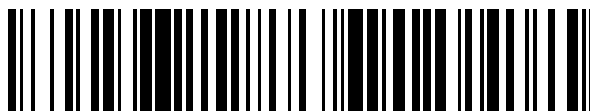


19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 707 751**

51 Int. Cl.:

**C07D 403/12** (2006.01)

**A01N 43/58** (2006.01)

**A01N 43/36** (2006.01)

**A01N 43/56** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **30.01.2015 PCT/EP2015/051968**

87 Fecha y número de publicación internacional: **06.08.2015 WO15114106**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **30.01.2015 E 15702245 (0)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **24.10.2018 EP 3099676**

54 Título: **Pirazoles para controlar plagas de invertebrados**

30 Prioridad:

**31.01.2014 EP 14153482**

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

**04.04.2019**

73 Titular/es:

**BASF SE (100.0%)  
Carl-Bosch-Strasse 38  
67056 Ludwigshafen am Rhein, DE**

72 Inventor/es:

**SOERGEL, SEBASTIAN;  
SAELINGER, DANIEL y  
GOCKEL, BIRGIT**

74 Agente/Representante:

**CARVAJAL Y URQUIJO, Isabel**

ES 2 707 751 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

Pirazoles para controlar plagas de invertebrados

5 La presente invención se refiere a novedosos pirazoles de fórmula I. Además, la invención se refiere a procesos y productos intermedios para preparar los pirazoles de fórmula I, y también a combinaciones de compuestos activos que los comprenden, a composiciones que los comprenden, y a su uso para proteger plantas en crecimiento del ataque o infestación por plagas de invertebrados. Adicionalmente, la invención se refiere a métodos de aplicación de tales compuestos. La presente invención también se refiere a semillas que comprenden tales compuestos.

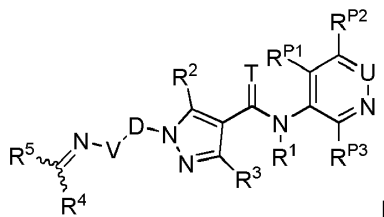
10 Las plagas de invertebrados y en particular los artrópodos y nematodos destruyen los cultivos en crecimiento y cosechados y atacan las viviendas de madera y las estructuras comerciales, causando grandes pérdidas económicas en el suministro de alimentos y en la propiedad. Existe una necesidad continua de nuevos agentes para combatir plagas de invertebrados tales como insectos, arácnidos y nematodos.

Los documentos WO 2009/027393, WO 2010/034737, WO 2010/034738, WO 2010/112177 y WO 2013/156318 describen derivados de N-arilamidas, derivados de ácidos pirazol carboxílicos. Se menciona que estos compuestos son útiles para combatir plagas de invertebrados.

15 No obstante, sigue existiendo la necesidad de agentes altamente efectivos y versátiles para combatir plagas de invertebrados. Por lo tanto, un objeto de la presente invención es proporcionar compuestos que tengan una buena actividad plaguicida y que muestren un amplio espectro de actividad contra un gran número de plagas de invertebrados diferentes, especialmente contra plagas difíciles de controlar, tales como insectos.

20 Se ha encontrado que estos objetivos se pueden lograr mediante compuestos de fórmula I como se describen y definen a continuación, y por sus estereoisómeros, sales, tautómeros y N-óxidos, en particular sus sales aceptables desde el punto de vista agrícola.

En un primer aspecto, la presente invención se refiere a compuestos de fórmula I



en donde

25 V es O;

D es C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alquileo;

U es N;

T es O;

RP<sup>1</sup>, RP<sup>2</sup>, y RP<sup>3</sup> son H;

30 R<sup>1</sup> es H, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alquilo, o C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alquilo;

R<sup>2</sup> es CH<sub>3</sub> o halometilo, y

R<sup>3</sup> es H, y en donde

R<sup>4</sup> es H, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cicloalquilo o C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cilcoalquilmetilo; y

35 R<sup>5</sup> es C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cicloalquilo o C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cilcoalquilmetilo, en donde en cada caso C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cicloalquilo o C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cilcoalquilmetilo pueden estar sin sustituir o pueden estar parcial o totalmente sustituidos por sustituyentes que, independientemente entre sí, se seleccionan de R<sup>A</sup>, o en donde

