

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 703 853**

51 Int. Cl.:

C07D 401/14 (2006.01)

C07D 231/12 (2006.01)

C07D 403/04 (2006.01)

A01N 43/56 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **05.08.2015 PCT/EP2015/068061**

87 Fecha y número de publicación internacional: **11.02.2016 WO16020441**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **05.08.2015 E 15747158 (2)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **26.09.2018 EP 3177607**

54 Título: **Compuestos de bipirazol sustituidos con halógeno para controlar plagas de animales**

30 Prioridad:

08.08.2014 EP 14180336

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

12.03.2019

73 Titular/es:

**BAYER ANIMAL HEALTH GMBH (100.0%)
Kaiser-Wilhelm-Allee 10
51373 Leverkusen, DE**

72 Inventor/es:

**MAUE, MICHAEL;
HARSCHNECK, TOBIAS;
FISCHER, REINER;
HAHN, JULIA JOHANNA;
DÉCOR, ANNE;
HALLENBACH, WERNER;
SCHWARZ, HANS-GEORG;
KÖBBERLING, JOHANNES;
HÜBSCH, WALTER y
BRETSCHNEIDER, MANFRED THOMAS**

74 Agente/Representante:

CARPINTERO LÓPEZ, Mario

ES 2 703 853 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 bipirazol sustituidos con halógeno para controlar plagas de animales

Antecedentes

5 La presente solicitud se refiere a compuestos sustituidos por halógeno novedosos, a procesos para su preparación y a su uso para controlar plagas animales, en particular artrópodos y especialmente insectos, arácnidos y nematodos.

Se sabe que determinados compuestos sustituidos por halógeno tienen acción herbicida (cf. J. Org. Chem. 1997, 62(17), 5908-5919, J. Heterocycl. Chem. 1998, 35(6), 1493-1499, WO 2004/035545, WO 2004/106324, US 2006/069132, WO 2008/029084).

10 Además, se sabe que determinados compuestos sustituidos por halógeno tienen acción insecticida (EP 1 911 751, WO2012/069366, WO2012/080376, WO2012/107434, WO2012/126766 y WO2014/122083).

Además, se sabe que determinados compuestos sustituidos por halógeno tienen actividades de inhibición de citocina (WO 2000/07980).

15 Las composiciones de protección de cultivo modernas deben cumplir con muchas demandas, por ejemplo, en relación con la eficacia, persistencia y espectro de su acción y posible uso. Las cuestiones de toxicidad, la capacidad de combinación con otros compuestos activos o auxiliares de formulación tienen una incidencia, así como la cuestión del gasto que la síntesis de un compuesto activo requiere. Además, pueden ocurrir resistencias. Por todas estas razones, la búsqueda de agentes de protección de cultivos novedosos nunca se puede considerar concluida y hay una necesidad constante de compuestos novedosos que tengan propiedades que, en comparación con los compuestos conocidos, mejoren al menos respecto de aspectos individuales.

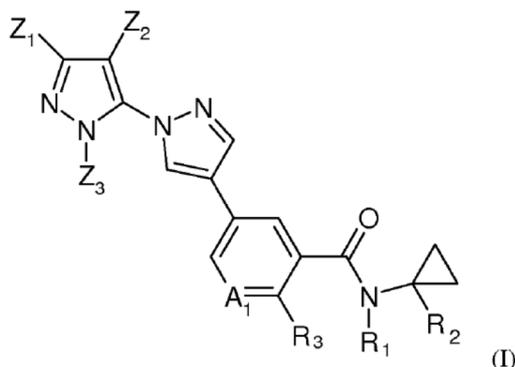
20 Era un objeto de la presente invención proporcionar compuestos que amplían el espectro de los pesticidas según varios aspectos y/o mejoran su actividad.

Sorprendentemente, se ha encontrado ahora que determinados compuestos sustituidos por halógeno tienen propiedades biológicas y son particularmente adecuados para controlar plagas de animales y por lo tanto se pueden usar particularmente bien en el campo agroquímico y en el sector de salud animal.

25 Compuestos similares ya se conocen de WO 2010/051926.

Compendio

Un aspecto de la presente invención se refiere a compuestos de la fórmula general (I),



en la que

- 30 Z₁ representa ciclopropilo 1-halogenado;
 Z₂ representa -S(O)₀₋₂-(C₁-C₂)-alquilo, (C₁-C₂)-halogenoalquilo, o nitro (NO₂);
 Z₃ representa (C₁-C₂)-alquilo;
 R₁ representa hidrógeno (H) o (C₁-C₂)-alquilo;
 R₂ representa H o ciano (CN);
 35 R₃ representa CH₃ o cloro (Cl);
 A₁ representa CH o nitrógeno (N).

El experto entenderá que todas las realizaciones de la presente invención se pueden combinar. Partes de combinaciones que contradicen las leyes naturales se excluyen.

En una realización preferida, en un compuesto de fórmula (I) A₁ es CH (mientras que todos los otros sustituyentes

son como se define anteriormente).

En otra realización preferida, en un compuesto de fórmula (I) A_1 es CH y R_3 es Cl (mientras que todos los otros sustituyentes son como se define anteriormente).

5 En aun otra realización preferida, en un compuesto de fórmula (I)

Z_1 es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo;

Z_2 es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₃, Cl, Br, I o NO₂;

Z_3 es CH₃ (mientras que todos los otros sustituyentes son como se define anteriormente).

En aun otra realización preferida, en un compuesto de fórmula (I)

10 Z_1 es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo;

Z_2 es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₃ o NO₂;

Z_3 es CH₃ (mientras que todos los otros sustituyentes son como se define anteriormente).

En aun otra realización preferida, en un compuesto de fórmula (I)

15 Z_1 es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo;

Z_2 es I, CF₃ o NO₂;

Z_3 es CH₃ (mientras que todos los otros sustituyentes son como se define anteriormente).

En aun otra realización preferida, en un compuesto de fórmula (I)

20 Z_1 es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo o 1-bromociclopropilo;

Z_2 es metilo fluorado (CF₃ CF₂H o CFH₂) o NO₂;

Z_3 es CH₃ (mientras que todos los otros sustituyentes son como se define anteriormente).

En aun otra realización preferida, en un compuesto de fórmula (I)

25 Z_1 es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo o 1-bromociclopropilo;

Z_2 es CF₃, CF₂H o NO₂;

Z_3 es CH₃ (mientras que todos los otros sustituyentes son como se define anteriormente).

En aun otra realización preferida, en un compuesto de fórmula (I)

30 Z_1 es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo o 1-bromociclopropilo;

Z_2 es CF₃ o NO₂;

Z_3 es CH₃ (mientras que todos los otros sustituyentes son como se define anteriormente).

En aun otra realización preferida, en un compuesto de fórmula (I)

35 Z_1 es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo o 1-bromociclopropilo;

Z_2 es S(O)_{0,1} o 2-CH₃;

Z_3 es CH₃ (mientras que todos los otros sustituyentes son como se define anteriormente).

En aun otra realización preferida, en un compuesto de fórmula (I)

40 Z_1 es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo o 1-bromociclopropilo;

Z_2 es S(O)_{0,1} o 2-CH₃;

35 Z_3 es CH₃ (mientras que todos los otros sustituyentes son como se define anteriormente).

En aun otra realización preferida, en un compuesto de fórmula (I)

40 Z_1 es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo o 1-bromociclopropilo;

Z_2 es S-CH₃;

Z_3 es CH₃ (mientras que todos los otros sustituyentes son como se define anteriormente).

En aun otra realización preferida, en un compuesto de fórmula (I)

45 Z_1 es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo o 1-bromociclopropilo;

Z_2 es S(O)₁-CH₃;

Z_3 es CH₃ (mientras que todos los otros sustituyentes son como se define anteriormente).

En aun otra realización preferida, en un compuesto de fórmula (I)

45 Z_1 es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo o 1-bromociclopropilo;

Z_2 es S(O)₂-CH₃;

Z_3 es CH₃ (mientras que todos los otros sustituyentes son como se define anteriormente).

En aun otra realización preferida, en un compuesto de fórmula (I)

50 Z_1 es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo o 1-bromociclopropilo;

Z_2 es NO₂;

Z_3 es CH₃ (mientras que todos los otros sustituyentes son como se define anteriormente).

En aun otra realización preferida, en un compuesto de fórmula (I)

Z_1 es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo o 1-bromociclopropilo;

Z_2 es CF₃;

Z₃ es CH₃ (mientras que todos los otros sustituyentes son como se define anteriormente).

En aun otra realización preferida, en un compuesto de fórmula (I)

Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo o 1-bromociclopropilo;

Z₂ es CF₂H;

5 Z₃ es CH₃ (mientras que todos los otros sustituyentes son como se define anteriormente).

En aun otra realización preferida, en un compuesto de fórmula (I) R₁ es H (mientras que todos los otros sustituyentes son como se define anteriormente).

En aun otra realización preferida, en un compuesto de fórmula (I) A₁ es N (mientras que Z₁, Z₂, Z₃, R₁, R₂, y R₃ son como se define anteriormente).

10 En aun otra realización preferida, en un compuesto de fórmula (I) R₃ es Cl (mientras que todos los otros sustituyentes son como se define anteriormente).

Otro aspecto se refiere al uso de un compuesto de la presente invención para controlar insectos, arácnidos y nematodos.

15 Aun otro aspecto se refiere a una composición farmacéutica que comprende al menos un compuesto de la presente invención.

Aun otro aspecto se refiere a un compuesto de la presente invención para usarse como medicamento.

Aun otro aspecto se refiere al uso de un compuesto de la presente invención para preparar una composición farmacéutica para controlar parásitos en animales.

20 Aun otro aspecto se refiere a un procedimiento para preparar una composición de protección de cultivo que comprende un compuesto de la presente invención y extensores y/o surfactantes habituales.

Aun otro aspecto se refiere a un compuesto que se selecciona del grupo que consiste en los compuestos (10), (11), (12), (13), (14) y (24) como se describe en la presente.

Aun otro aspecto se refiere a un compuesto de fórmula (10).

Aun otro aspecto se refiere a un compuesto de fórmula (11).

25 Aun otro aspecto se refiere a un compuesto de fórmula (12).

Aun otro aspecto se refiere a un compuesto de fórmula (13).

Aun otro aspecto se refiere a un compuesto de fórmula (14).

Aun otro aspecto se refiere a un compuesto de fórmula (24).

30 Aun otro aspecto se refiere a un procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula (I) que comprende los pasos de preparar compuestos de fórmula (10), (11), (12), (13) y (14) como se describe en la presente.

Aun otro aspecto se refiere a un procedimiento para controlar plagas, caracterizado porque a un compuesto de la presente invención se le permite actuar sobre plagas y/o su hábitat.

Aun otro aspecto se refiere al uso de un compuesto de la presente invención para proteger el material de propagación de plantas.

35 **Definiciones**

De acuerdo con la invención, "alquilo" - por sí solo o como parte de un grupo químico- representa hidrocarburos de cadena recta o ramificada que preferentemente tienen 1 a 6 átomos de carbono, tales como, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, s-butilo, t-butilo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 1,2-dimetilpropilo, 1,1-dimetilpropilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, hexilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,2-dimetilpropilo, 1,3-dimetilbutilo, 1,4-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 1,1-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etilbutilo y 2-etilbutilo. También se da preferencia a grupos alquilo que tienen 1 a 2 átomos de carbono.

De acuerdo con la invención, "halógeno" o "halo" representa flúor, cloro, bromo o yodo, en particular flúor, cloro o bromo.

45 Los grupos químicos sustituidos por halógeno de acuerdo con la invención tales como, por ejemplo, haloalquilo están mono- o polisustituidos por halógeno hasta el máximo número posible de sustituyentes (perhalogenado). En el caso de polisustitución por halógeno, los átomos de halógeno pueden ser idénticos o diferentes y se pueden unir a

uno o más de múltiples átomos de carbono. Aquí, halógeno representa en particular flúor, cloro, bromo o yodo, preferentemente flúor, cloro o bromo y particular y preferentemente flúor.

De acuerdo con la invención, "cicloalquilo", en sí mismo o como parte de un grupo químico, representa hidrocarburos monocíclicos que preferentemente tienen 3 carbonos (ciclopropilo). El grupo cicloalquilo de acuerdo con la invención puede estar sustituido por uno o más radicales idénticos o diferentes.

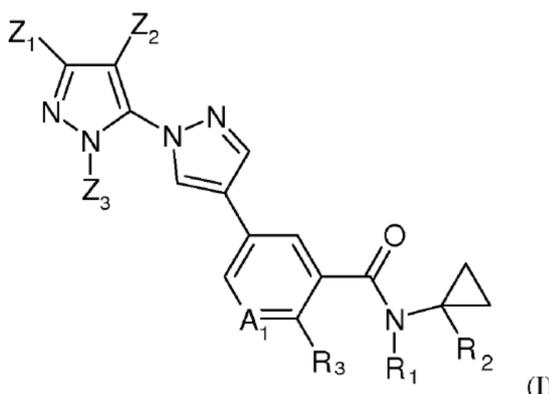
De acuerdo con la invención, "halogenoalquilo", "halogenocicloalquilo", "alquilo halogenado" y "cicloalquilo halogenado" representa alquilo/cicloalquilo sustituido por halógeno que preferentemente 1 a 5 átomos de halógeno idénticos o diferentes tales como, por ejemplo, monohaloalquilo tal como CH₂CH₂Cl, CH₂CH₂F, CHClCH₃, CHFCH₃, CH₂Cl, CH₂F; monohalocicloalquilo tal como 1-fluoro-cicloalquilo o 1-cloro-cicloalquilo; perhaloalquilo tal como CCl₃ o CF₃ o CF₂CF₃; polihaloalquilo tal como CHF₂, CH₂F, CH₂CHFCl, CHCl₂, CF₂CF₂H, CH₂CF₃.

Los compuestos de acuerdo con la invención pueden, dependiendo de la naturaleza de los sustituyentes, estar en la forma de isómeros geométricos y/u ópticamente activos o mezclas de isómero correspondiente en diferentes composiciones. Estos estereoisómeros son, por ejemplo, enantiómeros, diastereómeros, atropisómeros o isómeros geométricos. Por consiguiente, la invención abarca estereoisómeros puros y cualquier mezcla de estos isómeros.

En caso de ser apropiado, los compuestos de acuerdo con la invención pueden estar presentes en varias formas polimórficas o como una mezcla de diferentes formas polimórficas. Tanto los polimorfos puros como las mezclas de polimorfos se proporcionan por la invención y se pueden usar de acuerdo con la invención.

Descripción detallada

Los compuestos sustituidos por halógeno de acuerdo con la invención se definen por la fórmula general (I)



en la que

Z₁ representa ciclopropilo 1-halogenado;

Z₂ representa -S(O)₀₋₂-(C₁-C₂)-alquilo, (C₁-C₂)-halogenoalquilo, o nitro (NO₂);

Z₃ representa (C₁-C₂)-alquilo;

R₁ representa hidrógeno (H) o (C₁-C₂)-alquilo;

R₂ representa H o ciano (CN);

R₃ representa CH₃ o cloro (Cl);

A₁ representa CH o nitrógeno (N).

En las siguientes realizaciones preferidas cualquier sustituyente R₁ a R₃, A₁, Z₁ a Z₃ de compuestos de fórmula (I) tiene el significado como se define en el párrafo [0052] si no se define de otro modo en la realización preferida. El experto entiende que las realizaciones preferidas se pueden combinar siempre que la combinación no sea contra las leyes naturales existentes.

En una realización preferida, A₁ es CH.

En otra realización preferida, A₁ es CH y R₃ es Cl.

En otra realización preferida, Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida, Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₃, CF₂H, Cl, Br, I o NO₂.

En otra realización preferida, Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₃, CF₂H o NO₂.

En otra realización preferida, Z₂ es -S(O)₀₋₂-CH₃, CF₃,

En otra realización preferida, Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂.

En otra realización preferida, Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo.

En otra realización preferida

- 5 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 10 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 15 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

- 20 En otra realización preferida

Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 25 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 30 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 35 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

Z₁ es o 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

- 40 En otra realización preferida

A₁ es CH,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

- 45

En otra realización preferida

A₁ es CH,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

- 50

En otra realización preferida

A₁ es CH,

R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

5 En otra realización preferida

A₁ es CH,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

10

En otra realización preferida

A₁ es CH,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

15

En otra realización preferida

A₁ es CH,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

20

En otra realización preferida

A₁ es CH,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

25

En otra realización preferida

A₁ es CH,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

30

En otra realización preferida

A₁ es CH,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

35

40

En otra realización preferida, R₁ es H o CH₃.

En otra realización preferida, R₁ es H.

En otra realización preferida, R₁ es CH₃

En otra realización preferida

R₁ es H,
 A₁ es CH,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

45

50

En otra realización preferida

R₁ es H,
 A₁ es CH,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y

55

Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 5 R₁ es H,
A₁ es CH,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 10 R₁ es H,
A₁ es CH,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
15 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 20 R₁ es H,
A₁ es CH,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 25 R₁ es H,
A₁ es CH,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

30 En otra realización preferida

- R₁ es H,
A₁ es CH,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
35 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 40 R₁ es H,
A₁ es CH,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 45 R₁ es H,
A₁ es CH,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
50 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- R₁ es CH₃,
A₁ es CH,
R₃ es Cl,
55 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y

Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 5 R₁ es CH₃,
 A₁ es CH,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 10 R₁ es CH₃,
 A₁ es CH,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 15 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 20 R₁ es CH₃,
 A₁ es CH,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 25 R₁ es CH₃,
 A₁ es CH,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 30 R₁ es CH₃,
 A₁ es CH,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 35 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 40 R₁ es CH₃,
 A₁ es CH,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 45 R₁ es CH₃,
 A₁ es CH,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 50 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 55 R₁ es CH₃,
 A₁ es CH,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida, A₁ es N.

En otra realización preferida

R₁ es H,
A₁ es N,
R₃ es Cl,

- 5 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

R₁ es H,
A₁ es N,
R₃ es Cl,

- 10 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

R₁ es H,
A₁ es N,
R₃ es Cl,

- 15 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
20 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

R₁ es H,
A₁ es N,
R₃ es Cl,

- 25 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

R₁ es H,
A₁ es N,
R₃ es Cl,

- 30 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
35 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

R₁ es H,
A₁ es N,
R₃ es Cl,

- 40 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

R₁ es H,
A₁ es N,
R₃ es Cl,

- 45 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

R₁ es H,
A₁ es N,
R₃ es Cl,

- 50 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
55 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 5 R₁ es H,
A₁ es N,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.
- 10 En otra realización preferida
R₁ es CH₃,
A₁ es N,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
Z₃ es CH₃.
- 15 En otra realización preferida
R₁ es CH₃,
A₁ es N,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
20 Z₃ es CH₃.
- 25 En otra realización preferida
R₁ es CH₃,
A₁ es N,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.
- 30 En otra realización preferida
R₁ es CH₃,
A₁ es N,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
Z₃ es CH₃.
- 35 En otra realización preferida
R₁ es CH₃,
A₁ es N,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
40 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.
- 45 En otra realización preferida
R₁ es CH₃,
A₁ es N,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.
- 50 En otra realización preferida
R₁ es CH₃,
A₁ es N,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
55 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
R₁ es CH₃,
A₁ es N,

R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

5 En otra realización preferida

R₁ es CH₃,
 A₁ es N,
 R₃ es Cl,

10 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida, R₂ es H.

En otra realización preferida

15 R₁ es H,
 R₂ es H,
 A₁ es CH,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 20 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

25 R₁ es H,
 R₂ es H,
 A₁ es CH,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

30 R₁ es H,
 R₂ es H,
 A₁ es CH,
 R₃ es Cl,
 35 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

40 R₁ es H,
 R₂ es H,
 A₁ es CH,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

45 En otra realización preferida

R₁ es H,
 R₂ es H,
 A₁ es CH,
 R₃ es Cl,

50 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

55 R₁ es H,
 R₂ es H,
 A₁ es CH,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,

Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

5 R₁ es H,
R₂ es H,
A₁ es CH,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
10 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

15 R₁ es H,
R₂ es H,
A₁ es CH,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

20 R₁ es H,
R₂ es H,
A₁ es CH,
R₃ es Cl,
25 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

30 R₁ es CH₃,
R₂ es H,
A₁ es CH,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

35 R₁ es CH₃,
R₂ es H,
A₁ es CH,
R₃ es Cl,
40 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

45 R₁ es CH₃,
R₂ es H,
A₁ es CH,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
50 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

55 R₁ es CH₃,
R₂ es H,
A₁ es CH,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

- En otra realización preferida
 R₁ es CH₃,
 R₂ es H,
 A₁ es CH,
 5 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 10 R₁ es CH₃,
 R₂ es H,
 A₁ es CH,
 R₃ es Cl,
 15 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 20 R₁ es CH₃,
 R₂ es H,
 A₁ es CH,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 25 R₁ es CH₃,
 R₂ es H,
 A₁ es CH,
 R₃ es Cl,
 30 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 35 R₁ es CH₃,
 R₂ es H,
 A₁ es CH,
 R₃ es Cl,
 40 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 45 R₁ es H,
 R₂ es H,
 A₁ es N,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 50 R₁ es H,
 R₂ es H,
 A₁ es N,
 R₃ es Cl,
 55 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 60 R₁ es H,
 R₂ es H,
 A₁ es N,

R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

5 En otra realización preferida

R₁ es H,
 R₂ es H,
 A₁ es N,
 R₃ es Cl,

10 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

15 R₁ es H,
 R₂ es H,
 A₁ es N,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 20 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

25 R₁ es H,
 R₂ es H,
 A₁ es N,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

30 R₁ es H,
 R₂ es H,
 A₁ es N,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 35 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

40 R₁ es H,
 R₂ es H,
 A₁ es N,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

45 En otra realización preferida

R₁ es H,
 R₂ es H,
 A₁ es N,
 R₃ es Cl,

50 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

55 R₁ es CH₃,
 R₂ es H,
 A₁ es N,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,

Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 5 R₁ es CH₃,
R₂ es H,
A₁ es N,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
10 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 15 R₁ es CH₃,
R₂ es H,
A₁ es N,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 20 R₁ es CH₃,
R₂ es H,
A₁ es N,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
25 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 30 R₁ es CH₃,
R₂ es H,
A₁ es N,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 35 R₁ es CH₃,
R₂ es H,
A₁ es N,
R₃ es Cl,
40 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 45 R₁ es CH₃,
R₂ es H,
A₁ es N,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
50 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 55 R₁ es CH₃,
R₂ es H,
A₁ es N,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- R₁ es CH₃,
R₂ es H,
A₁ es N,
R₃ es Cl,
5 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida, R₂ es CN.
- En otra realización preferida
10 R₁ es H,
R₂ es CN,
A₁ es CH,
R₃ es Cl,
15 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₃, CF₂H, Cl, Br, I o NO₂, y
Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
20 R₁ es H,
R₂ es CN,
A₁ es CH,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.
- 25 En otra realización preferida
- R₁ es H,
R₂ es CN,
A₁ es CH,
R₃ es Cl,
30 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
35 R₁ es H,
R₂ es CN,
A₁ es CH,
R₃ es Cl,
40 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
45 R₁ es H,
R₂ es CN,
A₁ es CH,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
50 R₁ es H,
R₂ es CN,
A₁ es CH,
R₃ es Cl,
55 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida

5 R₁ es H,
 R₂ es CN,
 A₁ es CH,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

10 R₁ es H,
 R₂ es CN,
 A₁ es CH,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 15 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

20 R₁ es H,
 R₂ es CN,
 A₁ es CH,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

25 R₁ es CH₃,
 R₂ es CN,
 A₁ es CH,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 30 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

35 R₁ es CH₃,
 R₂ es CN,
 A₁ es CH,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

40 R₁ es CH₃,
 R₂ es CN,
 A₁ es CH,
 R₃ es Cl,
 45 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

50 R₁ es CH₃,
 R₂ es CN,
 A₁ es CH,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 55 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

R₁ es CH₃,
 R₂ es CN,

- 5 A₁ es CH,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.
- 10 En otra realización preferida
R₁ es CH₃,
R₂ es CN,
A₁ es CH,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.
- 15 En otra realización preferida
R₁ es CH₃,
R₂ es CN,
A₁ es CH,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
20 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
Z₃ es CH₃.
- 25 En otra realización preferida
R₁ es CH₃,
R₂ es CN,
A₁ es CH,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.
- 30 En otra realización preferida
R₁ es CH₃,
R₂ es CN,
A₁ es CH,
R₃ es Cl,
35 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.
- 40 En otra realización preferida
R₁ es H,
R₂ es CN,
A₁ es N,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
45 Z₃ es CH₃.
- 50 En otra realización preferida
R₁ es H,
R₂ es CN,
A₁ es N,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.
- 55 En otra realización preferida
R₁ es H,
R₂ es CN,
A₁ es N,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,

Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

5 R₁ es H,
R₂ es CN,
A₁ es N,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
10 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

15 R₁ es H,
R₂ es CN,
A₁ es N,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

20 R₁ es H,
R₂ es CN,
A₁ es N,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
25 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

30 R₁ es H,
R₂ es CN,
A₁ es N,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

35 R₁ es H,
R₂ es CN,
A₁ es N,
R₃ es Cl,
40 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

45 R₁ es H,
R₂ es CN,
A₁ es N,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
50 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

55 R₁ es CH₃,
R₂ es CN,
A₁ es N,
R₃ es Cl,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

- En otra realización preferida
 R₁ es CH₃,
 R₂ es CN,
 A₁ es N,
 5 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 10 R₁ es CH₃,
 R₂ es CN,
 A₁ es N,
 R₃ es Cl,
 15 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es CH₃,
 R₂ es CN,
 20 A₁ es N,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 25 R₁ es CH₃,
 R₂ es CN,
 A₁ es N,
 R₃ es Cl,
 30 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es CH₃,
 35 R₂ es CN,
 A₁ es N,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 40 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es CH₃,
 R₂ es CN,
 45 A₁ es N,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 50 R₁ es CH₃,
 R₂ es CN,
 A₁ es N,
 R₃ es Cl,
 55 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es CH₃,
 R₂ es CN,

- A₁ es N,
 R₃ es Cl,
 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- 5 En otra realización preferida, A₁ es CH y R₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
- A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- 10 En otra realización preferida
- A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- 15 En otra realización preferida
- A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- 20 En otra realización preferida
- A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- 25 En otra realización preferida
- A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- 30 En otra realización preferida
- A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- 35 En otra realización preferida
- A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- 40 En otra realización preferida
- A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- 45 En otra realización preferida
- A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- 50 En otra realización preferida
- A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- 55 En otra realización preferida
- A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,

Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 5 R₁ es H,
A₁ es CH,
R₃ es CH₃,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

- 10 En otra realización preferida

- R₁ es H,
A₁ es CH,
R₃ es CH₃,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
15 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 20 R₁ es H,
A₁ es CH,
R₃ es CH₃,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 25 R₁ es H,
A₁ es CH,
R₃ es CH₃,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
30 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 35 R₁ es H,
A₁ es CH,
R₃ es CH₃,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 40 R₁ es H,
A₁ es CH,
R₃ es CH₃,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 45 R₁ es H,
A₁ es CH,
R₃ es CH₃,
Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
50 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 55 R₁ es H,
A₁ es CH,
R₃ es CH₃,
Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 5 R₁ es H,
A₁ es CH,
R₃ es CH₃,
Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.
- 10 En otra realización preferida
R₁ es CH₃,
A₁ es CH,
R₃ es CH₃,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
Z₃ es CH₃.
- 15 En otra realización preferida
R₁ es CH₃,
A₁ es CH,
R₃ es CH₃,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
20 Z₃ es CH₃.
- 25 En otra realización preferida
R₁ es CH₃,
A₁ es CH,
R₃ es CH₃,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.
- 30 En otra realización preferida
R₁ es CH₃,
A₁ es CH,
R₃ es CH₃,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
Z₃ es CH₃.
- 35 En otra realización preferida
R₁ es CH₃,
A₁ es CH,
R₃ es CH₃,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
40 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.
- 45 En otra realización preferida
R₁ es CH₃,
A₁ es CH,
R₃ es CH₃,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.
- 50 En otra realización preferida
R₁ es CH₃,
A₁ es CH,
R₃ es CH₃,
Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
55 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
R₁ es CH₃,
A₁ es CH,

R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

5 En otra realización preferida

R₁ es CH₃,
 A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,

10 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

15 R₁ es H,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

20 R₁ es H,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 25 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

30 R₁ es H,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

35 R₁ es H,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

40 En otra realización preferida

R₁ es H,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,

45 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

50 R₁ es H,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

55 R₁ es H,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y

Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 5 R₁ es H,
A₁ es N,
R₃ es CH₃,
Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 10 R₁ es H,
A₁ es N,
R₃ es CH₃,
Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
15 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 20 R₁ es CH₃,
A₁ es N,
R₃ es CH₃,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 25 R₁ es CH₃,
A₁ es N,
R₃ es CH₃,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 30 R₁ es CH₃,
A₁ es N,
R₃ es CH₃,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
35 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 40 R₁ es CH₃,
A₁ es N,
R₃ es CH₃,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 45 R₁ es CH₃,
A₁ es N,
R₃ es CH₃,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
50 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- 55 R₁ es CH₃,
A₁ es N,
R₃ es CH₃,
Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

- R₁ es CH₃,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 5 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es CH₃,
 A₁ es N,
 10 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es CH₃,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,
 15 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 20 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es H,
 R₂ es H,
 A₁ es CH,
 25 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es H,
 R₂ es H,
 A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,
 30 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 35 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es H,
 R₂ es H,
 A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,
 40 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es H,
 R₂ es H,
 A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,
 45 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 50 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es H,
 R₂ es H,
 A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,
 55 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 60 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

- En otra realización preferida
 R₁ es H,
 R₂ es H,
 A₁ es CH,
 5 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 10 R₁ es H,
 R₂ es H,
 A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 15 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es H,
 R₂ es H,
 20 A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es H,
 R₂ es H,
 A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,
 25 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 30 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es CH₃,
 R₂ es H,
 A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,
 35 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 40 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es CH₃,
 R₂ es H,
 A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,
 45 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es CH₃,
 R₂ es H,
 A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,
 50 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 55 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es CH₃,
 R₂ es H,
 60 A₁ es CH,

R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

5 En otra realización preferida

R₁ es CH₃,
 R₂ es H,
 A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,

10 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

15 R₁ es CH₃,
 R₂ es H,
 A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 20 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

25 R₁ es CH₃,
 R₂ es H,
 A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

30 R₁ es CH₃,
 R₂ es H,
 A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 35 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

