Diloboderus abderus*; *Edessa* spp., *Epinothia* spp., *Formicidae*, *Geocoris* spp., *Globitermes sulfureus*, *Gryllotalpidae*, *Halotydeus destructor*, *Hipnodes bicolor*, *Hydrellia philippina*, *Julus* spp., *Laodelphax* spp., *Leptocorsia acuta*, *Leptocorsia oratorius*,

Liogenys fuscus, Lucillia spp., Lyogenys fuscus, Mahanarva spp., Maladera matrida, Marasmia spp., Mastotermes spp., Mealybugs, Megascelis ssp, Metamasius hemipterus, Microtheca spp., Mocis latipes, Murgantia spp., Mythemina separata, Neocapritermes opacus, Neocapritermes parvus, Neomegalotomus spp., Neotermes spp., Nymphula depunctalis, Oebalus pugnax, Orseolia spp. tales como Orseolia oryzae; Oxycaraenus hyalinipennis, 5 Plusia spp., Pomacea canaliculata, Procornitermes spp., Procornitermes triacifer, Psylloides spp., Rachiplusia spp., Rhodopholus spp., Scaptocoris castanea, Scaptocoris spp., Scirpophaga spp. tales como Scirpophaga incertulas, Scirpophaga innotata; Scotinophara spp. tales como Scotinophara coarctata; Sesamia spp. tales como Sesamia inferens, Sogaella frucifera, Solenopsis geminata, Spissistilus spp., barrenador del tallo, Stenchaetothrips biformis, Stenotarsonemus spinki, Sylepta derogata, Telehin licus, Trichostrongylus spp.

10

[0269] Los compuestos de la presente invención, que incluyen sus sales, estereoisómeros y tautómeros, son particularmente útiles para controlar insectos, preferiblemente insectos que chupan o perforan y mastican y pican tales como insectos de los géneros Lepidoptera, Coleoptera y Hemiptera, en particular Lepidoptera, Coleoptera y chinches.

15

[0270] Los compuestos de la presente invención, que incluyen sus sales, estereoisómeros y tautómeros, son útiles además para controlar insectos de los órdenes Thysanoptera, Diptera (especialmente moscas, mosquitos), Hymenoptera (especialmente hormigas) e Isoptera (especialmente termitas).

20 **[0271]** Los compuestos de la presente invención, que incluyen sus sales, estereoisómeros y tautómeros, son particularmente útiles para controlar insectos de los órdenes Lepidoptera y Coleoptera.

[0272] La invención también se refiere a composiciones agroquímicas que comprenden un auxiliar y al menos un compuesto I de acuerdo con la invención.

25

[0273] Una composición agroquímica comprende una cantidad eficaz como plaguicida de un compuesto I. El término "cantidad efectiva" indica una cantidad de la composición o de los compuestos I, que es suficiente para controlar hongos dañinos en plantas cultivadas o en la protección de materiales y que no produce un daño sustancial a las plantas tratadas. Dicha cantidad puede variar en un amplio intervalo y depende de varios factores, tales como la especie a controlar, la planta o material cultivado tratado, las condiciones climáticas y el compuesto I específico utilizado.

30

[0274] Los compuestos I, sus N-óxidos y sales se pueden convertir en tipos habituales de composiciones agroquímicas, por ejemplo, soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, pulverizados, pastas, gránulos, 35 prensados, cápsulas y sus mezclas. Ejemplos de tipos de composición son suspensiones (por ejemplo, SC, OD, FS), concentrados emulsionables (por ejemplo, EC), emulsiones (por ejemplo, EW, EO, ES, ME), cápsulas (por ejemplo, CS, ZC), pastas, pastillas, polvos humectables o polvos (por ejemplo, WP, SP, WS, DP, DS), prensados (por ejemplo, BR, TB, DT), gránulos (por ejemplo, WG, SG, GR, FG, GG, MG), artículos insecticidas (por ejemplo, LN) y formulaciones en gel para el tratamiento de materiales de propagación de plantas tales como semillas (por ejemplo, 40 GF). Estos y otros tipos de composiciones se definen en el "Catalogue of pesticide formulation types and international coding system", Monografía técnica n.º 2, 6ª edición, mayo de 2008, CropLife International.

40

[0275] Las composiciones se preparan de una manera conocida, tal como se describe por Mollet y Grubemann, tecnología de formulación, Wiley VCH, Weinheim, 2001; o Knowles, New developments in crop 45 protection product formulation, Agrow Reports DS243, T&F Informa, Londres, 2005.

[0276] Auxiliares adecuados son disolventes, vehículos líquidos, vehículos sólidos o cargas, agentes tensioactivos, dispersantes, emulsionantes, humectantes, adyuvantes, solubilizantes, potenciadores de la penetración, coloides protectores, agentes de adherencia, espesantes, humectantes, repelentes, atrayentes, 50 estimulantes de la alimentación, compatibilizadores, bactericidas, agentes anticongelantes, agentes antiespumantes, colorantes, agentes de pegajosidad y aglutinantes.

50

[0277] Los disolventes y vehículos líquidos adecuados son agua y disolventes orgánicos, tales como fracciones de aceite mineral de punto de ebullición medio a alto, por ejemplo, queroseno, gasóleo; aceites de origen 55 vegetal o animal; hidrocarburos alifáticos, cíclicos y aromáticos, por ejemplo, tolueno, parafina, tetrahidronaftaleno, naftaleno alquilados; alcoholes, por ejemplo, etanol, propanol, butanol, alcohol bencílico, ciclohexanol; glicoles; DMSO; cetonas, por ejemplo, ciclohexanona; ésteres, por ejemplo, lactatos, carbonatos, ésteres de ácidos grasos, gamma-butirolactona; ácidos grasos; fosfonatos; aminas; amidas, por ejemplo, N-metilpirrolidona, dimetilamidas de ácidos grasos; y sus mezclas.

55

[0278] Los vehículos o cargas sólidos adecuados son tierras minerales, por ejemplo, silicatos, geles de sílice, talco, caolines, piedra caliza, cal, tiza, arcillas, dolomita, tierra de diatomeas, bentonita, sulfato de calcio, sulfato de magnesio, óxido de magnesio; polisacáridos, por ejemplo, celulosa, almidón; fertilizantes, por ejemplo, sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, ureas; productos de origen vegetal, por ejemplo, harina de cereales, harina de corteza de árbol, harina de madera, harina de cáscara de nuez y sus mezclas.

[0279] Los tensioactivos adecuados son compuestos tensioactivos, tales como tensioactivos aniónicos, catiónicos, no iónicos y anfóteros, polímeros en bloque, polielectrolitos y sus mezclas. Dichos tensioactivos se pueden usar como emulsionante, dispersante, solubilizante, humectante, potenciador de la penetración, coloide protector o adyuvante. Los ejemplos de tensioactivos se enumeran en McCutcheon's, Vol.1: Emulsifiers&Detergents, McCutcheon's Directories, Glen Rock, EE. UU., 2008 (International Ed. O North American Ed.).

[0280] Los tensioactivos aniónicos adecuados son sales alcalinas, alcalinotérricas o de amonio de sulfonatos, sulfatos, fosfatos, carboxilatos y sus mezclas. Ejemplos de sulfonatos son alquilarilsulfonatos, difenilsulfonatos, alfaolefin sulfonatos, lignina sulfonatos, sulfonatos de ácidos grasos y aceites, sulfonatos de alquilfenoles etoxilados, sulfonatos de arilfenoles alcoxilados, sulfonatos de naftalenos condensados, sulfonatos de dodecilo y tridecibencenos, sulfonatos de naftalenos y alquilnaftalenos, sulfosuccinatos o sulfosuccinatos. Ejemplos de sulfatos son sulfatos de ácidos grasos y aceites, de alquilfenoles etoxilados, de alcoholes, de alcoholes etoxilados o de ésteres de ácidos grasos. Ejemplos de fosfatos son ésteres de fosfato. Ejemplos de carboxilatos son alquilcarboxilatos y alcohol carboxilado o alquilfenoletoxilatos.

[0281] Los tensioactivos no iónicos adecuados son alcoxilatos, amidas de ácidos grasos sustituidas en el N, óxidos de aminas, ésteres, tensioactivos basados en azúcar, tensioactivos poliméricos y sus mezclas. Los ejemplos de alcoxilatos son compuestos tales como alcoholes, alquilfenoles, aminas, amidas, arilfenoles, ácidos grasos o ésteres de ácidos grasos que se han alcoxilado con 1 a 50 equivalentes. Se pueden emplear óxido de etileno y/u óxido de propileno para la alcoxilación, preferiblemente óxido de etileno. Los ejemplos de amidas de ácidos grasos sustituidas en el N son glucamidas de ácidos grasos o alcanolamidas de ácidos grasos. Ejemplos de ésteres son ésteres de ácidos grasos, ésteres de glicerol o monoglicéridos. Ejemplos de tensioactivos a base de azúcar son sorbitanos, sorbitanos etoxilados, sacarosa y ésteres de glucosa o alquilpoliglucósidos. Ejemplos de tensioactivos poliméricos son homo- o copolímeros de vinilpirrolidona, vinilalcoholes, o acetato de vinilo.

[0282] Los tensioactivos catiónicos adecuados son tensioactivos cuaternarios, por ejemplo, compuestos de amonio cuaternario con uno o dos grupos hidrófobos, o sales de aminas primarias de cadena larga. Los tensioactivos anfóteros adecuados son alquilbetaínas e imidazolininas. Los polímeros en bloque adecuados son polímeros en bloque de tipo A-B o A-B-A que comprenden bloques de óxido de polietileno y óxido de polipropileno, o del tipo A-B-C que comprende alcohol, óxido de polietileno y óxido de polipropileno. Polielectrolitos adecuados son poliácidos o polibases. Ejemplos de poliácidos son sales alcalinas de ácido poliacrílico o polímeros peine de poliácido. Ejemplos de polibases son polivinilaminas o polietilenaminas.

[0283] Los adyuvantes adecuados son compuestos que tienen una actividad pesticida despreciable o incluso no tienen actividad pesticida propia, y que mejoran el rendimiento biológico del compuesto l sobre el objetivo. Los ejemplos son tensioactivos, aceites minerales o vegetales y otros auxiliares. Otros ejemplos están listados por Knowles, Adjuvants and additives, Agrow Reports DS256, T&F Informa UK, 2006, capítulo 5.

[0284] Los espesantes adecuados son polisacáridos (por ejemplo, goma de xantano, carboximetilcelulosa), arcillas inorgánicas (orgánicamente modificadas o no modificadas), policarboxilatos y silicatos.

[0285] Bactericidas adecuados son derivados de bronopol e isotiazolinona tales como alquilisotiazolinonas y benzisotiazolinonas.

[0286] Los agentes anticongelantes adecuados son etilenglicol, propilenglicol, urea y glicerina.

[0287] Los agentes antiespumantes adecuados son siliconas, alcoholes de cadena larga y sales de ácidos grasos.

[0288] Los colorantes adecuados (por ejemplo, en rojo, azul o verde) son pigmentos de baja solubilidad en agua y colorantes solubles en agua. Ejemplos son colorantes inorgánicos (por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, hexacianoferrato de hierro) y colorantes orgánicos (por ejemplo, colorantes de alizarin-, azo- y ftalo-cianina).

[0289] Los agentes de pegajosidad o aglutinantes adecuados son polivinilpirrolidonas, polivinilacetatos, poli (alcoholes vinílicos), poliacrilatos, ceras biológicas o sintéticas y éteres de celulosa.

5 **[0290]** Ejemplos de tipos de composición y su preparación son:

i) Concentrados solubles en agua (SL, LS)

10 **[0291]** Se disuelve el 10-60 % en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención y el 5-15 % en peso de agente humectante (por ejemplo, alcoxilatos de alcohol) en agua y/o en un disolvente soluble en agua (por ejemplo, alcoholes) hasta el 100 % en peso. La sustancia activa se disuelve con la dilución con agua.

ii) Concentrados dispersables (DC)

15 **[0292]** Se disuelve el 5-25 % en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención y el 1-10 % en peso de dispersante (por ejemplo, polivinilpirrolidona) en disolvente orgánico (por ejemplo, ciclohexanona) hasta el 100 % en peso. La dilución con agua da una dispersión.

iii) Concentrados emulsionables (CE)

20 **[0293]** Se disuelve el 15-70 % en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención y el 5-10 % en peso de emulsionantes (por ejemplo, dodecilbencenosulfonato de calcio y etoxilato de aceite de ricino) en disolvente orgánico insoluble en agua (por ejemplo, hidrocarburo aromático) hasta el 100 % en peso. La dilución con agua da una emulsión.

25 iv) Emulsiones (EW, EO, ES)

30 **[0294]** Se disuelve el 5-40 % en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención y el 1-10 % en peso de emulsionantes (por ejemplo, dodecilbencenosulfonato de calcio y etoxilato de aceite de ricino) en el 20-40 % en peso de disolvente orgánico insoluble en agua (por ejemplo, hidrocarburo aromático). Esta mezcla se introduce en agua al 100 % en peso por medio de una máquina emulsionante y se transforma en una emulsión homogénea. La dilución con agua da una emulsión.

v) Suspensiones (SC, OD, FS)

35 **[0295]** En un molino de bolas agitado, el 20-60 % en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención se trituran con la adición del 2-10 % en peso de dispersantes y agentes humectantes (por ejemplo, lignosulfonato de sodio y etoxilato de alcohol), el 0,1-2 % en peso de espesante (por ejemplo, goma de xantano) y agua al 100 % en peso para dar una suspensión fina de sustancia activa. La dilución con agua proporciona una suspensión estable de la sustancia activa. Para la composición de tipo FS, se añade hasta el 40 % en peso de aglutinante (por ejemplo, poli (alcohol vinílico)).

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

45 **[0296]** El 50-80 % en peso de un compuesto I según la invención se tritura finamente con adición de dispersantes y agentes humectantes (por ejemplo, lignosulfonato de sodio y etoxilato de alcohol) al 100 % en peso y se prepara como gránulos dispersables en agua o solubles en agua mediante aparatos técnicos (por ejemplo, extrusión, torre de pulverización, lecho fluidizado). La dilución con agua proporciona una dispersión o solución estable de la sustancia activa.

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

55 **[0297]** El 50-80 % en peso de un compuesto I según la invención se trituran en un molino rotor-estator con adición del 1-5 % en peso de dispersantes (por ejemplo, lignosulfonato sódico), el 1-3 % en peso de agentes humectantes (por ejemplo, alcohol etoxilado) y vehículo sólido (por ejemplo, gel de sílice) hasta el 100 % en peso. La dilución con agua proporciona una dispersión o solución estable de la sustancia activa.

viii) Gel (GW, GF)

[0298] En un molino de bolas agitado, se trituran el 5-25 % en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención con adición del 3-10 % en peso de dispersantes (por ejemplo, lignosulfonato de sodio), el 1-5 % en peso de espesante (por ejemplo, carboximetilcelulosa) y agua hasta el 100 % en peso para dar una suspensión fina de la sustancia activa. La dilución con agua proporciona una suspensión estable de la sustancia activa.

5

iv) Microemulsión (ME)

[0299] Se añade el 5-20 % en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención al 5-30 % en peso de mezcla de disolventes orgánicos (por ejemplo, dimetilamida de ácido graso y ciclohexanona), el 10-25 % en peso de mezcla de tensioactivo (por ejemplo, alcohol etoxilado y etoxilato de arilfenol), y agua hasta el 100 %. Esta mezcla se agita durante 1 h para producir espontáneamente una microemulsión termodinámicamente estable.

10

iv) Microcápsulas (CS)

[0300] Una fase oleosa que comprende el 5-50 % en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención, el 0-40 % en peso de disolvente orgánico insoluble en agua (por ejemplo, hidrocarburo aromático), y el 2-15 % en peso de monómeros acrílicos (por ejemplo, metacrilato de metilo, ácido metacrílico y o triacrilato) se dispersan en una solución acuosa de un coloide protector (por ejemplo, poli (alcohol vinílico)). La polimerización radicalaria iniciada por un iniciador radicalario da como resultado la formación de microcápsulas de poli (met)acrilato. Como alternativa, una fase oleosa que comprende el 5-50 % en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención, el 0-40 % en peso de disolvente orgánico insoluble en agua (por ejemplo, hidrocarburo aromático) y un monómero de isocianato (por ejemplo, difenilmetano-4,4'-diisocianato) se dispersan en una solución acuosa de un coloide protector (por ejemplo, alcohol polivinílico). La adición de una poliamina (por ejemplo, hexametildiamina) da como resultado la formación de una microcápsula de poliurea. Los monómeros ascienden al 1-10 % en peso. El % en peso se refiere a la composición de CS total.

20

25

ix) Polvos secos (DP, DS)

[0301] El 1-10 % en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención se muele finamente y se mezcla íntimamente con un vehículo sólido (por ejemplo, caolín finamente dividido) hasta el 100 % en peso.

30

x) Gránulos (GR, FG)

[0302] El 0,5-30 % en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención se muele finamente y se asocia con un vehículo sólido (por ejemplo, silicato) al 100 % en peso. La granulación se logra mediante extrusión, secado por pulverización o lecho fluidizado.

35

xi) Líquidos de volumen ultrabajo (UL)

[0303] El 1-50 % en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención se disuelven en disolvente orgánico (por ejemplo, hidrocarburo aromático) hasta el 100 % en peso.