40 R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un carbo- o heterociclo no aromático de 5 a 6 miembros, que pueden contener 1 o 2 heteroátomos que, independientemente entre sí, se seleccionan de NR<sup>B</sup>, O, y S, en donde S puede estar oxidado, y/o en donde el carbo- o heterociclo pueden estar sin sustituir o pueden estar parcial o totalmente sustituidos por sustituyentes que, independientemente entre sí, se seleccionan de R<sup>A</sup>; y en donde

R<sup>A</sup> es halógeno, CN, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alcoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-haloalcoxi, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-cicloalquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-halocicloalquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-cicloalcoxi, o C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-halocicloalcoxi; o en donde

dos R<sup>A</sup> están unidos al mismo átomo de carbono y junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un ciclopropano;

y en donde

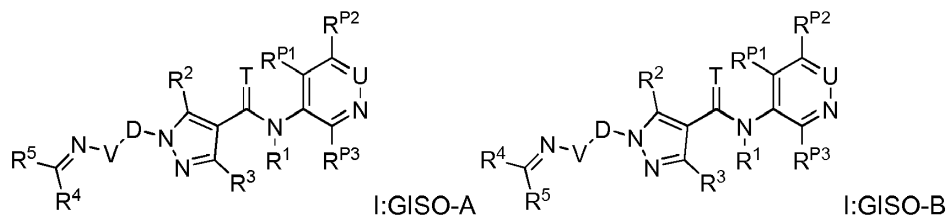
R<sup>B</sup> es H, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alquilcarbonilo, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-haloalquilcarbonilo, o C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alcoxicarbonilo;

5 y las sales, estereoisómeros, tautómeros y N-óxidos de los mismos.

En aspectos adicionales, la presente invención se refiere a una composición y a una composición agrícola para combatir plagas animales que comprende al menos un compuesto de fórmula I. En aspectos todavía adicionales, la presente invención se refiere a un método para combatir o controlar plagas de invertebrados y a un método para proteger a las plantas en crecimiento de ataques o infestaciones por plagas de invertebrados. En otro aspecto, la presente invención se refiere a semillas que comprenden un compuesto de fórmula I, y en aún otro aspecto, la presente invención se refiere al uso de los compuestos de fórmula I para proteger las plantas en crecimiento del ataque o la infestación por plagas de invertebrados.

Realizaciones adicionales de la presente invención se pueden encontrar en las reivindicaciones, la descripción y los ejemplos. Debe entenderse que las características mencionadas anteriormente y las que todavía deben ilustrarse a continuación del asunto objeto de la invención pueden aplicarse no solo en la combinación respectiva dada sino también en otras combinaciones sin salir del alcance de la invención.

En los compuestos de fórmula I anterior, las líneas onduladas de los sustituyentes R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> indican que R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> pueden estar presentes en ambas posiciones en el átomo de carbono del doble enlace carbono-nitrógeno, es decir, en configuración cis o en configuración trans relativa a V. Por lo tanto, dos isómeros geométricos GISO-A y GISO-B como se representan a continuación están cubiertos por los compuestos de fórmula I de la invención.

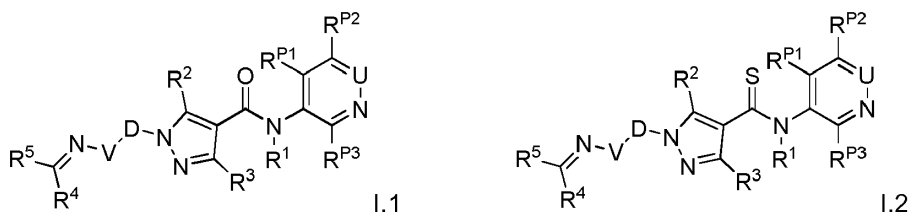


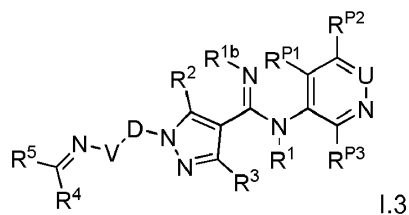
Por razones de claridad, se refiere al isómero geométrico GISO-A solo a lo largo de la especificación, pero su descripción también abarca la divulgación del otro isómero geométrico GISO-B.