40 R₁ es CH₃,
 R₂ es H,
 A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

45 En otra realización preferida

R₁ es H,
 R₂ es H,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,

50 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

55 R₁ es H,
 R₂ es H,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 60 Z₃ es CH₃.

- En otra realización preferida
 R₁ es H,
 R₂ es H,
 A₁ es N,
 5 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 10 R₁ es H,
 R₂ es H,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 15 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es H,
 R₂ es H,
 20 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es H,
 R₂ es H,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,
 25 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 30 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es H,
 R₂ es H,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,
 35 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 40 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es H,
 R₂ es H,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,
 45 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es H,
 R₂ es H,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,
 50 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 55 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es CH₃,
 R₂ es H,
 60 A₁ es N,

R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

5 En otra realización preferida

R₁ es CH₃,
 R₂ es H,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,

10 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

15 R₁ es CH₃,
 R₂ es H,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 20 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

25 R₁ es CH₃,
 R₂ es H,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

30 R₁ es CH₃,
 R₂ es H,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 35 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

40 R₁ es CH₃,
 R₂ es H,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

45 En otra realización preferida

R₁ es CH₃,
 R₂ es H,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,
 50 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

55 R₁ es CH₃,
 R₂ es H,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 60 Z₃ es CH₃.

- En otra realización preferida
 R₁ es CH₃,
 R₂ es H,
 A₁ es N,
 5 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 10 R₁ es H,
 R₂ es CN,
 A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 15 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es H,
 R₂ es CN,
 20 A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂,
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es H,
 R₂ es CN,
 A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,
 25 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 30 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es H,
 R₂ es CN,
 A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,
 35 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 40 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es H,
 R₂ es CN,
 A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,
 45 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es H,
 R₂ es CN,
 A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,
 50 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 55 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es H,
 R₂ es CN,
 60 A₁ es CH,

R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

5 En otra realización preferida

R₁ es H,
 R₂ es CN,
 A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,

10 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

15 R₁ es H,
 R₂ es CN,
 A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,

Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

25 R₁ es CH₃,
 R₂ es CN,
 A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,

Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

30 R₁ es CH₃,
 R₂ es CN,
 A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,

35 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

40 R₁ es CH₃,
 R₂ es CN,
 A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,

Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

45 En otra realización preferida

R₁ es CH₃,
 R₂ es CN,
 A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,

50 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

55 R₁ es CH₃,
 R₂ es CN,
 A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,

60 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

- En otra realización preferida
 R₁ es CH₃,
 R₂ es CN,
 A₁ es CH,
 5 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 10 R₁ es CH₃,
 R₂ es CN,
 A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 15 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es CH₃,
 R₂ es CN,
 20 A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es CH₃,
 R₂ es CN,
 A₁ es CH,
 R₃ es CH₃,
 25 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 30 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es H,
 R₂ es CN,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 35 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es H,
 R₂ es CN,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,
 40 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es H,
 R₂ es CN,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,
 45 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es H,
 R₂ es CN,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,
 50 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 55 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es H,
 R₂ es CN,
 A₁ es N,
 60

R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

5 En otra realización preferida

R₁ es H,
 R₂ es CN,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,

10 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

15 R₁ es H,
 R₂ es CN,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,

20 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

25 R₁ es H,
 R₂ es CN,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,

Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

30 R₁ es H,
 R₂ es CN,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,

35 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

40 R₁ es H,
 R₂ es CN,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,

Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

45 En otra realización preferida

R₁ es CH₃,
 R₂ es CN,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,

50 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

En otra realización preferida

55 R₁ es CH₃,
 R₂ es CN,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,

60 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

- En otra realización preferida
 R₁ es CH₃,
 R₂ es CN,
 A₁ es N,
 5 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 10 R₁ es CH₃,
 R₂ es CN,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 15 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es CH₃,
 R₂ es CN,
 20 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es CH₃,
 R₂ es CN,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,
 25 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo,
 30 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es CH₃,
 R₂ es CN,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,
 35 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₂H, CF₃, Cl, Br, I o NO₂, y
 40 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es CH₃,
 R₂ es CN,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,
 45 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- En otra realización preferida
 R₁ es CH₃,
 R₂ es CN,
 A₁ es N,
 R₃ es CH₃,
 50 Z₁ es 1-cloro-ciclopropilo,
 55 Z₂ es I, CF₂H, CF₃ o NO₂, y
 Z₃ es CH₃.
- Aun otra realización preferida se refiere a compuestos de fórmula (I) en la que
 R₁ es H,
 R₂ es CN o H,
 60 A₁ es C-H,

R₃ es Cl,

Z₁ es 1-halo-ciclopropilo, preferentemente 1-fluoro-ciclopropilo, 1-cloro-ciclopropilo, 1-bromo-ciclopropilo o 1-yodo-ciclopropilo, más preferentemente 1-fluoro-ciclopropilo, 1-cloro-ciclopropilo o 1-bromo-ciclopropilo,

Z₂ es -S-C₁-C₃-alquilo, C₁-C₃-alquilo fluorado o NO₂, preferentemente -S-CH₃, -CF₃, -CF₂H, -CFH₂ o -NO₂, y

Z₃ es CH₃.

5

Aun otra realización preferida se refiere a compuestos de fórmula (I) en la que

R₁ es H,

R₂ es CN o H,

A₁ es C-H,

R₃ es Cl,

Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo, 1-cloro-ciclopropilo, 1-bromo-ciclopropilo o 1-yodo-ciclopropilo, más preferentemente 1-fluoro-ciclopropilo, 1-cloro-ciclopropilo o 1-bromo-ciclopropilo,

Z₂ es -S-C₁-C₃-alquilo y

Z₃ es CH₃.

10

Aun otra realización preferida se refiere a compuestos de fórmula (I) en la que

R₁ es H,

R₂ es CN o H,

A₁ es C-H,

R₃ es Cl,

Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo, 1-cloro-ciclopropilo, 1-bromo-ciclopropilo o 1-yodo-ciclopropilo, más preferentemente 1-fluoro-ciclopropilo, 1-cloro-ciclopropilo o 1-bromo-ciclopropilo,

Z₂ es -S-CH₃, y

Z₃ es CH₃.

20

Aun otra realización preferida se refiere a compuestos de fórmula (I) en la que

R₁ es H,

R₂ es CN o H,

A₁ es C-H,

R₃ es Cl,

Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo, 1-cloro-ciclopropilo, 1-bromo-ciclopropilo o 1-yodo-ciclopropilo, más preferentemente 1-fluoro-ciclopropilo, 1-cloro-ciclopropilo o 1-bromo-ciclopropilo,

Z₂ es -C₁-C₃-alquilo fluorado, preferentemente metilo fluorado, y

Z₃ es CH₃.

25

Aun otra realización preferida se refiere a compuestos de fórmula (I) en la que

R₁ es H,

R₂ es CN o H,

A₁ es C-H,

R₃ es Cl,

Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo, 1-cloro-ciclopropilo, 1-bromo-ciclopropilo o 1-yodo-ciclopropilo, más preferentemente 1-fluoro-ciclopropilo, 1-cloro-ciclopropilo o 1-bromo-ciclopropilo,

Z₂ es -CF₃, -CF₂H, -CFH₂ y

Z₃ es CH₃.

40

Aun otra realización preferida se refiere a compuestos de fórmula (I) en la que

R₁ es H,

R₂ es CN o H,

A₁ es C-H,

R₃ es Cl,

Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo, 1-cloro-ciclopropilo, 1-bromo-ciclopropilo o 1-yodo-ciclopropilo, más preferentemente 1-fluoro-ciclopropilo, 1-cloro-ciclopropilo o 1-bromo-ciclopropilo,

Z₂ es -CF₃, y

Z₃ es CH₃.

50

Aun otra realización preferida se refiere a compuestos de fórmula (I) en la que

R₁ es H,

R₂ es CN o H,

A₁ es C-H,

R₃ es Cl,

Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo, 1-cloro-ciclopropilo, 1-bromo-ciclopropilo o 1-yodo-ciclopropilo, más preferentemente 1-fluoro-ciclopropilo, 1-cloro-ciclopropilo o 1-bromo-ciclopropilo,

Z₂ es -CF₂H, y

Z₃ es CH₃.

55

Aun otra realización preferida se refiere a compuestos de fórmula (I) en la que

60

R₁ es H,
 R₂ es CN o H,
 A₁ es C-H,
 R₃ es Cl,

- 5 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo, 1-cloro-ciclopropilo, 1-bromo-ciclopropilo o 1-yodo-ciclopropilo, más preferentemente 1-fluoro-ciclopropilo, 1-cloro-ciclopropilo o 1-bromo-ciclopropilo,
 Z₂ es -NO₂, y
 Z₃ es CH₃.

Aun otra realización preferida se refiere a compuestos de fórmula (I) en la que

- 10 R₁ es H,
 R₂ es CN o H,
 A₁ es N o C-H, preferentemente C-H,
 R₃ es Cl o Me, preferentemente Cl,
 15 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo, 1-cloro-ciclopropilo, 1-bromo-ciclopropilo o 1-yodo-ciclopropilo, más preferentemente 1-fluoro-ciclopropilo, 1-cloro-ciclopropilo o 1-bromo-ciclopropilo, aún más preferentemente 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es CF₃, y
 Z₃ es CH₃.

Aun otra realización preferida se refiere a compuestos de fórmula (I) en la que

- 20 R₁ es H,
 R₂ es CN o H,
 A₁ es C-H,
 R₃ es Cl,
 25 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es CF₃, y
 Z₃ es CH₃.

Aun otra realización preferida se refiere a compuestos de fórmula (I) en la que

- 30 R₁ es H,
 R₂ es CN o H,
 A₁ es C-H o N, preferentemente C-H,
 R₃ es Cl o Me, preferentemente Cl,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo, 1-cloro-ciclopropilo, 1-bromo-ciclopropilo o 1-yodo-ciclopropilo, más preferentemente 1-fluoro-ciclopropilo, 1-cloro-ciclopropilo o 1-bromo-ciclopropilo, aún más preferentemente 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 35 Z₂ es S(=O)_n-(CH₃), y
 Z₃ es CH₃.

Aun otra realización preferida se refiere a compuestos de fórmula (I) en la que

- 40 R₁ es H,
 R₂ es CN o H,
 A₁ es C-H
 R₃ es Cl o Me, preferentemente Cl,
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo,
 Z₂ es S(=O)_n-(CH₃), y
 Z₃ es CH₃.

- 45 Los compuestos de acuerdo con la invención se pueden preparar por procedimientos habituales conocidos por los expertos en la técnica.

Isómeros

- 50 Dependiendo de la naturaleza de los sustituyentes, los compuestos de la fórmula (I) pueden estar en la forma de isómeros geométricos y/u ópticamente activos o mezclas de isómeros correspondientes en diferentes composiciones. Estos estereoisómeros son, por ejemplo, enantiómeros, diastereómeros, atropisómeros o isómeros geométricos. Por consiguiente, la invención abarca estereoisómeros puros y cualquier mezcla de estos isómeros.

Procedimientos y usos

- 55 La invención también se refiere a procedimientos para controlar plagas de animales, en la que los compuestos de fórmula (I) se dejan actuar sobre plagas de animales y/o su hábitat. El control de las plagas de animales se lleva a cabo preferentemente en agricultura y silvicultura y en protección material. Preferentemente excluidos de la presente están los procedimientos para el tratamiento quirúrgico o terapéutico del cuerpo humano o animal y procedimientos de diagnóstico llevados a cabo en el cuerpo humano o animal.

La invención también se refiere al uso de los compuestos de la fórmula (I) como pesticidas, en particular agentes de

protección de cultivo.

En el contexto de la presente solicitud, el término "pesticida" en cada caso también siempre comprende el término "agente de protección de cultivo".

5 Los compuestos de la fórmula (I), que tienen buena tolerancia a las plantas, toxicidad de homotermia favorable y buena compatibilidad ambiental, son adecuados para proteger plantas y órganos de plantas contra estresores bióticos y abióticos, para aumentar los rendimientos de las cosechas, para mejorar la calidad del material cultivado y para controlar plagas de animales, especialmente insectos, arácnidos, helmintos, nematodos y moluscos, que se encuentran en la agricultura, en la horticultura, en la cría de animales, en cultivos acuáticos, en bosques, en jardines y en instalaciones de recreación, en la protección de productos almacenados y de materiales y en el sector de
10 higiene. Se pueden usar preferentemente como pesticidas. Son activos contra especies normalmente sensibles y resistentes y contra todas o algunas etapas de desarrollo. Las plagas antemencionadas incluyen:

15 plagas del filo de Arthropoda, en particular de la clase de Arachnida, por ejemplo *Acarus* spp., por ejemplo *Acarus siro*, *Aceria kuko*, *Aceria sheldoni*, *Aculops* spp., *Aculus* spp., *Aculus fockeui*, *Aculus schlechtendali*, *Amblyomma* spp., *Amphitetranychus viennensis*, *Argas* spp., *Boophilus* spp., *Brevipalpus* spp., por ejemplo *Brevipalpus phoenicis*, *Bryobia graminum*, *Bryobia praetiosa*, *Centruroides* spp., *Chorioptes* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Dermatophagoides pteronyssinus*, *Dermatophagoides farinae*, *Dermacentor* spp., *Eotetranychus* spp., por ejemplo *Eotetranychus hicoriae*, *Epitrimerus pyri*, *Eutetranychus* spp., por ejemplo *Eutetranychus banksi*, *Eriophyes* spp., por ejemplo *Eriophyes pyri*, *Glycyphagus domesticus*, *Halotydeus destructor*, *Hemitarsonemus* spp., por ejemplo *Hemitarsonemus latus* (=Polyphagotarsonemus latus), *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp.,
20 *Latrodectus* spp., *Loxosceles* spp., *Neutrombicula autumnalis*, *Nuphersa* spp., *Oligonychus* spp., por ejemplo *Oligonychus coniferarum*, *Oligonychus ilicis*, *Oligonychus indicus*, *Oligonychus mangiferus*, *Oligonychus pratensis*, *Oligonychus punicae*, *Oligonychus yothersi*, *Ornithodoros* spp., *Ornithonyssus* spp., *Panonychus* spp., por ejemplo *Panonychus citri* (=Metatetranychus citri), *Panonychus ulmi* (=Metatetranychus ulmi), *Phyllocoptura oleivora*, *Platytetranychus multidigituli*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psoroptes* spp., *Rhipicephalus* spp.,
25 *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., *Scorpio maurus*, *Steneotarsonemus* spp., *Steneotarsonemus spinki*, *Tarsonemus* spp., por ejemplo *Tarsonemus confusus*, *Tarsonemus pallidus*, *Tetranychus* spp., por ejemplo *Tetranychus canadensis*, *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus turkestanii*, *Tetranychus urticae*, *Trombicula alfreddugesi*, *Vaejovis* spp., *Vasates lycopersici*;

de la clase de Chilopoda, por ejemplo *Geophilus* spp., *Scutigera* spp.;

30 del orden o la clase de Collembola, por ejemplo *Onychiurus armatus*; *Sminthurus viridis*;

de la clase de Diplopoda, por ejemplo *Blaniulus guttulatus*;

de la clase de Insecta, por ejemplo del orden de Blattodea, por ejemplo *Blatta orientalis*, *Blattella asahinai*, *Blattella germanica*, *Leucophaea maderae*, *Panchlora* spp., *Parcoblatta* spp., *Periplaneta* spp., por ejemplo *Periplaneta americana*, *Periplaneta australasiae*, *Supella longipalpa*;

35 del orden de Coleoptera, por ejemplo *Acalymma vittatum*, *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus* spp., *Agelastica alni*, *Agriotes* spp., por ejemplo *Agriotes linneatus*, *Agriotes mancus*, *Alphitobius diaperinus*, *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora* spp., *Anthonomus* spp., por ejemplo *Anthonomus grandis*, *Anthrenus* spp., *Apion* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp., por ejemplo *Atomaria linearis*, *Attagenus* spp., *Baris caerulescens*, *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., por ejemplo *Bruchus pisorum*, *Bruchus rufimanus*, *Cassida* spp., *Ceratomyza trifurcata*, *Ceutorrhynchus* spp., por ejemplo *Ceutorrhynchus assimilis*, *Ceutorrhynchus quadridens*, *Ceutorrhynchus rapae*, *Chaetocnema* spp., por ejemplo *Chaetocnema confinis*, *Chaetocnema denticulata*, *Chaetocnema ectypa*, *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp., por ejemplo *Cosmopolites sordidus*, *Costelytra zealandica*, *Ctenicera* spp., *Curculio* spp., por ejemplo *Curculio caryae*, *Curculio caryatipes*, *Curculio obtusus*, *Curculio sayi*, *Cryptolestes ferrugineus*, *Cryptolestes pusillus*,
40 *Cryptorhynchus lapathi*, *Cryptorhynchus mangiferae*, *Cylindrocopturus* spp., *Cylindrocopturus adpersus*, *Cylindrocopturus furnissi*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., por ejemplo *Diabrotica balteata*, *Diabrotica barberi*, *Diabrotica undecimpunctata howardi*, *Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata*, *Diabrotica virgifera virgifera*, *Diabrotica virgifera zea*, *Dichocrocis* spp., *Diadisa armigera*, *Diloboderus* spp., *Epilachna* spp., por ejemplo *Epilachna borealis*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix* spp., por ejemplo *Epitrix cucumeris*, *Epitrix fuscata*, *Epitrix hirtipennis*, *Epitrix subcrinita*, *Epitrix tuberis*, *Faustinus* spp., *Gibbium psylloides*, *Gnathocerus cornutus*, *Hellula undalis*, *Heteronychus arator*, *Heteronyx* spp., *Hylamorpha elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypomeces squamosus*, *Hypothenemus* spp., por ejemplo *Hypothenemus hampei*, *Hypothenemus obscurus*, *Hypothenemus pubescens*, *Lachnosterna consanguinea*, *Lasioderma serricornis*, *Latheticus oryzae*, *Lathridius* spp., *Lema* spp., *Leptinotarsa decemlineata*, *Leucoptera* spp., por ejemplo *Leucoptera coffeella*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lixus* spp., *Luperomorpha xanthodera*, *Luperodes* spp., *Lyctus* spp., *Megascelis* spp., *Melanotus* spp., por ejemplo *Melanotus longulus oregonensis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha* spp., por ejemplo *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp., *Naupactus xanthographus*, *Necrobia* spp., *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Oryzaphagus oryzae*, *Otiorynchus* spp., por ejemplo *Otiorynchus cribricollis*, *Otiorynchus ligustici*, *Otiorynchus ovatus*, *Otiorynchus rugosostriarius*, *Otiorynchus*

- 5 sulcatus, Oxycetonia jucunda, Phaedon cochleariae, Phyllophaga spp., Phyllophaga helleri, Phyllotreta spp., por ejemplo Phyllotreta armoraciae, Phyllotreta pusilla, Phyllotreta ramosa, Phyllotreta striolata, Popillia japonica, Premnotypes spp., Prostephanus truncatus, Psylliodes spp., por ejemplo Psylliodes affinis, Psylliodes chrysocephala, Psylliodes punctulata, Ptinus spp., Rhizobius ventralis, Rhizopertha dominica, Sitophilus spp., por ejemplo Sitophilus granarius, Sitophilus linearis, Sitophilus oryzae, Sitophilus zeamais, Sphenophorus spp., Stegobium paniceum, Sternechus spp., por ejemplo Sternechus paludatus, Symphyletes spp., Tanymericus spp., por ejemplo Tanymericus dilaticollis, Tanymericus indicus, Tanymericus palliatus, Tenebrio molitor, Tenebrioides mauretanicus, Tribolium spp., por ejemplo Tribolium audax, Tribolium castaneum, Tribolium confusum, Trogoderma spp., Tychius spp., Xylotrechus spp., Zabrus spp., por ejemplo Zabrus tenebrioides;
- 10 del orden de Diptera, por ejemplo Aedes spp., por ejemplo Aedes aegypti, Aedes albopictus, Aedes sticticus, Aedes vexans, Agromyza spp., por ejemplo Agromyza frontella, Agromyza parvicornis, Anastrepha spp., Anopheles spp., por ejemplo Anopheles quadrimaculatus, Anopheles gambiae, Asphondylia spp., Bactrocera spp., por ejemplo Bactrocera cucurbitae, Bactrocera dorsalis, Bactrocera oleae, Bibio hortulanus, Calliphora erythrocephala, Calliphora vicina, Ceratitis capitata, Chironomus spp., Chrysomya spp., Chrysops spp., Chrysozona pluvialis, Cochliomya spp., Contarinia spp., por ejemplo Contarinia johnsoni, Contarinia nasturtii, Contarinia pyrivora, Contarinia schulzi, Contarinia sorghicola, Contarinia tritici, Cordylobia anthropophaga, Cricotopus sylvestris, Culex spp., por ejemplo Culex pipiens, Culex quinquefasciatus, Culicoides spp., Culiseta spp., Cuterebra spp., Dacus oleae, Dasineura spp., por ejemplo Dasineura brassicae, Delia spp., por ejemplo Delia antiqua, Delia coarctata, Delia florilega, Delia platura, Delia radicum, Dermatobia hominis, Drosophila spp., por ejemplo Drosophila melanogaster, Drosophila suzukii, Echinocnemus spp., Fannia spp., Gasterophilus spp., Glossina spp., Haematopota spp., Hydrellia spp., Hydrellia griseola, Hylemya spp., Hippobosca spp., Hypoderma spp., Liriomyza spp., por ejemplo Liriomyza brassicae, Liriomyza huidobrensis, Liriomyza sativae, Lucilia spp., por ejemplo Lucilia cuprina, Lutzomyia spp., Mansonia spp., Musca spp., por ejemplo Musca domestica, Musca domestica vicina, Oestrus spp., Oscinella frit, Paratanytarsus spp., Paralauterborniella subcincta, Pegomya spp., por ejemplo Pegomya betae, Pegomya hyoscyami, Pegomya rubivora, Phlebotomus spp., Phorbia spp., Phormia spp., Piophilina casei, Prodiplosis spp., Psila rosae, Rhagoletis spp., por ejemplo Rhagoletis cingulata, Rhagoletis completa, Rhagoletis fausta, Rhagoletis indifferens, Rhagoletis mendax, Rhagoletis pomonella, Sarcophaga spp., Simulium spp., por ejemplo Simulium meridionale, Stomoxys spp., Tabanus spp., Tetanops spp., Tipula spp., por ejemplo Tipula paludosa, Tipula simplex;
- 20 del orden de Hemiptera, por ejemplo Acizzia acaciaebaileyanae, Acizzia dodonaeae, Acizzia uncatoides, Acrida turrita, Acyrthosipon spp., por ejemplo Acyrthosipon pisum, Acrogonia spp., Aeneolamia spp., Agonoscena spp., Aleyrodes prolella, Aleurolobus barodensis, Aleurothrix floccosus, Allocaridara malayensis, Amrasca spp., por ejemplo Amrasca bigutulla, Amrasca devastans, Anuraphis cardui, Aonidiella spp., por ejemplo Aonidiella aurantii, Aonidiella citrina, Aonidiella inornata, Aphanostigma piri, Aphis spp., por ejemplo Aphis citricola, Aphis craccivora, Aphis fabae, Aphis forbesi, Aphis glycines, Aphis gossypii, Aphis hederiae, Aphis illinoisensis, Aphis middletoni, Aphis nasturtii, Aphis nerii, Aphis pomi, Aphis spiraeicola, Aphis viburniphila, Arboridia apicalis, Arytainilla spp., Aspidiella spp., Aspidiotus spp., por ejemplo Aspidiotus nerii, Atanus spp., Aulacorthum solani, Bemisia tabaci, Blastopsylla occidentalis, Boreioglycaspis melaleucaae, Brachycaudus helichrysi, Brachycolus spp., Brevicoryne brassicae, Cacopsylla spp., por ejemplo Cacopsylla pyricola, Calligypona marginata, Carnecephala fulgida, Ceratovacuna lanigera, Cercopidae, Ceroplastes spp., Chaetosiphon fragaefolii, Chionaspis tegalensis, Chlorita onukii, Chondracris rosea, Chromaphis juglandicola, Chrysomphalus ficus, Cicadulina mbila, Cocomytilus halli, Coccus spp., por ejemplo Coccus hesperidum, Coccus longulus, Coccus pseudomagnoliarum, Coccus viridis, Cryptomyzus ribis, Cryptoneossa spp., Ctenarytaina spp., Dalbulus spp., Dialeurodes citri, Diaphorina citri, Diaspis spp., Drosicha spp., Dysaphis spp., por ejemplo Dysaphis apiifolia, Dysaphis plantaginea, Dysaphis tulipae, Dymicoccus spp., Empoasca spp., por ejemplo Empoasca abrupta, Empoasca fabae, Empoasca maligna, Empoasca solana, Empoasca stevensi, Eriosoma spp., por ejemplo Eriosoma americanum, Eriosoma lanigerum, Eriosoma pyricola, Erythroneura spp., Eucalyptolyma spp., Euphyllura spp., Euscelis bilobatus, Ferrisia spp., Geococcus coffeae, Glycaspis spp., Heteropsylla cubana, Heteropsylla spinulosa, Homalodisca coagulata, Hyalopterus arundinis, Hyalopterus pruni, Icerya spp., por ejemplo Icerya purchasi, Idiocerus spp., Idioscopus spp., Laodelphax striatellus, Lecanium spp., por ejemplo Lecanium corni (=Parthenolecanium corni), Lepidosaphes spp., por ejemplo Lepidosaphes ulmi, Lipaphis erysimi, Lycorma delicatula, Macrosiphum spp., por ejemplo Macrosiphum euphorbiae, Macrosiphum lillii, Macrosiphum rosae, Macrosteles facifrons, Mahanarva spp., Melanaphis sacchari, Metcalfiella spp., Metcalfa pruinosa, Metopolophium dirhodum, Monellia costalis, Monelliopsis pecanis, Myzus spp., por ejemplo Myzus ascalonicus, Myzus cerasi, Myzus ligustri, Myzus ornatus, Myzus persicae, Myzus nicotianae, Nasonovia ribisnigri, Nephrotettix spp., por ejemplo Nephrotettix cincticeps, Nephrotettix nigropictus, Nilaparvata lugens, Oncometopia spp., Orthezia praelonga, Oxya chinensis, Pachypsylla spp., Parabemisia myricae, Paratrioza spp., por ejemplo Paratrioza cockerelli, Parlatoria spp., Pemphigus spp., por ejemplo Pemphigus bursarius, Pemphigus populivenae, Peregrinus maidis, Phenacoccus spp., por ejemplo Phenacoccus madeirensis, Phloeomyzus passerinii, Phorodon humuli, Phylloxera spp., por ejemplo Phylloxera devastatrix, Phylloxera notabilis, Pinnaspis aspidistrae, Planococcus spp., por ejemplo Planococcus citri, Prosopidopsylla flava, Protospulvinaria pyriformis, Pseudaulacaspis pentagona, Pseudococcus spp., por ejemplo Pseudococcus calceolariae, Pseudococcus comstocki, Pseudococcus longispinus, Pseudococcus maritimus, Pseudococcus viburni, Psyllopsis spp., Psylla spp., por ejemplo Psylla buxi, Psylla mali, Psylla pyri, Pteromalus spp., Pyrilla spp., Quadraspidotus spp., por