40

[0304] Las composiciones de los tipos i) a xi) pueden comprender opcionalmente otros auxiliares, tales como el 0,1-1 % en peso de bactericidas, el 5-15 % en peso de agentes anticongelantes, el 0,1-1 % en peso de agentes antiespumantes, y el 0,1-1 % en peso de colorantes.

45

[0305] Las composiciones agroquímicas generalmente comprenden entre el 0,01 y el 95 %, preferiblemente entre el 0,1 y el 90 %, y en particular entre el 0,5 y el 75 %, en peso de sustancia activa. Las sustancias activas se emplean en una pureza del 90 % al 100 %, preferiblemente del 95 % al 100 % (de acuerdo con el espectro de RMN).

50

[0306] Generalmente se emplean soluciones para el tratamiento de semillas (LS), suspoemulsiones (SE), concentrados fluidos (FS), polvos para tratamiento en seco (DS), polvos dispersables en agua para el tratamiento de pulpa (WS), polvos solubles en agua (SS), emulsiones (ES), concentrados emulsionables (EC) y geles (GF) para el tratamiento de materiales de propagación de plantas, particularmente semillas. Las composiciones en cuestión dan, después de una dilución de dos a diez veces, concentraciones de sustancia activa del 0,01 al 60 % en peso, preferiblemente del 0,1 al 40 % en peso, en las preparaciones listas para usar. La aplicación puede llevarse a cabo antes o durante la siembra. Los métodos para aplicar el compuesto I y sus composiciones, respectivamente, sobre el material de propagación de la planta, especialmente las semillas, incluyen métodos de aplicación, recubrimiento, sedimentación, espolvoreo, remojo y aplicación en surcos del material de propagación. Preferiblemente, el

55

compuesto I o sus composiciones, respectivamente, se aplican sobre el material de propagación de la planta mediante un método tal que no se induce la germinación, por ejemplo, mediante la aplicación de semillas, la sedimentación, el recubrimiento y el espolvoreo.

5 **[0307]** Cuando se emplean en la protección de plantas, las cantidades de sustancias activas aplicadas son, dependiendo del tipo de efecto deseado, de 0,001 a 2 kg por ha, preferiblemente de 0,005 a 2 kg por ha, más preferiblemente de 0,05 a 0,9 kg por ha, y en particular de 0,1 a 0,75 kg por ha.

10 **[0308]** En el tratamiento de materiales de propagación de plantas tales como semillas, por ejemplo, espolvoreando, recubriendo o empapando semillas, por lo general, se requieren cantidades de sustancia activa de 0,1 a 1000 g, preferiblemente de 1 a 1000 g, más preferiblemente de 1 a 100 g y lo más preferiblemente de 5 a 100 g por 100 kilogramos de material de propagación de plantas (preferiblemente semillas). Cuando se usa en la protección de materiales o productos almacenados, la cantidad de sustancia activa aplicada depende del tipo de área de aplicación y del efecto deseado. Las cantidades aplicadas habitualmente en la protección de materiales son
15 de 0,001 g a 2 kg, preferiblemente de 0,005 g a 1 kg de sustancia activa por metro cúbico de material tratado.

[0309] Se pueden añadir diversos tipos de aceites, humectantes, adyuvantes, fertilizantes o micronutrientes, y otros plaguicidas (por ejemplo, herbicidas, insecticidas, fungicidas, reguladores del crecimiento, protectores) a las sustancias activas o las composiciones que los comprenden como premezcla o, en su caso, inmediatamente antes
20 del uso (mezcla de tanque). Estos agentes se pueden mezclar con las composiciones de acuerdo con la invención en una relación en peso de 1:100 a 100:1, preferiblemente 1:10 a 10:1.

[0310] El usuario aplica la composición de acuerdo con la invención usualmente desde un dispositivo de predosificación, un pulverizador de mochila, un tanque de pulverización, un plano de pulverización o un sistema de riego. Habitualmente, la composición agroquímica se compone de agua, también y/o auxiliares adicionales para la
25 concentración de aplicación deseada y así se obtiene el licor de pulverización listo para usar o la composición agroquímica según la invención. Normalmente, se aplican de 20 a 2000 litros, preferiblemente de 50 a 400 litros, del licor de pulverización listo para usar por hectárea de área agrícola útil.

30 **[0311]** Según una realización, el propio usuario puede mezclar componentes individuales de la composición de acuerdo con la invención tales como partes de un kit o partes de una mezcla binaria o ternaria en un tanque de pulverización y se pueden añadir auxiliares adicionales, si es apropiado. En una realización adicional, el usuario puede mezclar componentes individuales de la composición según la invención o componentes parcialmente premezclados, por ejemplo, los componentes que comprenden los compuestos I y/o las sustancias activas de los
35 grupos M) o F) (véase a continuación) en un tanque de pulverización y pueden añadirse otros auxiliares y aditivos, si corresponde.

[0312] En una realización adicional, los componentes individuales de la composición de acuerdo con la invención o los componentes parcialmente premezclados, por ejemplo, los componentes que comprenden los
40 compuestos I y/o las sustancias activas de los grupos M.1 a M.UN.X o FI a F.XII, pueden aplicarse conjuntamente (por ejemplo, después de la mezcla del tanque) o consecutivamente.

[0313] La siguiente lista M de plaguicidas, agrupados de acuerdo con la Clasificación del Modo de Acción del Comité de Acción de Resistencia a Insecticidas (IRAC), junto con la cual pueden usarse los compuestos de acuerdo
45 con la invención y con los posibles efectos sinérgicos, pretende ilustrar las posibles combinaciones, pero no imponer ninguna limitación:

M.1 Inhibidores de la acetilcolinesterasa (AChE) de la clase de

50 M.1A carbamatos, por ejemplo, aldicarb, alanycarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbarilo, carbofurano, carbosulfano, etiofencarb, fenobucarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metiocarb, metomil, metolcarb, oxamil, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, trimethacarb, XMC, xililcarb y triazamato; o de la clase de
55 M.1B organofosfatos, por ejemplo, acefato, azametifos, azinfos-etilo, azinfosmetilo, cadusafos, cloretoxifos, clorfenvinfos, clormefos, clorpirifos, clorpirifos-metilo, cumafos, cianofos, demeton-S-metilo, diazinón, diclorvos/DDVP, dicrotofos, dimetoato, dimetilovinfos, disulfoton, EPN, etion, ethoprofos, famphur, fenamifos, fenitroton, fentiión, fostiazato, heptenofos, imicyafos, isofenfos, salicilato de isopropil O-(metoxiaminotio-fosforilo), isoxation, malation, mecarbam, methamidofos, methidation, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemeton-metilo, paratiión, paratiión-metilo, fetoato, forato, fosalona, fosmet, fosfamidón, phoxim,

pirimifosmetilo, profenofos, propetamfos, profofos, piraclufos, piridaphention, quinalfos, sulfotep, tebupirimfos, temefos, terbufos, tetraclorvinfos, tiometón, triazofos, triclorfón y vamidotión;

M.2. Antagonistas del canal de cloruro activados por GABA, tales como:

5

M.2A compuestos organoclorados de ciclodieno, como por ejemplo, endosulfan o clordano; o
M.2B fiproles (fenilpirazoles), como por ejemplo, ethiprol, fipronilo, flufiprol, pirafluprol y piriprol;

M.3 Moduladores de canales de sodio de la clase de

10

M.3A piretroides, por ejemplo, acrinatrina, aletrina, d-cis-trans aletrina, d-trans aletrina, bifentrina, bioaletrina, bioaletrina S-ciclopentenilo, bioserestrina, cicloprotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, gamma-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, beta-cipermetrina, theta-cipermetrina, zeta-cipermetrina, cifenotrina, deltametrina, empentrina, esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucirinato, flumetrina, tau-fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, meperflutrina, metoflutrina, mafluorotrina, permetrina, fenotrina, praletrina, proflutrina, piretrina (piretro), resmetrina, silafluofeno, teflutrina, tetrametilflutrina, tetrametrina, tralometrina y transflutrina; o

M.3B moduladores de canales de sodio tales como DDT o metoxicloro;

20

M.4 agonistas de los receptores de acetilcolina nicotínicos (nAChR) de la clase de

M.4A neonicotinoides, por ejemplo, acteamiprid, chlothianidin, dinotefuran, imidacloprid, nitenpiram, tiacloprid y tiametoxam; o los compuestos

25

M.4A.1: 1-[(6-cloro-3-piridinil) metil]-2,3,5,6,7,8-hexahidro-9-nitro-(5S, 8R)-5,8-epoxi -1H-imidazo [1,2-a] azepina; o

M.4A.2: 1-[(6-cloro-3-piridil) metil]-2-nitro-1-[(E)-pentilidenamino] guanidina; o

M.4A.3: 1-[(6-cloro-3-piridil) metil]-7-metil-8-nitro-5-propoxi-3,5,6,7-tetrahidro-2H-imidazo [1,2-a] piridina;

o M.4B nicotina.

30

M.5 Activadores alostéricos del receptor de acetilcolina nicotínico de la clase de espinosinas, por ejemplo, espinosad o spinetoram;

M.6 Activadores del canal de cloruro de la clase de avermectinas y milbemicinas, por ejemplo, abamectina, benzoato de emamectina, ivermectina, lepimectina o milbemectina;

35

M.7 miméticos de hormonas juveniles, como

M.7A análogos de hormonas juveniles como hidropreno, quinopreno y metopreno; u otros como M.7B fenoxicarb o M.7C piriproxifeno;

40

M.8 inhibidores no específicos (sitios múltiples) diversos, por ejemplo

M.8A halogenuros de alquilo como bromuro de metilo y otros haluros de alquilo, o

M.8B cloropicrina o M.8C fluoruro de sulfurilo o M.8D bórax o M.8E emético de tartrato;

45

M.9 Bloqueadores selectivos de la alimentación homóptera, por ejemplo

M.9B pimetrozina o M.9C flonicamid;

50

M.10 Inhibidores del crecimiento de ácaros, por ejemplo

M.10A clofentezina, hexitiazox y diflovidazina o M.10B etoxazol;

55

M.11 Disruptores microbianos de las membranas del intestino medio de insectos, por ejemplo, *bacillus thuringiensis* o *bacillus sphaericus* y las proteínas insecticidas que producen tales como *bacillus thuringiensis subesp. israelensis*, *bacillus sphaericus*, *bacillus thuringiensis subsp. aizawai*, *bacillus thuringiensis subsp. kurstaki* y *bacillus thuringiensis subsp. tenebrionis*, o las proteínas de cultivo Bt: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry2Ab, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb y Cry34/35Ab1;

- M.12 Inhibidores de la ATP sintetasa mitocondrial, por ejemplo
- M.12A diafentiuron, o
 5 M.12B acaricidas de organoestaño tales como óxido de azociclotina, cihexatina o fenbutatina, o M.12C propargita, o M.12D tetradifon;
- M.13 Desacopladores de la fosforilación oxidativa por disrupción del gradiente de protones, por ejemplo, clorfenapir, DNOC o sulfluramid;
- 10 M.14 Bloqueadores de los canales de los receptores nicotínicos de acetilcolina (nAChR), por ejemplo, análogos de nereistoxina como bensultap, clorhidrato de cartap, tiociclam o tiosultap sódico;
- M.15 Inhibidores de la biosíntesis de quitina tipo 0, tales como benzoilureas como por ejemplo, bistriflurón, clorfluazurón, diflubenzurón, flucicloxurón, flufenoxurón, hexaflumurón, lufenurón, novalurón, noviflumurón, teflubenzurón o triflumurón;
- 15 M.16 Inhibidores de la biosíntesis de quitina tipo 1, como por ejemplo, buprofezin;
- M.17 disruptores de la muda, dípteros, como por ejemplo, ciromazina;
- 20 M.18 agonistas del receptor de ecdisona tales como diacilhidrazinas, por ejemplo, metoxifenozida, tebufenozida, halofenozida, fufenozida o cromafenozida;
- M.19 agonistas del receptor de octopamin, como por ejemplo, amitraz;
- 25 M.20 Inhibidores del transporte de electrones del complejo mitocondrial III, por ejemplo
- M.20A hidrametilonon, o M.20B acequinocilo, o M.20C fluacrypirim;
- 30 M.21 Inhibidores del transporte de electrones del complejo mitocondrial I, por ejemplo
- M.21A Acaricidas e insecticidas METI tales como fenazaquin, fenpiroximato, pirimidifeno, piridaben, tebufenpirad o tolfenpirad, o M.21B rotenona;
- 35 M.22 Bloqueadores de canales de sodio dependientes del voltaje, por ejemplo
- M.22A Indoxacarb o M.22B metaflumizona o M.22C 1-[(E)-[2-(4-cianofenil)-1-[3-(trifluorometil) fenil] etiliden] amino]-3-[4-(difluorometoxi) fenil] urea;
- 40 M.23 Inhibidores de la acetil CoA carboxilasa, tales como los derivados del ácido tetrónico y tetrámico, por ejemplo, spirodiclofen, spiromesifen o spirotetramat;
- M.24 Inhibidores del transporte de electrones del complejo mitocondrial IV, por ejemplo, M.24A fosfina tal como fosfuro de aluminio, fosfuro de calcio, fosfina o fosfuro de cinc, o M.24B cianuro.
- 45 M.25 Inhibidores del transporte de electrones del complejo II mitocondrial, tales como derivados de beta-cetonitrilo, por ejemplo, cienopirafeno o ciflumetofeno;
- M.28 Moduladores del receptor de la rianodina de la clase de diamidas, como por ejemplo, flubendiamida, clorantraniliprol (rynaxypir®), ciantraniliprol (cyazypir®) o los compuestos de ftalamida.
- 50 M.28.1: (R)-3-Cloro-N1-{2-metil-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil) etil] fenil}-N2-(1-metil-2)-metilsulfoniletíl ftalamida y
 M.28.2: (S)-3-Cloro-N1-{2-metil-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil) etil] fenil}-N2-(1-metil-2)-metilsulfoniletíl ftalamida, o el compuesto
 M.28.3: 3-bromo-N-{2-bromo-4-cloro-6-[(1-ciclopropiletíl) carbamoil] fenil}-1-(3-clorpiridin-2-il)-1H-pirazol-5-carboxamida (nombre ISO propuesto: cyclaniliprole), o el compuesto
 M.28.4: metil-2-[3,5-dibromo-2-([3-bromo-1-(3-clorpiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il] carbonil) amino] benzoil]-1,2-dimetilhidrazincarboxilato; o un compuesto seleccionado entre M.28.5a) a M.28.5l):
- 55