Se observa que, como se usa en este documento, los términos "isómeros geométricos" e "isomerización geométrica" en particular se refieren a "isómeros E/Z" e "isomerización E/Z" con respecto al doble enlace carbono-nitrógeno de la oxima, el grupo tiooxima o hidrazona en los compuestos de fórmula I, en donde las configuraciones E y Z se determinan de acuerdo con IUPAC aplicando las reglas de prioridad de Cahn-Ingold-Prelog.

En el caso de los dobles enlaces carbono-nitrógeno presentes en los grupos de oxima, tiooxima o hidrazona de los compuestos de fórmula I de la invención, la barrera energética para las isomerizaciones E/Z es típicamente bastante baja, en particular si se compara con la barrera energética para las isomerizaciones E/Z de dobles enlaces carbono-carbono. Por consiguiente, si los isómeros geométricos GISO-A y GISO-B son, por ejemplo, proporcionados en solución, típicamente estarán presentes en un equilibrio, en donde el isómero geométrico, que es más estable, estará presente en una proporción más alta que el isómero geométrico, que es menos estable. Por razones estéricas, los isómeros E son frecuentemente más estables que los isómeros Z, y estarán presentes en exceso. Por lo tanto, es una realización preferida de la invención que en los compuestos de fórmula I, la relación del isómero E al isómero Z es al menos 50:50, preferiblemente al menos 70:30, más preferiblemente al menos 90:1, y lo más preferiblemente al menos 99:1. En ciertas realizaciones particularmente preferidas, los compuestos de fórmula I estarán presentes en forma del isómero E.

En una realización, la presente invención se refiere a compuestos de fórmula I, en donde T es O, S o NR<sup>1b</sup>. Estos compuestos corresponden a la fórmula I.1, fórmula 1.2 y fórmula 1.3, respectivamente.

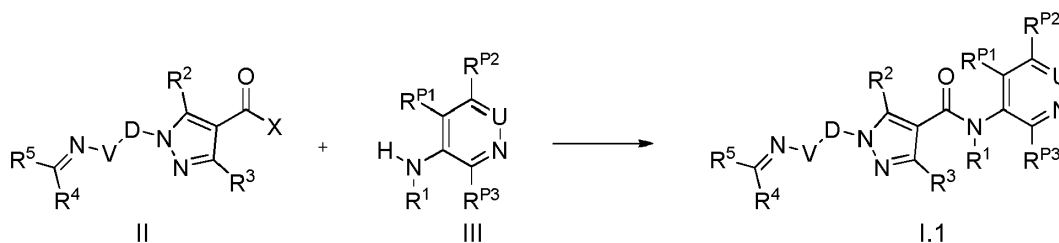




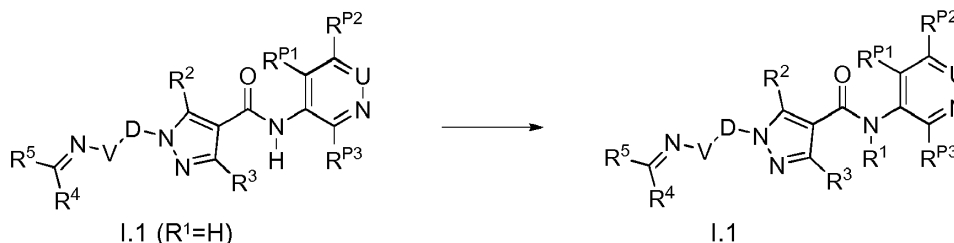
Los compuestos de fórmula I.1 se prefieren de acuerdo con la invención.

Los compuestos de acuerdo con la invención se pueden preparar de manera análoga a las rutas de síntesis descritas en los documentos WO 2009/027393 y WO 2010/034737 de acuerdo con procedimientos estándar de química orgánica.