- ejemplo *Quadraspidotus juglansregiae*, *Quadraspidotus ostreaeformis*, *Quadraspidotus perniciosus*, *Quesada gigas*, *Rastrococcus* spp., *Rhopalosiphum* spp., por ejemplo *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum oxyacanthae*, *Rhopalosiphum padi*, *Rhopalosiphum rufiabdominale*, *Saissetia* spp., por ejemplo *Saissetia coffeae*, *Saissetia miranda*, *Saissetia neglecta*, *Saissetia oleae*, *Scaphoideus titanus*, *Schizaphis graminum*,
5 *Selenaspidus articulatus*, *Sitobion avenae*, *Sogata* spp., *Sogatella furcifera*, *Sogatodes* spp., *Stictocephala festina*, *Siphoninus phillyreae*, *Tenalaphara malayensis*, *Tetragonocephala* spp., *Tinocallis caryaefoliae*, *Tomaspis* spp., *Toxoptera* spp., por ejemplo *Toxoptera aurantii*, *Toxoptera citricidus*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Trioza* spp., por ejemplo *Trioza diospyri*, *Typhlocyba* spp., *Unaspis* spp., *Viteus vitifolii*, *Zygina* spp.;
- del suborden de Heteroptera, por ejemplo *Anasa tristis*, *Antestiopsis* spp., *Boisea* spp., *Blissus* spp., *Calocoris* spp., *Campylomma livida*, *Cavelerius* spp., *Cimex* spp., por ejemplo *Cimex adjunctus*, *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Cimex pilosellus*, *Collaria* spp., *Creontiades dilutus*, *Dasynus piperis*, *Dichelops furcatus*, *Diconocoris hewetti*, *Dysdercus* spp., *Euschistus* spp., por ejemplo *Euschistus heros*, *Euschistus servus*, *Euschistus tristigma*, *Euschistus variolarius*, *Eurygaster* spp., *Halyomorpha halys*, *Heliopeltis* spp., *Horcias nobilellus*,
10 *Leptocoris* spp., *Leptocoris varicornis*, *Leptoglossus occidentalis*, *Leptoglossus phyllopus*, *Lygocoris* spp., por ejemplo *Lygocoris pabulinus*, *Lygus* spp., por ejemplo *Lygus elisus*, *Lygus hesperus*, *Lygus lineolaris*, *Macropes excavatus*, *Monalonion atratum*, *Nezara* spp., por ejemplo *Nezara viridula*, *Oebalus* spp., *Piesma quadrata*, *Piezodorus* spp., por ejemplo *Piezodorus guildinii*, *Psallus* spp., *Pseudacysta perseae*, *Rhodnius* spp., *Sahlbergella singularis*, *Scaptocoris castanea*, *Scotinophora* spp., *Stephanitis nashi*, *Tibraca* spp., *Triatoma* spp.;
- del orden de Hymenoptera, por ejemplo *Acromyrmex* spp., *Athalia* spp., por ejemplo *Athalia rosae*, *Atta* spp.,
20 *Diprion* spp., por ejemplo *Diprion similis*, *Hoplocampa* spp., por ejemplo *Hoplocampa cookei*, *Hoplocampa testudinea*, *Lasius* spp., *Linepithema humile*, *Monomorium pharaonis*, *Sirex* spp., *Solenopsis invicta*, *Tapinoma* spp., *Urocera* spp., *Vespa* spp., por ejemplo *Vespa crabro*, *Xeris* spp.;
- del orden de Isopoda, por ejemplo *Armadillidium vulgare*, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*;
- del orden de Isoptera, por ejemplo *Coptotermes* spp., por ejemplo *Coptotermes formosanus*, *Cornitermes cumulans*, *Cryptotermes* spp., *Incisitermes* spp., *Microtermes obesi*, *Odontotermes* spp., *Reticulitermes* spp., por
25 ejemplo *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes hesperus*;
- del orden de Lepidoptera, por ejemplo *Achroia grisella*, *Acronicta major*, *Adoxophyes* spp., por ejemplo *Adoxophyes orana*, *Aedia leucomelas*, *Agrotis* spp., por ejemplo *Agrotis segetum*, *Agrotis ipsilon*, *Alabama* spp.,
30 por ejemplo *Alabama argillacea*, *Amyelois transitella*, *Anarsia* spp., *Anticarsia* spp., por ejemplo *Anticarsia gemmatalis*, *Argyroploce* spp., *Barathra brassicae*, *Borbo cinnara*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Busseola* spp., *Cacoecia* spp., *Caloptilia theivora*, *Capua reticulana*, *Carpocapsa pomonella*, *Carposina niponensis*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo* spp., por ejemplo *Chilo plejadellus*, *Chilo suppressalis*, *Choristoneura* spp., *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocerus* spp., *Cnaphalocrocis medinalis*, *Cnephasia* spp., *Conopomorpha* spp., *Conotrachelus* spp., *Copitarsia* spp., *Cydia* spp., por ejemplo *Cydia nigricana*, *Cydia pomonella*, *Dalaca*
35 *noctuides*, *Diaphania* spp., *Diatraea saccharalis*, *Earias* spp., *Ecdytolopha aurantium*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Eldana saccharina*, *Ephestia* spp., por ejemplo *Ephestia elutella*, *Ephestia kuehniella*, *Epinotia* spp., *Epiphyas postvittana*, *Etiella* spp., *Eulia* spp., *Eupoecilia ambiguella*, *Euproctis* spp., por ejemplo *Euproctis chrysorrhoea*, *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Galleria mellonella*, *Gracillaria* spp., *Grapholitha* spp., por ejemplo *Grapholitha molesta*, *Grapholitha prunivora*, *Hedylepta* spp., *Helicoverpa* spp., por ejemplo *Helicoverpa armigera*, *Helicoverpa zea*,
40 *Heliopsis* spp., por ejemplo *Heliopsis virescens* *Hofmannophila pseudospretella*, *Homoeosoma* spp., *Homona* spp., *Hyponomeuta padella*, *Kakivoria flavofasciata*, *Laphygma* spp., *Leucinodes orbonalis*, *Leucoptera* spp., por ejemplo *Leucoptera coffeella*, *Lithocolletis* spp., por ejemplo *Lithocolletis blancardella*, *Lithophane antennata*, *Lobesia* spp., por ejemplo *Lobesia botrana*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria* spp., por ejemplo *Lymantria dispar*, *Lyonetia* spp., por ejemplo *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*, *Maruca testulalis*, *Mamestra brassicae*,
45 *Melanitis leda*, *Mocis* spp., *Monopis obviella*, *Mythimna separata*, *Nemapogon cloacellus*, *Nymphula* spp., *Oiketicus* spp., *Oria* spp., *Orthaga* spp., *Ostrinia* spp., por ejemplo *Ostrinia nubilalis*, *Oulema melanopus*, *Oulema oryzae*, *Panolis flammea*, *Parnara* spp., *Pectinophora* spp., por ejemplo *Pectinophora gossypiella*, *Perileucoptera* spp., *Phthorimaea* spp., por ejemplo *Phthorimaea operculella*, *Phyllocnistis citrella*, *Phyllonorycter* spp., por ejemplo *Phyllonorycter blancardella*, *Phyllonorycter crataegella*, *Pieris* spp., por ejemplo *Pieris rapae*, *Platynota stultana*, *Plodia interpunctella*, *Plusia* spp., *Plutella xylostella* (= *Plutella maculipennis*), *Prays* spp., *Prodenia* spp.,
50 *Protoparce* spp., *Pseudaletia* spp., por ejemplo *Pseudaletia unipuncta*, *Pseudoplusia includens*, *Pyrausta nubilalis*, *Rachiplusia nu*, *Schoenobius* spp., por ejemplo *Schoenobius bipunctifer*, *Scirpophaga* spp., por ejemplo *Scirpophaga innotata*, *Scotia segetum*, *Sesamia* spp., por ejemplo *Sesamia inferens*, *Sparganothis* spp., *Spodoptera* spp., por ejemplo *Spodoptera eradiana*, *Spodoptera exigua*, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera praefica*, *Stathmopoda* spp., *Stomopteryx subsecivella*, *Synanthedon* spp., *Tecia solanivora*, *Thermesia gemmatalis*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*, *Tortrix* spp., *Trichophaga tapetzella*, *Trichoplusia* spp., por ejemplo *Trichoplusia ni*, *Tryporyza incertulas*, *Tuta absoluta*, *Virachola* spp.;
- del orden de Orthoptera o Saltatoria, por ejemplo *Acheta domesticus*, *Dichroplis* spp., *Gryllotalpa* spp., por
60 ejemplo *Gryllotalpa gryllotalpa*, *Hieroglyphus* spp., *Locusta* spp., por ejemplo *Locusta migratoria*, *Melanoplus* spp., por ejemplo *Melanoplus devastator*, *Paratlanticus ussuriensis*, *Schistocerca gregaria*;

del orden de Phthiraptera, por ejemplo *Damalinea* spp., *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phylloxera vastatrix*, *Phthirus pubis*, *Trichodectes* spp.;

del orden de Psocoptera, por ejemplo *Lepinotus* spp., *Liposcelis* spp.;

5 del orden de Siphonaptera, por ejemplo, *Ceratophyllus* spp., *Ctenocephalides* spp., por ejemplo *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopis*;

10 del orden de Thysanoptera, por ejemplo *Anaphothrips obscurus*, *Baliothrips biformis*, *Drepanothrips reuteri*, *Enneothrips flavens*, *Frankliniella* spp., por ejemplo *Frankliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella schultzei*, *Frankliniella tritici*, *Frankliniella vaccinii*, *Frankliniella williamsi*, *Heliothrips* spp., *Hercinothrips femoralis*, *Rhipiphorothrips cruentatus*, *Scirtothrips* spp., *Taeniothrips cardamomi*, *Thrips* spp., por ejemplo *Thrips palmi*, *Thrips tabaci*;

del orden de Zygentoma (= Thysanura), por ejemplo *Ctenolepisma* spp., *Lepisma saccharina*, *Lepismodes inquilinus*, *Thermobia domestica*;

de la clase de Symphyla, por ejemplo *Scutigereilla* spp., por ejemplo *Scutigereilla immaculata*;

plagas del filo de Mollusca, por ejemplo de la clase de Bivalvia, por ejemplo *Dreissena* spp.,

15 y también de la clase de Gastropoda, por ejemplo *Arion* spp., por ejemplo *Arion ater rufus*, *Biomphalaria* spp., *Bulinus* spp., *Deroceras* spp., por ejemplo *Deroceras laeve*, *Galba* spp., *Lymnaea* spp., *Oncomelania* spp., *Pomacea* spp., *Succinea* spp.;

20 parásitos animales y humano del filo Platyminthes y Nematoda, por ejemplo *Aelurostrongylus* spp., *Amidostomum* spp., *Ancylostoma* spp., *Angiostrongylus* spp., *Anisakis* spp., *Anoplocephala* spp., *Ascaris* spp., *Ascaridia* spp., *Baylisascaris* spp., *Brugia* spp., *Bunostomum* spp., *Capillaria* spp., *Chabertia* spp., *Clonorchis* spp., *Cooperia* spp., *Crenosoma* spp., *Cyathostoma* spp., *Dicrocoelium* spp., *Dictyocaulus* spp., *Diphyllbothrium* spp., *Dipylidium* spp., *Dirofilaria* spp., *Dracunculus* spp., *Echinococcus* spp., *Echinostoma* spp., *Enterobius* spp., *Eucoleus* spp., *Fasciola* spp., *Fascioloides* spp., *Fasciolopsis* spp., *Filaroides* spp., *Gongylonema* spp., *Gyrodactylus* spp., *Habronema* spp., *Haemonchus* spp., *Heligmosomoides* spp., *Heterakis* spp., *Hymenolepis* spp., *Hyostrongylus* spp., *Litomosoides* spp., *Loa* spp., *Metastrongylus* spp., *Metorchis* spp., *Mesocestoides* spp., *Moniezia* spp., *Muellerius* spp., *Necator* spp., *Nematodirus* spp., *Nippostrongylus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Ollulanus* spp., *Onchocerca* spp., *Opisthorchis* spp., *Oslerus* spp., *Ostertagia* spp., *Oxyuris* spp., *Paracapillaria* spp., *Parafilaria* spp., *Paragonimus* spp., *Paramphistomum* spp., *Paranoplocephala* spp., *Parascaris* spp., *Passalurus* spp., *Protostrongylus* spp., *Schistosoma* spp., *Setaria* spp., *Spirocerca* spp., *Stephanofilaria* spp., *Stephanurus* spp., *Strongyloides* spp., *Strongylus* spp., *Syngamus* spp., *Taenia* spp., *Teladorsagia* spp., *Thelazia* spp., *Toxascaris* spp., *Toxocara* spp., *Trichinella* spp., *Trichobilharzia* spp., *Trichostrongylus* spp., *Trichuris* spp., *Uncinaria* spp., *Wuchereria* spp.;

35 plagas de plantas del filo de Nematoda, es decir nematodos fitoparasíticos, en particular *Aglenchus* spp., por ejemplo *Aglenchus agricola*, *Anguina* spp., por ejemplo *Anguina tritici*, *Aphelenchoides* spp., por ejemplo *Aphelenchoides arachidis*, *Aphelenchoides fragariae*, *Belonolaimus* spp., por ejemplo *Belonolaimus gracilis*, *Belonolaimus longicaudatus*, *Belonolaimus nortoni*, *Bursaphelenchus* spp., por ejemplo *Bursaphelenchus cocophilus*, *Bursaphelenchus eremus*, *Bursaphelenchus xylophilus*, *Cacopaurus* spp., por ejemplo *Cacopaurus pestis*, *Criconemella* spp., por ejemplo *Criconemella curvata*, *Criconemella onoensis*, *Criconemella ornata*, *Criconemella rusium*, *Criconemella xenoplax* (= *Mesocriconema xenoplax*), *Criconemoides* spp., por ejemplo *Criconemoides ferniae*, *Criconemoides onoense*, *Criconemoides ornatum*, *Ditylenchus* spp., por ejemplo *Ditylenchus dipsaci*, *Dolichodorus* spp., *Globodera* spp., por ejemplo *Globodera pallida*, *Globodera rostochiensis*, *Helicotylenchus* spp., por ejemplo *Helicotylenchus dihystra*, *Hemicriconemoides* spp., *Hemicycliophora* spp., *Heterodera* spp., por ejemplo *Heterodera avenae*, *Heterodera glycines*, *Heterodera schachtii*, *Hoplolaimus* spp., *Longidorus* spp., por ejemplo *Longidorus africanus*, *Meloidogyne* spp., por ejemplo *Meloidogyne chitwoodi*, *Meloidogyne fallax*, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloinema* spp., *Nacobbus* spp., *Neotylenchus* spp., *Paraphelenchus* spp., *Paratrichodorus* spp., por ejemplo *Paratrichodorus minor*, *Pratylenchus* spp., por ejemplo *Pratylenchus penetrans*, *Pseudohalenchus* spp., *Psilenchus* spp., *Punctodera* spp., *Quinisolius* spp., *Radopholus* spp., por ejemplo *Radopholus citrophilus*, *Radopholus similis*, *Rotylenchulus* spp., *Rotylenchus* spp., *Scutellonema* spp., *Subanguina* spp., *Trichodorus* spp., por ejemplo *Trichodorus obtusus*, *Trichodorus primitivus*, *Tylenchorhynchus* spp., por ejemplo *Tylenchorhynchus annulatus*, *Tylenchulus* spp., por ejemplo *Tylenchulus semipenetrans*, *Xiphinema* spp., por ejemplo *Xiphinema index*.

Además, es posible controlar, del subreino de Protozoarios, el orden de Coccidia, por ejemplo *Eimeria* spp.

Los compuestos de la fórmula (I) opcionalmente pueden, en determinadas concentraciones o velocidades de aplicación, usarse también como herbicidas, protectores, reguladores de crecimiento o agentes para mejorar las propiedades de plantas, como microbicidas o gametocidas, por ejemplo como fungicidas, antimicóticos, bactericidas, viricidas (incluyendo contra viroides) o como agentes contra MLO (organismos tipo micoplasma) y RLO (organismos tipo rickettsia). Si corresponde, también se pueden usar como intermedios o precursores para la síntesis de otros

compuestos activos.

Formulaciones

5 La presente invención se refiere además a formulaciones y formas de uso preparadas a partir de estas como pesticidas, por ejemplo licores de empapado, goteo y pulverización, que comprenden al menos un compuesto de la fórmula (I). En algunos casos, las formas de uso comprenden además pesticidas y/o adyuvantes que mejoran la acción, tales como penetrantes, por ejemplo, aceites vegetales, por ejemplo, aceite de colza, aceite de girasol, aceites minerales, por ejemplo, aceite de parafina, alquil ésteres de ácidos grasos vegetales, por ejemplo metil éster de aceite de colza o metil éster de aceite de soja, o alcanol alcoxilatos y/o esparcidores, por ejemplo, alquilsiloxanos y/o sales, por ejemplo, sales de amonio o fosfonio orgánicas o inorgánicas, por ejemplo, sulfato de amonio o hidrogenofosfato de diamonio y/o promotores de retención, por ejemplo dioctil sulfosuccinato o polímeros de hidroxipropil guar y/o humectantes, por ejemplo, glicerol y/o fertilizantes, por ejemplo, fertilizantes que contienen amonio, potasio o fósforo.

15 Las formulaciones habituales son, por ejemplo, líquidos solubles en agua (SL), concentrados de emulsión (EC), emulsiones en agua (EW), concentrados de suspensión (SC, SE, FS, OD), gránulos dispersables en agua (WG), gránulos (GR) y concentrados de cápsulas (CS); estos y otros tipos posibles de formulaciones se describen, por ejemplo, en Crop Life International and in Pesticide Specifications, Manual del desarrollo y uso de especificaciones de FAO y WHO para pesticidas, FAO Plant Production and Protection Papers – 173, preparados por FAO/WHO Joint Meeting on Pesticide Specifications, 2004, ISBN: 9251048576. Las formulaciones, además de uno o más compuestos de la fórmula (I), comprenden opcionalmente otros compuestos activos agroquímicamente.

20 Estas son preferentemente formulaciones o formas de uso que comprenden auxiliares, por ejemplo, extensores, solventes, promotores de espontaneidad, portadores, emulsionantes, dispersantes, protectores contra escarcha, biocidas, espesantes y/u otros auxiliares, por ejemplo adyuvantes. Un adyuvante en este contexto es un componente que mejora el efecto biológico de la formulación, sin que el componente en sí mismo tenga efecto biológico alguno. Ejemplos de adyuvantes son agentes que promueven la retención, propagación, unión a la superficie de hoja o penetración.

Estas formulaciones se preparan de una forma conocida, por ejemplo, mezclando los compuestos de la fórmula (I) con auxiliares tales como, por ejemplo, extensores, solventes y/o portadores sólidos y/u otros auxiliares tales como, por ejemplo, surfactantes. Las formulaciones se preparan en instalaciones adecuadas o antes o durante la aplicación.

30 Los auxiliares usados pueden ser sustancias adecuadas para impartir propiedades especiales, tales como determinadas propiedades físicas, técnicas y/o biológicas, a la formulación de los compuestos de fórmula (I), o para usar formas preparadas a partir de estas formulaciones (por ejemplo, pesticidas prontos para usar tales como licores en spray o productos de recubrimiento de semillas).

35 Los extensores adecuados son, por ejemplo, líquidos químicos orgánicos polares y no polares, por ejemplo de las clases de hidrocarburos aromáticos y no aromáticos (tales como parafinas, alquilbencenos, alquilnaftalenos, clorobencenos), los alcoholes y polioles (que, si corresponde, también se pueden sustituir, eterificar y/o esterificar), las cetonas (tales como acetona, ciclohexanona), ésteres (incluyendo grasas y aceites) y poli(éteres), las aminas, amidas, lactamas (tales como N-alquilpirrolidonas) y lactonas insustituídas y sustituidas, las sulfonas y sulfóxidos (tales como dimetil sulfóxido).

40 Si el extensor usado es agua, también es posible utilizar, por ejemplo, solventes orgánicos como solventes auxiliares. Esencialmente, los solventes líquidos adecuados son: aromáticos, tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, hidrocarburos aromáticos clorados o alifáticos clorados, tales como clorobencenos, cloroetilenos o metileno cloruro, hidrocarburos alifáticos tales como ciclohexano o parafinas, por ejemplo, fracciones de aceite mineral, aceites minerales y vegetales, alcoholes tales como butanol o glicol y sus éteres y ésteres, cetonas tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona o ciclohexanona, solventes fuertemente polares tales como dimetilformamida y dimetil sulfóxido y también agua.

45 En principio, es posible usar todos los solventes adecuados. Ejemplos de solventes adecuados son hidrocarburos aromáticos, tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, hidrocarburos aromáticos clorados o alifáticos clorados, tales como clorobenceno, cloroetileno o metileno cloruro, hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano, parafinas, fracciones de petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoholes, tales como metanol, etanol, isopropanol, butanol o glicol y sus éteres y ésteres, cetonas tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona o ciclohexanona, solventes fuertemente polares tales como dimetil sulfóxido y también agua.

55 En principio, es posible usar todos los portadores adecuados. Los portadores útiles incluyen especialmente: por ejemplo sales de amonio y minerales naturales molidos tales como caolinas, arcillas, talco, tiza, cuarzo, atapulgita, montmorillonita o tierra diatomea, y materiales sintéticos molidos tales como sílice finamente dividida, alúmina y silicatos naturales o sintéticos, resinas, ceras y/o fertilizantes sólidos. Igualmente pueden utilizarse mezclas de tales portadores. Portadores útiles para gránulos incluyen: por ejemplo, rocas naturales molidas y fraccionadas tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita y gránulos sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas y también

gránulos de material orgánico tal como aserrín, papel, cáscaras de coco, mazorca de maíz y tallos de tabaco.

También se pueden usar extensores o solventes gaseosos licuados. Los extensores y portadores particularmente adecuados son los que son gaseosos a temperatura ambiente y a presión atmosférica, por ejemplo, gases propulsores en aerosol, tales como halohidrocarburos y también butano, propano, nitrógeno y dióxido de carbono.

5 Ejemplos de emulsionantes y/o formadores de espuma, dispersantes o agentes humectantes con propiedades iónicas o no iónicas, o mezclas de estos surfactantes, son sales de ácido poliacrílico, sales de ácido lignosulfónico, sales de ácido fenolsulfónico o ácido naftalenosulfónico, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o con ácidos grasos o con aminas grasas, con fenoles sustituidos (preferentemente alquilfenoles o arilfenoles), sales de ésteres sulfosuccínicos, derivados de taurina (preferentemente alquil tauratos), ésteres fosfóricos de alcoholes polietoxilados o fenoles, ésteres grasos de polioles y derivados de los compuestos que contienen sulfatos, sulfonatos y fosfatos, por ejemplo, alquilaril poliglicol éteres, alquilsulfonatos, alquil sulfatos, arilsulfonatos, hidrolisados de proteína, licores de residuos de lignosulfito y metilcelulosa. La presencia de un surfactante es ventajosa si uno de los compuestos de fórmula (I) y/o uno de los portadores inertes es insoluble en agua y cuando la aplicación tiene lugar en agua.

15 Es posible usar colorantes tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio y azul de Prusia y tintes orgánicos tales como tintes de alizarin, tintes de azo y tintes de ftalocianina metálica, y nutrientes y nutrientes de traza tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y zinc como auxiliares adicionales en las formulaciones y las formas de uso derivadas de estos.

20 Componentes adicionales pueden ser estabilizadores, tales como estabilizadores a baja temperatura, conservantes, antioxidantes, estabilizadores de luz u otros agentes que mejoran la estabilidad química y/o física. Los formadores de espuma o antiespumantes también pueden estar presentes.

25 Los adhesivos tales como carboximetilcelulosa y polímeros naturales y sintéticos en la forma de polvos, gránulos o redes, tales como goma arábiga, polivinil alcohol y polivinil acetato, o fosfolípidos naturales tales como cefalinas y lecitinas y fosfolípidos sintéticos también pueden estar presentes como auxiliares adicionales en las formulaciones y las formas de uso que derivan de estos. Otros auxiliares posibles son aceites minerales y vegetales.

30 Opcionalmente, otros auxiliares pueden estar presentes en las formulaciones y las formas de uso que derivan de estos. Ejemplos de tales aditivos incluyen fragancias, coloides protectores, aglutinantes, adhesivos, espesantes, agentes tixotrópicos, penetrantes, promotores de retención, estabilizadores, secuestrantes, agentes formadores de complejo, humectantes, esparcidores. En general, los compuestos de la fórmula (I) se pueden combinar con cualquier aditivo sólido o líquido usado comúnmente a efectos de formulación.

Los promotores de retención útiles incluyen todas esas sustancias que reducen la tensión de superficie dinámica, por ejemplo dioctil sulfosuccinato o aumentar la viscoelasticidad, por ejemplo polímeros de horoxipropilguar.

35 Los penetrantes adecuados en el presente contexto son todas esas sustancias que se usan comúnmente para mejorar la penetración de compuestos activos como agroquímicos en plantas. Los penetrantes se definen en este contexto por su capacidad de penetrar del licor de aplicación (generalmente acuoso) y/o del recubrimiento de pulverizador en la cutícula de la planta y así aumentar la movilidad de los compuestos activos en la cutícula. El procedimiento descrito en la literatura (Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152) se puede usar para determinar esta propiedad. Ejemplos incluyen alcoxilatos de alcohol tales como etoxilato graso de coco (10) o etoxilato de isotridecilo (12), ésteres de ácido graso, por ejemplo, metil éster de aceite de colza o metil éster de aceite de soja, alcoxilados de amina grasa, por ejemplo, etoxilato de amina de sebo (15) o sales de amonio y/o fosfonio, por ejemplo sulfato de amonio o hidrogenofosfato de diamonio.

Las formulaciones preferentemente comprenden entre 0,0000001 y 98 % en peso del compuesto de fórmula (I) o, con particular preferencia, entre 0,01 % y 95 % en peso del compuesto de fórmula (I), más preferentemente entre 0,5 % y 90 % en peso del compuesto de la fórmula (I), en función del peso de la formulación.

45 El contenido del compuesto de fórmula (I) en las formas de uso preparadas a partir de la formulación (en particular pesticidas) puede variar dentro de amplios intervalos. La concentración del compuesto de fórmula (I) en las formas de uso es generalmente entre 0,0000001 y 95 % en peso del compuesto de la fórmula (I), preferentemente entre 0,00001 y 1 % en peso, en función del peso de la forma de uso. Los compuestos se utilizan en una forma habitual apropiada para las formas de uso.

50 **Mezclas**

Los compuestos de la fórmula (I) también se pueden utilizar como una mezcla con uno o más fungicidas, bactericidas, acaricidas, molusquicidas, nematocidas, insecticidas, microbiológicos, especies beneficiosas, herbicidas, fertilizantes, repelentes de aves, fitotónicos, esterilizadores, protectores, estereoquímicos y/o reguladores de crecimiento de plantas adecuados, para poder así, por ejemplo, ampliar el espectro de acción, prolongar la duración de la acción, aumentar la velocidad de acción, prevenir la repulsión o evitar la evolución de resistencia. Además, tales combinaciones de compuesto activo pueden mejorar el crecimiento y/o tolerancia de plantas a

factores abióticos, por ejemplo altas o bajas temperaturas, a sequías o a elevados contenidos de agua o salinidad de la tierra. También es posible mejorar el rendimiento de la generación de flores y frutas, optimizar la capacidad de germinación y desarrollo de la raíz, facilitar la cosecha y mejorar los rendimientos, influir en la maduración, mejorar la calidad y/o el valor nutricional de los productos cosechados, prolongar la duración en almacenaje y/o mejorar la procesabilidad de los productos cosechados.

5

Además, los compuestos de la fórmula (I) pueden estar presentes en una mezcla con otros compuestos activos o semioquímicos tales como atrayentes y/o repelentes de aves y/o activadores de plantas y/o reguladores de crecimiento y/o fertilizantes. Asimismo, los compuestos de la fórmula (I) pueden usarse para mejorar las propiedades de plantas tales como, por ejemplo, crecimiento, rendimiento y calidad del material cosechado.

10 En una realización particular de acuerdo con la invención, los compuestos de la fórmula (I) están presentes en formulaciones o formas de uso preparadas a partir de estas formulaciones en una mezcla con otros compuestos, preferentemente los que se describen a continuación.

Si uno de los compuestos mencionados a continuación puede ocurrir en diferentes formas tautoméricas, estas formas también se incluyen incluso si no se mencionan explícitamente en cada caso.

15 **Insecticidas/acaricidas/nematicidas**

Los compuestos activos identificados en la presente por sus nombres comunes se conocen y describen, por ejemplo, en el manual de pesticidas ("The Pesticide Manual" 16ª Ed., British Crop Protection Council 2012) o se pueden encontrar en Internet (por ejemplo, <http://www.alanwood.net/pesticides>).

20 (1) Inhibidores de acetilcolinesterasa (AChE), tales como, por ejemplo, carbamatos, por ejemplo alanicarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbaril, carbofuran, carbosulfan, etiofencarb, fenobucarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metiocarb, metomil, metolcarb, oxamil, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, triazamato, trimetacarb, XMC y xililcarb; u organofosfatos, por ejemplo acefato, azametifos, azinfos-etilo, azinfos-metilo, cadusafos, cloretoxifos, clorfenvinfos, clormefos, clorpirifos-metilo, coumafos, cianofos, demeton-S-metilo, diazinon, diclorvos/DDVP, dicrotofos, dimetoato, dimetilvinfos, disulfoton, EPN, etion, etoprofos, famfur, fenamifos, fenitroton, fention, fostiazato, heptenofos, imiciafos, isofenfos, isopropil O-
25 (metoxiaminotiofosforilo) salicilato, isoxation, malation, mecarbam, metamidofos, metidation, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemeton-metilo, paration-metilo, fentoato, forato, fosalona, fosmet, fosfamidon, foxim, pirimifos-metilo, profenofos, propetamfos, protiofos, piraclafos, piridafention, quinalfos, sulfotep, tebupirimfos, temefos, terbufos, tetraclorvinfos, tiometon, triazofos, triclorfon y vamidotion.

30 (2) Antagonistas del canal de cloruro regulado por GABA, tales como, por ejemplo, ciclodieno-organocloruros, por ejemplo, clordano y endosulfan o fenilpirazolos (fipros), por ejemplo etiprol y fipronil.

(3) Moduladores del canal de sodio/ bloqueadores del canal de sodio regulados por voltaje tales como, por ejemplo, piretroides, por ejemplo acrinatrin, alletrin, d-cis-trans aletrin, d-trans aletrin, bifentrin, bioaletrin, bioaletrin s-ciclopentenil isómero, bioresmetrin, cicloprotrin, ciflutrin, beta-ciflutrin, cihalotrin, lambda-cihalotrin, gamma-cihalotrin, cipermetrin, alfa-cipermetrin, beta-cipermetrin, theta-cipermetrin, zeta-cipermetrin, cifenotrin [(1R)-trans-isómero], deltametrin, empentrin [(EZ)-(1R)-isómero], esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrin, fenvalerato, flucitrinato, flumetrin, tau-fluvalinato, halfenprox, imiprotrin, kadetrin, permetrin, fenotrin [(1R)-trans-isómero], pralletrin, piretrinas (piretro), resmetrin, silafluofen, teflutrin, tetrametrin, tetrametrin [(1R)-isómero]], tralometrin y transflutrin o DDT o metoxiclor.

40 (4) Agonistas del receptor de acetilcolina nicotinérgica (nAChR), tales como, por ejemplo, neonicotinoides, por ejemplo, acetamiprid, clotianidin, dinotefuran, imidacloprid, nitenpiram, tiacloprid y tiametoxam o nicotina o sulfoxaflor.

(5) Activadores alostéricos del receptor de acetilcolina nicotinérgica (nAChR) tales como, por ejemplo, espinosinas, por ejemplo espinetoram y espinosad.

45 (6) Activadores del canal de cloruro, tales como, por ejemplo, avermectinas/milbemicinas, por ejemplo abamectina, emamectina benzoato, lepimectina y milbemectina.

(7) Imitadores de la hormona juvenil tales como, por ejemplo, análogos de la hormona juvenil, por ejemplo hidropreno, kinopreno y metopreno o fenoxicarb o piriproxifen.

50 (8) Compuestos activos con mecanismos no conocidos o no específicos de acción tales como, por ejemplo, alquil haluros, por ejemplo, metil bromuro y otros alquil haluros; o cloropicrina o sulfuril fluoruro o borax o tartaro emético.

(9) Antialimentarios selectivos, por ejemplo pimetrozina o flonicamid.

(10) Inhibidores del crecimiento de ácaros, por ejemplo clofentezina, hexitiazox y diflovidazin o etoxazol.