- M.28.5a) N-[4,6-dicloro-2-[(dietil-lambda-4-sulfaniliden) carbamoil]-fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil) pirazol-3-carboxamida;
- M.28.5b) N-[4-cloro-2-[(dietil-lambda-4-sulfaniliden) carbamoil]-6-metil-fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil) pirazol-3-carboxamida;
- 5 M.28.5c) N-[4-cloro-2-[(di-2-propil-lambda-4-sulfaniliden) carbamoil]-6-metilfenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil) pirazol-3-carboxamida;
- M.28.5d) N-[4,6-dicloro-2-[(di-2-propil-lambda-4-sulfaniliden) carbamoil]-fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil) pirazol-3-carboxamida;
- 10 M.28.5e) N-[4,6-dicloro-2-[(dietil-lambda-4-sulfaniliden) carbamoil]-fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(difluorometil) pirazol-3-carboxamida;
- M.28.5f) N-[4,6-dibromo-2-[(di-2-propil-lambda-4-sulfaniliden) carbamoil]-fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil) pirazol-3-carboxamida;
- M.28.5g) N-[4-cloro-2-[(di-2-propil-lambda-4-sulfaniliden) carbamoil]-6-cianofenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil) pirazol-3-carboxamida;
- 15 M.28.5h) N-[4,6-dibromo-2-[(dietil-lambda-4-sulfaniliden) carbamoil]-fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil) pirazol-3-carboxamida;
- M.28.5i) N-[2-(5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-il)-4-cloro-6-metil-fenil]-5-bromo-2-(3-cloro-2-piridil) pirazol-3-carboxamida;
- M.28.5j) 5-cloro-2-(3-cloro-2-piridil)-N-[2,4-dicloro-6-[(1-ciano-1-metiletil) carbamoil] fenil] pirazol-3-carboxamida;
- 20 M.28.5k) 5-bromo-N-[2,4-dicloro-6-(metilcarbamoil) fenil]-2-(3,5-dicloro-2-piridil) pirazol-3-carboxamida;
- M.28.5l) N-[2-(terc-butilcarbamoil)-4-cloro-6-metil-fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(fluorometoxi) pirazol-3-carboxamida; o un compuesto seleccionado entre
- M.28.6 N2-(1-ciano-1-metil-etil)-N1-(2,4-dimetilfenil)-3-yodo-ftalamida; o M.28.7 3-cloro-N2-(1-ciano-1-metil-etil)-N1-(2,4-dimetilfenil) ftalamida;
- 25 M.UN.X compuestos activos insecticidas de modo de acción desconocido o incierto, como por ejemplo, azadiractina, amidoflumet, benzoximato, bifenazato, bromopropilato, chinometionat, criolita, dicofol, flufenerim, flometoquina, fluensulfona, flupiradifurona, butóxido de piperonilo, piridalilo, pirifluquinazon, sulfoaxflor, piflubumida o los compuestos
- 30 M.UN.X.1: 4-[5-(3,5-Dicloro-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-isoxazol-3-il]-2-metil-N-[(2, 2,2-trifluoro-etilcarbamoil)-metil]-benzamida, o el compuesto
- M.UN.X.2: ácido ciclopropanoacético, 1,1'-[(3S, 4R, 4aR, 6S, 6aS, 12R, 12aS, 12bS)-4-[[[(2-ciclopropilacetil) oxil] metil]-1, 3,4,4a, 5,6,6a, 12,12a, 12b-decahidro-12-hidroxi-4,6a,12b-trimetil-11-oxo-9-(3-piridinil)-2H,11H-nafto
- 35 [2,1-b] pirano [3,4-e] piran-3,6-diil] éster, o el compuesto
- M.UN.X.3: 11-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-12-hidroxi-1,4-dioxa-9-azadispiro [4.2.4.2]-tetradec-11-en-10-ona o el compuesto
- M.UN.X.4: 3-(4'-fluoro-2,4-dimetilbifenil-3-il)-4-hidroxi-8-oxa-1-azaespiro [4.5] dec-3-en-2-ona o el compuesto
- 40 M.UN.X.5: 1-[2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil) sulfonil] fenil]-3-(trifluorometil)-1H-1,2,4-triazol-5-amina, o activos sobre la base de *Bacillus firmus* (Votivo, I-1582); o
- M.UN.X.6; un compuesto seleccionado del grupo de
- M.UN.X.6a) (E/Z)-N-[1-[(6-cloro-3-piridil) metil]-2-piridiliden]-2,2,2-trifluoroacetamida;
- M.UN.X.6b) (E/Z)-N-[1-[(6-cloro-5-fluoro-3-piridil) metil]-2-piridilideno]-2,2,2-trifluoro-acetamida;
- M.UN.X.6c) (E/Z)-2,2,2-trifluoro-N-[1-[(6-fluoro-3-piridil) metil]-2-piridiliden] acetamida;
- 45 M.UN.X.6d) (E/Z)-N-[1-[(6-bromo-3-piridil) metil]-2-piridiliden]-2,2,2-trifluoroacetamida;
- M.UN.X.6e) (E/Z)-N-[1-[1-(6-cloro-3-piridil) etil]-2-piridiliden]-2,2,2-trifluoroacetamida;
- M.UN.X.6f) (E/Z)-N-[1-[(6-cloro-3-piridil) metil]-2-piridiliden]-2,2-difluoro-acetamida;
- M.UN.X.6g) (E/Z)-2-cloro-N-[1-[(6-cloro-3-piridil) metil]-2-piridiliden]-2,2-difluoro-acetamida;
- M.UN.X.6h) (E/Z)-N-[1-[(2-cloropirimidin-5-il) metil]-2-piridiliden]-2,2,2-trifluoroacetamida y
- 50 M.UN.X.6i) (E/Z)-N-[1-[(6-cloro-3-piridil) metil]-2-piridilideno]-2,2,3,3,3-pentafluoro-propanamida); o los compuestos
- M.UN.X.7: 3-[3-cloro-5-(trifluorometil) fenil]-4-oxo-1-(pirimidin-5-ilmetil) pirido [1,2-a] pirimidin-1-ium-2-olato; o
- M.UN.X.8: 8-cloro-N-[2-cloro-5-metoxifenil] sulfonil]-6-trifluorometil-imidazo [1,2-a] piridin-2-carboxamida; o
- M.UN.X.9: 4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il]-2-metil-N-(1-oxotietan-3-il)benzamida; o
- 55 M.UN.X.10: 5-[3-[2,6-dicloro-4-(3,3-dicloroaliloxi) fenoxil] propoxil]-1H-pirazol; o
- M.UN.X.11: 4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il]-2-metil-N-[2-oxo-2-(2,2,2-trifluoroetilamino) etil] benzamida; o
- M.UN.X.12: 4-[5-[3-cloro-5-(trifluorometil) fenil]-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il]-N-[2-oxo-2-(2,2,2-trifluoroetilamino) etil] naftaleno-1-carboxamida.

[0314] Los compuestos disponibles en el mercado del grupo M mencionados anteriormente se pueden encontrar en The Pesticide Manual, 15ª Edición, CDS Tomlin, British Crop Protection Council (2011), entre otras publicaciones.

5

[0315] El derivado flometoquin de quinolina se muestra en el documento WO 2006/013896. Se conocen los compuestos de aminofuranona flupiradifurona del documento WO 2007/115644. El compuesto de sulfoximina sulfoxaflor se conoce del documento WO 2007/149134. El acaricida piflubumida es conocido del documento WO 2007/020986. Los compuestos de isoxazolina han sido descritos: M.UN.X.1 en el documento WO 2005/085216, M.UN.X.9 en el documento WO 2013/050317, M.UN.X.11 en el documento WO 2005/085216 y M.UN.X. en el documento WO 2009/002809 y en el documento WO 2011/149749. El derivado de piriropeno M.UN.X.2 se ha descrito en el documento WO 2006/129714. El derivado de cetoenol cíclico sustituido con espiroceto M.UN.X.3 es conocido del documento WO 2006/089633 y el derivado de cetoenol espirocíclico sustituido con bifenilo M.UN.X.4 del documento WO 2008/067911. Finalmente, el triazoilfenilsulfuro como M.UN.X.5 se ha descrito en el documento WO 2006/043635 y agentes de control biológico sobre la base de *Bacillus firmus* en el documento WO 2009/124707. Los neonicotinoides 4A.1 se conocen del documento WO 2012/069266 y WO 2011/06946, el M.4.A.2 del documento WO 2013/003977, el M4.A.3 del documento WO 2010/069266.

[0316] El análogo de metaflumizona M.22C se describe en el documento CN 10171577. Las ftalamidas M.28.1 y M.28.2 son conocidas por el documento WO 2007/101540. La antranilamida M.28.3 ha sido descrita en el documento WO 2005/077934. El compuesto de hidrazida M.28.4 se ha descrito en el documento WO 2007/043677. Las antranilamidas M.28.5a) a M.28.5h) pueden prepararse como se describe en el documento WO 2007/006670, WO 2013/024009 y WO 2013/024010, la antranilamida M.28.5i) se describe en el documento WO 2011/085575, el M.28.5j) en el documento WO 2008/134969, el M.28.5k) en el documento US2011/046186 y el M.28.5l) en el documento WO 2012/034403. Los compuestos de diamida M.28.6 y M.28.7 se pueden encontrar en el documento CN102613183.

[0317] Los compuestos M.UN.X.6a) a M.UN.X.6i) enumerados en M.UN.X.6 se han descrito en el documento WO 2012/029672. El compuesto antagonista mesoiónico M.UN.X.7 se ha descrito en el documento el documento WO 2012/092115, el nematicida M.UN.X.8 en el documento WO 2013/055584 y el análogo de tipo piridililo M.UN.X.10 en el documento WO 2010/060379.

[0318] Los ingredientes pesticidas activos adicionales preferidos son los seleccionados del grupo 1 de IRAC, los inhibidores de la acetilcolinesterasa (AChE), en el presente documento del grupo 1A (carbamatos) thiodicarb, methomilo y carbarilo, y del grupo 1B (organofosfatos), especialmente acefato, clorpirifos y dimetoato, del grupo 2B, los fiproles, en el presente documento especialmente etiprol y fipronilo, del grupo 3, los piretroides, en el presente documento especialmente lambda-cihalotrina, alfa-cipermetrina o deltametrina, y del grupo 4A, los neonicotinoides, en el presente documento especialmente acetamiprid, clotianidina, dinotefuran, imidacloprid, nitenpiram, tiacloprid o tiomethoxam.

40

[0319] Combinaciones de compuestos de la invención con fiproles, neonicotinoides o piretroides posiblemente pueden exhibir en especial un control sinérgico de chinches (según la fórmula de Colby), en particular *Euschistus*, por ejemplo, *Euschistus heros*.

[0320] La siguiente lista F de sustancias activas, junto con la que pueden usarse los compuestos según la invención, pretende ilustrar las posibles combinaciones pero no las limita:

FI) Inhibidores de la respiración

50 FI-1) Inhibidores del complejo III en el sitio Qo:

estrobilurinas: azoxistrobina, coumetoxistrobina, coumoxistrobina, dimoxistrobina, enestroburina, fluoxastrobina, kresoxim-metilo, metominostrobin, orisastrobina, picoxistrobina, piraclostrobin, pirametrobina, piraoxistrobina, piribencarb, triclopiricarb/clorodincarb, trifloxistrobina, éster metílico del ácido 2-[2-(2,5-dimetil-fenoximetil)-fenil]-3-metoxi-acrílico y 2-(2-(3-(2,6-diclorofenil)-1-metilalilidenoaminoximetil)-fenil)-2-metoxiimino-N-metil-acetamida; oxazolidinonas e imidazolinonas: famoxadona, fenamidona;

FI-2) Inhibidores del complejo II (por ejemplo, carboxamidas):

carboxanilidas: benodanilo, benzovindiflupir, bixafen, boscalid, carboxin, fenfuram, fenhexamid, fluopiram, flutolanilo, furametpir, isopirazam, isotianilo, mepronilo, oxicarboxin, penflufen, pentiopirad, sedaxano, tecloftalam, thifluzamida,

tiadinilo, 2-amino-4 metil-tiazol-5-carboxanilida, N-(3',4',5'-trifluorobifenil-2-il)-3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida (fluxapiraxad), N-(4'-trifluorometiltiobifenil-2-il)-3 difluorometil-1-metil-1H pirazol-4-carboxamida, N-(2-(1,3,3-trimetil-butil)-fenil)-1,3-dimetil-5-fluoro-1H-pirazol-4-carboxamida, 3-(difluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il) pirazol-4-carboxamida, 3-(trifluorometil)-1-metil-N-(1,1, 3-trimetilindan-4-il) pirazol-4-carboxamida, 5 1,3-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il) pirazol-4-carboxamida, 3-(trifluorometil)-1,5-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il) pirazol-4-carboxamida, 3-(difluorometil)-1,5-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il) pirazol-4-carboxamida, 1,3,5-trimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il) pirazol-4-carboxamida, 3-(difluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il) pirazol-4-carboxamida, 3-(trifluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il) pirazol-4-carboxamida, 1,3-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il) pirazol-4-carboxamida, 3-(trifluorometil)-1,5-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il) pirazol-4-carboxamida, 3-(difluorometil)-1,5-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il) pirazol-4-carboxamida, 1,3,5-trimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il) pirazol-4-carboxamida; 3-trimetilindan-4-il) pirazol-4-carboxamida, 3-(difluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il) pirazol-4-carboxamida, 3-(trifluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il) pirazol-4-carboxamida, 1,3-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il) pirazol-4-carboxamida, 3-(trifluorometil)-1,5-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il) pirazol-4-carboxamida, 1,3,5-trimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il) pirazol-4-carboxamida; 3-trimetilindan-4-il) pirazol-4-carboxamida, 3-(difluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il) pirazol-4-carboxamida, 3-(trifluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il) pirazol-4-carboxamida, 1,3-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il) pirazol-4-carboxamida, 3-(trifluorometil)-1,5-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il) pirazol-4-carboxamida, 1,3,5-trimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il) pirazol-4-carboxamida; 3-(difluorometil)-1,5-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il) pirazol-4-carboxamida, 1,3,5-trimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il) pirazol-4-carboxamida; 3-(difluorometil)-1,5-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il) pirazol-4-carboxamida, 1,3,5-trimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il) pirazol-4-carboxamida;

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

FI-4) Otros inhibidores de la respiración (complejo I, desacopladores) diflumetorim; (5,8-difluoro-quinazolin-4-il)-(2-[2-fluoro-4-(4-trifluorometilpiridin-2-iloxi)-fenil]-etil)-amina; tecnazen; ametoctradina; siltiofam; derivados de nitrofenilo: binapacril, dinobutón, dinocap, fluazinam, ferimona, nitrthal-isopropilo, e incluyendo compuestos organometálicos: sales de fentina, tales como acetato de fentina, cloruro de fentina o 35 hidróxido de fentina;

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

F.II-1) inhibidores de la C₁₄ desmetilasa (fungicidas DMI, por ejemplo, triazoles, imidazoles) triazoles: azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M, epoxiconazol, fenbuconazol, flusilazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanilo, paclobutrazol, penconazol, propiconazol, protioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefón, triadimenol, triticonazol, uniconazol, 1-[rel-(2S; 3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)-oxiranilmetil]-5-tiocianato-1H-[1,2,4] triazol, 2-[rel-(2S; 3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)-oxiranilmetil]-2H-[1,2,4] triazol-3-tiol; imidazoles: imazalil, 45 pefurazoato, oxpoconazol, procloraz, triflumizol; pirimidinas, piridinas y piperazinas: fenarimol, nuarimol, pirifenox, triforina, 1-[rel-(2S; 3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil) oxiranilmetil]-5-tiocianato-1H-[1,2,4] triazol, 2-[rel-(2S; 3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)-oxiranilmetil]-2H-[1, 2,4] triazol-3-tiol;

F.II-2) Inhibidores de Delta14-reductasa (aminas, por ejemplo, morfólinas, piperidinas) morfólinas: aldimorf, dodemorfo, dodemorfoacetato, fenpropimorf, tridemorf; piperidinas: fenpropidina, piperalina; espirocetalaminas: 50 espiroxamina;

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

F.III) Inhibidores de la síntesis de ácidos nucleicos

F.III-1) síntesis de ARN, ADN
 Fenilamidas o acil-aminoácidos: benalaxil, benalaxil-M, kiralaxil, metalaxil, metalaxil-M (mefenoxam), ofurace, oxadixilo; isoxazoles y iosotiazolonas: himexazol, octilina;
 F.III-2) inhibidores de la ADN topoisomerasa: ácido oxolínico;

F.III-3) Metabolismo de nucleótidos (por ejemplo, adenosin-desaminasa), hidroxi (2-amino)-pirimidinas: bupirimato;

F.IV) Inhibidores de la división celular y/o el citoesqueleto

5 F.IV-1) Inhibidores de tubulina: bencimidazoles y tiofanatos: benomilo, carbendazima, fuberidazol, tiabendazol, tiofanato-metilo;

triazolopirimidinas: 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)-[1,2,4] triazolo [1,5 a] pirimidina;

F.IV-2) Otros inhibidores de la división celular

benzamidas y fenilacetamidas: diethofencarb, ethaboxam, pencycuron, fluopicolida, zoxamida;

10 F.IV-3) Inhibidores de actina: benzofenonas: metrafenona, pirofenona;

FV) Inhibidores de la síntesis de aminoácidos y proteínas

FV-1) Inhibidores de la síntesis de metionina (anilino-pirimidinas)

15 anilino-pirimidinas: ciprodinilo, mepanipirim, nitrapirin, pirimetanilo;

FV-2) Inhibidores de la síntesis de proteínas (anilino-pirimidinas) antibióticos: blasticidina-S, kasugamicina, clorhidrato-hidrato de kasugamicina, mildiomicina, estreptomycin, oxitetraciclina, polioxina, validamicina A;

F.VI) inhibidores de la transducción de señales

20

F.VI-1) inhibidores de MAP/histidina quinasa (por ejemplo, anilino-pirimidinas)

dicarboximidas: fluoroimida, iprodiona, procimidona, vinclozolina;

fenilpirroles: fenciclonilo, fludioxonilo;

F.VI-2) inhibidores de la proteína G: quinolinas: quinoxifeno;

25

F.VII) Inhibidores de la síntesis de lípidos y membranas

F.VII-1) Inhibidores de la biosíntesis de fosfolípidos

compuestos organofosforados: edifenfos, iprobenfos, pirazofos;

30 ditiolanos: isoprotiolano;

F.VII-2) Peroxidación lipídica: hidrocarburos aromáticos: dicloran, quintozeno, tecnazeno, tolclofos-metilo, bifenilo, cloroneb, etridiazol;

F.VII-3) Amidas de ácido carboxílico (fungicidas CAA)

amidas de ácido cinámico o mandélico: dimetomorf, flumorph, mandiproamid, pirimorf; carbamatos de valinamida:

35 benthiavalicarb, iprovalicarb, piribencarb, valifenalato y éster de (4-fluorofenilo) del ácido N-(1-(1-(4-cianofenil) etanosulfonil)-but-2-il) carbámico;

F.VII-4) Compuestos que afectan la permeabilidad de la membrana celular y los ácidos grasos: 1-[4-[4-[5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il] etanona,

carbamatos: propamocarb, clorhidrato de propamocarb,

40 F.VII-5) Inhibidores de la amida hidrolasa de ácidos grasos: 1-[4-[4-[5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il] etanona;

F.VIII) Inhibidores con acción en sitios múltiples

45 F.VIII-1) Sustancias activas inorgánicas: mezcla de Burdeos, acetato de cobre, hidróxido de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre básico, azufre;

F.VIII-2) Tio- y ditiocarbamatos: ferbam, mancozeb, maneb, metam, methasulphocarb, metiram, propineb, thiram, zineb, ziram;

F.VIII-3) Compuestos organoclorados (por ejemplo, ftalimidas, sulfamidas, cloronitrilos): anilazina, clorotalonilo, captafol, captan, folpet, diclofluanida, diclorofeno, flusulfamida, hexaclorobenceno, pentaclorofeno y sus sales, ftalida, toliifluanida, N-(4-cloro-2-nitro-fenil)-N-etil-4-metil-bencenosulfonamida;