Los compuestos de fórmula I.1, en donde T es O, pueden prepararse, por ejemplo, haciendo reaccionar derivados de ácido pirazol carboxílico activados de fórmula II con una 3-aminopiridina o 4-aminopiridazina de fórmula III (por ejemplo, Houben-Weyl: "Methoden der organ. Chemie" [Methods of Organic Chemistry], Georg-Thieme-Verlag, Stuttgart, New York 1985, Volume E5, pp. 941-1045).



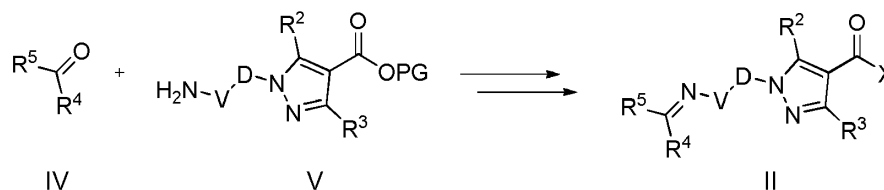
Los compuestos de fórmula I.1 en donde R<sup>1</sup> es diferente de hidrógeno también pueden prepararse mediante la alquilación de las amidas I.1, en donde R<sup>1</sup> es hidrógeno, usando agentes de alquilación adecuados en presencia de bases. La alquilación se puede efectuar bajo condiciones estándar conocidas de la literatura.



En las fórmulas II y III, los radicales tienen los significados mencionados anteriormente para la fórmula I y, en particular, los significados mencionados como preferidos, X es un grupo saliente adecuado tal como halógeno, N<sub>3</sub>, p-nitrofenoxi o pentafluorofenoxi y similares.

Derivados de ácido pirazol carboxílico activados de fórmula II son preferiblemente haluros, ésteres activados, anhídridos, azidas, por ejemplo cloruros, fluoruros, bromuros, ésteres de para-nitrofenilo, ésteres de pentafluorofenilo, N-hidroxisuccinimidas, ésteres de hidroxibenzotriazol-1-ilo.

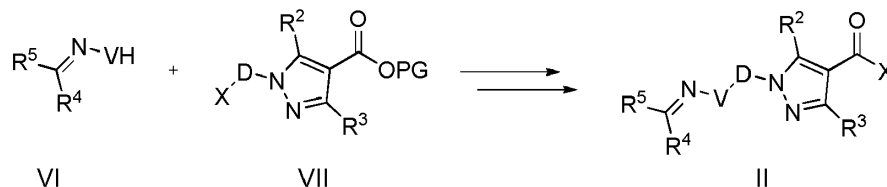
El grupo oxima, tioxima o hidrazona de los derivados de ácido pirazol carboxílico activados de fórmula II puede formarse haciendo reaccionar un aldehído o cetona de fórmula IV con un derivado de ácido pirazol carboxílico protegido de fórmula V, en donde PG es un grupo protector tal como etilo tert-butilo, bencilo o similares. El producto resultante puede luego desprotegerse y transformarse en el derivado de ácido pirazol carboxílico activado de fórmula II. Los métodos para preparar compuestos de fórmula II con V siendo O, V siendo S y V siendo NR<sup>1a</sup> se describen en el documento WO 2013/072882, J. Org. Chem. 48 (20), pág. 3531 (1983) y JP 2013/023476, respectivamente.



Alternativamente, el grupo oxima, tioxima o hidrazona de los derivados de ácido pirazolcarboxílico activados de fórmula II puede formarse haciendo reaccionar una oxima, tioxima o hidrazona de fórmula VI con un derivado de ácido

pirazolcarboxílico protegido de fórmula VII, en donde PG es un grupo protector tal como etilo, tert-butilo, bencilo o similares, y en donde X es un grupo saliente tal como cloro, bromo, yodo, metilsulfonilo, 4-toluenosulfonilo o similares. El producto resultante puede luego desprotegerse y transformarse en el derivado de ácido pirazol carboxílico activado de fórmula II. Un método para preparar oximas de acuerdo con este procedimiento es, por ejemplo, descrito en J. Med. Chem, 28 (7), pág. 896 (1985).