- (11) Alteradores microbianos de la membrana intestinal de insectos, por ejemplo, *Bacillus thuringiensis* subespecie israelensis, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* subespecie aizawai, *Bacillus thuringiensis* subespecie kurstaki, *Bacillus thuringiensis* subespecie tenebrionis, y proteínas de plantas BT: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry2Ab, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34/35Ab1.
- 5 (12) Inhibidores de fosforilación oxidativa, alteradores de ATP tales como, por ejemplo, compuestos de diafentiuron u organoestaño, por ejemplo azociclotina, cihexatina y óxido de fenbutatina o propargita o tetradifon;
- (13) Desacopladores de fosforilación oxidativa que actúan interrumpiendo el gradiente de protones H tales como, por ejemplo, clorfenapir, DNOC y sulfluramid.
- 10 (14) Antagonistas del receptor de acetilcolina nicotinérgica tales como, por ejemplo, bensultap, cartap clorhidrato, tiocilam, y tiosultap-sodio.
- (15) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 0, tales como, por ejemplo, bistrifluron, clorfluazuron, diflubenzuron, flucicloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron y triflumuron.
- (16) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 1, por ejemplo buprofezin.
- 15 (17) Inhibidores de muda (en particular para Diptera, es decir dípteros) tales como, por ejemplo, ciromazina.
- (18) Agonistas del receptor de ecdisona tales como, por ejemplo, cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida y tebufenozida.
- (19) Agonistas octopaminérgicos, tales como, por ejemplo, amitraz.
- 20 (20) Inhibidores de transporte de electrones de complejo III tales como, por ejemplo hidrametilnona o acequinolico o fluacipirim.
- (21) Inhibidores de transporte de electrones de complejo I, por ejemplo del grupo de los acaricidas METI, por ejemplo fenazaquin, fenpiroximato, pirimidifen, piridaben, tebufenpirad y tolfenpirad o rotenona (Derris).
- (22) Bloqueadores de canal de sodio regulado por voltaje, por ejemplo, indoxacarb o metaflumizona.
- 25 (23) Inhibidores de acetil-CoA carboxilasa tales como, por , derivados de ácido tetrónico y tetrámico, por ejemplo, espirodiclofen, espiromesifen y espirotetramat.
- (24) Inhibidores del transporte de electrones del complejo IV tales como, por ejemplo, fosfinas, por ejemplo, fosfito de aluminio, fosfito de calcio, fosfina y fosfito de zinc o cianuro.
- (25) Inhibidores de transporte de electrones de complejo II tales como, por ejemplo, cienopirafen y ciflumetofen.
- 30 (28) Efectores del receptor de rianodina tales como, por ejemplo, diamidas, por ejemplo, clorantraniliprol, ciantraniliprol y flubendiamida,
- otros compuestos activos tales como, por ejemplo, afidopiropen, azadiractina, benclotiaz, benzoximato, bifenazato, bromopropilato, quinometionat, criolita,
- dicofol, diflovidazina, fluensulfona, flometoquina, flufenerim, flufenoxistrobina, flufiprol, fluopiram, flupiradifurona, fufenozida, heptaflutrina, imidaclotiz, iprodiona, meperflutrin, paichongding, piflubumida, pirifluquinazona, 35 piriminostrobina, tetrametilflutrina y yodometano; además preparaciones a base de *Bacillus firmus* (1-1582, BioNeem, Votivo), y también los siguientes compuestos: 3-bromo-N-{2-bromo-4-cloro-6-[(1-ciclopropil)etil]fenil}-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido de WO2005/077934) y 1-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil}-3-(trifluorometil)-1H-1,2,4-triazol-5-amina (conocido de WO2006/043635), {1'-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]-5-fluorospiro[indol-3,4'-piperidin]-1(2H)-il]}(2-cloropiridin-4-il)metanona (conocido de WO2003/106457), 2-cloro-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]piperidin-4-il}-4-(trifluorometil)fenil]isonicotinamida (conocido de WO2006/003494), 3-(2,5-dimetilfenil)-4-hidroxi-8-metoxi-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-2-one (conocido de WO2009/049851), 3-(2,5-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-4-il-etilcarbonato (conocido de WO2009/049851), 4-(but-2-in-1-iloxi)-6-(3,5-dimetilpiperidin-1-il)-5-fluoropirimidina (conocido de WO2004/099160), 4-(but-2-in-1-iloxi)-6-(3-clorofenil)pirimidina (conocido de WO2003/076415), PF1364 (n.º de registro CAS 1204776-60-2), 4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-2-metil-N-{2-oxo-2-[(2,2,2-trifluoroetil)amino]etil}benzamida (conocido de WO2005/085216), 4-[5-[3-cloro-5-(trifluorometil)fenil]-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-N-{2-oxo-2-[(2,2,2-trifluoroetil)amino]etil}-1-naftamida (conocido de WO2009/002809), 2-[2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil}amino)-5-cloro-3-metilbenzoil]-2-metilhidrazinacarboxilato de metilo (conocido de WO2005/085216), 2-[2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil}amino)-5-ciano-3-metilbenzoil]-2-etilhidrazinacarboxilato de metilo (conocido de WO2005/085216), 2-[2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil}amino)-5-ciano-3-metilbenzoil]-2-metilhidrazinacarboxilato de metilo (conocido de WO2005/085216), 2-[3,5-dibromo-2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-

il)-1H-pirazol-5-il]carbonil}amino)benzoil]-2-etilhidrazinacarboxilato de metilo (conocido de WO2005/085216), 1-(3-cloropiridin-2-il)-N-[4-ciano-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-3-[[5-(trifluorometil)-2H-tetrazol-2-il]metil]-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido de WO2010/069502), N-[2-(5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-il)-4-cloro-6-metilfenil]-3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido de CN102057925), 3-cloro-N-(2-cianopropan-2-il)-N-[4-(1,1,1,2,3,3,3-heptafluoropropan-2-il)-2-metilfenil]ftalamida (conocido de WO2012/034472), 8-cloro-N-[(2-cloro-5-metoxifenil)sulfonil]-6-(trifluorometil)imidazo[1,2-a]piridina-2-carboxamida (conocido de WO2010/129500), 4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-2-metil-N-(1-oxidotietan-3-il)benzamida (conocido de WO2009/080250), N-[(2E)-1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]piridin-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoroacetamida (conocido de WO2012/029672), 1-[(2-cloro-1,3-tiazol-5-il)metil]-4-oxo-3-fenil-4H-pirido[1,2-a]pirimidin-1-io-2-olato (conocido de WO2009/099929), 1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]-4-oxo-3-fenil-4H-pirido[1,2-a]pirimidin-1-io-2-olato (conocido de WO2009/099929), (5S,8R)-1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]-9-nitro-2,3,5,6,7,8-hexahidro-1H-5,8-epoxiidiazol[1,2-a]azepina (conocido de WO2010/069266), (2E)-1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]-N'-nitro-2-pentilidenediazinacarboximidamida (conocido de WO2010/060231), 4-(3-[2,6-dicloro-4-[(3,3-dicloroprop-2-en-1-il)oxil]fenoxi]propoxi)-2-metoxi-6-(trifluorometil)pirimidina (conocido de CN101337940), N-[2-(terc-butilcarbamoil)-4-cloro-6-metilfenil]-1-(3-cloropiridin-2-il)-3-(fluorometoxi)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido de WO2008/134969).

Fungicidas

Los compuestos activos especificados en la presente por sus nombres comunes se conocen y describen, por ejemplo, en "Pesticide Manual" o en Internet (por ejemplo: <http://www.alanwood.net/pesticides>).

(1) Inhibidores de la biosíntesis de ergosterol tales como, por ejemplo, (1.1) aldimorf, (1.2) azaconazol, (1.3) bitertanol, (1.4) bromuconazol, (1.5) ciproconazol, (1.6) diclobutrazol, (1.7) difenoconazol, (1.8) diniconazol, (1.9) diniconazol-M, (1.10) dodemorf, (1.11) dodemorf acetato, (1.12) epoxiconazol, (1.13) etaconazol, (1.14) fenarimol, (1.15) fenbuconazol, (1.16) fenhexamida, (1.17) fenpropidin, (1.18) fenpropimorf, (1.19) fluquinconazol, (1.20) flurprimidol, (1.21) flusilazol, (1.22) flutriafol, (1.23) furconazol, (1.24) furconazol-cis, (1.25) hexaconazol, (1.26) imazalil, (1.27) imazalil sulfato, (1.28) imibenconazol, (1.29) ipconazol, (1.30) metconazol, (1.31) miclobutanil, (1.32) naftifin, (1.33) nuarimol, (1.34) oxpoconazol, (1.35) paclobutrazol, (1.36) pefurazoato, (1.37) penconazol, (1.38) piperalina, (1.39) procloraz, (1.40) propiconazol, (1.41) protioconazol, (1.42) piributicarb, (1.43) pirifenox, (1.44) quinconazol, (1.45) simeconazol, (1.46) spiroxamina, (1.47) tebuconazol, (1.48) terbinafin, (1.49) tetraconazol, (1.50) triadimefon, (1.51) triadimenol, (1.52) tridemorf, (1.53) triflumizol, (1.54) triforina, (1.55) triticonazol, (1.56) uniconazol, (1.57) uniconazol-P, (1.58) viniconazol, (1.59) triflufenazol, (1.60) 1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)cicloheptanol, (1.61) 1-(2,2-dimetil-2,3-dihidro-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato de metilo, (1.62) N'-[5-(difluorometil)-2-metil-4-[3-(trimetilsilil)propoxi]fenil]-N-etil-N-metilimidofornamida, (1.63) N-etil-N-metil-N'-[2-metil-5-(trifluorometil)-4-[3-(trimetilsilil)propoxi]fenil]imidofornamida y (1.64) O-[1-(4-metoxifenoxi)-3,3-dimetilbutan-2-il]-1H-imidazol-1-carbotioato, (1.65) pirisoxazol.

(2) Inhibidores de respiración (inhibidores de cadena respiratoria) tales como, por ejemplo, (2.1) bixafen, (2.2) boscalid, (2.3) carboxina, (2.4) diflumetorim, (2.5) fenfuram, (2.6) fluopiram, (2.7) flutolanil, (2.8) fluxapiraxad, (2.9) furametpir, (2.10) furmeciclox, (2.11) mezcla de isopirazam del racemato syn-epimerico 1RS,4SR,9RS y el racemato anti-empimerico 1RS,4SR,9SR, (2.12) isopirazam (racemato anti-epimerico), (2.13) isopirazam (enantiómero anti-epimerico 1R,4S,9S), (2.14) isopirazam (enantiómero anti-epimerico 1S,4R,9R), (2.15) isopirazam (racemato syn-epimerico 1RS,4SR,9RS), (2.16) isopirazam (enantiómero syn-epimerico 1R,4S,9R), (2.17) isopirazam (enantiómero syn-epimerico 1S,4R,9S), (2.18) mepronil, (2.19) oxicarboxina, (2.20) penflufen, (2.21) pentiopirad, (2.22) sedaxano, (2.23) tifulzamida, (2.24) 1-metil-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil]-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.25) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.26) 3-(difluorometil)-N-[4-fluoro-2-(1,1,2,3,3,3-hexafluoropropoxi)fenil]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.27) N-[1-(2,4-diclorofenil)-1-metoxipropan-2-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.28) 5,8-difluoro-N-[2-(2-fluoro-4-[[4-(trifluorometil)piridin-2-il]oxi]fenil]etil]quinazolina-4-amina, (2.29) benzovindiflupir, (2.30) N-[(1S,4R)-9-(diclorometileno)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida y (2.31) N-[(1R,4S)-9-(diclorometileno)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.32) 3-(difluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.33) 1,3,5-trimetil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.34) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.35) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.36) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.37) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.38) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.39) 1,3,5-trimetil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.40) 1,3,5-trimetil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.41) benodanil, (2.42) 2-cloro-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)piridina-3-carboxamida, (2.43) isofetamida

(3) Inhibidores de respiración (inhibidores de cadena respiratoria) que actúan sobre el complejo III de la cadena respiratoria tales como, por ejemplo, (3.1) ametocradina, (3.2) amisulbrom, (3.3) azoxistrobina, (3.4) ciazofamid, (3.5) coumetoxistrobina, (3.6) coumoxistrobina, (3.5) dimoxistrobina, (3.8) enestroburina, (3.9) famoxadona, (3.10) fenamidona, (3.11) flufenoxistrobina, (3.12) fluoxastrobina, (3.13) kresoxim-metilo, (3.14) metominoestrobina, (3.15) orisastrobina, (3.16) picoxistrobina, (3.17) piraclostrobina, (3.18) pirametostrobina,

- (3.19) piraoxistrobina, (3.20) piribencarb, (3.21) triclopiricarb, (3.22) trifloxistrobina, (3.23) (2E)-2-(2-[[6-(3-cloro-2-metilfenoxi)-5-fluoropirimidin-4-il]oxi]fenil)-2-(metoxiimino)-N-metiletanamida, (3.24) (2E)-2-(metoxiimino)-N-metil-2-(2-[[[[(1E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etiliden]amino]oxi]metil]fenil]etanamida, (3.25) (2E)-2-(metoxiimino)-N-metil-2-[[[[(E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etoxi]imino]metil]fenil]etanamida, (3.26) (2E)-2-[[[[(1E)-1-(3-[[[(E)-1-fluoro-2-feniletetil]oxi]fenil]etiliden]amino]oxi]metil]fenil]-2-(metoxiimino)-N-metiletanamida, (3.27) (2E)-2-[[[[(2E,3E)-4-(2,6-diclorofenil)but-3-en-2-iliden]amino]oxi]metil]fenil]-2-(metoxiimino)-N-metiletanamida, (3.28) 2-cloro-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)piridina-3-carboxamida, (3.29) 5-metoxi-2-metil-4-(2-[[[[(1E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etiliden]amino]oxi]metil]fenil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-ona, (3.30) (2E)-2-[[[[(ciclopropil[(4-metoxifenil)imino]metil]sulfanil]metil]fenil]-3-metoxi-2-propenoato de metilo, (3.31) N-(3-etil-3,5,5-trimetilciclohexil)-3-(formilamino)-2-hidroxibenzamida, (3.32) 2-[[[[(2,5-dimetilfenoxi)metil]fenil]-2-metoxi-N-metilacetamida, (4) inhibidores de la mitosis y división celular tales como, por ejemplo, (4.1) benomilo, (4.2) carbendazim, (4.3) clorfenazol, (4.4) dietofencarb, (4.5) etaboxam, (4.6) fluopicolid, (4.7) fuberidazol, (4.8) pencicuron, (4.9) tiabendazol, (4.10) tiofanato-metilo, (4.11) tiofanato, (4.12) zoxamida, (4.13) 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina y (4.14) 3-cloro-5-(6-cloropiridin-3-il)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)piridazina.
- (5) Compuestos que tienen actividad de múltiples sitios tales como, por ejemplo, (5.1) mezcla Bordeaux, (5.2) captafol, (5.3) captan, (5.4) clorotalonil, (5.5) preparaciones de cobre tales como hidróxido de cobre, (5.6) naftenato de cobre, (5.7) óxido de cobre, (5.8) oxiclouro de cobre, (5.9) sulfato de cobre, (5.10) diclofluanil, (5.11) ditionon, (5.12) dodina, (5.13) dodina base libre, (5.14) ferbam, (5.15) fluorfolpet, (5.16) folpet, (5.17) guazatina, (5.18) guazatina acetato, (5.19) iminocadina, (5.20) iminocadina albesilato, (5.21) iminocadina triacetato, (5.22) mancobre, (5.23) mancozeb, (5.24) maneb, (5.25) metiram, (5.26) metiram de zinc, (5.27) oxina de cobre, (5.28) propamidina, (5.29) propineb, (5.30) azufre y preparaciones de azufre tales como, por ejemplo, polisulfuro de calcio, (5.31) tiram, (5.32) tolilfluaniid, (5.33) zineb, (5.34) ziram y (5.35) anilazina.
- (6) Inductores de resistencia tales como, por ejemplo, (6.1) acibenzolar-S-metilo, (6.2) isotianil, (6.3) probenazol, (6.4) tiadinil y (6.5) laminarina.
- (7) Inhibidores de biosíntesis de aminoácidos y proteínas tales como, por ejemplo, (7.1) , (7.2) blasticidina-S, (7.3) ciprodinil, (7.4) kasugamicina, (7.5) hidrato de kasugamicina clorhidrato, (7.6) mepanipirim, (7.7) pirimetanil, (7.8) 3-(5-fluoro-3,3,4,4-tetrametil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina y (7.9) oxitetraciclina y (7.10) estreptomina.
- (8) Inhibidores de producción de ATP tales como, por ejemplo, (8.1) acetato de fentina, (8.2) cloruro de fentina, (8.3) hidróxido de fentina y (8.4) siltiofam.
- (9) Inhibidores de la síntesis de pared celular tales como, por ejemplo, (9.1) bentiavalicarb, (9.2) dimetomorf, (9.3) flumorf, (9.4) iprovalicarb, (9.5) mandipropamid, (9.6) polioxinas, (9.7) polioxorim, (9.8) validamicina A, (9.9) valifenalato y (9.10) polioxina B.
- (10) Inhibidores de síntesis de membrana y lípidos tales como, por ejemplo, (10.1) bifenilo, (10.2) clorneb, (10.3) dicloran, (10.4) edifenfos, (10.5) etridiazol, (10.6) yodocarb, (10.7) iprobenfos, (10.8) isoprotiolano, (10.9) propamocarb, (10.10) propamocarb clorhidrato, (10.11) protiocarb, (10.12) pirazofos, (10.13) quintozeno, (10.14) tecnazeno y (10.15) tolclofos-metilo.
- (11) Inhibidores de la biosíntesis de melanina, por ejemplo (11.1) carpropamid, (11.2) diclocimet, (11.3) fenoxanil, (11.4) ftalida, (11.5) piroquilon, (11.6) triciclazol y (11.7) {3-metil-1-[(4-metilbenzoil)amino]butan-2-il}carbamato de 2,2,2-trifluoroetilo.
- (12) Inhibidores de la síntesis de ácido nucleico tales como, por ejemplo, (12.1) benalaxilo, (12.2) benalaxil-M (kiralaxil), (12.3) bupirimato, (12.4) clozilacon, (12.5) dimetirimol, (12.6) etirimol, (12.7) furalaxilo, (12.8) himexazol, (12.9) metalaxilo, (12.10) metalaxil-M (mefenoxam), (12.11) ofurace, (12.12) oxadixilo, (12.13) ácido oxolínico y (12.14) octilinoá.
- (13) Inhibidores de la transducción de señales tales como, por ejemplo, (13.1) clozolinato, (13.2) fenpiclonil, (13.3) fludioxonil, (13.4) iprodiona, (13.5) procimidona, (13.6) quinoxifen, (13.7) vinclozolin y (13.8) proquinazid.
- (14) Desacopladores tales como, por ejemplo, (14.1) binapacril, (14.2) dinocap, (14.3) ferimzona, (14.4) fluazinam y (14.5) meptildinocap.
- (15) Compuestos adicionales tales como, por ejemplo, (15.1) bentiazol, (15.2) betoxazina, (15.3) capsimicina, (15.4) carvona, (15.5) cinometionat, (15.6) piriofenona (clazafenona), (15.7) cufraneb, (15.8) ciflufenamid, (15.9) cimoxanil, (15.10) ciprosulfamida, (15.11) dazomet, (15.12) debacarb, (15.13) diclorofen, (15.14) diclomezina, (15.15) difenzoquat, (15.16) difenzoquat metilsulfato, (15.17) difenilamina, (15.18) EcoMate, (15.19) fenpirazamina, (15.20) flumetover, (15.21) fluorimid, (15.22) flusulfamida, (15.23) flutianil, (15.24) fosetil-aluminio, (15.25) fosetil-calcio, (15.26) fosetil-sodio, (15.27) hexaclorobenceno, (15.28) irumamicina, (15.29) metasulfocarb, (15.30) isotiocianato de metilo, (15.31) metrafenona, (15.32) mildiomicina, (15.33) natamicina, (15.34) dimetilditiocarbamato de níquel, (15.35) nitrotal-isopropilo, (15.36) octilinoá, (15.37) oxamocarb, (15.38)

oxifentiina, (15.39) pentaclorofenol y sus sales, (15.40) fenotrin, (15.41) ácido fosfórico y sus sales, (15.42) propamocarb-fosetilato, (15.43) propanosina-sodio, (15.44) pirimorf, (15.45) (2E)-3-(4-terc-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona, (15.46) (2Z)-3-(4-terc-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona, (15.47) pirrolnitrin, (15.48) tebufloquin, (15.49) tecloftalam, (15.50) tolnifanida (15.51) triazóxido, (15.52) triclamida, (15.53) zarilamid, (15.54) (3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[[3-[(isobutiriloxi)metoxi]-4-metoxipiridin-2-il]carbonil]amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-il 2-metilpropanoato, (15.55) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, (15.56) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, (15.57) 1-(4-{4-[5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, (15.58) 1-(4-metoxifenoxi)-3,3-dimetilbutan-2-il 1H-imidazol-1-carboxilato, (15.59) 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)piridina, (15.60) 2,3-dibutil-6-clorotieno[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona, (15.61) 2,6-dimetil-1H,5H-[1,4]ditiino[2,3-c:5,6-c']dipirole-1,3,5,7(2H,6H)-tetrona, (15.62) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(5R)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il)etanona, (15.63) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(5S)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il)etanona, (15.64) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il)etanona, (15.65) 2-butoxi-6-yodo-3-propil-4H-cromen-4-ona, (15.66) 2-cloro-5-[2-cloro-1-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-4-metil-1H-imidazol-5-il]piridina, (15.67) 2-fenilfenoly sales, (15.68) 3-(4,4,5-trifluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina, (15.69) 3,4,5-tricloropiridina-2,6-dicarbonitrilo, (15.70) 3-cloro-5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-metilpiridazina, (15.71) 4-(4-clorofenil)-5-(2,6-difluorofenil)-3,6-dimetilpiridazina, (15.72) 5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-tiol, (15.73) 5-cloro-N'-fenil-N'-(prop-2-in-1-il)tiofen-2-sulfonohidrazida, (15.74) 5-fluoro-2-[[4-fluorobenzil]oxi]pirimidina-4-amina, (15.75) 5-fluoro-2-[[4-metilbenzil]oxi]pirimidina-4-amina, (15.76) 5-metil-6-octil[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina-7-amina, (15.77) (2Z)-3-amino-2-ciano-3-fenilacrilato de etilo, (15.78) N'-(4-[[3-(4-clorobencil)-1,2,4-tiadiazol-5-il]oxi]-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.79) N-(4-clorobencil)-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]propanamida, (15.80) N-[[4-clorofenil](ciano)metil]-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]propanamida, (15.81) N-[[5-bromo-3-cloropiridin-2-il]metil]-2,4-dicloronicotinamida, (15.82) N-[[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloronicotinamida, (15.83) N-[[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2-fluoro-4-yodonicotinamida, (15.84) N-[[E)-[[ciclopropilmetoxi]imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-fenilacetamida, (15.85) N-[[Z)-[[ciclopropilmetoxi]imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-fenilacetamida, (15.86) N'-4-[[3-terc-butil-4-ciano-1,2-tiazol-5-il]oxi]-2-cloro-5-metilfenil]-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.87) N-metil-2-(1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-N-(1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il)-1,3-tiazol-4-carboxamida, (15.88) N-metil-2-(1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-N-[[1R)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il]-1,3-tiazol-4-carboxamida, (15.89) N-metil-2-(1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-N-[[1S)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il]-1,3-tiazol-4-carboxamida, (15.90) pentil {6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilene]amino]oxi]metil]piridin-2-il]carbamato, (15.91) ácido fenazina-1-carboxílico, (15.92) quinolin-8-ol, (15.93) quinolin-8-ol sulfato (2:1), (15.94) {6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilene]amino]oxi]metil]piridin-2-il]carbamato de terc-butilo, (15.95) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[2'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.96) N-(4'-clorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.97) N-(2',4'-diclorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.98) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[4'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.99) N-(2',5'-difluorobifenil-2-il)-1-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.100) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.101) 5-fluoro-1,3-dimetil-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.102) 2-cloro-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]nicotinamida, (15.103) 3-(difluorometil)-N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.104) N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.105) 3-(difluorometil)-N-(4'-etinilbifenil-2-il)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.106) N-(4'-etinilbifenil-2-il)-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.107) 2-cloro-N-(4'-etinilbifenil-2-il)nicotinamida, (15.108) 2-cloro-N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]nicotinamida, (15.109) 4-(difluorometil)-2-metil-N-[4'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1,3-tiazol-5-carboxamida, (15.110) 5-fluoro-N-[4'-(3-hidroxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.111) 2-cloro-N-[4'-(3-hidroxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]nicotinamida, (15.112) 3-(difluorometil)-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.113) 5-fluoro-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.114) 2-cloro-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]nicotinamida, (15.115) (5-bromo-2-metoxi-4-metilpiridin-3-il)(2,3,4-trimetoxi-6-metilfenil)metanona, (15.116) N-[2-(4-[[3-(4-clorofenil)prop-2-in-1-il]oxi]-3-metoxifenil)etil]-N2-(metilsulfonil)valinamida, (15.117) ácido 4-oxo-4-[[2-feniletil]amino]butanoico, (15.118) but-3-in-1-il {6-[[[(Z)-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilene]amino]oxi]metil]piridin-2-il]carbamato, (15.119) 4-amino-5-fluoropirimidin-2-ol (forma tautomérica: 4-amino-5-fluoropirimidin-2(1H)-ona), (15.120) 3,4,5-trihidroxibenzoinato de propilo, (15.121) 1,3-dimetil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.122) 1,3-dimetil-N-[[3(R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.123) 1,3-dimetil-N-[[3(S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.124) [3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (15.125) (S)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (15.126) (R)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (15.127) 2-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.128) 1-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-il tiocianato, (15.129) 5-(allilsulfanil)-1-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (15.130) 2-[1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.131) 2-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-

- 2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.132) 2-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.133) 1-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-il tiocianato, (15.134) 1-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-il tiocianato, (15.135) 5-(alilsulfanil)-1-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (15.136) 5-(alilsulfanil)-1-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (15.137) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.138) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.139) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.140) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.141) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.142) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.143) 2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.144) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.145) 2-fluoro-6-(trifluorometil)-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)benzamida, (15.146) 2-(6-bencilpiridin-2-il)quinazolina, (15.147) 2-[6-(3-fluoro-4-metoxifenil)-5-metilpiridin-2-il]quinazolina, (15.148) 3-(4,4-difluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina, (15.149) ácido abscísico, (15.150) 3-(difluorometil)-N-metoxi-1-metil-N-[1-(2,4,6-triclorofenil)propan-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.151) N'-[5-bromo-6-(2,3-dihidro-1H-inden-2-iloxi)-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.152) N'-[5-bromo-6-[1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.153) N'-[5-bromo-6-[(1R)-1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.154) N'-[5-bromo-6-[(1S)-1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.155) N'-[5-bromo-6-[(cis-4-isopropilciclohexil)oxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.156) N'-[5-bromo-6-[(trans-4-isopropilciclohexil)oxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.157) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.158) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropilbencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.159) N-(2-terc-butilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.160) N-(5-cloro-2-etilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.161) N-(5-cloro-2-isopropilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.162) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-5-fluorobencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.163) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(5-fluoro-2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.164) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropil-5-fluorobencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.165) N-(2-ciclopropil-5-fluorobencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.166) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-fluoro-6-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.167) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-5-metilbencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.168) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropil-5-metilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.169) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropil-5-metilbencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.170) N-(2-terc-butil-5-metilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.171) N-[5-cloro-2-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.172) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-N-[5-metil-2-(trifluorometil)bencil]-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.173) N-[2-cloro-6-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.174) N-[3-cloro-2-fluoro-6-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.175) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-4,5-dimetilbencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.176) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.177) 3-(difluorometil)-N-(7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.178) 3-(difluorometil)-N-[(3R)-7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.179) 3-(difluorometil)-N-[(3S)-7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.180) N'-(2,5-dimetil-4-fenoxifenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.181) N'-[4-[(4,5-dicloro-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilfenil]-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.182) N-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina Todos los componentes de mezcla mencionados en las clases (1) a (15) pueden, si son capaces según sus grupos funcionales, opcionalmente formar sales con bases o ácidos adecuados.

Pesticidas biológicos como componentes de mezcla

Los compuestos de la fórmula (I) se pueden combinar con pesticidas biológicos.

Los pesticidas biológicos comprenden en particular bacterias, hongos, levaduras, extractos de plantas y productos formados por microorganismos, incluyendo proteínas y metabolitos secundarios.

- 55 Los pesticidas biológicos comprenden bacterias tales como bacterias que forman esporas, bacterias de colonización de raíz y bacterias que actúan como insecticidas, fungicidas o nematocidas biológicos.

Ejemplos de tales bacterias que se utilizan o pueden usar como pesticidas biológicos son:

- 60 *Bacillus amyloliquefaciens*, cepa FZB42 (DSM 231179), o *Bacillus cereus*, en particular *B. cereus* cepa CNCM I-1562 o *Bacillus firmus*, cepa I-1582 (número de acceso CNCM I-1582) o *Bacillus pumilus*, en particular cepa GB34 (número de acceso ATCC 700814) y cepa QST2808 (número de acceso NRRL B-30087), o *Bacillus subtilis*, en particular cepa GB03 (número de acceso ATCC SD-1397), o *Bacillus subtilis* cepa QST713 (número de acceso NRRL B-21661) o *Bacillus subtilis* cepa OST 30002 (número de acceso NRRL B-50421) *Bacillus thuringiensis*, en

particular *B. thuringiensis* subespecie *israelensis* (serotipo H-14), cepa AM65-52 (número de acceso ATCC 1276), o *B. thuringiensis* subsp. *aizawai*, en particular cepa ABTS-1857 (SD-1372), o *B. thuringiensis* subsp. *kurstaki* cepa HD-1, o *B. thuringiensis* subsp. *tenebrionis* cepa NB 176 (SD-5428), *Pasteuria penetrans*, *Pasteuria* spp. (Rotylenchulus reniformis nemátodo)-PR3 (número de acceso ATCC SD-5834), *Streptomyces microflavus* cepa AQ6121 (= QRD 31.013, NRRL B-50550), *Streptomyces galbus* cepa AQ 6047 (número de acceso NRRL 30232).

Ejemplos de hongos y levaduras que se utilizan o pueden usar como pesticidas biológicos son:

Beauveria bassiana, en particular cepa ATCC 74040, *Coniothyrium minitans*, en particular cepa CON/M/91-8 (número de acceso DSM-9660), *Lecanicillium* spp., en particular cepa HRO LEC 12, *Lecanicillium lecanii*, (antes conocida como *Verticillium lecanii*), en particular cepa KV01, *Metarhizium anisopliae*, en particular cepa F52 (DSM3884/ ATCC 90448), *Metschnikowia fructicola*, en particular cepa NRRL Y-30752, *Paecilomyces fumosoroseus* (ahora: *Isaria fumosorosea*), en particular cepa IFPC 200613, o cepa Apopka 97 (número de acceso ATCC 20874), *Paecilomyces lilacinus*, en particular *P. lilacinus* cepa 251 (AGAL 89/030550), *Talaromyces flavus*, en particular cepa V117b, *Trichoderma atroviride*, en particular cepa SC1 (número de acceso CBS 122089), *Trichoderma harzianum*, en particular *T. harzianum rifai* T39. (número de acceso CNCM I-952).