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

55 F.VIII-5) Antraquinonas: dithianon;

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

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

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

FX) Inductores de la defensa de plantas

- 5 FX-1) vía del ácido salicílico: acibenzolar-S-metil;
 FX-2) Otros: probenazol, isotianilo, tiadinilo, prohexadiona-calcio;
 fosfonatos: fosetilo, fosetil-aluminio, ácido fosforoso y sus sales;
 F.XI) Modo de acción desconocido: bronopol, chinometionat, cyflufenamid, cymoxanilo, dazomet, debacarb, diclomezina, difenzoquat, difenzoquat-metilsulfato, difhenilamin, fenpirazamina, flumetover, flusulfamida, flutianilo,
 10 methasulfocarb, nitrapirin, nitrothal-isopropilo, oxathiapiprolin, oxin-cobre, proquinazid, tebufloquin, tecloftalam, triazóxido, 2-butoxi-6-yodo-3-propilcromen-4-ona, N-(ciclopropilmetoxiimin-(6-difluoro-metoxi-2,3-difluoro-fenil)-metil)-2-fenil acetamida, N'-(4-(4-cloro-3-trifluorometil-fenoxi)-2,5-dimetil-fenil)-N-etil-N metil formamidina, N'-(4-(4-fluoro)-3-trifluorometil-fenoxi)-2,5-dimetil-fenil)-N-etil-N-metil formamidina, N'-(2-metil-5-trifluorometil-4-(3-trimetilsilanil-propoxi)-fenilo)-N-etil-N-metil formamidina, N'-(5-difluorometil-2-metil-4-(3-trimetilsilanil-propoxi)-fenil)-N-etil-N-metil
 15 formamidina, metil-(1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-il)-amida del ácido 2-{1-[2-(5-metil-3-trifluorometil-pirazol] 1-il)-acetil]-piperidin-4-il}-tiazol-4-carboxílico, 2-{1-[2-(metil-(R)-1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-il)-amida del ácido (5-metil-3-trifluorometil-pirazol-1-il)-acetil]-piperidin-4-il}-tiazol-4-carboxílico, éster de 6-terc-butil-8-fluoro-2,3-dimetil-quinolin-4-ilo del ácido metoxiacético y N-metil-2-{1-[(5-metil-3)-trifluorometil-1H-pirazol-1-il)-acetil]-piperidin-4-il}-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il]-4-tiazolecarboxamida, 3-[5-(4-cloro-fenil)-2,3-dimetil-isoxazolidin-3-il]-piridina,
 20 pirizoxazol, S-alil éster del ácido 5-amino-2-isopropil-3-oxo-4-orto-tolil-2,3-dihidro-pirazol-1 carbotioico, amida del ácido N-(6-metoxi-piridin-3-il) ciclopropanocarboxílico, 5-cloro-1-(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)-2-metil-1H-benzoimidazol, 2-(4-cloro-fenil)-N-[4-(3,4-dimetoxi)-fenil]-isoxazol-5-il]-2-prop-2-iniloxiacetamida,
 F.XII) Reguladores del crecimiento: ácido abscísico, amido-clor, ancimidol, 6-bencilaminopurina, brassinólida, butralina, cloromequat (cloruro de cloromequat), cloruro de colina, ciclilanilida, daminozida, dikegulac, dimetipina, 2,6-
 25 dimetilpuridina, etefón, flumetralina, flurprimidol, flutiacet, forclorfenuron, ácido giberélico, inabenfida, ácido indol-3-acético, hidrazida maleica, mefluidida, mepiquat (cloruro de mepiquat), ácido naftalenoacético, N6-benciladenina, paclobutrazol, prohexadiona (prohexadiona-calcio), prohidrojasmon, tidiazuron, triapentenol, fosforotritioato de tributilo, ácido 2,3,5-triyodobenzoico, trinexapac-etilo y uniconazol;
 F.XIII) Agentes de control biológico
 30 *Ampelomyces quisqualis* (por ejemplo, AQ 10® de Intrachem Bio GmbH&Co. KG, Alemania), *Aspergillus flavus* (por ejemplo, AFLAGUARD® de Syngenta, CH), *Aureobasidium pullulans* (por ejemplo, BOTECTOR® de bio-ferm GmbH, Alemania), *Bacillus pumilus* (por ejemplo, NRRL n.º de registro B-30087 en SONATA® y BALLAD® Plus de AgraQuest Inc., EE. UU.), *Bacillus subtilis* (por ejemplo, aislado NRRL-Nr. B-21661 en RHAPSODY®, SERENADE® MAX y SERENADE® ASO de AgraQuest Inc., EE. UU.), *Bacillus subtilis* var. *amilolique-faciens* FZB24 (por ejemplo,
 35 TAEGRO® de Novozyme Biologicals, Inc., EE. UU.), *Candida oleophila* I-82 (por ejemplo, ASPIRE® de Ecogen Inc., EE. UU.), *Candida saitoana* (por ejemplo, BIOCURE® (en mezcla con lisozima) y BIOCOAT® de Micro Flo Company, EE. UU. (BASF SE) y Arysta), quitosano (por ejemplo, ARMOR-ZEN de BotriZen Ltd., NZ), *Clonostachys rosea* f. *catenulata*, también llamada *Gliocladium catenulatum* (por ejemplo, aislado J1446: PRESTOP® de Verdera, Finlandia), *Coniothyrium minitans* (por ejemplo, CONTANS® de Prophya, Alemania), *Cryphonectria parasitica* (por
 40 ejemplo, *Endothia parasitica* de CNICM, Francia), *Cryptococcus albidus* (por ejemplo, YIELD PLUS® de Anchor BioTechnologies, Sudáfrica), *Fusarium oxysporum* (por ejemplo, BIOFOX® de SIAPA, Italia, FUSACLEAN® de Natural Plant Protection, Francia), *Metschnikowia fructicola* (por ejemplo, SHEMER® de Agrogreen, Israel), *Microdochium dimerum* (por ejemplo, ANTIBOT® de Agrauxine, Francia), *Phlebiopsis gigantea* (por ejemplo, ROTSOP® de Verdera, Finlandia), *Pseudozyma flocculosa* (por ejemplo, SPORODEX® de Plant Products Co. Ltd.,
 45 Canadá), *Pythium oligandrum* DV74 (por ejemplo, POLYVERSUM® de Remeslo SSRO, Biopreparaty, República Checa), *Reynoutria sachlinensis* (por ejemplo, REGALIA® de Marrone BioInnovations, EE. UU.), *Talaromyces flavus* V117b (por ejemplo, PROTUS® de Prophya, Alemania), *Trichoderma asperellum* SKT-1 (por ejemplo, ECO-HOPE® de Kumiai Chemical Industry Co., Ltd., Japón), *T. atroviride* LC52 (por ejemplo, SENTINEL® de Agrimm Technologies Ltd, NZ), *T. harzianum* T-22 (por ejemplo, PLANTSHIELD® de Firma BioWorks Inc., EE. UU.), *T. harzianum* TH35
 50 (por ejemplo, ROOT PRO® de Mycontrol Ltd., Israel), *T. harzianum* T-39 (por ejemplo, TRICHODEX® y TRICHODERMA 2000® de Mycontrol Ltd., Israel y Makhteshim Ltd., Israel), *T. harzianum* y *T. viride* (por ejemplo, TRICHOPEL de Agrimm Technologies Ltd, NZ), *T. harzianum* ICC012 y *T. viride* ICC080 (por ejemplo, REMEDIER® WP de Isagro Ricerca, Italia), *T. polysporum* y *T. harzianum* (por ejemplo, BINAB® de BINAB Bio-Innovation AB, Suecia), *T. stromaticum* (por ejemplo, TRICOVAB® de CEPLAC, Brasil), *T. virens* GL-21 (por ejemplo, SOILGARD®
 55 de Certis LLC, EE. UU.), *T. viride* (por ejemplo, TRIECO® de Ecosense Labs. (India) Pvt. Ltd., Indien, BIO-CURE® F de T. Stanes&Co. Ltd., Indien), *T. viride* TV1 (por ejemplo, *T. viride* TV1 de Agribiotec srl, Italia), *Ulocladium oudemansii* HRU3 (por ejemplo, BOTRY-ZEN® de Botry-Zen Ltd, NZ).

[0321] Los compuestos II disponibles en el mercado del grupo F enumerados anteriormente pueden

encontrarse en The Pesticide Manual, 15ª Edición, CDS Tomlin, British Crop Protection Council (2011), entre otras publicaciones. Se conoce su preparación y su actividad contra los hongos nocivos (cf.: <http://www.alanwood.net/pesticides/>); estas sustancias están disponibles en el mercado. Los compuestos descritos por la nomenclatura IUPAC, su preparación y su actividad fungicida también son conocidos (véase Can. J. Plant Sci. 48 (6), 587-94, 1968; documentos EPA 141 317; EP-A 152 031; EP-A 226 917; EP A243 970; EP A 256 503; EP-A428 941; EP-A 532 022; EP-A 1.028.125; EP-A 1.035.122; EPA 1 201 648; EP A 1122244. JP 2002316902; DE 19650197; DE 10021412; DE 102005009458; US 3.296.272; US 3.325.503; WO 98/46608; WO 99/14187; WO 99/24413; WO 99/27783; WO 00/29404; WO 00/46148; WO 00/65913; WO 01/54501; WO 01/56358; WO 02/22583; WO 02/40431; WO 03/10149; WO 03/11853; WO 03/14103; WO 03/16286; WO 03/53145; WO 03/61388; WO 03/66609; WO 03/74491; WO 04/49804; WO 04/83193; WO 05/120234; WO 05/123689; WO 05/123690; WO 05/63721; WO 05/87772; WO 05/87773; WO 06/15866; WO 06/87325; WO 06/87343; WO 07/82098; WO 07/90624, WO 11/028657).

[0322] Los compuestos de la invención se pueden mezclar con tierra, turba u otros medios de enraizamiento para la protección de plantas contra enfermedades fúngicas transmitidas por semillas, transmitidas por el suelo o foliares.

[0323] Los ejemplos de agentes sinérgicos adecuados para usar en las composiciones incluyen butóxido de piperonilo, sesamex, safroxan y dodecil imidazol.

[0324] Los herbicidas y reguladores del crecimiento de plantas adecuados para su inclusión en las composiciones dependerán del objetivo deseado y del efecto requerido.

[0325] Un ejemplo de un herbicida selectivo de arroz que puede incluirse es propanil. Un ejemplo de un regulador de crecimiento de plantas para su uso en algodón es PIX™.

[0326] Algunas mezclas pueden comprender ingredientes activos que tienen propiedades físicas, químicas o biológicas significativamente diferentes de modo que no se prestan fácilmente al mismo.

[0327] La plaga de invertebrados (también denominada "plaga animal"), es decir, los insectos, arácnidos y nematodos, la planta, el suelo o el agua en los que la planta crece o puede crecer puede ponerse en contacto con los compuestos o la composición(es) de la presente invención que los comprende mediante cualquier método de aplicación conocido en la técnica. Como tal, "contacto" incluye tanto el contacto directo (aplicación de los compuestos/composiciones directamente sobre la plaga de invertebrados o planta -normalmente al follaje, tallo o raíces de la planta) como el contacto indirecto (aplicación de los compuestos/composiciones al lugar de la plaga de invertebrados o planta). Los compuestos de la presente invención o las composiciones plaguicidas que los comprenden pueden usarse para proteger las plantas y los cultivos en crecimiento contra el ataque o la infestación por plagas de animales, especialmente insectos, ácaros o arácnidos poniendo en contacto la planta/cultivo con una cantidad eficaz como plaguicida de compuestos de la presente invención. El término "cultivo" se refiere tanto a los cultivos en crecimiento como a los cosechados.

[0328] Los compuestos de la presente invención y las composiciones que los comprenden son particularmente importantes en el control de una multitud de insectos en diversas plantas cultivadas, tales como cereales, tubérculos, cultivos oleaginosos, vegetales, especias, plantas ornamentales, por ejemplo, semilla de trigo duro y otros cereales, cebada, avena, centeno, maíz (maíz forrajero y maíz azucarero/maíz dulce y de campo), soja, oleaginosas, crucíferas, algodón, girasoles, plátanos, arroz, colza, nabo, remolacha azucarera, remolacha forrajera, berenjenas, patatas, hierba, césped, forraje, tomates, puerros, calabaza/calabacín, repollo, lechuga iceberg, pimiento, pepinos, melones, especies de Brassica, melones, judías, guisantes, ajo, cebollas, zanahorias, plantas tuberosas como las patatas, caña de azúcar, tabaco, uvas, petunias, geranio/pelargonio, pensamientos e impatiens.

[0329] Los compuestos de la presente invención se emplean como tales o en forma de composiciones tratando los insectos o las plantas, materiales de propagación de plantas, tales como semillas, suelo, superficies, materiales o habitaciones para protegerlos del ataque insecticida con una cantidad insecticidamente efectiva de los compuestos activos. La aplicación puede llevarse a cabo tanto antes como después de la infección de las plantas, los materiales de propagación de las plantas, tales como las semillas, el suelo, las superficies, los materiales o las habitaciones por los insectos.

[0330] Además, las plagas de invertebrados pueden controlarse poniendo en contacto la plaga diana, su suministro de alimentos, hábitat, caldo de cultivo o su locus con una cantidad eficaz como plaguicida de compuestos

de la presente invención. Como tal, la aplicación puede llevarse a cabo antes o después de la infección del locus, el cultivo de cosechas o los cultivos cosechados por la plaga.

[0331] Los compuestos de la presente invención también se pueden aplicar preventivamente a lugares en los que se espera la aparición de las plagas.

[0332] Los compuestos de la presente invención también pueden usarse para proteger a las plantas en crecimiento del ataque o la infestación por plagas al poner en contacto la planta con una cantidad eficaz como plaguicida de compuestos de la presente invención. Como tal, "contacto" incluye tanto el contacto directo (aplicación de los compuestos/composiciones directamente sobre la plaga y/o planta –normalmente al follaje, tallo o raíces de la planta) como contacto indirecto (aplicación de los compuestos/composiciones al locus de la plaga y/o planta).

[0333] "Locus" significa un hábitat, caldo de cultivo, planta, semilla, suelo, área, material o entorno en el cual una plaga o parásito está creciendo o puede crecer.

[0334] En general, "cantidad eficaz como plaguicida" significa la cantidad de ingrediente activo necesaria para lograr un efecto observable sobre el crecimiento, incluidos los efectos de necrosis, muerte, retraso, prevención y eliminación, destrucción o disminución de otra manera de la aparición y actividad del organismo objetivo. La cantidad eficaz como plaguicida puede variar para los diversos compuestos/composiciones usados en la invención. Una cantidad eficaz como plaguicida de las composiciones también variará de acuerdo con las condiciones predominantes, tales como el efecto plaguicida y la duración deseados, el clima, las especies diana, locus, modo de aplicación y similares.

[0335] En el caso del tratamiento del suelo o de la aplicación al lugar de habitación o al nido de las plagas, la cantidad de ingrediente activo varía de 0,0001 a 500 g por 100 m², preferiblemente de 0,001 a 20 g por 100 m².

[0336] Las tasas de aplicación habituales en la protección de materiales son, por ejemplo, de 0,01 g a 1000 g de compuesto activo por m² de material tratado, deseablemente de 0,1 g a 50 g por m².

[0337] Las composiciones insecticidas para su uso en la impregnación de materiales contienen normalmente del 0,001 al 95 % en peso, preferiblemente del 0,1 al 45 % en peso, y más preferiblemente del 1 al 25 % en peso de al menos un repelente y/o insecticida.

[0338] Para su uso en el tratamiento de plantas de cultivo, la velocidad de aplicación de los ingredientes activos de esta invención puede estar en el intervalo de 0,1 g a 4000 g por hectárea, deseablemente de 5 g a 500 g por hectárea, más deseablemente de 5 g a 200 g por hectárea.

[0339] Los compuestos de la presente invención son efectivos a través de ambos contactos (vía suelo, vidrio, pared, mosquitero, alfombra, partes de plantas o partes de animales), y la ingestión (cebo, o parte de la planta).

[0340] Los compuestos de la presente invención también pueden aplicarse contra plagas de insectos que no son de cultivo, tales como hormigas, termitas, avispas, moscas, mosquitos, grillos o cucarachas. Para su uso contra dichas plagas no cultivadas, los compuestos de la presente invención se usan preferiblemente en una composición de cebo.

[0341] El cebo puede ser un líquido, un sólido o una preparación semisólida (por ejemplo, un gel). Los cebos sólidos se pueden formar en diversas estructuras y formas adecuadas para la aplicación respectiva, por ejemplo, gránulos, bloques, barras, discos. Los cebos líquidos pueden llenarse en varios dispositivos para garantizar una aplicación adecuada, por ejemplo, contenedores abiertos, dispositivos de pulverización, fuentes de gotas o fuentes de evaporación. Los geles se pueden basar en matrices acuosas u oleosas y se pueden formular según necesidades particulares en términos de adherencia, retención de humedad o características de envejecimiento. El cebo empleado en la composición es un producto que es suficientemente atractivo para incitar a insectos como hormigas, termitas, avispas, moscas, mosquitos, grillos, etc. o cucarachas a comerlo. El atractivo puede ser manipulado mediante el uso de estimulantes alimenticios o feromonas sexuales. Los estimulantes alimenticios son elegidos, por ejemplo, pero no exclusivamente, entre proteínas animales y/o vegetales (harina de carne, de pescado o de sangre, partes de insectos, yema de huevo), de grasas y aceites de origen animal y/o vegetal, o mono, oligo o poliorganosacáridos, especialmente de sacarosa, lactosa, fructosa, dextrosa, glucosa, almidón, pectina o incluso melaza o miel. Las partes frescas o en descomposición de frutas, cultivos, plantas, animales, insectos o partes específicas de los mismos también pueden servir como estimulante alimenticio. Las feromonas sexuales son

conocidas por ser más específicas de insectos. Las feromonas específicas se describen en la bibliografía y son conocidas por los expertos en la materia.