5



Los compuestos de fórmula IV y VI son conocidos en la técnica o están disponibles comercialmente o pueden prepararse por métodos conocidos en la literatura.

10

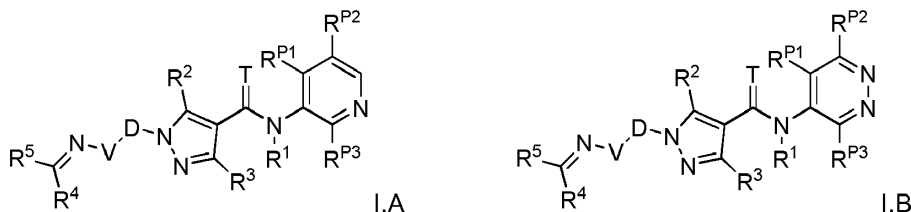
Los compuestos de fórmula III, V y VII son conocidos en la técnica o están disponibles comercialmente o pueden prepararse por métodos conocidos de la literatura (cf. WO 05/040169; WO 08/074824; Journal of Fluorine chemistry 132 (11), p. 995 (2011)).

Los compuestos de fórmula 1.2, en donde T es S, pueden prepararse, por ejemplo haciendo reaccionar compuestos de fórmula I.1 con 2,4-bis (4-metoxifenil)-1,3,2,4-ditiadifosfetano-2,4-disulfuro o PS<sub>5</sub> de acuerdo con el método descrito en Synthesis 2003, p. 1929.

15

Los compuestos de fórmula 1.3, en donde T es NR<sup>1b</sup>, pueden prepararse, por ejemplo a través de la formación de imina a partir de los compuestos de fórmula I.1.

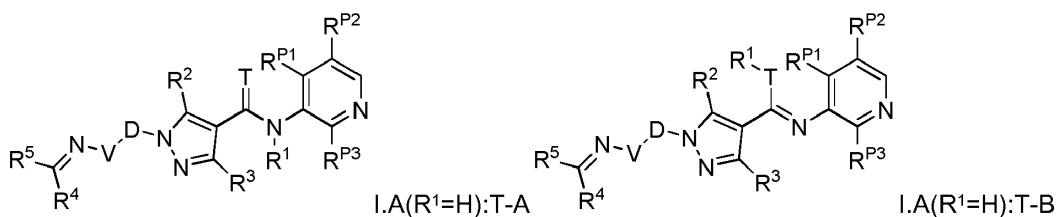
En una realización, la presente invención se refiere a compuestos de fórmula I, en donde U es CR<sup>u</sup>, preferiblemente CH o N. Los compuestos, en donde U es CH y U es N, corresponden a la fórmula I.A y la fórmula I.B, respectivamente.



20

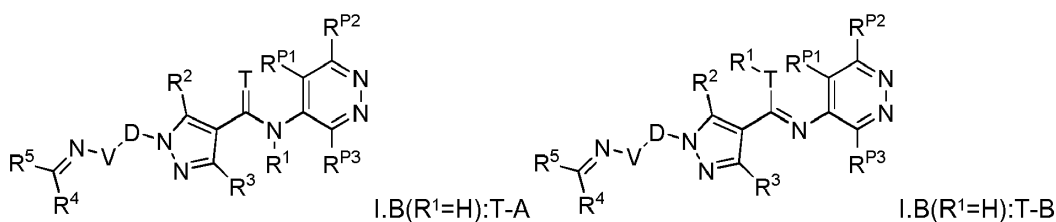
Los compuestos de fórmula I.B son particularmente preferidos de acuerdo con la invención.

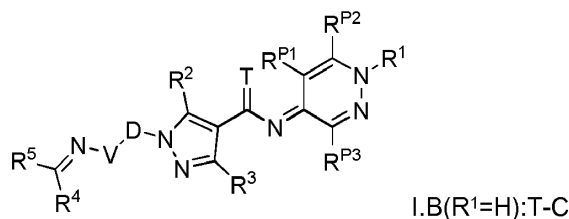
Si R<sup>1</sup> es H, los compuestos de fórmula I pueden estar presentes en dos o tres formas tautoméricas dependiendo del significado de U. Por ejemplo, si U se selecciona como CH, como en los compuestos de fórmula IA, se pueden formar dos tautómeros T-A y T-B.