Ejemplos de virus que se utilizan o pueden usar como pesticidas biológicos son:

Adoxophyes orana (tortrix de fruta de verano) virus granulosis (GV), *Cydia pomonella* (polilla del manzano) virus granulosis (GV), *Helicoverpa armigera* (gusano cogollero) virus de la polihedrosis nuclear (NPV), *Spodoptera exigua* (gusano soldado) mNPV, *Spodoptera frugiperda* (cogollero del maíz) mNPV, *Spodoptera littoralis* (rosquilla negra) NPV.

También se incluyen bacterias y hongos que se agregan como "inoculante" para plantas o partes de plantas u órganos de plantas y que, en virtud de sus propiedades particulares, promueven el crecimiento de plantas y salud de plantas. Los ejemplos que se pueden mencionar son:

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

Ejemplos de extractos y productos de plantas formados por microorganismos que incluyen proteínas y metabolitos secundarios que se utilizan o se pueden utilizar como pesticidas biológicos son:

Allium sativum, *Artemisia absinthium*, azadirachtin, Biokeeper WP, *Cassia nigricans*, *Celastrus angulatus*, *Chenopodium anthelminticum*, chitin, Armour-Zen, *Dryopteris filix-mas*, *Equisetum arvense*, Fortune Aza, Fungastop, Heads Up (extracto de quinoa saponina *Chenopodium*), *Pyrethrum/Pyrethrins*, *Quassia amara*, *Quercus*, Quillaja, Regalia, "Requiem™ Insecticide", rotenona, riania/rianodina, *Symphytum officinale*, *Tanacetum vulgare*, timol, Triact 70, TriCon, *Tropaeolum majus*, *Urtica dioica*, *Veratrin*, *Viscum album*, extracto de Brassicaceae, en particular semilla de colza en polvo o mostaza en polvo.

Protector como componentes de mezcla

Los compuestos de la fórmula (I) se pueden combinar con protectores tales como, por ejemplo, benoxacor, cloquintocet (-mexil), ciometrinil, ciprosulfamida, diclormid, fenclorazol (-etil), fenclorim, flurazol, fluxofenim, furilazol, isoxadifen (-etil), mefenpir (-dietil), anhídrido naftálico, oxabetrinilo, 2-metoxi-N-({4-[(metilcarbamoil)amino]fenil}sulfonil)benzamida (CAS 129531-12-0), 4-(dicloroacetil)-1-oxa-4-azaspiro[4.5]decano (CAS 71526-07-3), 2,2,5-trimetil-3-(dicloroacetil)-1,3-oxazolidina (CAS 52836-31-4).

Plantas y partes de plantas

Todas las plantas y partes de plantas se pueden tratar de acuerdo con la invención. Aquí, plantas se refiere a todas las plantas y partes de plantas tales como plantas salvajes deseadas e indeseadas o plantas de cultivo (incluyendo plantas de cultivo de origen natural), por ejemplo, cereales (trigo, arroz, triticale, cebada, centeno, avena), maíz, semillas de soja, patata, remolacha azucarera, caña de azúcar, tomates, frijoles y otras especies vegetales, algodón, tabaco, semilla de colza y también plantas frutales (con las frutas manzana, pera, frutas cítricas y parras). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que se pueden obtener por procedimientos de reproducción y optimización convencionales o por procedimientos de ingeniería genética y biotecnológicos o combinaciones de estos procedimientos, incluyendo plantas transgénicas e incluyendo las variedades de plantas que pueden o no estar protegidas por derechos de propiedad de variedad. Partes de plantas se refieren a todas las partes y órganos de las plantas por encima y debajo de la tierra, tales como tallo, hoja, flor y raíz, algunos ejemplos que se dan son hojas, agujas, caña, tallo, flores, cuerpos de frutas, frutas y semillas y también tubérculos, raíces y rizomas. Partes de plantas también incluyen plantas cosechadas y material de propagación vegetativo y generativo, por ejemplo, plántulas, tubérculos, rizomas, esquejes y semillas.

El tratamiento de acuerdo con la invención de las plantas y partes de plantas con los compuestos de la fórmula (I) se lleva a cabo directamente o permitiendo que los compuestos actúan en los alrededores, ambiente o espacio de almacenamiento por los procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo, por inmersión, pulverización,

evaporación, niebla, dispersión, pintura, inyección y, en el caso de material de propagación, en particular en el caso de semillas, también aplicando una o más capas.

Como ya se mencionó anteriormente, es posible tratar todas las plantas y sus partes de acuerdo con la invención. En una realización preferida, se tratan las especies de planta salvaje y variedades cultivadas de planta, o las obtenidas por procedimientos de cruzamiento biológico convencional, tales como cruzamiento o fusión de protoplastos, y también partes de estos. En una realización preferida, se tratan las plantas transgénicas y variedades cultivadas de plantas obtenidas por procedimientos de ingeniería genética, si corresponde en combinación con procedimientos convencionales (organismos genéticamente modificados) y partes de estos. El término "partes" o "partes de plantas" o "partes de planta" se explicaron anteriormente. La invención se usa con preferencia particular para tratar plantas de las variedades cultivadas comercialmente habituales respectivas o las que están en uso. Se debe entender que las variedades cultivadas se refieren a plantas que tienen nuevas propiedades ("rasgos") y que se obtuvieron por cruzamiento convencional, por mutagénesis o por técnicas de ADN recombinante. Estos pueden ser variedades cultivadas, variedades biotipos o genotipos.

Planta transgénica, tratamiento de semilla y eventos de integración

Las plantas transgénica so variedades cultivadas de plantas (las obtenidas por ingeniería genética) que se deben tratar con preferencia de acuerdo con la invención incluyen plantas que, a través de modificación genética, recibieron material genético que otorga propiedades útiles ventajosas particulares ("rasgos") a estas plantas. Ejemplos de tales propiedades son mejor crecimiento de la planta, mayor tolerancia a altas o bajas temperaturas, mayor tolerancia a sequía o a niveles de agua o salinidad del suelo, mejor rendimiento de la floración, más fácil cosecha, maduración acelerada, mayores rendimientos, mayor calidad y/o un mayor valor nutricional de los productos cosechados, mejor vida en almacenamiento y/o procesabilidad de los productos cosechados. Ejemplos adicionales y particularmente destacados de tales propiedades son mayor resistencia de las plantas contra plagas animales y microbianas, tales como contra insectos, arácnidos, nematodos, ácaros, babosas y caracoles que se deben, por ejemplo, a toxinas formadas en las plantas, en particular las formadas en las plantas por el material genético de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo por los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF y también combinaciones de estos), además mayor resistencia de las plantas contra hongos, bacterias y/o virus fitopatogénicos que se deben, por ejemplo, a resistencia adquirida sistémica (SAR), sistemina, fitoalexinas, provocadores y también genes de resistencia y proteínas y toxinas expresadas conforme a esto, y también mayor tolerancia de las plantas a determinados compuestos herbicidamente activos, por ejemplo, imidazolinonas, sulfonilureas, glifosato o fosinotricina (por ejemplo el gen "PAT"). Los genes que otorgan los rasgos deseados en cuestión también pueden estar presentes en combinaciones entre sí en las plantas transgénicas. Ejemplos de plantas transgénicas que se pueden mencionar con las plantas de cultivo importantes, tales como cereales (trigo, arroz, triticale, cebada, centeno, avena), maíz, semillas de soja, patata, remolacha azucarera, caña de azúcar, tomates, frijoles y otros tipos de vegetales, algodón, tabaco, semilla de colza y también plantas frutales (con las frutas manzana, pera, frutas cítricas y uvas), con énfasis particular en el maíz, semillas de soja, trigo, arroz, patatas, algodón, caña de azúcar, tabaco y semilla de colza. Los rasgos a los que se les da un énfasis particular son la mayor resistencia de las plantas a insectos, arácnidos, nematodos y babosas y caracoles.

Protección de cultivo - tipos de tratamiento

El tratamiento de las plantas y partes de plantas con los compuestos de la fórmula (I) se lleva a cabo directamente o por acción de su ambiente, hábitat o espacio de almacenamiento usando procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo por goteo, pulverización, atomización, irrigación, evaporación, espolvoreo, niebla, transmisión, formación de espuma, pintada, aplicación, inyección, agua (empapado), irrigación por goteo y, en el caso de material de propagación, en particular en el caso de semillas, también como un polvo para el tratamiento de semilla seca, una solución para el tratamiento de semilla líquida, un polvo soluble en agua para tratamiento de suspensión, mediante incrustación, recubrimiento con una o más capas, etc. También es posible aplicar los compuestos de la fórmula (I) por el procedimiento de volumen ultra bajo o inyectar la forma de aplicación o el propio compuesto de la fórmula (I) en el suelo.

Un tratamiento directo preferido de las plantas es la aplicación foliar, es decir, los compuestos de la fórmula (I) se aplican al follaje, en el que la frecuencia de tratamiento y la velocidad de aplicación se deberían ajustar de acuerdo con el nivel de infestación con la plaga en cuestión.

En el caso de compuestos sistemáticamente activos, los compuestos de la fórmula (I) también acceden a las plantas mediante el sistema de raíz. Luego las plantas se tratan por la acción de los compuestos de la fórmula (I) en el hábitat de la planta. Esto se puede hacer, por ejemplo, por empapado o mezclando con el suelo o la solución de nutriente, es decir, el locus de la planta (por ejemplo, suelo o sistemas hidropónicos) se impregnan con una forma líquida de los compuestos de la fórmula (I), o por aplicación en el suelo, es decir, los compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la invención se introducen en forma sólida (por ejemplo, en la forma de gránulos) en el locus de las plantas. En el caso de cultivos de arrozal, esto se puede hacer midiendo el compuesto de la fórmula (I) en una forma de aplicación sólida (por ejemplo como gránulos) en un campo de arrozal inundado.

Tratamiento de semillas

El control de plagas de animales tratando la semilla de plantas se ha conocido por largo tiempo y es sujeto de mejoras continuas. Sin embargo, el tratamiento de semillas implica una serie de problemas que no siempre se pueden solucionar de forma satisfactoria. Por lo tanto, se desea desarrollar procedimientos para proteger la semilla y la planta germinada que la dispensa, o al menos reducir considerablemente, la aplicación adicional de pesticidas durante el almacenamiento, luego de la siembra o después de la emergencia de las plantas. También se desea optimizar la cantidad de compuesto activo utilizado de una forma de proporcionar protección óptima para la semilla y planta germinada de ataques de plagas de animales, pero sin dañar la planta en sí misma por el compuesto activo utilizado. En particular, los procedimientos para el tratamiento de semillas también deberían considerar las propiedades insecticidas o nematocidas intrínsecas de plantas transgénicas resistentes o tolerantes a las plagas para lograr la protección óptima de la semilla y también la planta germinada con un mínimo de pesticidas utilizados.

Por lo tanto la presente invención en particular también se refiere a un procedimiento para la protección de semillas y plantas germinadas, de ataques de plagas, tratando la semilla con uno de los compuestos de la fórmula (I). El procedimiento de acuerdo con la invención para proteger semillas y plantas germinadas contra ataques de plagas también comprende un procedimiento en el que la semilla se trata simultáneamente en una operación o secuencialmente con un compuesto de la fórmula (I) y un componente de mezcla. También comprende un procedimiento en el que la semilla se trata en momentos diferentes con un compuesto de la fórmula (I) y un componente de mezcla.

La invención igualmente se refiere al uso de los compuestos de la fórmula (I) para el tratamiento de semillas para proteger la semilla y la planta resultante de plagas de animales.

Además, la invención se refiere a la semilla que se trató con un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la invención como para proporcionar protección de plagas de animales. La invención también se refiere a semillas que se trataron simultáneamente con un compuesto de la fórmula (I) y un componente de mezcla. La invención también se refiere a semillas que se trataron en momentos diferentes con un compuesto de la fórmula (I) y un componente de mezcla. En el caso de semillas tratadas en puntos diferentes en el tiempo con un compuesto de la fórmula (I) y un componente de mezcla, las sustancias individuales pueden estar presentes en la semilla en diferentes capas. Aquí, las capas que comprenden un compuesto de la fórmula (I) y los componentes de mezclas se pueden separar opcionalmente por una capa intermedia. La invención también se refiere a semillas en las que un compuesto de la fórmula (I) y un componente de mezcla se aplicaron como un componente de recubrimiento o como una capa adicional o capas adicionales además del recubrimiento.

Además, la invención se refiere a semillas que, después del tratamiento con un compuesto de la fórmula (I), se someten a un procedimiento de recubrimiento de película para evitar la abrasión de polvos en la semilla.

Una de las ventajas encontradas con un compuesto de acción sistémica de la fórmula (I) es el hecho de que, al tratar la semilla, no solo la semilla en sí misma sino también las plantas que resultan de estas estén, luego de la emergencia, protegidas contra plagas de animales. De esta forma, se puede prescindir del tratamiento inmediato del cultivo al momento de sembrar o poco después de eso.

Se debe considerar una ventaja adicional que por el tratamiento de la semilla con un compuesto de la fórmula (I), se puede mejorar la germinación y emergencia de la semilla tratada.

También se debe considerar ventajoso que los compuestos de la fórmula (I) se pueden usar en particular también para la semilla transgénica.

Además, los compuestos de la fórmula (I) se pueden emplear en combinación con composiciones o compuestos de tecnología de señalización, lo que lleva a una mejor colonización por simbiotas tales como, por ejemplo, hongos o bacterias rizobio, micorrizas y/o endofítica y/o a una mejor fijación de nitrógeno.

Los compuestos de la fórmula (I) son adecuados para la protección de semillas de cualquier variedad de planta que se usa en la agricultura, en el invernadero, en bosques o en horticultura. En particular, esto adopta la forma de semilla de cereales (por ejemplo, trigo, cebada, centeno, mijo y avena), maíz, algodón, semillas de sojas, arroz, patatas, girasol, café, tabaco, canola, semilla de colza, remolacha (por ejemplo remolacha azucarera y forrajera), maní, vegetales (por ejemplo, tomates, pepinos, frijol, vegetales crucíferos, cebollas y lechugas), plantas de frutas, pastos y plantas ornamentales. El tratamiento de la semilla de cereales (tales como trigo, cebada, centeno y avena), maíz, semillas de sojas, algodón, canola, semilla de colza y arroz es de particular importancia.

Como ya se mencionó anteriormente, el tratamiento de semilla transgénica con un compuesto de la fórmula (I) también es de particular importancia. Esto adopta la forma de semillas de plantas que, como norma, comprenden al menos un gen heterólogo que gobierna la expresión de un polipéptido en particular con propiedades insecticidas y/o nematocidas. Los genes heterólogos en semilla transgénica pueden originar de microorganismos tales como Bacillus, Rhizobium, Pseudomonas, Serratia, Trichoderma, Clavibacter, Glomus o Gliocladium. La presente invención es particularmente adecuada para el tratamiento de semillas transgénicas que comprenden al menos un gen heterólogo que se origina de Bacillus sp. Particularmente se prefiere un gen heterólogo derivado de Bacillus thuringiensis.

En el contexto de la presente invención, el compuesto de la fórmula (I) se aplica a la semilla. Preferentemente, la

- semilla se trata en un estado en el que es lo suficientemente estable evitar el daño durante el tratamiento. En general, la semilla se puede tratar en cualquier momento de tiempo entre la cosecha y la siembra. La semilla generalmente usada se separó de la planta y no tiene mazorcas, cáscaras, tallos, recubrimientos, pelos o la pulpa de las frutas. Por ejemplo, es posible usar semillas que se cosecharon, limpiaron y secaron a un contenido de
- 5 humedad que permite el almacenaje. De manera alternativa, también es posible usar semillas que, luego del secado, fueron tratadas con, por ejemplo, agua y luego volverse a secar, por ejemplo cebarse. En el caso de semillas de arroz, también es posible usar semillas que se empaparon, por ejemplo en agua hasta determinada etapa del embrión de arroz ("etapa pecho de paloma"), estimulando la germinación y una emergencia más uniforme.
- Al tratar la semilla, generalmente se debe tener cuidado de que la cantidad del compuesto de la fórmula (I) aplicado a la semilla y/o la cantidad de aditivos adicionales se elija de forma tal que la germinación de la semilla no se vea afectada de forma adversa, o que la planta resultante no se dañe. Eso se debe asegurar particularmente en el caso de compuestos activos que pueden presentar efectos fitotóxicos en determinadas velocidades de aplicación.
- 10 En general, los compuestos de la fórmula (I) se aplican a la semilla en una formulación adecuada. El experto en la técnica conoce formulaciones y procesos adecuados para el tratamiento de semillas.
- 15 Los compuestos de la fórmula (I) se pueden convertir en las formulaciones de recubrimiento de semilla habituales, tales como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, espumas, lechadas u otras composiciones de recubrimiento para semillas, y también formulaciones de ULV.
- Estas formulaciones se preparan de forma conocida mezclando los compuestos de la fórmula (I) con aditivos habituales tales como, por ejemplo, extensores habituales y también solventes o diluyentes, colorantes, agentes humectantes, dispersantes, emulsionantes, antiespumantes, conservantes, espesantes secundarios, adhesivos, giberelinas y también agua.
- 20 Los colorantes que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención son todos colorantes que son habituales para tales efectos. Es posible usar pigmentos, que sean bastante solubles en agua o tintes que sean solubles en agua. Ejemplos incluyen los tintes conocidos por los nombres Rodamina B, C.I. pigmento rojo 112 y C.I. solvente rojo 1.
- 25 Los agentes humectantes útiles que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semilla útiles de acuerdo con la invención son todas las sustancias que promueven la humectación y que se usan convencionalmente para la formulación de compuestos agroquímicamente activos. Se da preferencia al uso de alquilnaftalenosulfonatos, tales como diisopropil o diisobutil naftalenosulfonatos.
- 30 Los agentes dispersantes y/o emulsionantes útiles que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semilla útiles de acuerdo con la invención son todos los dispersantes no iónicos, aniónico y catiónicos que se usan convencionalmente para la formulación de compuestos agroquímicamente activos. Se da preferencia al uso de dispersantes no iónicos o aniónicos o mezclas de dispersantes no iónicos o aniónicos. Los dispersantes no iónicos adecuados incluyen en particular polímeros de bloque de óxido de etileno/óxido de propileno, alquilfenol poliglicol éteres y trisrilfenol poliglicol éteres y los derivados fosfatados o sulfatados de estos. Los dispersantes aniónicos adecuados son en particular lignosulfonatos, sales de ácido poliacrílico y condensados de arilsulfonato/formaldehído.
- 35 Los agentes antiespumantes que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semilla útiles de acuerdo con la invención son todas las sustancias que inhiben la espuma que se usan convencionalmente para la formulación de compuestos agroquímicamente activos. Se da preferencia al uso de antiespumantes de silicona y estearato de magnesio.
- 40 Los conservantes que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semilla útiles de acuerdo con la invención son todas las sustancias que se usan con tales efectos en las composiciones agroquímicas. Ejemplos incluyen diclorofeno y bencil alcohol hemiformal.
- 45 Los espesantes secundarios que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semilla útiles de acuerdo con la invención son todas las sustancias que se pueden usar con tales efectos en las composiciones agroquímicas. Se prefieren los derivados de celulosa, derivados de ácido acrílico, xantana, arcillas modificadas y sílice finamente dividido.
- 50 Los adhesivos que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semilla útiles de acuerdo con la invención son todos los aglutinantes útiles en los productos de recubrimiento de semilla. Se pueden mencionar polivinilpirrolidona, polivinil acetato, polivinil alcohol y tilosa como preferidos.
- 55 Las giberelinas que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semilla que se pueden usar de acuerdo con la invención son preferentemente las giberelinas A1, A3 (= ácido giberélico), A4 y A7; el ácido giberélico se usa de manera especialmente preferida. Las giberelinas se conocen (véase, R. Wegler "Chemie der Pflanzenschutz- and Schädlingsbekämpfungsmittel", vol. 2, Springer Verlag, 1970, pp. 401-412).

Las formulaciones de recubrimiento de semilla útiles de acuerdo con la invención se pueden usar para tratar una amplia variedad de diferentes tipos de semillas sea directamente o después de la dilución previa con agua. Por ejemplo, los concentrados o las preparaciones que se pueden obtener a partir de estos por dilución con agua se pueden usar para recubrir la semilla de cereales, tales como trigo, cebada, centeno, avena y triticale y también la semilla de maíz, arroz, semilla de colza, arvejas, frijoles, algodón, girasol, semillas de soja y remolachas o una amplia variedad de diferentes semillas vegetales. Las formulaciones de recubrimiento de semillas útiles de acuerdo con la invención, o las formas de uso diluidas de estas, también se pueden usar para recubrir la semilla de plantas transgénicas.

Para el tratamiento de semillas con las formulaciones de recubrimiento de semilla útiles de acuerdo con la invención, o las formas de uso preparadas a partir de esto agregando agua, todas las unidades de mezcla útiles habitualmente para el recubrimiento de semillas son útiles. Específicamente, el procedimiento de recubrimiento de semilla debe colocar la semilla en un mezclador, que funciona por lotes o continuamente, agregar la cantidad deseada particular de formulaciones de recubrimiento de semilla, sea como tal o después de la dilución previa con agua y mezclar todo hasta que la formulación se distribuya homogéneamente en la semilla. Si corresponde, esto es seguido de una operación de secado.

La velocidad de aplicación de las formulaciones de recubrimiento de semilla útiles de acuerdo con la invención puede variar dentro de un amplio relativamente amplio. Es guiada por el contenido particular de los compuestos de la fórmula (I) en las formulaciones y por la semilla. Las tasas de aplicación del compuesto de fórmula (I) son generalmente entre 0,001 y 50 g por kilogramo de semilla, preferentemente entre 0,01 y 15 g por kilogramo de semilla.

Salud animal

En el campo de la salud animal, es decir, en el campo de medicina veterinaria, los compuestos de la fórmula (I) son activos contra parásitos animales, en particular ectoparásitos o endoparásitos. El término endoparásitos incluye en particular helmintos y protozoarios, tales como coccidia. Los ectoparásitos son típica y preferentemente artrópodos, en particular insectos y acáridos.

En el campo de la medicina veterinaria, los compuestos de la fórmula (I) son adecuados, con toxicidad de homeotermia favorable, para controlar parásitos que ocurren en reproducción animal y cría animal en animales de ganado, reproducción, de zoológico, laboratorio, experimentales o domésticos. Son activos contra todas las etapas o etapas específicas de desarrollo de los parásitos.

El ganado agrícola incluye, por ejemplo, mamíferos, tales como ovejas, cabras, caballos, burros, camellos, búfalos, conejos, renos, gamos, y en particular ganado y cerdos; o aves de corral tales como pavos, patos, gansos y en particular gallinas; peces y crustáceos, por ejemplo, en cultivo acuático; y también insectos tales como abejas.

Los animales domésticos incluyen, por ejemplo, mamíferos, tales como hámsteres, cobayos, ratas, ratones, chinchillas, hurones y en particular perros, gatos, aves enjauladas, reptiles, anfibios y peces de acuario.

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

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

Al usar los compuestos de la fórmula (I) para controlar parásitos de animales, se pretende reducir o evitar enfermedades, casos de muerte y reducciones de rendimiento (en el caso de carne, leche, lana, pieles, huevos, miel y similares), de modo de posibilitar un mantenimiento más económico y simple y se logre un mejor bienestar animal.

El término "control" o "controlar" como se usa en la presente respecto del campo de salud animal, significa que los compuestos de la fórmula (I) son eficaces para reducir la incidencia del parásito respectivo en un animal infectado con tales parásitos a niveles inocuos. Más específicamente, "controlar", como se usa en la presente, significa que el compuesto de la fórmula (I) es eficaz para matar el parásito respectivo, inhibir su crecimiento o inhibir su proliferación.

Los artrópodos incluyen:

del orden de Anoplurida, por ejemplo *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp., *Solenopotes* spp.; del orden de Mallophagida y los subórdenes de Amblycerina e Ischnocerina, por ejemplo *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp., *Felicola* spp.; del orden de Diptera y los subórdenes de Nematocerina y Brachycerina, por ejemplo *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp., *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides* spp., *Chrysops* spp., *Odagmia* spp., *Wilhelmia* spp., *Hybomitra* spp., *Atylotus* spp., *Tabanus* spp., *Haematopota* spp., *Philipomyia* spp., *Braula* spp., *Musca* spp., *Hydrotaea* spp., *Stomoxys* spp., *Haematobia* spp., *Morellia* spp., *Fannia* spp., *Glossina* spp., *Calliphora* spp., *Lucilia* spp., *Chrysomyia* spp., *Wohlfahrtia* spp., *Sarcophaga* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Gasterophilus* spp., *Hippobosca* spp.,

Lipoptena spp., Melophagus spp., Rhinoestrus spp., Tipula spp.; del orden de Siphonapterida, por ejemplo Pulex spp., Ctenocephalides spp., Tunga spp., Xenopsylla spp., Ceratophyllus spp.;

del orden de Heteropterida, por ejemplo Cimex spp., Triatoma spp., Rhodnius spp., Panstrongylus spp.; así como plagas problemáticas o de higiene del orden de Blattarida.

5 Los artrópodos incluyen además:

de la subclase de Acari (Acarina) y del orden de Metastigmata, por ejemplo de la familia tipo argasidae Argas spp., Ornithodoros spp., Otobius spp., de la familia tipo Ixodidae Ixodes spp., Amblyomma spp., Rhipicephalus (Boophilus) spp Dermacentor spp., Haemophysalis spp., Hyalomma spp., Rhipicephalus spp. (el género original de garrapatas de múltiples hospedadores); del orden tipo mesostigmata Dermanyssus spp., Ornithonyssus spp., Pneumonyssus spp., Raillietia spp., Pneumonyssus spp., Sternostoma spp., Varroa spp., Acarapis spp.; del orden de Actiniedida (Prostigmata), por ejemplo Acarapis spp., Cheyletiella spp., Ornithocheyletia spp., Myobia spp., Psorergates spp., Demodex spp., Trombicula spp., Neotrombicula spp., Listrophorus spp.; y del orden de Acaridida (Astigmata), por ejemplo Acarus spp., Tyrophagus spp., Caloglyphus spp., Hypodectes spp., Pterolichus spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Otodectes spp., Sarcoptes spp., Notoedres spp., Knemidocoptes spp., Cytodites spp., Laminosioptes spp.

Los protozoarios de parásitos incluyen:

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

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

Apicomplexa (Sporozoa) tal como Eimeridae, por ejemplo, Eimeria acervulina, E. adenoides, E. alabamensis, E. anatis, E. anserina, E. arloingi, E. ashata, E. auburnensis, E. bovis, E. brunetti, E. canis, E. chinchillae, E. clupearum, E. columbae, E. contorta, E. crandalis, E. deblickei, E. dispersa, E. ellipsoidales, E. falciformis, E. faurei, E. flavescens, E. gallopavonis, E. hagani, E. intestinalis, E. iroquoina, E. irresidua, E. labbeana, E. leucarti, E. magna, E. maxima, E. media, E. meleagridis, E. meleagritidis, E. mitis, E. necatrix, E. ninakohlyakimovae, E. ovis, E. parva, E. pavonis, E. perforans, E. phasani, E. piriformis, E. praecox, E. residua, E. scabra, E. spec., E. stiedai, E. suis, E. tenella, E. truncata, E. truttae, E. zuernii, Globidium spec., Isospora belli, I. canis, I. felis, I. ohioensis, I. rivolta, I. spec., I. suis, Cystisporidium spec., Cryptosporidium spec., en particular C. parvum; tal como Toxoplasmatidae, por ejemplo, Toxoplasma gondii, Hammondia heydornii, Neospora caninum, Besnoitia besnoitii; tal como Sarcocystidae, por ejemplo, Sarcocystis bovicanis, S. bovis, S. ovicanis, S. ovifelis, S. neurona, S. spec., S. suihominis, tal como Leucosporidia, por ejemplo, Leucozytozoon simondi, tal como Plasmodiidae, por ejemplo, Plasmodium berghei, P. falciparum, P. malariae, P. ovale, P. vivax, P. spec., tal como Piroplasma, por ejemplo, Babesia argentina, B. bovis, B. canis, B. spec., Theileria parva, Theileria spec., tal como Adeleina, por ejemplo, Hepatozoon canis, H. spec.