[0342] Para su uso en composiciones de cebo, el contenido típico de ingrediente activo es del 0,001 % en peso al 15 % en peso, deseablemente del 0,001 % en peso al 5 % en peso de ingrediente activo.

[0343] Las formulaciones de compuestos de la presente invención como aerosoles (por ejemplo, en botes de pulverización), pulverizaciones de aceite o pulverizadores de bomba son muy adecuados para el usuario no profesional para controlar plagas tales como moscas, pulgas, garrapatas, mosquitos o cucarachas. Las recetas de aerosol se componen preferiblemente del compuesto activo, disolventes tales como alcoholes inferiores (por ejemplo, metanol, etanol, propanol, butanol), cetonas (por ejemplo, acetona, metiletilcetona), hidrocarburos de parafina (por ejemplo, querosenos) que tienen intervalos de ebullición de aproximadamente 50 a 250 °C, dimetilformamida, N-metilpirrolidona, dimetilsulfóxido, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, xileno, agua, además auxiliares tales como emulsionantes tales como monooleato de sorbitol, etoxilato de oleilo que tiene 3-7 moles de óxido de etileno, etoxilato de alcohol graso, aceites de perfume tales como aceites etéreos, ésteres de ácidos grasos medios con alcoholes inferiores, compuestos de carbonilo aromáticos, en caso apropiado estabilizadores tales como benzoato de sodio, tensioactivos anfóteros, epóxidos inferiores, ortoformiato de trietilo y, si es necesario, propulsores tales como propano, butano, nitrógeno, aire comprimido, dimetil éter, dióxido de carbono, óxido nitroso o mezclas de estos gases.

[0344] Las formulaciones de pulverización de aceite difieren de las recetas de aerosoles en que no se usan propulsores.

[0345] Para su uso en composiciones de pulverización, el contenido de ingrediente activo es del 0,001 al 80 % en peso, preferiblemente del 0,01 al 50 % en peso y lo más preferiblemente del 0,01 al 15 % en peso.

[0346] Los compuestos de la presente invención y sus respectivas composiciones también se pueden usar en bobinas para mosquitos y fumigantes, cartuchos de humo, placas vaporizadoras o vaporizadores a largo plazo y también en papeles para polillas, almohadillas para polillas u otros sistemas vaporizadores independientes del calor.

[0347] Los métodos para controlar enfermedades infecciosas transmitidas por insectos (por ejemplo, malaria, dengue y fiebre amarilla, filariasis linfática y leishmaniasis) con compuestos de la presente invención y sus respectivas composiciones también comprenden tratar superficies de cabañas y casas, pulverización e impregnación de cortinas, carpas, prendas de vestir, mosquiteros, trampas para moscas tsetse o similares. Las composiciones insecticidas para la aplicación a fibras, tejidos, artículos de punto, materiales no tejidos, material de malla o láminas y lonas, preferiblemente comprenden una mezcla que incluye el insecticida, opcionalmente un repelente y al menos un aglutinante. Los repelentes adecuados, por ejemplo, son N,N-dietil-meta-toluamida (DEET), N,N-dietilfenilacetamida (DEPA), 1-(3-ciclohexan-1-il-carbonil)-2-metilpiperina, lactona del ácido (2-hidroximetilciclohexil) acético, 2-etil-1,3-hexandiol, indalona, metilneodecanamida (MNDA), un piretroide no utilizado para el control de insectos, como {(+/-)-3-alil-2-metil-4-oxociclopent-2-(+)-enilo-(+)-trans-crisantemato (Esbiothrin)}, un repelente derivado de o idéntico a extractos de plantas como limoneno, eugenol, (+)-Eucamalol (1), (-)-1-epi-eucamalol o extractos de plantas crudas de plantas como *Eucalyptus maculata*, *Vitex rotundifolia*, *Cymbopogon martinii*, *Cymbopogon citratus* (hierba de limón), *Cymbopogon nartdus* (citronela). Los aglutinantes adecuados se seleccionan, por ejemplo, de polímeros y copolímeros de ésteres vinílicos de ácidos alifáticos (tales como acetato de vinilo y versatato de vinilo), ésteres acrílicos y metacrílicos de alcoholes, tales como acrilato de butilo, acrilato de 2-etilhexilo y acrilato de metilo, hidrocarburos mono- y di-etilénicamente insaturados, tales como estireno y dienos alifáticos, tales como butadieno.

[0348] La impregnación de cortinas y mosquiteros en general se realiza sumergiendo el material textil en emulsiones o dispersiones del insecticida o pulverizándolas sobre las redes. Los compuestos de la presente invención y sus composiciones pueden usarse para proteger materiales de madera tales como árboles, vallas de tablas, traviesas, etc. y edificios tales como casas, dependencias, fábricas, pero también materiales de construcción, muebles, cueros, fibras, artículos de vinilo, hilos y cables eléctricos, etc., de hormigas y/o termitas, y para controlar que las hormigas y las termitas no dañen los cultivos o el ser humano (por ejemplo, cuando las plagas invaden las casas y las instalaciones públicas). Los compuestos de la presente invención se aplican no solo a la superficie del suelo circundante o al subsuelo para proteger los materiales de madera, sino que también se pueden aplicar a artículos con armadura tal como superficies del hormigón debajo del piso, postes de alcoba, vigas, contrachapados, muebles, etc., artículos de madera tales como tableros de partículas, medios tableros, etc. y artículos de vinilo tales como cables eléctricos revestidos, láminas de vinilo, materiales aislantes del calor como espumas de estireno, etc. En caso de aplicación contra hormigas que dañan cultivos o a seres humanos, el controlador de hormigas de la

presente invención se aplica a los cultivos o al suelo circundante, o se aplica directamente al nido de hormigas o similar.

5 **[0349]** Los compuestos de la presente invención también son adecuados para el tratamiento de material de propagación de plantas, especialmente semillas, para protegerlas de plagas de insectos, en particular de plagas de insectos que viven en el suelo y las raíces y brotes resultantes de la planta contra plagas del suelo e insectos foliares.

10 **[0350]** Los compuestos de la presente invención son particularmente útiles para la protección de las semillas de las plagas del suelo y las raíces y brotes resultantes de la planta contra las plagas del suelo y los insectos foliares. Se prefiere la protección de las raíces y brotes resultantes de la planta. Más preferida es la protección de los brotes resultantes de plantas frente a insectos perforadores y chupadores, en el que la protección contra los áfidos es la más preferida.

15 **[0351]** Por lo tanto, la presente invención comprende un método para la protección de semillas frente a los insectos, en particular frente a los insectos del suelo y de las raíces y brotes de plántulas frente a los insectos, en particular de insectos del suelo y foliares, dicho método que comprende poner en contacto las semillas antes de la siembra y/o después de la pregerminación con un compuesto de la presente invención, que incluye una sal del mismo. Particularmente preferido es un método, donde las raíces y brotes de la planta están protegidos, más
20 preferiblemente un método, donde los brotes de las plantas están protegidos de insectos perforantes y chupadores, más preferiblemente un método, donde los brotes de las plantas están protegidos de los áfidos.

[0352] El término semilla abarca semillas y propágulos de plantas de todo tipo que incluyen, pero no se limitan a semillas verdaderas, trozos de semilla, retoños, cormos, bulbos, frutas, tubérculos, granos, esquejes, brotes
25 cortados y similares y en una realización preferida significa verdaderas semillas.

[0353] El término tratamiento de semillas comprende todas las técnicas adecuadas de tratamiento de semillas conocidas en la técnica, tales como aplicación de semillas, recubrimiento de semillas, espolvoreo de semillas, remojo de semillas y sedimentación de semillas.
30

[0354] La presente invención también comprende semillas recubiertas con o que contienen el compuesto activo.

35 **[0355]** El término "recubierto con y/o que contiene" generalmente significa que el ingrediente activo está en su mayor parte en la superficie del producto de propagación en el momento de la aplicación, aunque una parte mayor o menor del ingrediente puede penetrar en el producto de propagación, dependiendo del método de aplicación. Cuando dicho producto de propagación se (re)planta, puede absorber el ingrediente activo.

40 **[0356]** Las semillas adecuadas son semillas de cereales, tubérculos, oleaginosas, hortalizas, especias, plantas ornamentales, por ejemplo, semillas de trigo duro y otros cereales, cebada, avena, centeno, maíz (maíz forrajero y maíz azucarero/maíz dulce y de campo), soja, oleaginosas, crucíferas, algodón, girasoles, plátanos, arroz, colza, nabo, remolacha, berenjenas, patatas, hierba, césped, forraje, tomates, puerros, calabaza/calabacín, repollo, lechuga iceberg, pimienta, pepinos, melones, especies de Brassica, melones, judías, guisantes, ajo, cebollas, zanahorias, plantas tuberosas como las patatas, caña de azúcar, tabaco, uvas, petunias, geranio/pelargonía,
45 pensamientos e impatiens.

[0357] Además, el compuesto activo también puede usarse para el tratamiento de semillas de plantas, que toleran la acción de herbicidas o fungicidas o insecticidas debido a la cría, incluidos los métodos de ingeniería genética.
50

[0358] Por ejemplo, el compuesto activo puede emplearse en el tratamiento de semillas de plantas, que son resistentes a herbicidas del grupo que consiste en sulfonilureas, imidazolinonas, glufosinato de amonio o glifosato isopropilamónico y sustancias activas análogas (véase, por ejemplo, los documentos EP-A 242 236, EP-A 242 246) (documento WO 92/00377) (documentos EP-A 257 993, US 5.013.659) o en plantas de cultivos transgénicos, por ejemplo, algodón, con la capacidad de producir toxinas de *Bacillus thuringiensis* (toxinas Bt) que hacen a las plantas resistentes a ciertas plagas (documentos EP-A 142 924, EP-A 193 259). Además, el compuesto activo también puede usarse para el tratamiento de semillas de plantas, que tienen características modificadas en comparación con las plantas existentes, que pueden generarse, por ejemplo, mediante métodos de reproducción tradicionales y/o la generación de mutantes, o mediante procedimientos recombinantes). Por ejemplo, se han descrito varios casos de

modificaciones recombinantes de plantas de cultivo con el fin de modificar el almidón sintetizado en las plantas (por ejemplo, documentos WO 92/11376, WO 92/14827, WO 91/19806) o de plantas de cultivos transgénicos que tienen una composición modificada de ácidos grasos (documento WO 91/13972).

5 **[0359]** La aplicación del tratamiento de semillas del compuesto activo se lleva a cabo mediante pulverización o espolvoreo de las semillas antes de la siembra de las plantas y antes de la emergencia de las plantas.

[0360] Las composiciones que son especialmente útiles para el tratamiento de semillas son, por ejemplo:

- 10 A Concentrados solubles (SL, LS)
- D Emulsiones (EW, EO, ES)
- E Suspensiones (SC, OD, FS)
- F Gránulos dispersables en agua y gránulos solubles en agua (WG, SG)
- G Polvos dispersables en agua y polvos solubles en agua (WP, SP, WS)
- 15 H Formulaciones en gel (GF)
- I Polvos secos (DP, DS)

[0361] Las formulaciones de tratamiento de semillas convencionales incluyen, por ejemplo, concentrados fluidos FS, soluciones LS, polvos para tratamiento seco DS, polvos dispersables en agua para el tratamiento en suspensión WS, polvos solubles en agua SS y emulsión ES y EC y formulación en gel GF. Estas formulaciones se pueden aplicar a la semilla diluida o no diluida. La aplicación a las semillas se lleva a cabo antes de la siembra, ya sea directamente en las semillas o después de haber pregerminado las semillas.

[0362] En una realización preferida, se usa una formulación de FS para el tratamiento de semillas. Normalmente, una formulación de FS puede comprender 1-800 g/l de ingrediente activo, 1-200 g/l de tensioactivo, 0 a 200 g/l de agente anticongelante, 0 a 400 g/l de aglutinante, 0 a 200 g/l de un pigmento y hasta 1 litro de un disolvente, preferiblemente agua.

[0363] Las formulaciones de FS especialmente preferidas de compuestos de la presente invención para el tratamiento de semillas habitualmente comprenden del 0,1 al 80 % en peso (1 a 800 g/l) del ingrediente activo, del 0,1 al 20 % en peso (1 a 200 g/l) de al menos un tensioactivo, por ejemplo, del 0,05 al 5 % en peso de un humectante y del 0,5 al 15 % en peso de un agente dispersante, hasta el 20 % en peso, por ejemplo, del 5 al 20 % de un agente anticongelante, del 0 al 15 % en peso, por ejemplo, del 1 al 15 % en peso de un pigmento y/o un colorante, del 0 al 40 % en peso, por ejemplo, del 1 al 40 % en peso de un aglutinante (adhesivo/agente de adhesión), opcionalmente hasta el 5 % en peso, por ejemplo, del 0,1 al 5 % en peso de un espesante, opcionalmente del 0,1 al 2 % de un agente antiespumante, y opcionalmente un conservante tal como un biocida, antioxidante o similar, por ejemplo, en una cantidad del 0,01 al 1 % en peso y una carga/vehículo hasta el 100 % en peso.

40 **[0364]** Las formulaciones para el tratamiento de semillas pueden comprender adicionalmente aglutinantes y opcionalmente colorantes.

[0365] Los aglutinantes se pueden añadir para mejorar la adhesión de los materiales activos sobre las semillas después del tratamiento. Los aglutinantes adecuados son homo y copolímeros de óxidos de alqueno como
45 óxido de etileno u óxido de propileno, acetato de polivinilo, polivinilalcoholes, polivinilpirrolidonas y copolímeros de los mismos, copolímeros de etileno-acetato de vinilo, homo y copolímeros acrílicos, polietilenaminas, polietilenamidas y polietileniminas, polisacáridos como celulosas, tilosa y almidón, homo y copolímeros de poliolefina como copolímeros de olefina/anhídrido maleico, poliuretanos, poliésteres, homo y copolímeros de poliestireno.

50 **[0366]** Opcionalmente, también se pueden incluir colorantes en la formulación. Los colorantes o pigmentos adecuados para las formulaciones de tratamiento de semillas son Rhodamin B, C.I. pigmento rojo 112, C.I. Solvent Red 1, pigmento azul 15:4, pigmento azul 15:3, pigmento azul 15:2, pigmento azul 15:1, pigmento azul 80, pigmento amarillo 1, pigmento amarillo 13, pigmento rojo 112, pigmento rojo 48:2, pigmento rojo 48:1, pigmento rojo 57:1, pigmento rojo 53:1, pigmento naranja 43, pigmento naranja 34, pigmento naranja 5, pigmento verde 36, pigmento
55 verde 7, pigmento blanco 6, pigmento marrón 25, violeta básico 10, violeta básico 49, rojo ácido 51, rojo ácido 52, rojo ácido 14, azul ácido 9, amarillo ácido 23, rojo básico 10, rojo básico 108.

Ejemplos de un agente gelificante es carragenano (Satiagel®)

[0367] En el tratamiento de semillas, las tasas de aplicación de los compuestos de la presente invención generalmente son de 0,01 g a 10 kg por 100 kg de semilla, preferiblemente de 0,05 g a 5 kg por 100 kg de semilla, más preferiblemente de 0,1 g a 1000 g por 100 kg de semillas y, en particular, de 0,1 a 200 g por 100 kg de semillas.

5 **[0368]** La invención, por lo tanto, también se refiere a semillas que comprenden un compuesto de la presente invención, que incluyen una sal agrícola útil del mismo, como se ha definido en el presente documento. La cantidad del compuesto de la presente invención, incluyendo una sal agrícola útil de la misma variará en general de 0,01 g a 10 kg por 100 kg de semilla, preferiblemente de 0,05 g a 5 kg por 100 kg de semilla, en particular de 0,1 g a 1000 g por 100 kg de semilla. Para cultivos específicos como la lechuga, la tasa puede ser más alta.

10 **[0369]** Los métodos que pueden emplearse para tratar la semilla son, en principio, todas las técnicas adecuadas de tratamiento de semillas y especialmente técnicas de preparación de semillas conocidas en la técnica, tales como recubrimiento de semillas (por ejemplo, sedimentación de semillas), espolvoreo de semillas e imbibición de semillas (por ejemplo, remojo de semillas). En el presente documento, "tratamiento de semillas" se refiere a todos
15 los métodos que ponen las semillas y los compuestos de la presente invención en contacto entre sí, y "aplicación de semillas" a métodos de tratamiento de semillas que proporcionan a las semillas una cantidad de los compuestos de la presente invención, es decir, que generan una semilla que comprende un compuesto de la presente invención. En principio, el tratamiento se puede aplicar a la semilla en cualquier momento desde la cosecha de la semilla hasta la siembra de la semilla. La semilla puede tratarse inmediatamente antes, o durante, la plantación de la semilla, por
20 ejemplo, usando el método del "macetero". Sin embargo, el tratamiento también puede llevarse a cabo durante varias semanas o meses, por ejemplo hasta 12 meses, antes de plantar la semilla, por ejemplo en forma de un tratamiento de tratamiento de semillas, sin que se observe una eficacia sustancialmente reducida.