Endoparásitos patogénicos que son helmintos incluyen Platyhelmintha (por ejemplo Monogenea, cestodos y trematodos), nematodos, Acanthocephala, y Pentastoma, incluyendo:

Monogenea: por ejemplo: Gyrodactylus spp., Dactylogyrus spp., Polystoma spp.;

40 Cestodos: del orden de Pseudophyllidea por ejemplo: Diphyllbothrium spp., Spirometra spp., Schistocephalus spp., Ligula spp., Bothridium spp., Diplogonoporus spp.;

del orden de Cyclophyllida por ejemplo: Mesocestoides spp., Anoplocephala spp., Paranoplocephala spp., Moniezia spp., Thysanosoma spp., Thysaniezia spp., Avitellina spp., Stilesia spp., Cittotaenia spp., Andrya spp., Bertiella spp., Taenia spp., Echinococcus spp., Hydatigera spp., Davainea spp., Raillietina spp., Hymenolepis spp., Echinolepis spp., Echinocotyle spp., Diorchis spp., Dipylidium spp., Joyeuxiella spp., Diplopylidium spp.;

50 Trematodos: de la clase de Digenea por ejemplo: Diplostomum spp., Posthodiplostomum spp., Schistosoma spp., Trichobilharzia spp., Ornithobilharzia spp., Austrobilharzia spp., Gigantobilharzia spp., Leucochloridium spp., Brachylaima spp., Echinostoma spp., Echinoparyphium spp., Echinochasmus spp., Hypoderaeum spp., Fasciola spp., Fascioloides spp., Fasciolopsis spp., Cyclocoelum spp., Typhlocoelum spp., Paramphistomum spp., Calicophoron spp., Cotylophoron spp., Gigantocotyle spp., Fiscoederius spp., Gastrothylacus spp., Notocotylus spp., Catatropis spp., Plagiorchis spp., Prosthogonimus spp., Dicrocoelium spp., Eurytrema spp., Troglotrema spp., Paragonimus spp., Collyriclum spp., Nanophyetus spp., Opisthorchis spp., Clonorchis spp. Metorchis spp., Heterophyes spp., Metagonimus spp.;

55 Nematodos: Trichinellida zum Beispiel: Trichuris spp., Capillaria spp., Paracapillaria spp., Eucoleus spp., Trichosomoides spp., Trichinella spp.;

del orden de Tylenchida por ejemplo: *Micronema* spp., *Strongyloides* spp.;

del orden de Rhabditida por ejemplo: *Strongylus* spp., *Triodontophorus* spp., *Oesophagodontus* spp., *Trichonema* spp., *Gyalocephalus* spp., *Cylindropharynx* spp., *Poteriostomum* spp., *Cyclococercus* spp., *Cylicostephanus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Chabertia* spp., *Stephanurus* spp., *Ancylostoma* spp., *Uncinaria* spp., *Necator* spp., *Bunostomum* spp., *Globocephalus* spp., *Syngamus* spp., *Cyathostoma* spp., *Metastrongylus* spp., *Dictyocaulus* spp., *Muellerius* spp., *Protostrongylus* spp., *Neostrongylus* spp., *Cystocaulus* spp., *Pneumostrongylus* spp., *Spicocaulus* spp., *Elaphostrongylus* spp., *Parelaphostrongylus* spp., *Crenosoma* spp., *Paracrenosoma* spp., *Oslerus* spp., *Angiostrongylus* spp., *Aelurostrongylus* spp., *Filaroides* spp., *Parafilaroides* spp., *Trichostrongylus* spp., *Haemonchus* spp., *Ostertagia* spp., *Teladorsagia* spp., *Marshallagia* spp., *Cooperia* spp., *Nippostrongylus* spp., *Heligmosomoides* spp., *Nematodirus* spp., *Hyostongylus* spp., *Obeliscoides* spp., *Amidostomum* spp., *Ollulanus* spp.;

del orden de Spirurida, por ejemplo: *Oxyuris* spp., *Enterobius* spp., *Passalurus* spp., *Syphacia* spp., *Aspicularis* spp., *Heterakis* spp.; *Ascaris* spp., *Toxascaris* spp., *Toxocara* spp., *Baylisascaris* spp., *Parascaris* spp., *Anisakis* spp., *Ascaridia* spp.; *Gnathostoma* spp., *Physaloptera* spp., *Thelazia* spp., *Gongylonema* spp., *Habronema* spp., *Parabronema* spp., *Draschia* spp., *Dracunculus* spp.; *Stephanofilaria* spp., *Parafilaria* spp., *Setaria* spp., *Loa* spp., *Dirofilaria* spp., *Litomosoides* spp., *Brugia* spp., *Wuchereria* spp., *Onchocerca* spp., *Spirocerca* spp.;

Acanthocephala: del orden de Oligacanthorhynchida, por ejemplo: *Macracanthorhynchus* spp., *Prosthenorchis* spp.; del orden de Polymorphida, por ejemplo: *Filicollis* spp.; del orden de Moniliformida, por ejemplo: *Moniliformis* spp.;

del orden de Echinorhynchida, por ejemplo, *Acanthocephalus* spp., *Echinorhynchus* spp., *Leptorhynchoides* spp.;

Pentastoma: del orden de Porocephalida, por ejemplo, *Linguatula* spp.

En el campo veterinario y para mantener animales, la administración de los compuestos de la fórmula (I) se lleva a cabo por procedimientos conocidos generalmente en la técnica, tales como de forma entérica, parenteral, dérmica o nasal en forma de preparaciones adecuadas. La administración se puede llevar a cabo profiláctica o terapéuticamente.

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

Un aspecto adicional se refiere al uso de un compuesto de la fórmula (I) como un agente antiendoparasitario, en particular un agente helminticida o agente antiprotozoario. Los compuestos de la fórmula (I) son adecuados para usarse como un agente antiendoparasitario, en particular un agente helminticida o agente antiprotozoario, por ejemplo en la cría de animales, en la reproducción de animales, en el alojamiento de animales y en el sector de higiene.

Un aspecto adicional a su vez se refiere al uso de un compuesto de la fórmula (I) como antiectoparasitario, en particular un artropodocida tal como un insecticida o un acaricida. Un aspecto adicional se refiere al uso de un compuesto de la fórmula (I) como antiectoparasitario, en particular un artropodocida tal como un insecticida o un acaricida, por ejemplo, en cría de animales, en reproducción de animales, en establos en el sector de higiene.

Control de vector

Los compuestos de la fórmula (I) también se pueden usar en el control de vector. A efectos de la presente invención, un vector es un artrópodo, en particular un insecto o un arácnido, capaz de transmitir patógenos tales como, por ejemplo, virus, gusanos, organismos unicelulares y bacterias de un depósito (planta, animal, humano, etc.). Los patógenos se pueden transmitir mecánicamente (por ejemplo tracoma por moscas que no pican) a un hospedador o por inyección (por ejemplo, parásitos de malaria por mosquitos) en un hospedador.

Ejemplos de vectores y las enfermedades o patógenos que transmiten son:

1) Mosquitos

- *Anopheles*: malaria, filariasis;
- *Culex*: encefalitis japonesa, filariasis, otras enfermedades virales, transmisión de gusanos;
- *Aedes*: fiebre amarilla, fiebre del dengue, filariasis, otras enfermedades virales;
- *Simuliidae*: transmisión de gusanos, en particular *Onchocerca volvulus*;

2) Piojos: infecciones de piel, tifus epidémica;

3) Pulgas: peste, tifus endémica;

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

5) Ácaros: acariosis, tifus epidémica, rickettsialpox, tularemia, encefalitis de San Luis, encefalitis transmitida por garrapatas (TBE), fiebre hemorrágica de Crimea–Congo, borreliosis;

5 6) Garrapatas: borreliosis tales como *Borrelia duttoni*, encefalitis transmitida por garrapatas, fiebre Q (*Coxiella burnetii*), babesiosis (*Babesia canis canis*).

Ejemplos de vectores en el sentido de la presente invención son insectos, por ejemplo, áfidos, moscas, chicharritas o trips, que son capaces de transmitir virus de plantas a plantas. Otros vectores que pueden transmitir virus de plantas son los ácaros de araña, piojos, escarabajos y nematodos.

10 Ejemplos adicionales de vectores en el sentido de la presente invención son insectos y arácnidos tales como mosquitos, en particular del género *Aedes*, *Anopheles*, por ejemplo *A. gambiae*, *A. arabiensis*, *A. funestus*, *A. dirus* (malaria) y *Culex*, piojos, polillas, moscas, ácaros y garrapatas que pueden transmitir patógenos a animales y/o seres humanos.

El control de vectores también es posible si los compuestos de la fórmula (I) rompen la resistencia.

15 Los compuestos de la fórmula (I) son adecuados para usarse en la prevención de enfermedades y/o patógenos transmitidos por vectores. Por lo tanto, un aspecto adicional de la presente invención es el uso de compuestos de la fórmula (I) para el control de vectores, por ejemplo en la agricultura, horticultura, en jardines e instalaciones de recreación y también en la protección de materiales y productos almacenados.

Protección de materiales industriales

20 Los compuestos de la fórmula (I) son adecuados para proteger materiales industriales contra ataque o destrucción por insectos, por ejemplo, del orden Coleoptera, Hymenoptera, Isoptera, Lepidoptera, Psocoptera y Zygentoma.

Materiales industriales en el contexto de la presente se refieren a materiales inanimados, tales como preferentemente plásticos, adhesivos, colas, papeles y tarjetas, cuero, madera, productos de madera procesada y composiciones de recubrimiento. El uso de la invención para proteger madera es particularmente preferido.

25 En una realización adicional, los compuestos de la fórmula (I) se usan junto con al menos un insecticida adicional y/o al menos un fungicida.

En una realización adicional, los compuestos de la fórmula (I) están presentes como un pesticida pronto para usarse, es decir, se pueden aplicar al material en cuestión sin modificaciones adicionales. Insecticidas o fungicidas adicionales adecuados son en particular los mencionados anteriormente.

30 Sorprendentemente, también se encontró que los compuestos de la fórmula (I) se pueden utilizar para proteger objetos que entran en contacto con agua salada o agua salobre, en particular, cascos, pantallas, redes, edificios, amarraderos y sistemas de señalización, contra contaminaciones. Asimismo, los compuestos de la fórmula (I), solo o en combinaciones con otros compuestos activos, se pueden usar como agentes anticontaminantes.

Control de plagas de animales en el sector higiene

35 Los compuestos de la fórmula (I) son adecuados para controlar plagas de animales en el sector higiene. En particular, la invención se puede aplicar en el sector doméstico, en el sector higiene y en la protección de productos almacenados, especialmente para controlar insectos, arácnidos y ácaros encontrados en espacios cerrados tales como viviendas, corredores de fábricas, oficinas, cabinas de vehículos. Para controlar plagas de animales, los compuestos de la fórmula (I) se usan solos o en combinación con otros compuestos activos y/o auxiliares. Se usan preferentemente en productos insecticidas domésticos. Los compuestos de la fórmula (I) son eficaces contra especies sensibles y resistentes, y contra todas las etapas de desarrollo.

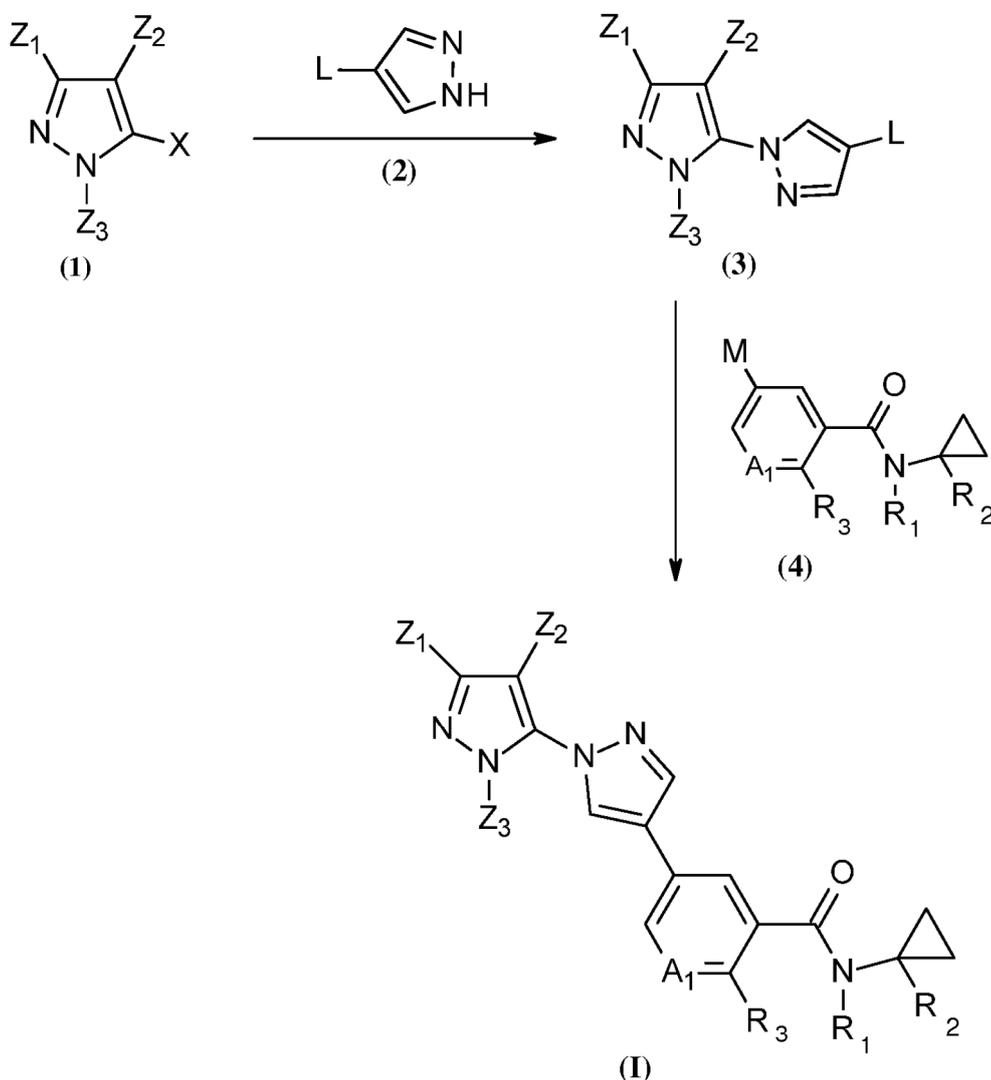
Estas plagas incluyen, por ejemplo, plagas de la clase Arachnida, del orden Escorpiones, Araneae y Opiliones, de las clases Chilopoda y Diplopoda, de la clase Insecta del orden Blattodea, del orden Coleoptera, Dermaptera, Diptera, Heteroptera, Hymenoptera, Isoptera, Lepidoptera, Phthiraptera, Psocoptera, Saltatoria u Orthoptera, Siphonaptera y Zygentoma y de la clase Malacostraca del orden Isopoda.

45 Se usan, por ejemplo, en aerosoles, productos de pulverización sin presión, por ejemplo pulverizadores de bomba o atomizador, sistemas de niebla automáticos, formadores de niebla, espumas, geles, productos evaporadores con tabletas de evaporación hechas de celulosa o plástico, evaporadores líquidos, evaporadores de gel y membrana, evaporadores impulsados por propulsor, sistemas de evaporación libres de energía o pasivos, papel de polilla, bolsa de polilla y geles de polilla, como gránulos o polvos, en cebos para esparcir o en estaciones de cebos.

50 Esquemas de reacción

Los compuestos de la invención se pueden hacer por los siguientes procedimientos.

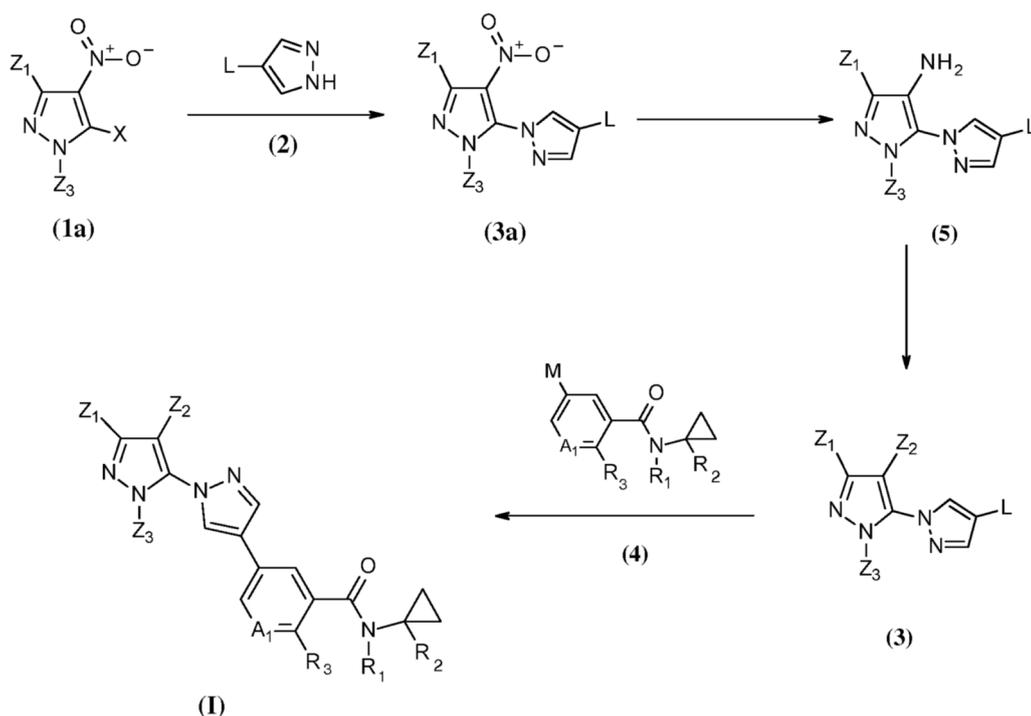
La vía de síntesis para compuestos de la invención (I) en los que Z_2 representa $-S(O)_{1-2}-(C_1-C_2)$ -alquilo, (C_1-C_2) -halogenalquilo, o nitro (NO_2), se muestra a continuación.



5 Z_1 , Z_3 , R_1 , R_2 , R_3 y A_1 representan los residuos antes mencionados. L representa bromo o yodo, mientras que M representa ácido borónico, ésteres de ácido borónico o trifluoroboronato. Z_2 representa $-S(O)_{1-2}-(C_1-C_2)$ -alquilo, (C_1-C_2) -halogenalquilo, o nitro (NO_2). X representa un grupo saliente adecuado como cloruro o fluoruro.

10 Compuestos de fórmula (I) en los que Z_2 representa $-S(O)_{1-2}-(C_1-C_2)$ -alquilo, (C_1-C_2) -halogenalquilo, o nitro (NO_2) se pueden sintetizar por reacciones catalizadas de metal de transición (por ejemplo, paladio) de un compuesto de fórmula (3) con un compuesto de la fórmula (4). Esas reacciones se pueden realizar en analogía a procedimientos descritos en la literatura [véase, por ejemplo: WO2005-040110; WO2009-089508]. Los compuestos de la fórmula (4) están comercialmente disponibles o se pueden sintetizar en analogía a procedimientos conocidos de la literatura. Los compuestos de fórmula (3) se pueden preparar en una sustitución nucleofílica de compuestos de fórmula (1) y un derivado de pirazol correspondiente (2). Ejemplos de reacciones similares se describen en la literatura [véase, por ejemplo: European Chemical Bulletin 2013, 2 (12), 981-984; Monatshefte fuer Chemie 1981, 112 (5), 675-678].
15 Las vías de síntesis general de los compuestos de fórmula (1) se describen más adelante en el presente capítulo.

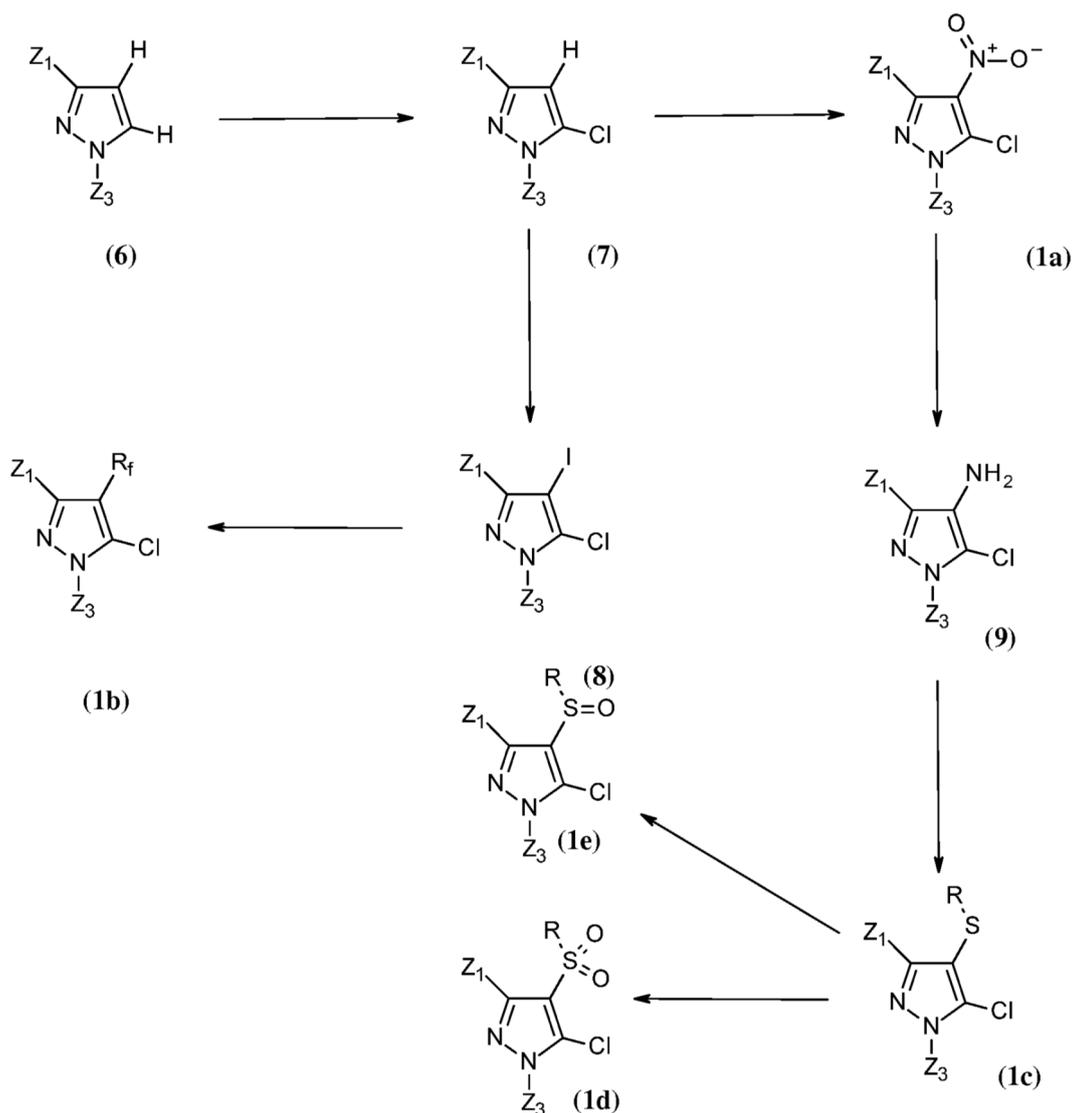
Un ejemplo de una vía de síntesis para compuestos de la invención (I) en los que Z_2 representa $-S-(C_1-C_2)$ -alquilo se muestra a continuación.



Z_1 , Z_3 , R_1 , R_2 , R_3 y A_1 representan los residuos descritos anteriormente. Z_2 representa $-\text{S}-(\text{C}_1-\text{C}_2)$ -alquilo, L representa bromo o yodo, mientras que M representa ácido borónico, ésteres de ácido borónico o trifluoroboronato. X representa un grupo saliente adecuado como cloruro o fluoruro.

- 5 Compuestos de fórmula (I) en los que Z_2 representa $-\text{S}-(\text{C}_1-\text{C}_2)$ -alquilo se pueden sintetizar por reacciones catalizadas de metal de transición (por ejemplo, paladio) de un compuesto de fórmula (3) con un compuesto de la fórmula (4). Esas reacciones se pueden realizar en analogía a procedimientos descritos en la literatura [véase, por ejemplo: WO2005-040110; WO2009-089508]. Los compuestos de la fórmula (4) están comercialmente disponibles o se pueden sintetizar en analogía a procedimientos conocidos de la literatura. Los compuestos de fórmula (3) se pueden sintetizar en analogía a los procedimientos conocidos en la literatura a partir de compuestos de fórmula (5) [véase, por ejemplo: WO2013-092522]. Los compuestos de fórmula (5) se pueden preparar mediante la reducción de compuestos de fórmula (3a). Los agentes de reducción adecuados pueden ser cloruro de estaño(II) o hierro(0). Ejemplos se describen ampliamente en la literatura [véase, por ejemplo: Fe(0) WO2012-062783 o WO2014-023258; véase, por ejemplo: Sn(II)Cl₂ WO2009-056556 o WO2002-016364]. Los compuestos de fórmula (3a) se pueden preparar en una sustitución nucleofílica a partir de compuestos de fórmula (1a) y un derivado de pirazol correspondiente (2) como se describe anteriormente en la síntesis de (3). A continuación se describe la vía de síntesis general de los compuestos de fórmula (1a).
- 10
- 15

A continuación se muestran las síntesis generales de los intermedios centrales (1a) – (1e).

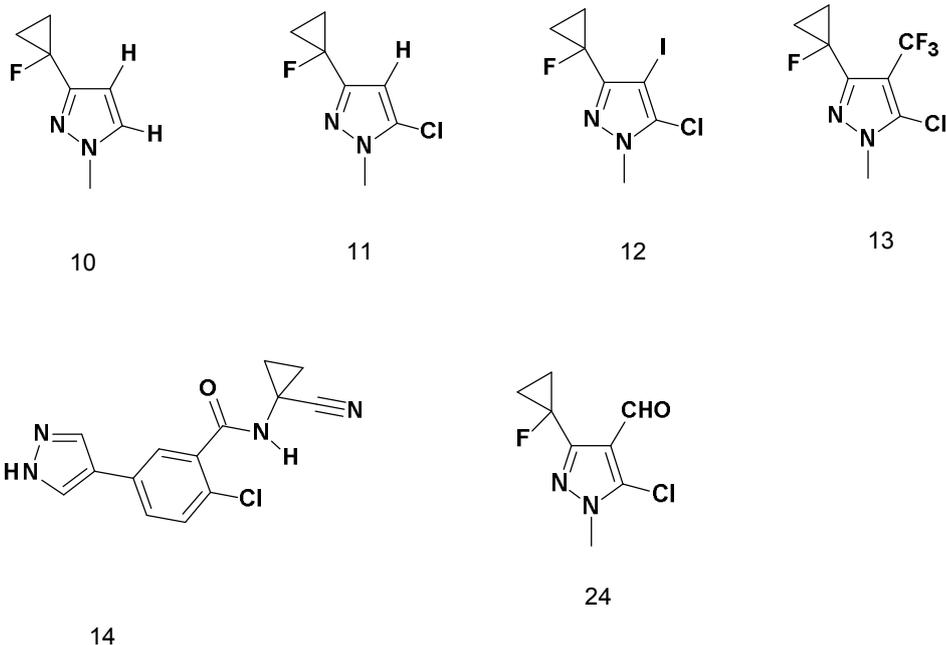


5 Los compuestos de fórmula (1d) y (1e) se pueden sintetizar por oxidación de los compuestos de fórmula (1c). Los oxidantes adecuados son, por ejemplo, ácido m-cloroperbenzoico y peróxido de hidrógeno. Los procedimientos adecuados ya se describieron en la literatura [véase, por ejemplo: oxidación a sulfona: WO2013-018804; WO2007-138050; oxidación a sulfóxido: WO2010-035915; WO2007-138050].

10 Los compuestos de fórmula (1c) se pueden sintetizar en analogía a los procedimientos conocidos en la literatura a partir de compuestos de fórmula (9) [véase, por ejemplo: WO2013-092522]. Los compuestos de fórmula (9) se pueden sintetizar en analogía a los procedimientos conocidos en la literatura a partir de compuestos de fórmula (1a) como se describe anteriormente en la síntesis de (5). Los compuestos de fórmula (1a) se pueden preparar comenzando por compuestos de fórmula (7) por una reacción de nitración. Reacciones similares se describen en la literatura [véase, por ejemplo: EP1987-110490; DE1985-3528478]. Los compuestos de fórmula (7) se pueden preparar comenzando por compuestos de fórmula (6) por una reacción de cloración. Reacciones similares se describen en la literatura [véase, por ejemplo: WO2012-062783; WO2011-131615].

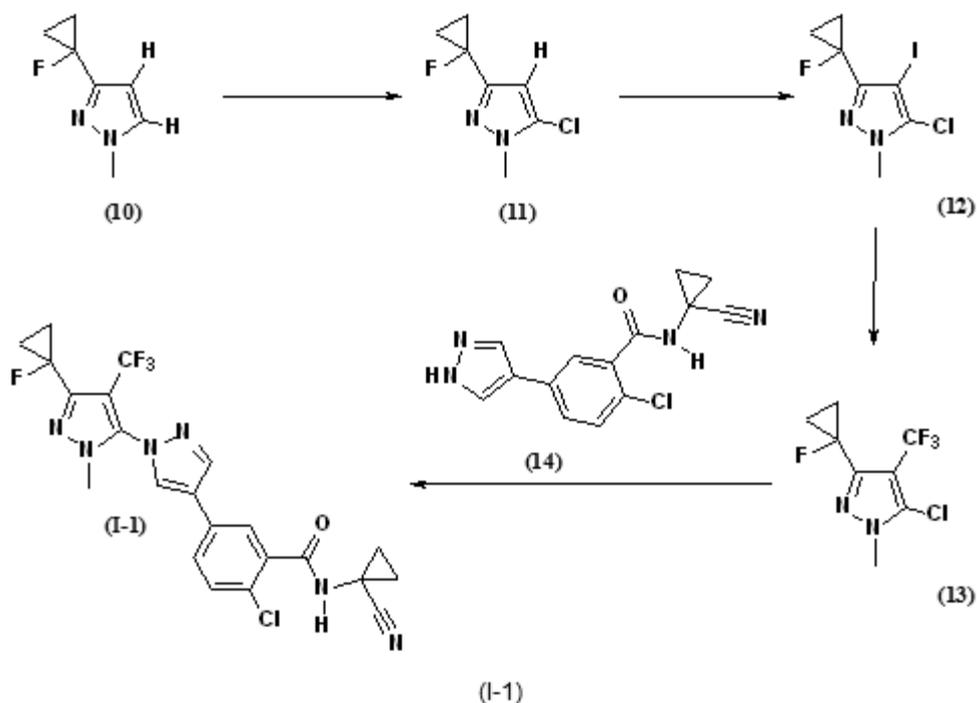
15 Los compuestos de fórmula (1b) se pueden sintetizar a partir de compuestos de fórmula (8). Reacciones similares se describen en la literatura [véase, por ejemplo: WO2010-051926, WO2005-095351]. Los compuestos de fórmula (8) se pueden sintetizar por yodación a partir de compuestos de fórmula (7). Reacciones similares se describen en la literatura [véase, por ejemplo: WO2010-051926, WO2008-098104].

Una realización preferida de la presente invención se refiere a cualquiera de los intermedios



Parte experimental

Síntesis de 2-cloro-N-(1-cianociclopropil)-5-[5'-(1-fluorociclopropil)-2'-metil-4'-(trifluorometil)-2'H-1,3'-bipirazol-4-il]benzamida (I-1)



5

5-cloro-3-(1-fluorociclopropil)-1-metil-1H-pirazol (11)

Se disolvieron 840 mg (5,99 mmol) 3-(1-fluorociclopropil)-1-metil-1H-pirazol en 10 ml de THF abs. en atmósfera de argón y se enfriaron a -75 °C. La solución se trató por goteo con 5,62 ml (8,99 mmol) de n-butillitio como una solución 1,6 M en hexanos. La mezcla se agitó durante 30 minutos a -75 °C. Se disolvieron 1,70 g (7,19 mmol) de hexcloroetano en 10 ml de THF abs. en atmósfera de argón y se enfriaron a -75 °C. La mezcla de reacción de pirazol se transfirieron lentamente mediante una cánula de Teflón a la solución de hexacloroetano enfriado. La mezcla de reacción combinada se agitó 1h a -75 °C. La reacción se inactivó mediante la adición de solución de carbonato de sodio saturado. La mezcla de reacción se calentó hasta temperatura ambiente. El producto bruto se extrajo varias

10

veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre MgSO₄, filtraron y concentraron al vacío (máx. 35 °C; > 80 mbar). El residuo se purificó por cromatografía ultrarrápida en SiO₂.

Se aislaron 535 mg de 5-cloro-3-(1-fluorociclopropil)-1-metil-1*H*-pirazol (**11**) como una mezcla 1:1 con 3-(1-fluorociclopropil)-1-metil-1*H*-pirazol como un líquido amarillo.

5 GC-MS[™]): Índice = 1128, Masa (m/z) = 174 [M]⁺.

¹H-RMN (400 MHz, DMSO-d₆): 6,51 (s, 1H), 3,76 (s, 3H), 1,45 – 1,30 (m, 2H), 1,10 – 1,00 (m, 2H).

5-cloro-3-(1-fluorociclopropil)-4-yodo-1-metil-1*H*-pirazol (12)

10 La mezcla que antecede (535 mg) se disolvió en 5 ml de MeCN. Se agregaron 266 mg de I₂ (1,05 mmol) y 479 mg (NH₄)Ce(NO₂)₆ (0,87 mmol) y la mezcla se agitó a reflujo durante 3 °h y se siguió agitando a temperatura ambiente durante la noche. La mezcla se dividió entre H₂O y EtOAc. La capa orgánica se lavó con Na₂S₂O₃ ac. y se secó sobre MgSO₄. El solvente se evaporó.

Se aislaron 863 mg de 5-cloro-3-(1-fluorociclopropil)-4-yodo-1-metil-1*H*-pirazol (**12**) como una mezcla con 3-(1-fluorociclopropil)-4-yodo-1-metil-1*H*-pirazol y se usaron en el siguiente paso sin purificación.

15 GC-MS[™]): Índice = 1490, Masa (m/z) = 300 [M]⁺.

¹H-RMN (400 MHz, DMSO-d₆): 3,86 (s, 3H), 1,41 – 1,31 (m, 2H), 1,06 – 0,99.

5-cloro-3-(1-fluorociclopropil)-1-metil-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol (13)

20 Se disolvieron 665 mg de CuI (3,49 mmol) y 162 mg de KF (2,80 mmol) en 6 ml de DMF abs. y la solución se saturó con argón. Se agregaron 700 mg de la mezcla aislada anterior de (**12**) y 994 mg de Trimetil(trifluorometil)silan y la mezcla se agitó a 80 °C durante 6 °h. La mezcla se diluyó con EtOAc y se filtró con un tapón de SiO₂. El filtrado se lavó con H₂O y la capa orgánica se secó sobre MgSO₄. El solvente se evaporó.

Se aislaron 776 mg de 5-cloro-3-(1-fluorociclopropil)-1-metil-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol bruto (**13**) como un líquido pardo.

GC-MS[™]): Índice = 1195, Masa (m/z) = 242 [M]⁺.

2-cloro-*N*-(1-cianociclopropil)-5-[5'-(1-fluorociclopropil)-2'-metil-4'-(trifluorometil)-2'*H*-1,3'-bipirazol-4-il]benzamida (I-1)

25 Se disolvieron 300 mg de 5-cloro-3-(1-fluorociclopropil)-1-metil-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol (**13**), 121 mg de 2-cloro-*N*-(1-cianociclopropil)-5-(1*H*-pirazol-4-il)benzamida (**14**) (0,42 mmol) y 342 mg de Cs₂CO₃ (1,05 mmol) en 10 ml de DMF abs. en una atmósfera de argón. La mezcla se agitó a 80 °C durante la noche. La mezcla se diluyó con EtOAc y se agregó NH₄Cl ac. La mezcla se extrajo con EtOAc. La capa orgánica combinada se lavó con H₂O y salmuera y se secó sobre MgSO₄. El solvente se evaporó y el residuo se purificó por cromatografía ultrarrápida y HPLC.

3 mg de 2-cloro-*N*-(1-cianociclopropil)-5-[5'-(1-fluorociclopropil)-2'-metil-4'-(trifluorometil)-2'*H*-1,3'-bipirazol-4-il]benzamida (I-1) se aislaron como resina incolora.

HPLC-MS[™]): referirse a la Tabla 1

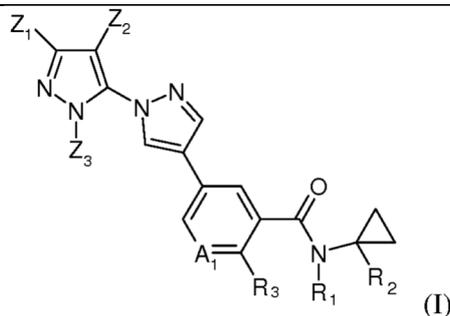
Datos de ¹H-RMN: referirse a la lista de picos.

35

Tabla 1

Ej. n.º	Z ¹	Z ²	Z ³	A ₁	R ¹	R ₂	R ₃	logP ^{*)}	Masa [m/z] ^{*)}
I-1	1-fluorociclopropilo	CF ₃	Me	CH	H	CN	Cl	3,09	493
I-2	1-fluorociclopropilo	CF ₂ H	Me	CH	H	CN	Cl	2,78	475

(continuación)



Ej. n.º	Z ¹	Z ²	Z ³	A ₁	R ¹	R ₂	R ₃	logP ^{*)}	Masa [m/z] ^{*)}
I-3	1-fluorociclopropilo	CF ₂ H	Me	CH	H	H	Cl	2,81	450
I-4	1-fluorociclopropilo	NO ₂	Me	CH	H	CN	Cl	2,69	470
I-5	1-fluorociclopropilo	NO ₂	Me	CH	H	H	Cl	2,70	445
I-6	1-bromociclopropilo	NO ₂	Me	CH	H	H	Cl	2,98	505
I-7	1-clorociclopropilo	CF ₂ H	Me	CH	H	CN	Cl	2,96	491
I-8	1-clorociclopropilo	CF ₂ H	Me	CH	H	H	Cl	3,05	466
I-9	1-clorociclopropilo	CF ₂ H	Me	N	H	CN	Cl	2,63	492
I-10	1-clorociclopropilo	CF ₂ H	Me	N	H	H	Cl	2,60	467
I-11	1-fluorociclopropilo	CF ₂ H	Me	N	H	CN	Cl	2,44	476
I-12	1-fluorociclopropilo	CF ₂ H	Me	N	H	H	Cl	2,42	451

La masa establecida es el pico del patrón de isotipo del ion [M+H]⁺ de mayor intensidad; si se detecta el ion [M-H]⁻, la masa establecida se marca con ².

5 ² La masa establecida es el pico del patrón de isotipo del ion [M-H]⁻ de mayor intensidad. Si la masa se determinó por medición GCMS (véase a continuación los procedimientos), la masa establecida se marca con ³.

10 ^{*)} Nota respecto de la determinación de los valores logP y la detección de masa: La determinación de los valores logP dados se llevaron a cabo de acuerdo con la directiva EEC 79/831 Annex V.A8 por HPLC (cromatografía líquida de alto rendimiento) en una columna de fase inversa (C18). Sistema Agilent 1100 LC; 50*4.6 Zorbax Eclipse Plus C18 1,8 micrones; fase móvil A: acetonitrilo (0,1 % de ácido fórmico); fase móvil B: agua (0,09 % de ácido fórmico); gradiente lineal de 10 % de acetonitrilo a 95 % de acetonitrilo en 4,25 min, luego 95 % de acetonitrilo durante otros 1,25 min; temperatura de horno 55 °C; velocidad de flujo: 2.0 ml/min. Detección de masa se lleva a cabo mediante un sistema Agilent MSD.

^{**) Agilent 6890 GC, HP5979 MSD, 10m DB-1, iD=0,18 mm, FILM=0,4 µm, lny.: 250 °C, flujo const.: 1,6 mm/min He, Det.:MSD: 280 °C, FID: 320 °C, Horno: 50 °C(1 min) - 40 °C/min - 320 °C (3,25 min)}

15 Datos de RMN de ejemplos seleccionados

Procedimiento de lista de pico RMN

Los datos de 1H-RMN de ejemplos seleccionados se escriben en la forma de listas de picos de 1H-RMN. Para cada pico de señal se enumera el valor δ en ppm y la intensidad de señal en paréntesis curvo. Entre el valor δ- pares de intensidad de señal hay punto y coma como delimitador.

20 La lista de pico de un ejemplo por lo tanto tiene la forma:

δ_1 (intensidad₁); δ_2 (intensidad₂);.....; δ_i (intensidad_i);.....; δ_n (intensidad_n)

La intensidad de señales agudas se correlaciona con la altura de las señales en un ejemplo impreso de un espectro de RMN en cm y muestra las relaciones reales de intensidades de señal. De señales amplias se pueden mostrar varios picos o el medio de la señal y su intensidad relativa en comparación con la señal más intensiva en el espectro.

5

Para calibrar el cambio químico para espectro ¹H, usamos tetrametilsilano y/o el cambio químico del solvente usado, especialmente en el caso de espectros medidos en DMSO. Por lo tanto en listas de picos de RMN, el pico de tetrametilsilano puede ocurrir pero no necesariamente.

Las listas de picos ¹H-RMN son similares a impresiones de ¹H-RMN clásicas y por lo tanto generalmente contiene todos los picos, que se enumeran en interpretación de RMN clásica.

10

Adicionalmente pueden mostrar señales de impresiones de ¹H-RMN clásicas de solventes, estereoisómeros de los compuestos objetivo, que también son objeto de la invención y/o picos de impurezas.

Para mostrar las señales de compuesto en el intervalo delta de solventes y/o agua los picos generales de solventes, por ejemplo picos de DMSO en DMSO-D₆ y el pico de agua se muestran en nuestras listas de picos ¹H-RMN y generalmente tienen en promedio una alta intensidad.

15

Los picos de estereoisómeros de los compuestos objetivos y/o picos de impurezas generalmente tienen en promedio una intensidad menor que los picos de los compuestos objetivo (por ejemplo con una pureza >90 %).

Tales estereoisómeros y/o impurezas pueden ser típicos para el procedimiento de preparación específico. Por lo tanto sus picos pueden ayudar a reconocer la reproducción de nuestro procedimiento de preparación mediante "huellas de subproductos".

20

Un experto, que calcula los picos de los compuestos objetivo con procedimientos conocidos (MestreC, simulación ACD, pero también con valores de expectación evaluados empíricamente) pueden aislar los picos de los compuestos objetivos según se necesite opcionalmente usando filtros de intensidad adicional. Este aislamiento sería similar a una elección de pico relevante a una interpretación de ¹H-RMN clásica.

Detalles adicionales de la descripción de datos de RMN con listas de picos se encuentran en la solicitud "Citation of RMN Peaklist Data within Patent Applications" de la base de datos de investigación de descripción número 564025.

25

Ejemplo I-1: ¹H-RMN(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9.447(2.3);8.806(3.1);8.535(3.4);8.337(0.4);8.317(1.1);7.832(0.6);7.827(1.7);7.823(2.4);7.817(2.2);7.810(1.6);7.804(0.8);7.589(2.0);7.579(0.4);7.567(1.7);6.578(2.2);5.396(1.0);3.687(7.7);3.328(330.5);2.718(0.8);2.675(2.3);2.671(3.2);2.666(2.4);2.541(2.0);2.524(8.0);2.511(180.1);2.506(368.9);2.502(488.4);2.497(360.3);2.493(179.7);2.333(2.3);2.329(3.2);2.324(2.4);2.075(2.0);1.621(0.9);1.607(2.0);1.599(2.2);1.586(1.0);1.514(0.4);1.497(1.1);1.493(1.1);1.478(0.5);1.468(0.5);1.452(1.1);1.448(1.2);1.432(0.6);1.411(1.0);1.285(1.1);1.270(4.2);1.251(1.2);1.233(1.8);1.217(1.6);1.196(0.4);1.169(16.0);0.008(1.4);0.000(47.9);-0.009(1.9)

Ejemplo I-2: ¹H-RMN(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9.437(4.5);8.756(6.5);8.503(7.0);8.313(0.4);7.831(3.8);7.827(5.0);7.822(4.2);7.814(3.2);7.809(1.5);7.585(3.9);7.575(0.8);7.562(3.3);7.128(1.4);6.994(3.2);6.859(1.6);5.754(3.3);3.702(16.0);3.315(140.8);2.675(1.2);2.670(1.7);2.666(1.2);2.505(204.4);2.501(266.9);2.497(198.3);2.332(1.2);2.328(1.6);2.323(1.2);1.620(1.6);1.605(4.2);1.599(4.4);1.586(1.8);1.494(0.7);1.478(2.3);1.474(2.2);1.459(1.0);1.448(0.8);1.432(2.2);1.427(2.3);1.413(1.0);1.288(2.0);1.274(4.2);1.267(4.6);1.253(1.7);1.236(0.4);1.221(1.0);1.205(2.6);1.200(3.3);1.184(3.0);1.163(0.7);0.008(0.3);0.000(8.5)

Ejemplo I-3: ¹H-RMN(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ = 8.733(6.8);8.528(2.2);8.517(2.4);8.490(7.3);8.312(0.6);7.778(1.3);7.772(3.8);7.768(5.1);7.763(4.7);7.756(3.6);7.750(1.6);7.535(4.3);7.525(0.8);7.512(3.6);7.126(1.5);6.991(3.4);6.856(1.6);5.753(0.8);3.722(0.7);3.706(16.0);3.317(224.2);2.862(0.7);2.853(0.9);2.844(1.5);2.834(1.4);2.825(0.9);2.816(0.7);2.675(1.0);2.670(1.4);2.666(1.0);2.523(4.3);2.510(86.6);2.506(174.2);2.501(231.1);2.497(170.0);2.492(85.2);2.337(0.5);2.332(1.0);2.328(1.4);2.323(1.0);1.492(0.7);1.477(2.3);1.472(2.3);1.457(1.0);1.447(0.8);1.431(2.2);1.426(2.3);1.411(1.0);1.296(0.4);1.221(0.9);1.205(2.5);1.200(3.2);1.184(3.0);1.180(2.5);1.163(0.7);0.732(0.9);0.719(2.6);0.714(3.7);0.702(3.4);0.696(2.9);0.685(1.2);0.564(1.2);0.553(3.6);0.547(3.3);0.543(3.1);0.537(3.0);0.525(1.0);0.000(5.3)

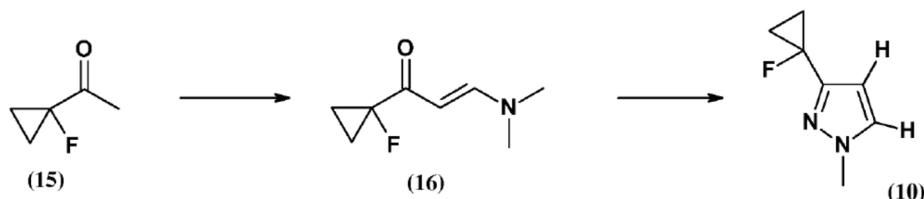
Ejemplo I-4: ¹H-RMN(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9.470(4.3);8.903(6.3);8.591(6.3);8.317(0.6);7.832(1.3);7.826(2.4);7.815(3.3);7.809(7.7);7.607(3.4);7.600(0.9);7.590(0.7);7.584(2.8);3.798(16.0);3.329(231.5);2.675(1.2);2.671(1.6);2.666(1.3);2.524(4.0);2.510(90.3);2.506(185.0);2.502(246.5);2.497(184.6);2.493(93.9);2.333(1.1);2.329(1.6);2.324(1.2);2.075(3.1);1.622(1.4);1.608(3.6);1.601(3.9);1.588(1.7);1.529(0.6);1.508(1.8);1.492(0.8);1.484(0.7);1.463(1.9);1.447(0.8);1.288(2.3);1.273(5.3);1.268(6.3);1.252(3.6);1.230(0.6);0.008(0.5);0.000(15.5);-0.008(0.7)

(continuación)

Ejemplo I-5: ¹ H-RMN(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.885(6.1);8.579(6.2);8.563(2.1);8.551(2.1);7.773(1.4);7.767(2.2);7.749(8.7);7.557(2.7);7.535(2.2);3.799(16.0);3.332(77.1);2.862(0.6);2.853(0.9);2.844(1.3);2.834(1.3);2.826(0.9);2.816(0.6);2.675(0.4);2.671(0.6);2.667(0.4);2.506(64.1);2.502(84.3);2.498(65.6);2.333(0.4);2.329(0.5);2.325(0.4);2.075(0.5);1.529(0.6);1.508(2.0);1.492(0.9);1.484(0.8);1.462(2.1);1.447(0.9);1.290(0.8);1.269(2.8);1.252(2.6);1.231(0.6);0.734(0.8);0.721(2.4);0.716(3.3);0.704(3.1);0.698(2.7);0.687(1.1);0.562(1.0);0.551(3.2);0.545(3.2);0.536(2.9);0.524(0.9);0.000(28.3)
Ejemplo I-6: ¹ H-RMN(600.1 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.883(4.7);8.565(4.8);8.547(1.6);8.540(1.7);7.766(1.4);7.762(1.8);7.752(0.9);7.748(4.8);7.744(1.8);7.548(2.4);7.5344(2.1);7.5337(2.0);5.755(6.9);4.015(0.7);3.850(1.0);3.806(0.8);3.780(0.6);3.768(16.0);3.744(0.4);3.335(43.7);3.186(1.1);2.853(0.5);2.847(0.7);2.841(1.0);2.834(1.1);2.828(0.7);2.822(0.6);2.523(0.4);2.520(0.5);2.517(0.5);2.508(12.8);2.505(27.0);2.502(37.0);2.499(26.8);2.496(12.5);1.552(14.7);1.512(0.4);0.725(0.7);0.716(1.9);0.713(2.6);0.705(2.6);0.701(2.3);0.693(1.0);0.688(0.4);0.557(0.8);0.550(2.3);0.546(2.3);0.543(2.2);0.539(2.3);0.531(1.0);0.527(0.4);0.000(1.1)
Ejemplo I-7: ¹ H-RMN(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.433(4.4);8.747(5.8);8.493(6.1);8.482(0.6);8.313(0.9);7.820(4.9);7.814(3.9);7.806(3.0);7.801(1.8);7.581(3.2);7.572(0.8);7.559(2.8);7.181(1.3);7.047(3.0);6.912(1.5);4.056(0.9);4.038(2.5);4.020(2.5);4.002(0.8);3.810(0.4);3.750(0.7);3.692(16.0);3.313(209.1);2.670(2.9);2.505(315.8);2.501(413.5);2.497(328.8);2.328(2.7);1.988(10.3);1.618(1.5);1.604(4.0);1.597(4.3);1.584(1.8);1.454(15.5);1.426(0.9);1.398(0.4);1.286(1.8);1.272(4.2);1.266(4.3);1.251(1.6);1.235(0.5);1.193(2.8);1.175(5.5);1.157(2.7);1.069(0.4);0.146(0.5);0.000(106.1);-0.150(0.5)
Ejemplo I-8: ¹ H-RMN(601.6 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.724(5.6);8.518(2.0);8.511(2.1);8.481(5.8);7.761(3.5);7.758(4.6);7.755(3.7);7.750(2.8);7.746(1.3);7.529(3.0);7.523(0.7);7.520(0.6);7.514(2.8);7.134(1.2);7.044(2.8);6.955(1.3);5.754(3.4);3.711(0.6);3.694(16.0);3.335(0.4);3.311(142.8);2.853(0.5);2.846(0.8);2.841(1.2);2.834(1.2);2.828(0.8);2.822(0.6);2.615(0.8);2.612(1.1);2.609(0.8);2.521(2.1);2.518(2.6);2.515(2.9);2.503(122.5);2.500(162.2);2.497(124.2);2.384(1.1);2.382(0.8);1.453(11.7);0.722(0.8);0.714(2.4);0.711(3.1);0.702(3.0);0.699(2.5);0.691(0.9);0.556(0.9);0.549(3.0);0.545(3.0);0.542(2.8);0.539(2.8);0.531(0.8);0.000(6.2)
Ejemplo I-9: ¹ H-RMN(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.604(4.1);8.911(3.3);8.905(3.3);8.855(5.5);8.589(5.8);8.327(3.4);8.322(3.3);8.313(0.6);7.195(1.2);7.060(2.7);6.926(1.3);4.038(0.5);4.020(0.5);3.757(0.4);3.700(14.7);3.314(93.0);2.670(1.1);2.504(121.4);2.501(154.2);2.328(1.0);1.988(2.0);1.648(1.4);1.634(3.6);1.627(3.8);1.614(1.5);1.458(16.0);1.436(0.7);1.296(1.7);1.282(3.6);1.276(3.8);1.261(1.4);1.193(0.5);1.175(1.0);1.157(0.5);0.000(36.8)
Ejemplo I-10: ¹ H-RMN(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.855(3.3);8.849(3.4);8.839(5.2);8.690(1.9);8.680(1.9);8.582(5.3);8.252(3.2);8.246(3.1);7.191(1.2);7.056(2.6);6.922(1.3);5.753(2.2);3.717(0.7);3.702(13.6);3.685(0.4);3.314(38.5);2.873(0.5);2.864(0.7);2.855(1.1);2.845(1.1);2.837(0.8);2.827(0.5);2.671(0.5);2.505(54.4);2.501(70.5);2.497(55.5);2.328(0.4);1.988(1.3);1.457(16.0);1.413(0.4);1.356(0.6);1.193(0.4);1.175(0.7);1.157(0.4);0.759(0.7);0.746(2.2);0.741(2.8);0.729(2.7);0.724(2.3);0.712(0.9);0.568(0.9);0.558(2.8);0.551(2.8);0.542(2.4);0.530(0.7);0.000(16.9)
Ejemplo I-11: ¹ H-RMN(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.607(4.8);8.919(4.7);8.913(4.7);8.863(7.0);8.598(7.5);8.336(4.8);8.330(4.7);8.313(0.4);7.141(1.4);7.007(3.3);6.873(1.7);3.710(16.0);3.317(82.7);2.675(0.6);2.670(0.8);2.666(0.6);2.510(53.4);2.506(105.7);2.501(139.2);2.497(102.4);2.492(51.2);2.332(0.6);2.328(0.9);2.323(0.6);1.649(1.7);1.635(4.2);1.628(4.4);1.615(1.9);1.498(0.7);1.482(2.2);1.478(2.2);1.463(0.9);1.452(0.8);1.436(2.2);1.431(2.3);1.416(1.0);1.298(1.9);1.284(4.1);1.277(4.4);1.263(1.6);1.225(0.9);1.210(2.4);1.205(3.1);1.189(2.9);1.184(2.4);1.167(0.7);0.000(4.3)
Ejemplo I-12: ¹ H-RMN(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.863(4.6);8.857(4.8);8.847(6.9);8.695(2.1);8.684(2.1);8.606(0.3);8.591(7.3);8.313(0.5);8.260(4.5);8.254(4.4);7.138(1.5);7.004(3.3);6.869(1.6);5.753(5.1);3.727(0.7);3.712(16.0);3.325(127.6);3.320(106.7);2.874(0.7);2.865(0.9);2.856(1.4);2.846(1.4);2.837(0.9);2.828(0.7);2.675(0.7);2.670(1.0);2.666(0.7);2.506(122.3);2.501(160.1);2.497(117.6);2.332(0.7);2.328(1.0);2.324(0.7);1.497(0.7);1.481(2.3);1.476(2.2);1.461(0.9);1.451(0.8);1.434(2.2);1.430(2.3);1.415(1.0);1.225(1.0);1.209(2.5);1.205(3.2);1.189(3.0);1.167(0.7);0.760(0.9);0.747(2.7);0.742(3.6);0.730(3.5);0.724(2.8);0.713(1.1);0.569(1.2);0.558(3.5);0.552(3.3);0.543(3.0);0.531(0.9);0.000(4.4)

Preparación de los materiales de partida

Síntesis de 3-(1-fluorociclopropil)-1-metil-1H-pirazol (10)



(2E)-3-(dimetilamino)-1-(1-fluorociclopropil)prop-2-en-1-ona (16)

Se sintetizó (2E)-3-(dimetilamino)-1-(1-fluorociclopropil)prop-2-en-1-ona (16) como se describe para (2E)-3-(dimetilamino)-1-(ciclopropil)prop-2-en-1-ona en *J. Med. Chem.* 2011, 54, 7974 comenzando por (15).

5 HPLC-MS²: logP = 1,16, Masa (m/z) = 158 [M+H]⁺.

¹H-RMN (400 MHz, DMSO-d₆): 7,63 (d,1H), 5,47-5,43 (m,1H), 3,12 (s,3H), 2,84 (s,3H), 1,28-1,10 (m,4H)

3-(1-fluorociclopropil)-1-metil-1H-pirazol (10)

Se disolvieron 685 mg (4,35 mmol) de (2E)-3-(dimetilamino)-1-(1-fluorociclopropil)prop-2-en-1-ona (16) en 10 ml de EtOH y se agregaron 0,35 ml de metilhidrazina (6,53 mmol). La mezcla se agitó a 60 °C durante la noche. Se agregaron 1,16 ml de metilhidrazina (2,18 mmol) y se siguió agitando a 60 °C otras 5 h. La mezcla se enfrió a temperatura ambiente y el solvente se evaporó. El residuo se disolvió en EtOAc y la solución se lavó con solución de Na₂CO₃ acuoso saturado y salmuera. La capa orgánica se secó en MgSO₄ y el solvente se evaporó. El residuo se purificó por cromatografía ultrarrápida en SiO₂.

10 Se disolvieron 685 mg (4,35 mmol) de (2E)-3-(dimetilamino)-1-(1-fluorociclopropil)prop-2-en-1-ona (16) en 10 ml de EtOH y se agregaron 0,35 ml de metilhidrazina (6,53 mmol). La mezcla se agitó a 60 °C durante la noche. Se agregaron 1,16 ml de metilhidrazina (2,18 mmol) y se siguió agitando a 60 °C otras 5 h. La mezcla se enfrió a temperatura ambiente y el solvente se evaporó. El residuo se disolvió en EtOAc y la solución se lavó con solución de Na₂CO₃ acuoso saturado y salmuera. La capa orgánica se secó en MgSO₄ y el solvente se evaporó. El residuo se purificó por cromatografía ultrarrápida en SiO₂.

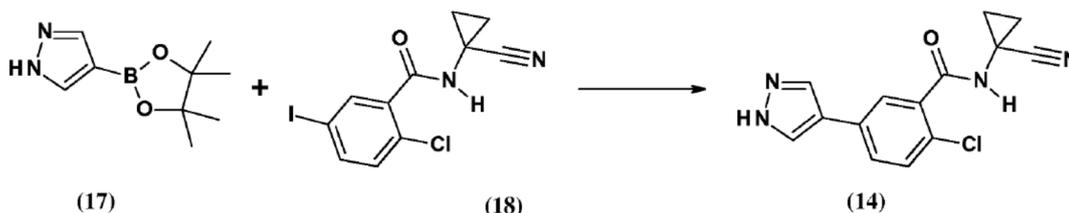
Se aislaron 156 mg de 3-(1-fluorociclopropil)-1-metil-1H-pirazol (10) como una mezcla 6:4 con 5-(1-fluorociclopropil)-1-metil-1H-pirazol como un líquido amarillo.

15 Se aislaron 156 mg de 3-(1-fluorociclopropil)-1-metil-1H-pirazol (10) como una mezcla 6:4 con 5-(1-fluorociclopropil)-1-metil-1H-pirazol como un líquido amarillo.

GC-MS²): Índice = 1086, Masa (m/z) = 140 [M]⁺.

¹H-RMN (400 MHz, DMSO-d₆): 7,67 (d,1H), 6,29 (d,1H), 3,79 (s,3H), 1,38 – 1,30 (m,2H), 1,07-1,00 (m,2H).

Síntesis de 2-cloro-N-(1-cianociclopropil)-5-(1H-pirazol-4-il)benzamida (14)



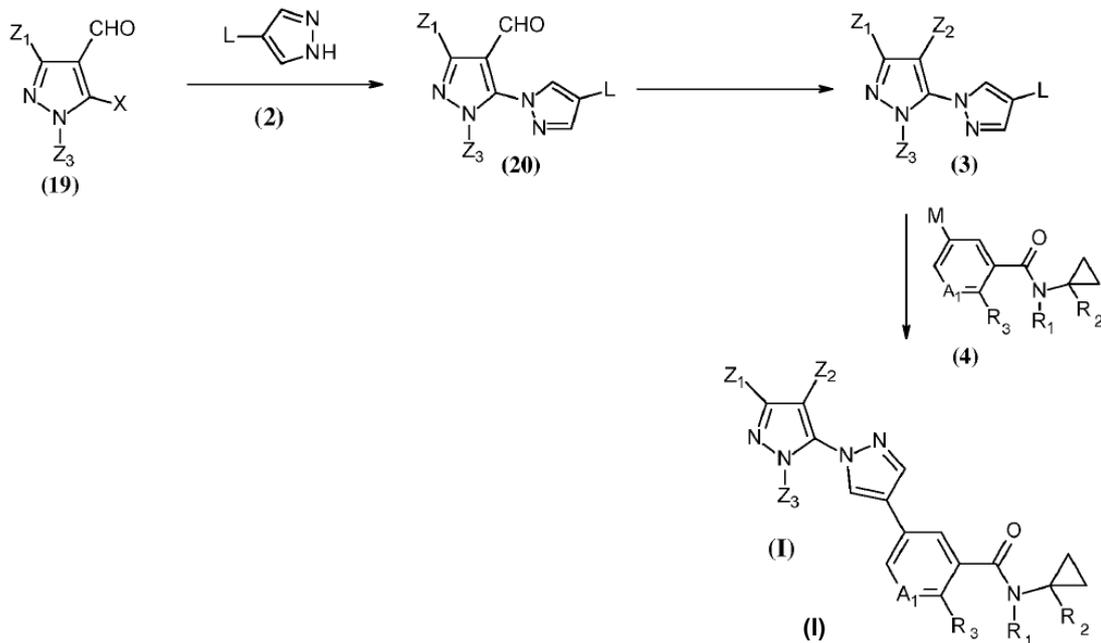
20 Se disolvieron 2,25 g de 4-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1H-pirazol (17) (11,5 mmol), 2,00 g de 2-cloro-N-(1-cianociclopropil)-5-yodobenzamida (18) (5,77 mmol) y 667 mg de Pd(PPh₃)₄ (1,16 mmol) en 186 ml de 2-propanol y se agregaron 18 ml de NaHCO₃ ac. 1 M. La mezcla se desgasificó y agitó a reflujo durante la noche. El solvente se evaporó y el residuo se disolvió en EtOAc. La capa orgánica se lavó con H₂O y salmuera, se secó sobre MgSO₄ y el solvente se evaporó. El residuo se purificó por cromatografía ultrarrápida en SiO₂.