[0370] De manera conveniente, el tratamiento se aplica a semillas sin sembrar. Como se usa en el presente
25 documento, la expresión "semilla sin sembrar" pretende incluir semillas en cualquier período desde la cosecha de la semilla hasta la siembra de la semilla en el suelo con el propósito de la germinación y el crecimiento de la planta.

[0371] Específicamente, se sigue un procedimiento en el tratamiento en el que se mezclan las semillas, en un dispositivo adecuado, por ejemplo, un dispositivo de mezcla para compañeros de mezcla sólidos o sólidos/líquidos,
30 con la cantidad deseada de formulaciones de tratamiento de semillas, ya sea como tales o después de dilución con agua, hasta que la composición se distribuya uniformemente en la semilla. Si es apropiado, esto va seguido por un paso de secado.

[0372] Los compuestos de la presente invención, que incluyen sus estereoisómeros, sales o N-óxidos
35 veterinariamente aceptables, también son adecuados en particular para ser utilizados para combatir parásitos en y sobre animales.

[0373] Un objeto de la presente descripción también es, por tanto, proporcionar nuevos métodos para
40 controlar parásitos en y sobre animales. Otro objeto de la invención es proporcionar pesticidas más seguros para animales. Otro objeto de la invención además es proporcionar pesticidas para animales que pueden usarse en dosis más bajas que los pesticidas existentes. Y otro objeto de la invención es proporcionar pesticidas para animales, que proporcionan un control residual prolongado de los parásitos.

[0374] La invención también se refiere a composiciones que comprenden una cantidad eficaz como
45 parasiticida de compuestos de la presente invención, que incluyen sus estereoisómeros, sales o N-óxidos veterinariamente aceptables, y un vehículo aceptable, para combatir parásitos en y sobre animales.

[0375] La presente invención también proporciona un compuesto de la presente invención, que incluye sus estereoisómeros, sales o N-óxidos veterinariamente aceptables, o una composición que lo comprende, para usar en
50 un método para tratar, controlar, prevenir y proteger animales contra la infestación e infección por parásitos, que comprende administrar oral, tópica o parenteralmente o aplicar a los animales una cantidad eficaz como parasiticida de un compuesto de la presente invención, que incluye sus estereoisómeros, sales o N-óxidos veterinariamente aceptables, o una composición que lo comprende.

55 **[0376]** La invención también proporciona un compuesto de la presente invención, que incluye sus estereoisómeros, sales o N-óxidos veterinariamente aceptables, para su uso en el tratamiento o protección de un animal contra la infestación o infección por plagas de invertebrados.

[0377] La invención también proporciona un proceso para la preparación de una composición para tratar,

controlar, prevenir o proteger animales contra la infestación o infección por parásitos que comprende una cantidad eficaz como parasiticida de un compuesto de la presente invención, incluyendo sus estereoisómeros, sales aceptables veterinariamente o N-óxidos, o una composición que lo comprende.

5 **[0378]** La actividad de compuestos contra plagas agrícolas no sugiere su idoneidad para el control de endo y ectoparásitos en y sobre animales, lo que requiere, por ejemplo, dosis bajas, no eméticas en el caso de aplicación oral, compatibilidad metabólica con el animal, baja toxicidad, y un manejo seguro.

10 **[0379]** Sorprendentemente, ahora se ha comprobado que los compuestos de fórmula (I) y sus estereoisómeros, sales, tautómeros y N-óxidos veterinariamente aceptables, son adecuados para combatir endo y ectoparásitos en y sobre animales.

15 **[0380]** Los compuestos de la presente invención, especialmente los compuestos de fórmula (I) y sus estereoisómeros, sales, tautómeros y N-óxidos veterinariamente aceptables, y las composiciones que los comprenden se usan preferiblemente para controlar y prevenir infestaciones e infecciones en animales incluyendo animales de sangre caliente (incluidos los seres humanos) y peces. Son adecuados, por ejemplo, para controlar y prevenir infestaciones e infecciones en mamíferos tales como ganado, ovejas, cerdos, camellos, ciervos, caballos, cerdos, aves de corral, conejos, cabras, perros y gatos, búfalos de agua, burros, gamos y renos, y también en animales con pelaje, como el visón, la chinchilla y el mapache, aves como gallinas, gansos, pavos y patos y peces como peces de agua dulce y salada, como truchas, carpas y anguilas.

25 **[0381]** Los compuestos de la presente invención, que incluyen sus estereoisómeros, sales o N-óxidos veterinariamente aceptables, y las composiciones que los comprenden se usan preferiblemente para controlar y prevenir infestaciones e infecciones en animales domésticos, tales como perros o gatos.

[0382] Las infestaciones en animales y peces de sangre caliente incluyen, pero no se limitan a, piojos, piojos picadores, garrapatas, moscardones nasales, moscas melófagas, moscas mordientes, moscas muscoides, moscas, larvas de moscas miasóticas, niguas, jejenes, mosquitos y pulgas.

30 **[0383]** Los compuestos de la presente invención, que incluyen sus estereoisómeros, sales o N-óxidos veterinariamente aceptables, y las composiciones que los comprenden son adecuados para el control sistémico y/o no sistémico de ecto- y/o endoparásitos. Son activos contra todas o algunas etapas del desarrollo.

35 **[0384]** Los compuestos de la presente invención son especialmente útiles para combatir parásitos de las siguientes órdenes y especies, respectivamente:

pulgas (Siphonaptera), por ejemplo, *Ctenocephalides felis*, *Ctenocephalides canis*, *Xenopsilla cheopis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans* y *Nosopsyllus fasciatus*, cucarachas (Blattaria-Blattodea), por ejemplo, *Blattella germanica*, *Blattella asahinae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta japonica*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta australasiae* y *Blatta orientalis*,
 40 moscas, mosquitos (Diptera), por ejemplo, *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Anopheles crucians*, *Anopheles albimanus*, *Anopheles gambiae*, *Anopheles freeborni*, *Anopheles leucosphyrus*, *Anopheles minimus*, *Anopheles quadrimaculatus*, *Calliphora vicina*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Chrysops discalis*, *Chrysops silacea*, *Chrysops atlanticus*, *Cochliomyia hominivorax*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culicoides furens*, *Culex pipiens*, *Culex nigripalpus*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex tarsalis*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Dermatobia hominis*, *Fannia canicularis*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Glossina palpalis*, *Glossina fuscipes*, *Glossina tachinoides*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hippelates* spp., *Hypoderma lineata*, *Leptoconops torrens*, *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Lycoria pectoralis*, *Mansonia* spp., *Musca domestica*,
 45 *Muscina stabulans*, *Oestrus ovis*, *Phlebotomus argentipes*, *Psorophora columbiae*, *Psorophora discolor*, *Prosimulium mixtum*, *Sarcophaga haemorrhoidalis*, *Sarcophaga* sp., *Simulium vittatum*, *Stomoxys calcitrans*, *Tabanus bovinus*, *Tabanus atratus*, *Tabanus lineola*, y *Tabanus similis*,
 50 piojos (Phthiraptera), por ejemplo, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pthirus pubis*, *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus suis*, *Linognathus vituli*, *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*,
 55 *Menacanthus stramineus* and *Solenopotes capillatus*.
 garrapatas y ácaros parásitos (Parasitiformes): garrapatas (Ixodida), por ejemplo, *Ixodes scapularis*, *Ixodes holocyclus*, *Ixodes pacificus*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor variabilis*, *Amblyomma americanum*, *Amblyomma maculatum*, *Ornithodoros hermsi*, *Ornithodoros turicata* y ácaros parásitos (Mesostigmata), por ejemplo, *Ornithonyssus bacoti* y *Dermanyssus gallinae*,

- Actiniedida (Prostigmata) y Acaridida (Astigmata), por ejemplo, *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Ornithocheyletia* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Listrophorus* spp., *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp., y *Laminosioptes* spp., Bugs (Heteroptera): *Cimex lectularius*, *Cimex hemipterus*, *Reduvius senilis*, *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp. Y *Ariulus critatus*, Anoplurida, por ejemplo, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp., y *Solenopotes* spp. Mallophagida (subórdenes *Armblycerina* e *Ischnocerina*), por ejemplo, *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Trichodectes* spp., y *Felicola* spp., gusanos nematodos: Gusanos marinos y triquinosis (*Trichosyringida*), por ejemplo, *Trichinellidae* (*Trichinella* spp.), (*Trichuridae*) *Trichuris* spp., *Capillaria* spp., *Rhabditida*, por ejemplo, *Rhabditis* spp., *Strongiloides* spp., *Helicephalobus* spp., *Strongilida*, por ejemplo, *Strongilus* spp., *Ancilostoma* spp., *Necator americanus*, *Bunostomum* spp. (*Anquilostomo*), *Trichostrongilus* spp., *Haemonchus contortus*, *Ostertagia* spp., *Cooperia* spp., *Nematodirus* spp., *Dictyocaulus* spp., *Cyathostoma* spp., *Oesophagostomum* spp., *Stephanurus dentatus*, *Ollulanus* spp., *Chabertia* spp., *Stephanurus dentatus*, *Syngamus trachea*, *Ancilostoma* spp., *Uncinaria* spp., *Globocephalus* spp., *Necator* spp., *Metastrongilus* spp., *Muellerius capillaris*, *Protostrongilus* spp., *Angiostrongilus* spp., *Parelaphostrongilus* spp., *Aleurostrongilus abstrusus* y *Dioctophyma renale*, Lombrices intestinales (*Ascaridida*), por ejemplo, *Ascaris lumbricoides*, *Ascaris suum*, *Ascaridia galli*, *Parascaris equorum*, *Enterobius vermicularis* (*Threadworm*), *Toxocara canis*, *Toxascaris leonine*, *Skrjabinema* spp., y *Oxiuris equi*, Camallanida, por ejemplo, *Dracunculus medinensis* (gusano de Guinea) *Spirurida*, por ejemplo, *Thelacy* spp., *Wuchereria* spp., *Brugia* spp., *Onchocerca* spp., *Dirofilaria* spp., *Dipetalonema* spp., *Setaria* spp., *Elaeophora* spp., *Spirocerca lobos*, y *Habronema* spp. Lombrices de cabeza espinosa (*Acanthocephala*), por ejemplo, *Acanthocephalus* spp., *Macracanthorhynchus hirudinaceus* y *Oncicola* spp., Planarios (*Plathelminthes*): Trematodos (*Trematoda*), por ejemplo, *Faciola* spp., *Fascioloides magna*, *Paragonimus* spp., *Dicrocoelium* spp., *Fasciolopsis buski*, *Clonorchis sinensis*, *Schistosoma* spp., *Trichobilharzia* spp., *Alaria alata*, *Paragonimus* spp., y *Nanocyetes* spp., *Cercomeromorpha*, en particular *Cestoda* (tenias), por ejemplo, *Diphilobothrium* spp., *Tenia* spp., *Echinococcus* spp., *Dipilidium caninum*, *Multiceps* spp., *Hymenolepis* spp., *Mesocestoides* spp., *Vampirolepis* spp., *Moniezia* spp., *Anoplocephala* spp., *Sirometra* spp., *Anoplocephala* spp., e *Hymenolepis* spp.

[0385] La presente descripción se refiere al uso terapéutico y no terapéutico de compuestos de la presente invención y a composiciones que los comprenden para controlar y/o combatir parásitos en y/o sobre animales. Los compuestos de la presente invención y las composiciones que los comprenden pueden usarse para proteger a los animales del ataque o la infestación por parásitos al ponerlos en contacto con una cantidad eficaz como parasitocida de los compuestos de la presente invención y las composiciones que los contienen. Los compuestos de la presente invención y las composiciones que los comprenden pueden ser eficaces tanto por contacto (a través del suelo, vidrio, pared, mosquitera, alfombra, mantas o partes de animales) como por ingestión (por ejemplo, cebos). Como tal, "contacto" incluye ambos contacto directo (aplicando las mezclas/composiciones plaguicidas que contienen los compuestos de la presente invención directamente sobre el parásito, que puede incluir un contacto indirecto en su locus-P, y opcionalmente también administrando las mezclas/composición plaguicidas directamente sobre el animal que se va a proteger) y contacto indirecto (aplicando los compuestos/composiciones al locus del parásito). El contacto del parásito a través de la aplicación a su locus es un ejemplo de uso no terapéutico de los compuestos de la presente invención. "Locus-P", como se usa anteriormente, significa el hábitat, el suministro de alimentos, el caldo de cultivo, el área, el material o el entorno en el que crece un parásito o puede crecer fuera del animal.

[0386] En general, "cantidad parasitocida efectiva" significa la cantidad de ingrediente activo necesaria para lograr un efecto observable sobre el crecimiento, incluidos los efectos de la necrosis, muerte, retraso, prevención y eliminación, destrucción o disminución de otro modo de la aparición y actividad del organismo objetivo. La cantidad eficaz como parasitocida puede variar para los diversos compuestos/composiciones de la presente invención. Una cantidad eficaz como parasitocida de las composiciones también variará de acuerdo con las condiciones predominantes tales como el efecto y duración parasitocida deseada, especies diana, modo de aplicación y similares.

[0387] Los compuestos de la presente invención también se pueden aplicar preventivamente a lugares en los

que se espera la aparición de las plagas o parásitos.

[0388] La administración puede llevarse a cabo profiláctica y terapéuticamente. La administración de los compuestos activos se lleva a cabo directamente o en forma de preparaciones adecuadas, por vía oral, tópica/dérmica o parenteral.

[0389] Los compuestos de isotiazolina de la presente invención son menos persistentes, bioacumulativos y/o tóxicos que los compuestos de la técnica anterior, y especialmente los insecticidas de isoxazolina de la técnica anterior, que muestran una alta persistencia en el suelo y, por lo tanto, se acumulan allí.

10

EJEMPLOS

[0390] La presente invención se ilustra ahora con más detalles mediante los siguientes ejemplos, sin imponer ninguna limitación a los mismos.

15

Ejemplos de preparación

[0391] Los compuestos se pueden caracterizar, por ejemplo, mediante cromatografía líquida de alta resolución/espectrometría de masas acopladas (HPLC/MS), por RMN ¹H y/o por sus puntos de fusión.

20

Columna de HPLC analítica:

[0392] Método: Columna UPLC analítica: Phenomenex Kinetex 1,7 μm XB-C18 100A; 50 x 2,1 mm de Phenomenex, Alemania. Elución: acetonitrilo + 0,1 % de ácido trifluoroacético (TFA)/agua + 0,1 % de ácido trifluoroacético (TFA) en una relación de 5:95 a 100:0 en 1,5 min a 60 °C. Flujo: 0,8 ml/min a 1 ml/min en 1,5 min. Método MS: ESI positivo.

25

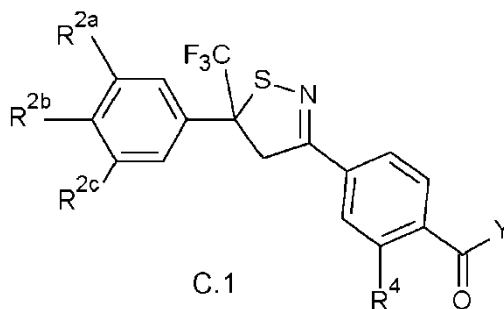
RMN ¹H: Las señales se caracterizan por el desplazamiento químico (ppm, δ [delta]) frente a tetrametilsilano, respectivamente CDCl₃ para RMN ¹³C, por su multiplicidad y por su integral (número relativo de átomos de hidrógeno dado). Para caracterizar la multiplicidad de las señales se utilizan las siguientes abreviaturas: m = multiplete, q = cuartete, t = triplete, d = doblete y s = singlete.

30

C.1 Ejemplos de compuestos

[0393] Los ejemplos de los compuestos 1-1 a 1-42 corresponden a los compuestos de fórmula C.1:

35



en la que R^{2a}, R^{2b}, R^{2c}, R⁴ e Y de cada compuesto sintetizado se define en una fila de la tabla C.1 a continuación (por lo que los compuestos 1-18, 1-23 y 1-33 no son parte del invención). Los compuestos se sintetizaron de forma análoga al Ejemplo de síntesis S.1.

40

Tabla C.1

Ej.	R ^{2a} , R ^{2b} , R ^{2c}	R ⁴	Y	HPLC-MS: R _t (min) y [M + H] ⁺	
1-1	Cl, Cl, Cl	H	azetidín-1-ilo	1,431	495,1
1-2	Cl, Cl, Cl	H	pirrolidín-1-ilo	1,461	507,1
1-3	Cl, F, Cl	Cl	3,3-difluoro-pirrolidín-1-ilo	1,447	562,9

1-4	Cl, F, Cl	Cl	3,3,4,4-tetrafluoro-pirrolidin-1-ilo	1,498	597,0
1-5	Cl, F, Cl	Cl	4,4-difluoro-piperidin-1-ilo	1,485	575,1
1-6	Cl, F, Cl	Cl	3,3-difluoro-azetidín-1-ilo	1,451	549,1
1-7	Cl, F, Cl	Cl	4-ciano-1-piperidilo	1,408	566,1
				R _t (min) y [M + H] ⁺	
1-8	Cl, F, Cl	Cl	3-acetamidopirrolidin-1-ilo	1,33	584,4
1-9	Cl, F, Cl	Cl	2-metoxicarbonilaziridin-1-ilo	1,517	557,3
1-10	Cl, F, Cl	Cl	3-[(2,2,2-trifluoroacetil)-amino]-pirrolidin-1-ilo	1,455	638,4
1-11	Cl, F, Cl	Cl	4-acetilpiperazin-1-ilo	1,366	584,5
1-12	Cl, F, Cl	Cl	3-cianopirrolidin-1-ilo	1,424	550,6
1-13	Cl, F, Cl	Cl	2-(metilcarbamoil)-pirrolidin-1-ilo	1,362	583,6
1-14	Cl, F, Cl	Cl	2-(2,2,2-trifluoroetil-carbamoil)-pirrolidin-1-ilo	1,447	651,6
1-15	Cl, F, Cl	Cl	2,2,6,6-tetrafluoromorfolin-4-ilo	1,54	612,7
1-16	Cl, F, Cl	Cl	3-cianoazetidín-1-ilo	1,418	538,4
1-17	Cl, F, Cl	Cl	2-metoxicarbonilazetidín-1-ilo	1,451	571,4
1-18	Cl, F, Cl	Cl	3-metil-4-oxo-imidazolidin-1-ilo	1,351	555,6
1-19	Cl, F, Cl	Cl	3-ciano-1-piperidilo	1,447	563,8
1-20	Cl, F, Cl	Cl	3-(metilcarbamoil)-pirrolidin-1-ilo	1,33	584,4
1-21	Cl, F, Cl	Cl	3-(metilcarbamoil)-1-piperidilo	1,377	598,5
1-22	Cl, F, Cl	Cl	2-(2,2,2-trifluoroetil-carbamoil)-azetidín-1-ilo	1,434	636,7
1-23	Cl, F, Cl	Cl		1,35	602,6
1-24	Cl, F, Cl	Cl	4-(metilcarbamoil)-1-piperidilo	1,341	596,7
1-25	Cl, F, Cl	Cl	2-(metilcarbamoil)-1-azetidínilo	1,330	569,6
1-26	Cl, F, Cl	Cl	3-(etilcarbamoilamino)-1-pirrolidinilo	1,326	612,6
1-27	Cl, F, Cl	Cl	3-(3,3,3-trifluoropropanoilamino)-1-pirrolidinilo	1,393	651,5
1-28	Cl, F, Cl	Cl	3-(propanoilamino)-1-pirrolidinilo	1,349	598,7
1-29	Cl, F, Cl	Cl	3-(metoxicarbonilamino)-1-pirrolidinilo	1,374	600,7
1-30	Cl, F, Cl	Cl	3-acetamidoazetidín-1-ilo	1,298	567,7
1-31	Cl, F, Cl	Cl	3-(metilcarbamoilamino)-pirrolidin-1-ilo	1,311	599,7
1-32	Cl, F, Cl	Cl	3-(2,2,2-trifluoroetil-carbamoil)pirrolidin-1-ilo	1,377	651,5
1-33	Cl, F, Cl	Cl	2-oxo-3-(2,2,2-trifluoroetil)imidazolidin-1-ilo	1,514	623,6
1-34	Cl, F, Cl	Cl	aziridin-1-ilo	RMN ¹ H (400 MHz, CDCl ₃): δ 7,9-7,8 (m, 2H), 7,8-7,6 (m, 1H), 7,35-7,25 (m, 2H), 4,6-4,4 (m, 2H), 4,3-4,1 (m, 3H), 3,9 (d, 1H)	
1-35	Cl, F, Cl	Cl	azetidín-1-ilo	1,480	513,1
1-36	Cl, F, Cl	Cl	2-cianopirrolidin-1-ilo	1,478	552,1
1-37	Cl, F, Cl	Cl	2-(2,2,2-trifluoroetil-carbamoil)	1,507	624,0

			aziridin-1-ilo		
1-38	Cl, F, Cl	Cl	3-[(2,2,2-trifluoroacetil)-amino] azetidín-1-ilo	1,417	621,8
1-39	Cl, F, Cl	Cl	3-(ciclobutanecarbonilamino) azetidín-1-ilo	1,395	609,8
1-40	Cl, F, Cl	Cl	3-[(2-metoxiacetil) amino]-azetidín-1-ilo	1,329	599,8
1-41	Cl, F, Cl	Cl	3-(propanoilamino) azetidín-1-ilo	1,364	584,0
1-42	Cl, F, Cl	Cl	3-(ciclopropanocarbonilamino) azetidín-1-ilo	1,357	594,8

Ejemplo de síntesis S.1

[2-Cloro-4-[5-(3,5-dicloro-4-fluoro-fenil)-5-(trifluorometil)-4H-isotiazol-3-il] fenil]-(4,4-difluoro-1-piperidil) metanona

5

[0394] (Ejemplo de compuesto 1-5; compuesto de fórmula IA, en la que R^{2a} y R^{2c} son Cl, R^{2b} es F, R⁴ es Cl y R⁵ y R⁶, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, son 4,4-difluoro-1-piperidilo.

Etapa 1: 1-(3,5-Dicloro-4-fluoro-fenil)-2,2,2-trifluoro-etanona

10

[0395] A una solución de 1,3-dicloro-2-fluoro-5-yodo-benceno (CAS 133307-08-1, 50 g) y 2,2,2-trifluoro-N-metoxi-N-metil-acetamida (40,5 g) en THF (800 ml) a -78 °C se le añadió n-BuLi (82,5 ml, 2,5 M en hexanos). La reacción se agitó durante 20 minutos, a continuación se inactivó con una solución acuosa saturada de NH₄Cl y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó (Na₂SO₄), se filtró, y se concentró. El residuo se purificó por cromatografía ultrarrápida sobre gel de sílice para proporcionar el producto (24 g, 53 %).

15

RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃): δ 8,0 (m, 2H).

Etapa 2: 4-acetil-2-cloro-benzoato de terc-butilo

20

[0396] A una solución de 4-bromo-2-cloro-benzoato de terc-butilo (CAS 929000-18-0, 85 g) en xileno (600 ml) se le añadieron tris (dibencilidenacetona) de dipaladio (0) ("Pd₂(dba)₃", 4,3 g), 1,1'-binaftaleno-2,2'-diil bis (difenilfosfina) ("BINAP", 3,7 g) y tributil (1-etoxivinil) estaño (126,6 g). La mezcla se agitó bajo N₂ a 150 °C durante la noche, después la mezcla se concentró, y el residuo se disolvió en THF y una solución acuosa 2 M de HCl y se agitó a temperatura ambiente durante 2 h. La mezcla se extrajo con acetato de etilo, y la capa orgánica se concentró para dar un residuo, que se purificó por cromatografía ultrarrápida sobre gel de sílice para proporcionar el producto (60 g, 81 %).

25

RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃): δ 7,9 (s, 1H), 7,8 (d, 1H), 7,7 (d, 1H), 2,6 (s, 3H), 1,6 (s, 9H).

30

Etapa 3: 2-cloro-4-[3-(3,5-dicloro-4-fluoro-fenil)-4,4,4-trifluoro-3-hidroxi-butanoil] benzoato de terc-butilo

[0397] Una solución del producto de la etapa 1 (30 g) y el producto de la etapa 2 (23,4 g) en una mezcla de trietilamina (10 ml) y heptano (300 ml) se agitó a 70 °C durante la noche. Entonces, la mezcla se concentró. El residuo se purificó por cromatografía ultrarrápida sobre gel de sílice para proporcionar el producto (37,5 g, 63 %).

35

RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃): δ 7,9 (s, 1H), 7,8 (m, 2H), 7,5 (m, 2H), 5,5 (s, 1H), 3,7 (d, 1H), 3,6 (d, 1H), 1,6 (s, 9H).

Etapa 4: 2-cloro-4-[3-(3,5-dicloro-4-fluoro-fenil)-4,4,4-trifluoro-but-2-enoil] benzoato de terc-butilo

40

[0398] Al producto de la etapa 4 (50 g) en piridina (27 g) y tolueno (400 ml) se le añadió cloruro de tionilo (45 g) a 60 °C. A continuación, la mezcla se calentó a 80 °C durante 5 h, y se concentró. El residuo se purificó por cromatografía ultrarrápida sobre gel de sílice para proporcionar el producto como una mezcla de isómeros E/Z (42 g, 87 %).

45

RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃): δ 7,9-6,8 (m, 6H), 1,6 (s, 9H).

Etapa 5: 2-cloro-4-[3-(3,5-dicloro-4-fluoro-fenil)-4,4,4-trifluoro-3-sulfanil-butanoil] benzoato de terc-butilo

[0399] El producto de la etapa 4 (56 g, mezcla de *E/Z* isómeros) en CH₂Cl₂ (500 ml) se trató con trietilamina (114 g). A 0 °C, se burbujeó sulfuro de hidrógeno gaseoso (H₂S) a través de la solución hasta que la solución se saturó. La mezcla se agitó durante 1 h a 0 °C, y después se diluyó con CH₂Cl₂ (200 ml). La capa orgánica se lavó con una solución acuosa el 10 % de ácido clorhídrico (3 x), se secó (Na₂SO₄), se filtró, y se concentró para proporcionar el producto en bruto (59,9 g, cuant.), que se usó en la siguiente etapa sin ninguna purificación adicional.

10 RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃): δ 7,9 (s, 1H), 7,8 (m, 2H), 7,6 (d, 2H), 4,2 (d, 1H), 3,9 (d, 1H), 3,2 (s, 1H (SH)), 1,6 (s, 9H).

Etapa 6: 2-cloro-4-[5-(3,5-dicloro-4-fluoro-fenil)-5-(trifluorometil)-4H-isotiazol-3-il] benzoato de terc-butilo

15 **[0400]** A -15 °C, el producto de la etapa 5 (59,9 g) en CH₂Cl₂ (600 ml) se trató con trietilamina (45,6 g) y con una solución de ácido hidroxilamina-O-sulfónico ("HOSA", 15,3 g) en agua (20 ml). La reacción se calentó a 0 °C y se agitó a 0 °C durante 1 h, y después se diluyó con CH₂Cl₂ (300 ml). La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de NH₄Cl (3x), se secó (Na₂SO₄) y se filtró. A la solución obtenida, se le añadió ácido para-toluenosulfónico ("p-TsOH", 0,5 g) y la mezcla se agitó durante 2 h a temperatura ambiente. Entonces, la reacción se lavó con una solución acuosa de K₂CO₃ al 5 % (3x), se secó (Na₂SO₄) y se concentró. El residuo obtenido se purificó por trituración (hexanos/CH₂Cl₂) para proporcionar un sólido blanco (34,4 g, 58 %).

RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃): δ 7,8 (m, 2H), 7,7 (m, 1H), 7,4 (m, 2H), 4,2 (d, 1H), 3,9 (d, 1H), 1,6 (s, 9H).

25 Etapa 7: Ácido 2-cloro-4-[5-(3,5-dicloro-4-fluoro-fenil)-5-(trifluorometil)-4H-isotiazol-3-il] benzoico

[0401] A 0 °C, el producto de la etapa 6 (16,2 g) en CH₂Cl₂ (120 ml) se trató con ácido trifluoroacético ("TFA", 60 ml), y la mezcla se agitó durante la noche a temperatura ambiente, la reacción se concentró, y co-evaporó con CH₂Cl₂ (5x) para proporcionar un sólido de color amarillo pálido. El residuo se purificó por trituración (éter de petróleo/acetato de etilo) para proporcionar el producto (14,1 g, 97 %).

RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃): δ 8,1 (d, 1H), 7,8 (s, 1H), 7,7 (d, 1H), 7,4 (m, 2H), 4,2 (d, 1H), 3,9 (d, 1H).

35 Etapa 8: [2-Cloro-4-[5-(3,5-dicloro-4-fluoro-fenil)-5-(trifluorometil)-4H-isotiazol-3-il] fenil]-(4,4-difluoro)-1-piperidil] metanona

[0402] A una solución del producto de la etapa 7 (0,4 g) en CH₂Cl₂/tolueno (1:1, 20 ml) a temperatura ambiente se le añadió N,N-dimetilformamida ("DMF", 1 gota) y cloruro de oxalilo (0,21 g). La reacción se agitó durante la noche a temperatura ambiente y se concentró. El residuo se co-evaporó con CH₂Cl₂ (5x) y se usó en la siguiente etapa sin ninguna purificación adicional (0,41 g, "cloruro de ácido").

[0403] Se añadió una solución del "cloruro de ácido" (0,2 g) en THF (10 ml) a una solución de clorhidrato de 4,4-difluoropiperidina (80 mg) en THF (10 ml) a 0 °C. La solución resultante se agitó a temperatura ambiente durante 66 h, a continuación se filtró y se concentró. El residuo se purificó por cromatografía ultrarrápida sobre gel de sílice (acetato de etilo/ciclohexano) para proporcionar el producto (0,12 g, 51 %).

RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃): δ 7,9-7,6 (m, 2H), 7,4 (m, 3H), 4,2 (d, 1H), 3,8 (m, 2H), 3,4 (m, 1H), 3,3 (m, 1H), 2,2-2,0 (m, 3H), 2,0-1,8 (m, 1H).

50 II. Evaluación de la actividad pesticida:

[0404] La actividad de los compuestos de fórmula I de la presente invención se puede demostrar y evaluar mediante la siguiente prueba biológica.

55 B.1 Polilla de espalda de diamante (*Plutella xylostella*)

[0405] Hojas de col china se sumergieron en solución de prueba y se secaron al aire. Las hojas tratadas se colocaron en un recipiente de petri revestido con papel de filtro húmedo. La mortalidad se registró 24, 72 y 120 horas después del tratamiento.

[0406] En esta prueba, los compuestos 1-1, 1-2, 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33 y 1-34 a 500 ppm, respectivamente, mostraron una mortalidad de al menos un 75 % en comparación con controles no tratados.

5

B.2 Áfido verde del melocotón (*Myzus persicae*)

[0407] Para evaluar el control del áfido verde del melocotón (*Myzus persicae*) a través de medios sistémicos, la unidad de prueba consistió en placas de microtitulación de 96 pocillos que contenían dieta líquida artificial bajo una membrana artificial.

10

[0408] Los compuestos se formularon usando una solución que contenía un 75 % en v/v de agua y un 25 % en v/v de DMSO. Se pipetearon diferentes concentraciones de compuestos formulados en la dieta de áfidos, utilizando una pipeta personalizada, en dos repeticiones.

15

[0409] Después de la aplicación, se colocaron 5-8 áfidos adultos sobre la membrana artificial dentro de los pocillos de la placa de microtitulación. A continuación se permitió que los áfidos chuparan la dieta de áfidos tratados y se incubaron a aproximadamente 23 ± 1 °C y aproximadamente 50 ± 5 % de humedad relativa durante 3 días. La mortalidad y fecundidad de áfidos se evaluó visualmente.

20

[0410] En esta prueba, los compuestos 1-1, 1-2, 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36 y 1-37 a 2500 ppm, respectivamente, mostraron una mortalidad de al menos un 75 % en comparación con los controles no tratados.

25

B.3 Mosca mediterránea de la fruta (*Ceratitis capitata*)

[0411] Para evaluar el control de la mosca mediterránea de la fruta (*Ceratitis capitata*), la unidad de prueba consistió en placas de microtitulación que contenían una dieta para insectos y 50-80 huevos de *C. capitata*. Los compuestos se formularon usando una solución que contenía un 75 % en v/v de agua y un 25 % en v/v de DMSO. Se pulverizaron diferentes concentraciones de compuestos formulados sobre la dieta de insectos a 5 µl, usando un micro-atomizador construido a medida, en dos repeticiones.

30

[0412] Después de la aplicación, las placas de microtitulación se incubaron a aproximadamente 28 ± 1 °C y a aproximadamente el 80 ± 5 % de humedad relativa durante 5 días. La mortalidad de huevos y larvas se evaluó visualmente.

35

[0413] En esta prueba, los compuestos 1-1, 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-12, 1-13, 1-16, 1-18, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-32, 1-34, 1-35 y 1-36 a 2500 ppm, respectivamente, mostraron una mortalidad de al menos un 75 % en comparación con los controles no tratados.

40

B.4 Tisanópteros de orquídeas (*dichromothrips corbetti*)

[0414] Se obtuvieron *dichromothrips corbetti* adultos utilizados para bioensayo a partir de una colonia mantenida de forma continua en condiciones de laboratorio. Para fines de prueba, el compuesto de ensayo se diluyó a una concentración de 500 ppm (compuesto en peso: diluyente en vol) en una mezcla 1:1 de acetona:agua (vol:vol), más el 0,01 % vol/vol de tensioactivo Kinetic®.

45

[0415] La potencia sobre los tisanópteros de cada compuesto se evaluó mediante el uso de una técnica de inmersión floral. Se utilizaron placas de Petri de plástico como arenas de prueba. Todos los pétalos de flores de orquídeas individuales e intactas se sumergieron en una solución de tratamiento y se dejaron secar. Las flores tratadas se colocaron en placas de Petri individuales junto con 10-15 tisanópteros adultos. Las placas de Petri se cubrieron con tapas. Todas las arenas de prueba se mantuvieron bajo luz continua y a una temperatura de aproximadamente 28 °C durante la duración del ensayo. Después de 4 días, se contaron las cantidades de tisanópteros vivos en cada flor y en las paredes internas de cada placa de Petri. El nivel de mortalidad de los tisanópteros se extrapoló de los números de tisanópteros previos al tratamiento.

50

[0416] En esta prueba, los compuestos 1-1, 1-2, 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-10, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-31, 1-32, 1-33 y 1-34 a 500 ppm,

respectivamente, mostraron una mortalidad de al menos un 75 % en comparación con controles sin tratamiento.