25 Se aislaron 995 mg de 2-cloro-N-(1-cianociclopropil)-5-(1H-pirazol-4-il)benzamida (14) como un sólido incoloro.

HPLC-MS²): logP = 1,31, Masa (m/z) = 287 [M+H]⁺.

¹H-RMN (400 MHz, acetonitrile-d₃): 7,93 (s,2H), 7,66 – 7,59 (m,3H), 7,43 (d,1H), 1,59 - 1,56 (m,2H), 1,36 - 1,32 (m,2H).

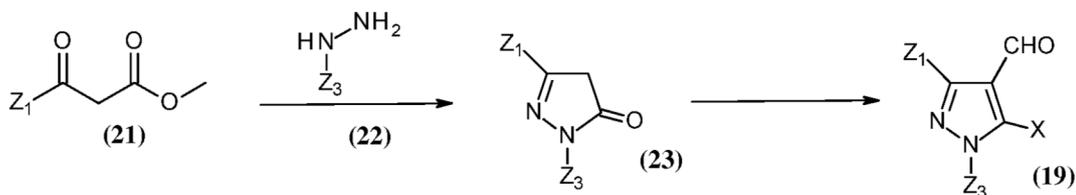
30 Un ejemplo para la síntesis de los compuestos de la invención (I) en los que Z₂ representa –CHF₂ se muestra a continuación.



Z₁, Z₃, R₁, R₂, R₃ y A₁ representan los residuos descritos anteriormente. Z₂ representa –CHF₂, L representa bromo o yodo, mientras que M representa ácido borónico, ésteres de ácido borónico o trifluoroboronato. X representa un grupo saliente adecuado como cloruro o fluoruro.

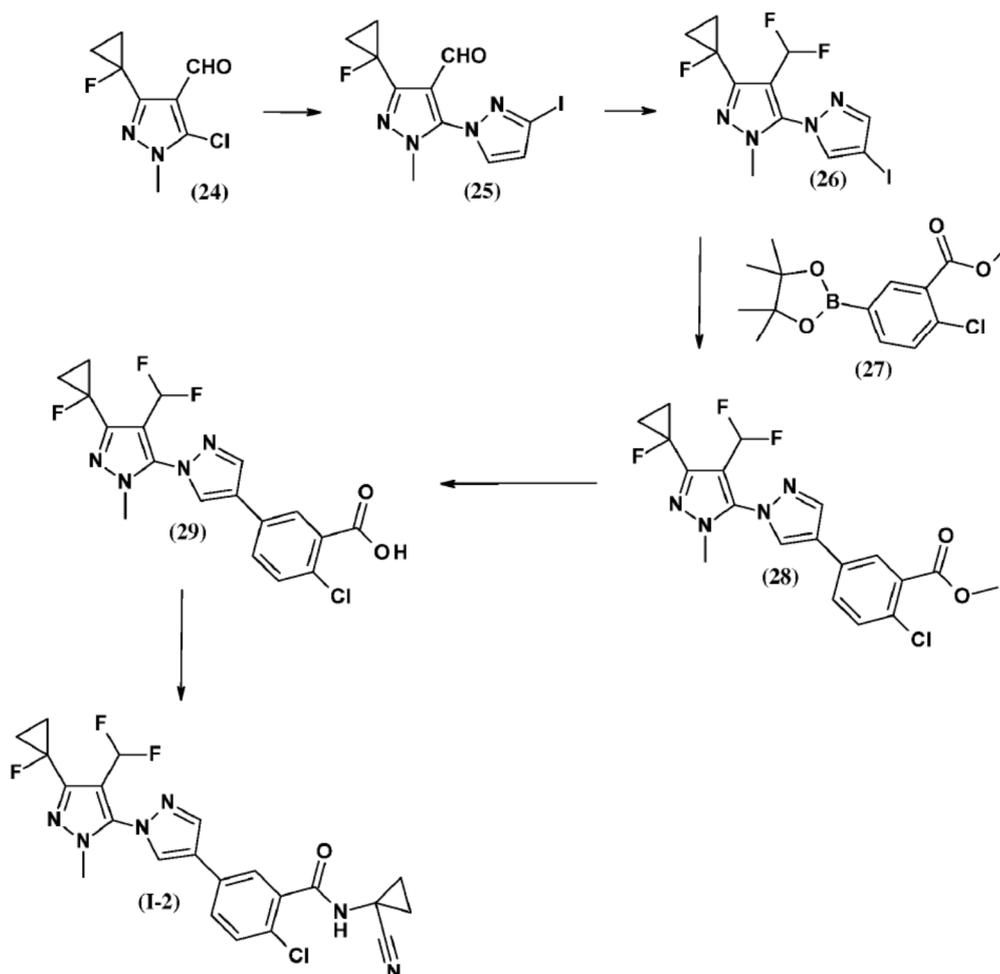
- 5 Compuestos de fórmula (I) en los que Z₂ representa –CHF₂ se pueden sintetizar por reacciones catalizadas de metal de transición (por ejemplo, paladio) de un compuesto de fórmula (3) con un compuesto de la fórmula (4). Esas reacciones se pueden realizar en analogía a procedimientos descritos en la literatura [véase, por ejemplo: WO2005-040110; WO2009-089508]. Los compuestos de la fórmula (4) están comercialmente disponibles o se pueden sintetizar en analogía a procedimientos conocidos de la literatura. Los compuestos de fórmula (3) se pueden sintetizar en analogía a los procedimientos conocidos en la literatura a partir de compuestos de fórmula (20) [véase, por ejemplo: US2008-0033013]. Los compuestos de fórmula (20) se pueden preparar en una sustitución nucleofílica a partir de compuestos de fórmula (19) y un derivado de pirazol correspondiente (2) como se describe anteriormente en la síntesis de (3). A continuación se describe la vía de síntesis general de los compuestos de fórmula (19).

A continuación se muestra la síntesis general de los intermedios (19).



- 15 Los compuestos de fórmula (19) se pueden sintetizar a partir de compuestos de fórmula (23). Reacciones similares se describen en la literatura [véase, por ejemplo: *Org. Lett.* 2015, 17, 932-935.]. Los compuestos de fórmula (23) se pueden sintetizar a partir de compuestos de fórmula (21) por condensación con derivados de hidrazina (22). Reacciones similares se describen en la literatura [véase, por ejemplo: US2008-0194617]

- 20 **Síntesis de 2-cloro-N-(1-cianociclopropil)-5-[4'-(difluorometil)-5'-(1-fluorociclopropil)-2'-metil-2'-H-1,3'-bipirazol-4-il]benzamida (I-2)**



5'-(1-fluorociclopropil)-4-yodo-2'-metil-2'H-1,3'-bipirazol-4'-carbaldehído (25)

Se agregaron 593 mg de 5-cloro-3-(1-fluorociclopropil)-1-metil-1H-pirazol-4-carbaldehído (**24**) (2,70 mmol) a una solución de 840 mg de 4-yodo-1H-pirazol (4,33 mmol) y 2,20 g de Cs₂CO₃ (6,76 mmol) en DMF anhidro. La solución se agitó durante 16 h a temperatura ambiente. La solución se diluyó con EtOAc, se lavó con solución NH₄Cl y la capa acuosa se extrajo con EtOAc. Se lavaron las capas orgánicas combinadas con salmuera, se secaron MgSO₄ y se evaporó el solvente. El residuo se purificó por cromatografía ultrarrápida.

Se asilaron 200 mg de 5'-(1-fluorociclopropil)-4-yodo-2'-metil-2'H-1,3'-bipirazol-4'-carbaldehído (**25**) como un sólido incoloro.

HPLC-MS³): logP = 2,86, Masa (m/z) = 376 [M⁺].

¹H-RMN (400 MHz, DMSO-d₆): 9,86(s,1H), 8,54(s,1H), 8,06(s,1H), 3,73(s,3H), 1,47-1,46(m,4H)

4'-(difluorometil)-5'-(1-fluorociclopropil)-4-yodo-2'-metil-2'H-1,3'-bipirazol (26)

Se disolvieron 200 mg de 5'-(1-fluorociclopropil)-4-yodo-2'-metil-2'H-1,3'-bipirazol-4'-carbaldehído (**25**) (0,5 mmol) en 10 ml de CH₂Cl₂ y se agregaron 542 mg de N,N-dietilaminosulfurtrifluoruro (3,0 mmol) en 20 ml de CH₂Cl₂. La solución se agitó a t.a. durante 48 h. La reacción se inactivó por la adición de solución acuosa de NaHCO₃. La mezcla se extrajo con EtOAc. Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre en Na₂SO₄ y el solvente se evaporó.

Se aislaron 214 mg de 4'-(difluorometil)-5'-(1-fluorociclopropil)-4-yodo-2'-metil-2'H-1,3'-bipirazol (**26**) como un aceite amarillo y se usaron en el siguiente paso sin purificación adicional.

HPLC-MS³): logP = 3,37, Masa (m/z) = 398 [M⁺].

¹H-RMN (400 MHz, DMSO-d₆): 8,38(s,1H), 8,01(s,1H), 6,99(t,1H), 3,62(s,3H), 1,44-1,43(m,4H)

2-cloro-5-[4'-(difluorometil)-5'-(1-fluorociclopropil)-2'-metil-2'H-1,3'-bipirazol-4-il]benzoato de metilo (28)

Se disolvieron 189 mg de 4'-(difluorometil)-5'-(1-fluorociclopropil)-4-yodo-2'-metil-2'H-1,3'-bipirazol (**26**), 170 mg de 2-cloro-5-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)benzoato de metilo (**27**) y 22,8 mg de Pd(PPh₃)₄ en 5 ml de 1,4-dioxano y se agregó una solución de 2 ml de NaHCO₃. La mezcla se agitó a 80 °C durante 16 h. La solución se

enfrió hasta temperatura ambiente y se filtró sobre sílice. El filtrado se concentró y el residuo se purificó por cromatografía ultrarrápida.

Se aislaron 87 mg de 2-cloro-5-[4'-(difluorometil)-5'-(1-fluorociclopropil)-2'-metil-2'H-1,3'-bipirazol-4-il]benzoato de metilo (28) como aceite amarillo.

5 HPLC-MS^{*}): logP = 3,63, Masa (m/z) = 424 [M+].

1H-RMN (400 MHz, DMSO-d₆): 8,77(s,1H), 8,50(s,1H), 8,12(d,1H), 7,93-7,91(m,1H), 7,65(d,1H), 7,00(t,1H), 3,90(s,3H), 3,71(s,3H), 1,49-1,41(m,2H), 1,23-1,16(m,2H)

Ácido 2-cloro-5-[4'-(difluorometil)-5'-(1-fluorociclopropil)-2'-metil-2'H-1,3'-bipirazol-4-il]benzoico (29)

10 Se disolvieron 87 mg de 2-cloro-5-[4'-(difluorometil)-5'-(1-fluorociclopropil)-2'-metil-2'H-1,3'-bipirazol-4-il]benzoato de metilo (28) en 2 ml de THF y se agregaron 14,7 mg de LiOH disueltos en 2 ml de H₂O. La solución se agitó a t.a. durante 3 h. La mezcla se diluyó con EtOAc y se lavó con HCl 1 M y salmuera. La capa orgánica se secó en MgSO₄ y el solvente se evaporó. El residuo se utilizó en el siguiente paso sin purificación adicional.

Se aislaron 82 mg de ácido 2-cloro-5-[4'-(difluorometil)-5'-(1-fluorociclopropil)-2'-metil-2'H-1,3'-bipirazol-4-il]benzoico (29) como un aceite amarillo.

15 HPLC-MS^{*}): logP = 2,71, Masa (m/z) = 410 [M+].

2-cloro-N-(1-cianociclopropil)-5-[4'-(difluorometil)-5'-(1-fluorociclopropil)-2'-metil-2'H-1,3'-bipirazol-4-il]benzamida (I-2)

20 Se disolvieron 41 mg de ácido 2-cloro-5-[4'-(difluorometil)-5'-(1-fluorociclopropil)-2'-metil-2'H-1,3'-bipirazol-4-il]benzoico (29) 36,5 mg de 4-N,N-dimetilaminopiridina y 57,4 mg de 1-Etil-3-(3-dimetilaminopropil)carbodiimida en 9 ml de CH₂Cl₂ y 1 ml de DMF. La mezcla se agitó a t.a. durante 12 h. La solución se diluyó con CH₂Cl₂ y se lavó con HCl 1M y salmuera. La capa orgánica se secó en MgSO₄ y el solvente se evaporó. El residuo se purificó por HPLC preparativa.

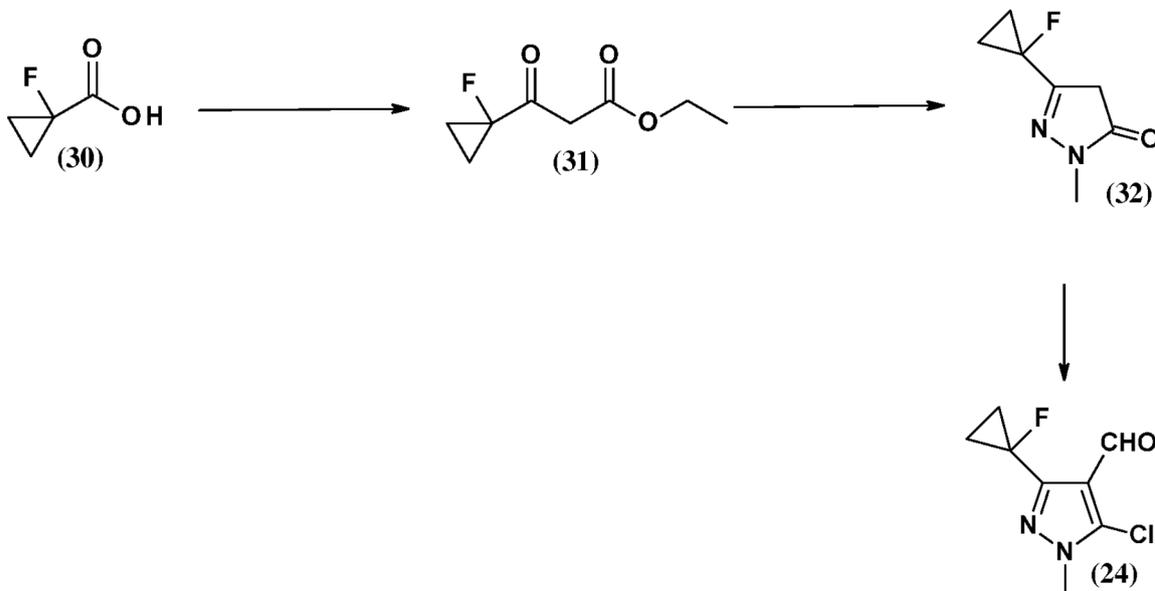
Se aislaron 25 mg de 2-cloro-N-(1-cianociclopropil)-5-[4'-(difluorometil)-5'-(1-fluorociclopropil)-2'-metil-2'H-1,3'-bipirazol-4-il]benzamida (I-2) como un sólido incoloro.

25 HPLC-MS³): referirse a la Tabla 1

Datos de ¹H-RMN: referirse a la lista de picos.

Preparación de los materiales de partida

Síntesis de 5-cloro-3-(1-fluorociclopropil)-1-metil-1H-pirazol-4-carbaldehído (24)



30 3-(1-fluorociclopropil)-3-oxopropanoato de metilo (31)

Se disolvieron 10 g de ácido 1-fluorociclopropanocarboxílico (30) en 80 ml de CH₂Cl₂ y se agregaron 10,9 g de TMS-CH₂N₂ gota a gota. La mezcla se agitó a t.a. durante 1^oh. El solventes se evaporó y el producto se usó en el siguiente paso si purificación adicional.

35 Se disolvieron 11,3 g de acetato de etilo en 150 ml de THF. Se agregaron 122 ml de LiHMDS 1 M en hexanos gota a gota a -78 °C. La mezcla se agitó a -78 °C durante 1 h. Se disolvieron 8,0 g del metil éster que antecede en 150 ml

de THF gota a gota a -78 °C y la mezcla se agitó por otras 3 h. La reacción se inactivó por la adición de una solución NH₄Cl acuosa saturada. La mezcla se dejó calentar a t.a. y se extrajo con EtOAc. Las capas orgánicas combinadas se lavaron con salmuera y se secaron sobre MgSO₄. El solvente se evaporó y el producto se usó en la siguiente etapa sin purificación adicional.

- 5 Se aislaron 10,9 g de metilo 3-(1-fluorociclopropil)-3-oxopropanoato de metilo (31) como aceite amarillo. GC-MS**): Índice = 1502, Masa (m/z) = 175 [M+H]⁺

5-(1-fluorociclopropil)-2-metil-2,4-dihidro-3H-pirazol-3-ona (32)

- 10 Se disolvieron 10,9 g de 3-(1-fluorociclopropil)-3-oxopropanoato de metilo (31) en 150 ml de tolueno. Se disolvieron 2,31 g de metilhidrazina en 100 ml de tolueno gota a gota a 0 °C. La mezcla se calentó hasta 100 °C y se agitó durante 2 h. El solvente se evaporó y el residuo se purificó por cromatografía ultrarrápida.

Se aislaron 1,5 g de 5-(1-fluorociclopropil)-2-metil-2,4-dihidro-3H-pirazol-3-ona (32) como un sólido amarillo. HPLC-MS*): logP = 0,38, Masa (m/z) = 157 [M+H]⁺.
1H-RMN (400 MHz, DMSO-d₆): 11,00(s,1H), 5,41(s,1H), 3,46(s,3H), 1,30-1,18(m,2H), 0,99-0,93(m,2H)

5-cloro-3-(1-fluorociclopropil)-1-metil-1H-pirazol-4-carbaldehído (24)

- 15 Se disolvieron 298 mg de 5-(1-fluorociclopropil)-2-metil-2,4-dihidro-3H-pirazol-3-ona (32) en 5 ml de DMF y se agregaron 732 mg de POCl₃. La reacción se agitó a 80 °C durante 4 h. La solución se enfrió hasta t.a. y se filtró sobre hielo. La mezcla se extrajo con CH₂Cl₂. Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre MgSO₄ y el solvente se evaporó. El residuo se utilizó en el siguiente paso sin purificación adicional.

- 20 Se aislaron 795 mg de 5-(1-fluorociclopropil)-2-metil-2,4-dihidro-3H-pirazol-3-ona (32) como aceite amarillo en mezcla con DMF. HPLC-MS*): logP = 1,71, Masa (m/z) = 203 [M+H]⁺.
1H-RMN (400 MHz, DMSO-d₆): 3,83 (s,3H), 1,47 – 1,43 (m, 2H) 1,19 – 1,17 (m, 2H)

Eficacia biológica

Boophilus microplus – Prueba de inyección (iny BOOPMI)

- 25 Solvente: dimetil sulfóxido

Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, se disolvieron 10 mg del compuesto activo en 0,5 ml de solvente y el concentrado se diluye con solvente a la concentración deseada.

Se inyectan cinco garrapatas hembra dilatadas adultas (*Boophilus microplus*) con una solución de compuesto de 1 µl en el abdomen. Las garrapatas se transfieren a placas replicadas y se incubaron en una cámara climática.

- 30 Luego de 7 días se monitorea la deposición de huevos de huevos fértiles. Los huevos en los que no es visible fertilidad se almacenan en una cámara climática hasta la incubación luego de alrededor de 42 días. Una eficacia de 100 % significa que todos los huevos son infértiles; 0 % significa que todos los huevos son fértiles.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación mostraron buena actividad de 100 % a una velocidad de aplicación de 20 µg /animal: I-4

- 35 **Ctenocephalides felis – prueba oral (CTECFE)**

Solvente: dimetil sulfóxido

Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, se disolvieron 10 mg del compuesto activo en 0,5 ml de solvente y el concentrado se diluye con sangre de ganado a la concentración deseada.

- 40 Aproximadamente 20 pulgas de gato (*Ctenocephalides felis*) se colocaron en cámaras de pulgas. La cámara de sangre, sellada con parafilm en la parte inferior, se llenan con sangre de ganado suministrada con solución de compuesto y se colocan en la parte superior cubierta con gasa de la cámara de pulgas, para que las pulgas puedan chupar la sangre. La cámara de sangre se calienta a 37 °C mientras que la cámara de pulgas se mantiene a temperatura ambiente.

- 45 Luego de 2 días se determina la mortalidad en %. 100 % significa que se mataron todas las pulgas; 0 % significa que no se mató ninguna pulga.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación mostraron buena actividad de 100 % a una velocidad de aplicación de 100 ppm: I-4

Lucilia cuprina – prueba (LUCICU)

Solvente: dimetilsulfóxido

Se disuelven 10 mg de compuesto activo en 0,5 ml de dimetil sulfóxido. Se hacen diluciones en serie para obtener las velocidades deseadas.

- 5 Se transfieren aproximadamente 20 larvas de estadio 1 de la mosca califórida australiana (*Lucilia cuprina*) a un tubo de ensayo que contiene carne de caballo molida y solución de compuesto de la concentración deseada.

Luego de 2 días se determina la mortalidad en %. 100 % significa que se mataron todas las larvas; 0 % significa que no se mató ninguna larva.

- 10 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación mostraron buena actividad de 100 % a una velocidad de aplicación de 100 ppm: I-4

Myzus persicae – prueba de pulverización

Solvente: 78,0 partes en peso de acetona
1.5 partes en peso de dimetilformamida
Emulsionante: alquilarilpoliglicol éter

- 15 Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, 1 parte en peso de compuesto activo se mezcla con la cantidad establecida de solventes y se diluye con agua, que contiene una concentración emulsionante de 1000 ppm, a la concentración deseada. Concentraciones de prueba adicionales se preparan por dilución con agua que contiene emulsionante.

- 20 Discos de hoja de col china (*Brassica pekinensis*) infectados con todos los estadios de pulgón del melocotonero (*Myzus persicae*) se pulverizan con una preparación del ingrediente activo de la concentración deseada.

Luego de 6 días se determina la mortalidad en %. 100 % significa que se mataron todos los áfidos; 0 % significa que no se mató ningún áfido.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación mostraron buena actividad de 100 % a una velocidad de aplicación de 100 g/ha: I-9

- 25 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación mostraron buena actividad de 90 % a una velocidad de aplicación de 100 g/ha: I-3, I-7, I-10, I-11, I-12

Phaedon cochleariae – prueba de pulverización

- 30 Solvente: 78,0 partes en peso de acetona
1,5 partes en peso de dimetilformamida.
Emulsionante: alquilarilpoliglicol éter

Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, 1 parte en peso de compuesto activo se mezcla con la cantidad establecida de solventes y se diluye con agua, que contiene una concentración emulsionante de 1000 ppm, a la concentración deseada. Concentraciones de prueba adicionales se preparan por dilución con agua que contiene emulsionante.

- 35 Discos de hoja de col china (*Brassica pekinensis*) se pulverizan con una preparación del ingrediente activo de la concentración deseada. Una vez secos, los discos de hojas se infectan con larva de escarabajo de la mostaza (*Phaedon cochleariae*).

Luego de 7 días se determina la mortalidad en %. 100 % significa que se mataron todas las larvas de escarabajo; 0 % significa que no se mató ninguna larva de escarabajo.

- 40 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación mostraron buena actividad de 100 % a una velocidad de aplicación de 100 g/ha: I-2, I-3, I-4, I-6, I-7, I-8, I-9, I-10, I-11, I-12

Spodoptera frugiperda – prueba de pulverización

- 45 Solvente: 78,0 partes en peso de acetona
1.5 partes en peso de dimetilformamida
Emulsionante: alquilarilpoliglicol éter

Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, 1 parte en peso de compuesto activo se mezcla con la cantidad establecida de solventes y se diluye con agua, que contiene una concentración emulsionante de 1000 ppm, a la concentración deseada. Concentraciones de prueba adicionales se preparan por dilución con agua que contiene emulsionante.

Secciones de hoja de maíz (*Zea mays*) se pulverizan con una preparación del ingrediente activo de la concentración deseada. Una vez secas, las secciones de hojas se infectan con larva de cogollero del maíz (*Spodoptera frugiperda*).

5 Luego de 7 días se determina la mortalidad en %. 100 % significa que se mataron todas las orugas; 0 % significa que no se mató ninguna oruga.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación mostraron buena actividad de 100 % a una velocidad de aplicación de 100 g/ha: I-2, I-7, I-8

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación mostraron buena actividad de 83 % a una velocidad de aplicación de 100 g/ha: I-3

10 **Tetranychus urticae – prueba de pulverización resistente a OP**

Solvente:	78,0 partes en peso de acetona
Emulsionante:	1.5 partes en peso de dimetilformamida alquilarilpoliglicol éter

15 Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, 1 parte en peso de compuesto activo se mezcla con la cantidad establecida de solventes y se diluye con agua, que contiene una concentración emulsionante de 1000 ppm, a la concentración deseada. Concentraciones de prueba adicionales se preparan por dilución con agua que contiene emulsionante.

Discos de hoja de judía (*Phaseolus vulgaris*) infectados con todos los estadios de ácaro de dos puntos (*Myzus persicae*) se pulverizan con una preparación del ingrediente activo de la concentración deseada.

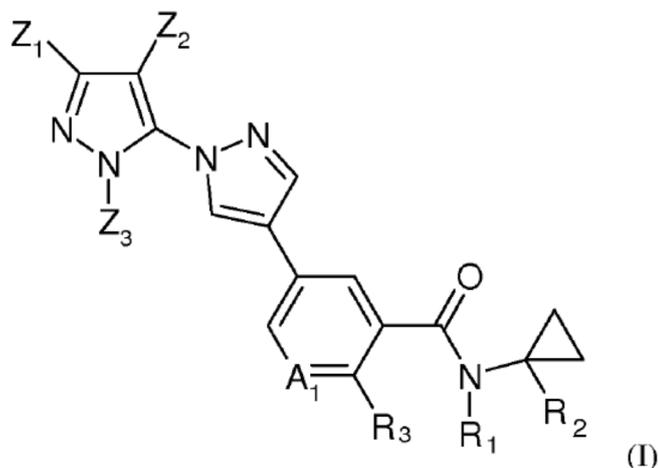
20 Luego de 6 días se determina la mortalidad en %. 100 % significa que se mataron todos los ácaros; 0 % significa que no se mató ningún ácaro.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación mostraron buena actividad de 100 % a una velocidad de aplicación de 100 g/ha: I-2, I-3, I-4, I-6, I-7, I-8, I-9, I-11, I-12

25 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación mostraron buena actividad de 90 % a una velocidad de aplicación de 100 g/ha: I-10

REIVINDICACIONES

1. Compuestos de fórmula general (I),

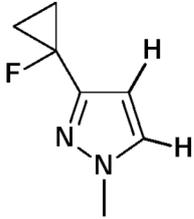


en la que

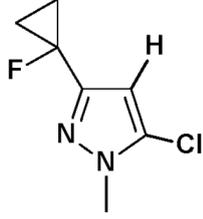
- 5 Z₁ representa ciclopropilo 1-halogenado;
 Z₂ representa -S(O)₀₋₂-(C₁-C₂)-alquilo, (C₁-C₂)-halogenoalquilo, o nitro (NO₂);
 Z₃ representa (C₁-C₂)-alquilo;
 R₁ representa hidrógeno (H) o (C₁-C₂)-alquilo;
 R₂ representa H o ciano (CN);
 10 R₃ representa CH₃ o cloro (Cl);
 A₁ representa CH o nitrógeno (N).
2. Compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en el que A₁ es CH.
3. Compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, en el que A₁ es CH y R₃ es Cl.
- 15 4. Compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en el que
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo;
 Z₂ es -S-CH₃, -SO-CH₃, -SO₂-CH₃, CF₃, CF₂H, Cl, Br, I o NO₂;
 Z₃ es CH₃.
- 20 5. Compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en el que
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo;
 Z₂ es -S-CH₃, Cl, Br, I, CF₃, CF₂H, o NO₂;
 Z₃ es CH₃.
- 25 6. Compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en el que
 Z₁ es 1-fluoro-ciclopropilo o 1-cloro-ciclopropilo;
 Z₂ es I, CF₃, CF₂H, o NO₂;
 Z₃ es CH₃.
7. Compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en el que R₁ es H.
8. Compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 o 4 a 7, en el que A₁ es N.
9. Compuesto de acuerdo con la reivindicación 8, en el que R₃ es Cl.
- 30 10. Uso de un compuesto de fórmula general (I) de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 8, para
 controlar insectos, arácnidos y nematodos quedando excluidos los procedimientos para el tratamiento quirúrgico o
 terapéutico del cuerpo humano o animal y los procedimientos de diagnóstico realizados en el cuerpo humano o
 animal.
11. Composición farmacéutica que comprende al menos un compuesto de acuerdo a cualquiera de las
 Reivindicaciones 1 a 9.
- 35 12. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 8, para su uso como medicamento.

13. Uso de un compuesto de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 9, para preparar una composición farmacéutica para controlar parásitos en animales.

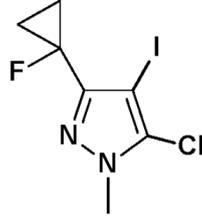
14. Un compuesto seleccionado del grupo que consiste en



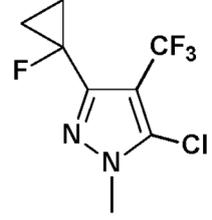
10



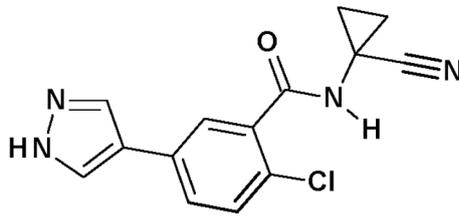
11



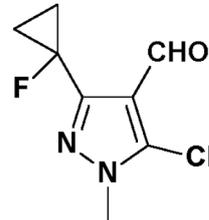
12



13



14



24

5

15. Uso de un compuesto de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 9, para proteger el material de propagación de plantas.