B.5 Saltahojas verde de arroz (*Nephotettix virescens*)

5 [0417] Las plántulas de arroz se limpiaron y lavaron 24 horas antes de la pulverización. Los compuestos activos se formularon en 50:50 de acetona:agua (vol:vol) y se añadió tensioactivo al 0,1 % vol/vol (EL 620). Las plántulas de arroz en macetas se pulverizaron con 5 ml de solución de prueba, se secaron al aire, se colocaron en jaulas y se inocularon con 10 adultos. Las plantas de arroz tratadas se mantuvieron a aproximadamente 28-29 °C y a una humedad relativa de aproximadamente el 50-60 %. El porcentaje de mortalidad se registró después de 72
10 horas.

[0418] En esta prueba, los compuestos 1-3, 1-4, 1-5, 1-12, 1-16, 1-17, 1-18, 1-22, 1-25 y 1-29 a 500 ppm, respectivamente, mostraron una mortalidad de al menos un 75 % en comparación con los controles no tratados.

15 B.6 Áfido de la veza (*Megoura viciae*)

[0419] Para evaluar el control del áfido de la veza (*Megoura viciae*) a través de medios de contacto o sistémicos, la unidad de prueba consistió en placas de microtitulación de 24 pocillos que contenían discos de hojas de habas anchas.

20

[0420] Los compuestos se formularon usando una solución que contenía un 75 % en v/v de agua y un 25 % en v/v de DMSO. Se pulverizaron diferentes concentraciones de compuestos formulados sobre los discos de hojas a 2,5 µl, utilizando un micro-atomizador construido a medida, en dos repeticiones.

25 [0421] Después de la aplicación, los discos de hojas se secaron al aire y se colocaron 5-8 áfidos adultos en los discos de hojas dentro de los pocillos de la placa de microtitulación. Entonces se dejó que los áfidos chuparan los discos de hojas tratadas y se incubaron a aproximadamente 23 ± 1 °C y a aproximadamente el 50 ± 5 % de humedad relativa durante 5 días. La mortalidad y fecundidad de áfidos se evaluó visualmente.

30 [0422] En esta prueba, los compuestos 1-1, 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-9, 1-10, 1-12, 1-13, 1-16, 1-17, 1-18, 1-19, 1-22, 1-25, 1-28, 1-29, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36 y 1-37 a 2500 ppm, respectivamente, mostraron una mortalidad de al menos un 75 % en comparación con los controles no tratados.

B.7 Gusano de la yema del tabaco (*Heliothis virescens*)

35

[0423] Para evaluar el control del gusano de la yema del tabaco (*Heliothis virescens*), la unidad de prueba consistió en placas de 96 pocillos de microtitulación que contenían una dieta para insectos y 15-25 huevos de *H. virescens*.

40 [0424] Los compuestos se formularon usando una solución que contenía un 75 % en v/v de agua y un 25 % en v/v de DMSO. Se pulverizaron diferentes concentraciones de compuestos formulados sobre la dieta de insectos a 10 µl, usando un micro-atomizador construido a medida, en dos repeticiones.

[0425] Después de la aplicación, las placas de microtitulación se incubaron a aproximadamente 28 ± 1 °C y a
45 aproximadamente el 80 ± 5 % de humedad relativa durante 5 días. La mortalidad de huevos y las larvas se evaluó visualmente.

[0426] En esta prueba, los compuestos 1-1, 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34 y 1-35 a
50 2500 ppm, respectivamente, mostraron una mortalidad de al menos un 75 % en comparación con los controles no tratados.

B.8 Gorgojo de la cápsula (*Anthonomus grandis*)

55 [0427] Para evaluar el control del gorgojo de la cápsula (*Anthonomus grandis*), la unidad de prueba consistió en placas de microtitulación de 24 pocillos que contenían una dieta para insectos y 20-30 huevos de *A. grandis*.

[0428] Los compuestos se formularon usando una solución que contenía un 75 % en v/v de agua y un 25 % en v/v de DMSO. Se pulverizaron diferentes concentraciones de compuestos formulados sobre la dieta de insectos a

20 µl, usando un micro-atomizador construido a medida, en dos repeticiones.

[0429] Después de la aplicación, las placas de microtitulación se incubaron a aproximadamente 23 ± 1 °C y a aproximadamente el 50 ± 5 % de humedad relativa durante 5 días. La mortalidad de huevos y larvas se evaluó visualmente.

[0430] En esta prueba, los compuestos 1-1, 1-2, 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36 y 1-37 a 2500 ppm, respectivamente, mostraron una mortalidad de al menos un 75 % en comparación con los controles no tratados.

B.9 Ácaro araña roja (*Tetranychus kanzawai*)

[0431] El compuesto activo se disolvió a la concentración deseada en una mezcla de agua destilada:acetona 1:1 (v/v). Se añadió un tensioactivo (Alkamuls® EL 620) a una concentración del 0,1 % (v/v).

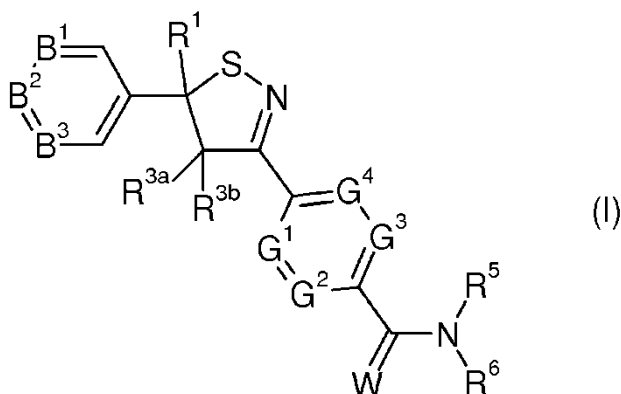
[0432] Las habas de caupí en maceta de 7-10 días de edad se limpiaron con agua del grifo y se pulverizaron con 5 ml de la solución de prueba utilizando un atomizador manual accionado por aire. Las plantas tratadas se dejaron secar al aire y después se incidieron con 20 o más ácaros cortando una sección de la hoja de yuca con una población conocida de ácaros. Las plantas tratadas se colocaron dentro de una sala de mantenimiento a aproximadamente 25-27 °C y aproximadamente el 50-60 % de humedad relativa.

[0433] La mortalidad se determinó contando los ácaros vivos 72 h después del tratamiento. El porcentaje de mortalidad se evaluó después de 72 h.

[0434] En esta prueba, los compuestos 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-17, 1-18, 1-22, 1-25, 1-29 y 1-34 a 500 ppm, respectivamente, mostraron una mortalidad de al menos un 75 % en comparación con los controles no tratados.

REIVINDICACIONES

1. Compuestos de isotiazolina de la fórmula I



5

en la que:

- B¹, B² y B³ son cada uno independientemente CR²;
 G¹, G³ y G⁴ son CH y G² es CR⁴;
 W es O;
 R¹ es CF₃;
 cada R² se selecciona independientemente entre hidrógeno, halógeno y haloalquilo C₁-C₂;
 R^{3a}, R^{3b} cada uno se selecciona independientemente entre hidrógeno y halógeno;
 R⁴ se selecciona entre hidrógeno, halógeno y metilo;
 R⁵ y R⁶, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un anillo heteromonocíclico saturado de 3, 4, 5 o 6 miembros, donde el anillo puede contener además 1 o 2 heteroátomos o grupos que contienen heteroátomos seleccionados entre O, S, SO, SO₂ y NH como miembros del anillo, en el que el anillo heteromonocíclico puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4, 5 o 6 sustituyentes R⁷;
 cada R⁷ se selecciona independientemente entre halógeno, ciano, oxo, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, en el que los 8 últimos sustituyentes mencionados pueden llevar un radical R⁸; alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, -N(R^{10a})R^{10b}, -C(=O)N(R^{10a})R^{10b}, -C(=S)N(R^{10a})R^{10b}, y -C(=O)R⁸;
 R⁸ como sustituyente en un grupo alifático o cicloalifático se selecciona entre ciano, cicloalquilo C₃-C₆ que puede estar sustituido con 1 o 2 sustituyentes seleccionados entre CN, metilo y oxo; halocicloalquilo C₃-C₆, y -OR⁹; y
 R⁸ en el grupo -C(=O)R⁸ se selecciona entre hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquilo C₁-C₆ que lleva un grupo CN; cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₄, donde el resto cicloalquilo en los 4 últimos radicales mencionados pueden llevar un grupo CN; alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, -OR⁹ y -N(R^{10a})R^{10b};
 cada R⁹ se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₆ y haloalquilo C₁-C₆;
 R^{10a} es hidrógeno o metilo; y R^{10b} se selecciona entre hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, -C(=O)R¹³, y -C(=O)N(R^{14a})R^{14b};
 R¹³ se selecciona entre alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, donde los restos cicloalquilo en los dos últimos grupos mencionados pueden estar sustituidos con un grupo ciano; alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;
 R^{14a} se selecciona entre hidrógeno y alquilo C₁-C₆;
 R^{14b} se selecciona entre hidrógeno, alquilo C₁-C₆ y haloalquilo C₁-C₆;
 y los N-óxidos, estereoisómeros y sales agrícola o veterinariamente aceptables de los mismos;
 a excepción de los compuestos I en los que B¹ y B³ son C-Cl, y simultáneamente B² es C-H, G² es C-F, C-Cl o C-CH₃, y R⁵ y R⁶, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo seleccionado entre aziridin-1-ilo, azetidín-1-ilo, pirrolidin-1-ilo, piperidin-1-ilo, tiazolidín-3-ilo, morfolin-4-ilo, tiomorfolin-4-ilo, 1-oxo-1,4-tiazinan-4-ilo y 1,1-dioxo-1,4-tiazinan-4-ilo.

45

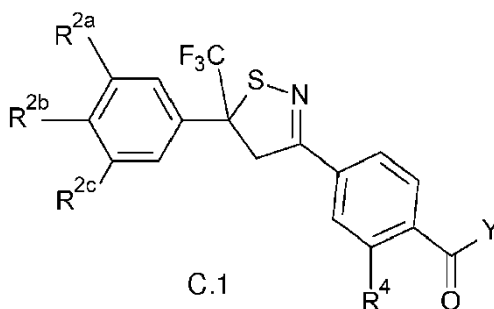
2. Los compuestos según la reivindicación 1, donde R⁸ en el grupo -C(=O)R⁸ se selecciona entre alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, -OR⁹ y -N(R^{10a})R^{10b}.

3. Los compuestos según la reivindicación 1, donde B¹ y B³ son CR², donde R² no es hidrógeno, y B² es CR², donde R² tienen uno de los significados dados en la reivindicación 1.

4. Los compuestos según la reivindicación 3, donde B¹ y B³ son C-Cl y B² es C-F; o B¹ y B³ son C-CF₃ y B² es C-H; o B¹ y B³ son C-Br y B² es C-F; o B¹, B² y B³ son C-Cl; o B¹ es C-Cl, B² es C-H y B³ es C-CF₃; o B¹ es C-Br, B² es C-H y B³ es C-CF₃.

10

5. Un compuesto según la reivindicación 1 de fórmula C.1, que se selecciona entre los siguientes:



Ej.	R ^{2a} , R ^{2b} , R ^{2c}	R ⁴	Y
1-1	Cl, Cl, Cl	H	azetidín-1-ilo
1-2	Cl, Cl, Cl	H	pirrolidín-1-ilo
1-3	Cl, F, Cl	Cl	3,3-difluoro-pirrolidín-1-ilo
1-4	Cl, F, Cl	Cl	3,3,4,4-tetrafluoro-pirrolidín-1-ilo
1-5	Cl, F, Cl	Cl	4,4-difluoro-piperidín-1-ilo
1-6	Cl, F, Cl	Cl	3,3-difluoro-azetidín-1-ilo
1-7	Cl, F, Cl	Cl	4-ciano-1-piperidilo
1-8	Cl, F, Cl	Cl	3-acetamidopirrolidín-1-ilo
1-9	Cl, F, Cl	Cl	2-metoxicarbonilaziridín-1-ilo
1-10	Cl, F, Cl	Cl	3-[(2,2,2-trifluoroacetil)-amino]-pirrolidín-1-ilo
1-11	Cl, F, Cl	Cl	4-acetilpiperazín-1-ilo
1-12	Cl, F, Cl	Cl	3-cianopirrolidín-1-ilo
1-13	Cl, F, Cl	Cl	2-(metilcarbamoil)-pirrolidín-1-ilo
1-14	Cl, F, Cl	Cl	2-(2,2,2-trifluoroetil-carbamoil)-pirrolidín-1-ilo
1-15	Cl, F, Cl	Cl	2,2,6,6-tetrafluoromorfolín-4-ilo
1-16	Cl, F, Cl	Cl	3-cianoazetidín-1-ilo
1-17	Cl, F, Cl	Cl	2-metoxicarbonilazetidín-1-ilo
1-19	Cl, F, Cl	Cl	3-ciano-1-piperidilo
1-20	Cl, F, Cl	Cl	3-(metilcarbamoil)-pirrolidín-1-ilo
1-21	Cl, F, Cl	Cl	3-(metilcarbamoil)-1-piperidilo
1-22	Cl, F, Cl	Cl	2-(2,2,2-trifluoroetil-carbamoil)-azetidín-1-ilo
1-24	Cl, F, Cl	Cl	4-(metilcarbamoil)-1-piperidilo
1-25	Cl, F, Cl	Cl	2-(metilcarbamoil)-1-azetidínilo
1-26	Cl, F, Cl	Cl	3-(etilcarbamoilamino)-1-pirrolidínilo
1-27	Cl, F, Cl	Cl	3-(3,3,3-trifluoropropanoílamino)-1-pirrolidínilo
1-28	Cl, F, Cl	Cl	3-(propanoílamino)-1-pirrolidínilo
1-29	Cl, F, Cl	Cl	3-(metoxicarbonílamino)-1-pirrolidínilo
1-30	Cl, F, Cl	Cl	3-acetamidoazetidín-1-ilo
1-31	Cl, F, Cl	Cl	3-(metilcarbamoílamino)-pirrolidín-1-ilo

1-32	Cl, F, Cl	Cl	3-(2,2,2-trifluoroetil-carbamoil) pirrolidin-1-ilo
1-34	Cl, F, Cl	Cl	aziridin-1-ilo
1-35	Cl, F, Cl	Cl	azetidin-1-ilo
1-36	Cl, F, Cl	Cl	2-cianopirrolidin-1-ilo
1-37	Cl, F, Cl	Cl	2-(2,2,2-trifluoroetil-carbamoil) aziridin-1-ilo
1-38	Cl, F, Cl	Cl	3-[(2,2,2-trifluoroacetil)-amino] azetidin-1-ilo
1-39	Cl, F, Cl	Cl	3-(ciclobutanecarbonilamino) azetidin-1-ilo
1-40	Cl, F, Cl	Cl	3-[(2-metoxiacetil) amino]-azetidin-1-ilo
1-41	Cl, F, Cl	Cl	3-(propanoilamino) azetidin-1-ilo
1-42	Cl, F, Cl	Cl	3-(ciclopropanocarbonilamino) azetidin-1-ilo

6. Una composición agrícola que comprende al menos un compuesto de la fórmula I, como se ha definido en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, un estereoisómero del mismo y/o al menos una sal agrícolamente aceptable del mismo, y al menos un vehículo líquido y/o sólido inerte agrícolamente aceptable.
- 5 7. Una composición veterinaria que comprende al menos un compuesto de la fórmula I, como se ha definido en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, un estereoisómero del mismo y/o al menos una sal veterinariamente aceptable del mismo, y al menos un vehículo líquido y/o sólido inerte veterinariamente aceptable.
- 10 8. Un compuesto como se ha definido en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, o un estereoisómero y/o una sal veterinariamente aceptable del mismo, para su uso en el tratamiento o protección de un animal de la infestación o infección por plagas de invertebrados.
9. Un método no terapéutico para controlar plagas de invertebrados cuyo método consiste en tratar las
15 plagas, su suministro de alimentos, su hábitat o su caldo de cultivo o una planta, material de propagación de plantas, suelo, área, material o entorno en el que crecen o pueden crecer las plagas, o los materiales, plantas, material de propagación de plantas, suelos, superficies o espacios a proteger del ataque de plagas o infestación de invertebrados con una cantidad eficaz como plaguicida de al menos un compuesto de imina de la fórmula I como se ha definido en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5; un estereoisómero del mismo y/o al menos una de sus sales
20 agrícolamente aceptables.
10. El método según la reivindicación 9, para:
- (i) proteger las plantas del ataque o infestación por plagas de invertebrados, método que comprende tratar las
25 plantas con una cantidad eficaz como plaguicida de al menos un compuesto de la fórmula I como se ha definido en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, un estereoisómero del mismo y/o al menos una sal agrícolamente aceptable del mismo; o
- (ii) para proteger el material de propagación de plantas y/o las plantas que crecen del ataque o infestación por
30 plagas de invertebrados, método que comprende tratar el material de propagación de plantas con una cantidad eficaz como plaguicida de al menos un compuesto de fórmula I como se ha definido en cualquier de las reivindicaciones 1 a 5, un estereoisómero del mismo y/o al menos una sal agrícolamente aceptable del mismo.
11. Material de propagación de plantas, que comprende al menos un compuesto de la fórmula I como se
35 ha definido en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, un estereoisómero del mismo y/o al menos una sal agrícolamente aceptable del mismo.