25

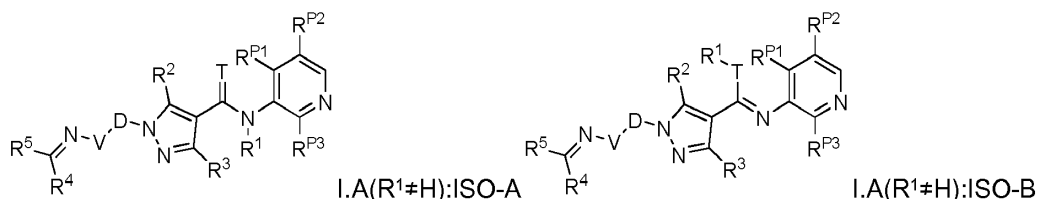
Si se selecciona U como N, como en los compuestos de fórmula I.N, se pueden formar tres tautómeros T-A, T-B y T-C.



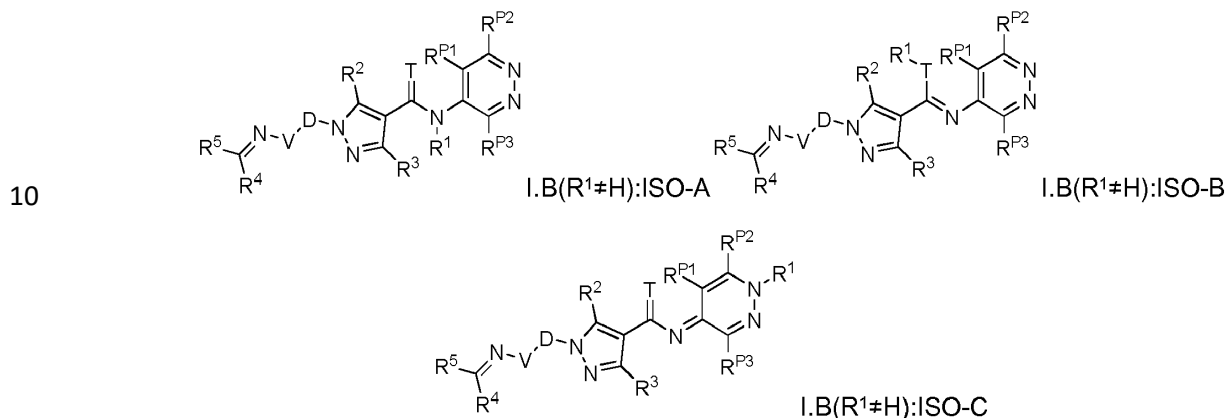


Por razones de claridad, se hace referencia al tautómero T-A solo a lo largo de la memoria descriptiva, pero su descripción también abarca la divulgación de los otros tautómeros.

- 5 Si R<sup>1</sup> es diferente de H, los compuestos de fórmula I pueden estar presentes en dos o tres formas isoméricas dependiendo del significado de U. Por ejemplo, si U se selecciona como CH, como en los compuestos de fórmula IA, se pueden formar dos isómeros estructurales ISO-A y ISO-B.

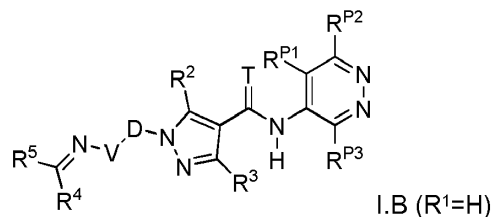


Si se selecciona U como N, como en los compuestos de fórmula I.B, se pueden formar tres isómeros estructurales ISO-A, ISO-B e ISO-C.



- 15 De acuerdo con la presente invención, se prefiere que los compuestos de fórmula I estén presentes en forma de los isómeros estructurales ISO-A. Sin embargo, los compuestos de fórmula I también pueden estar presentes en forma de los isómeros estructurales ISO-B o ISO-C o en forma de mezclas de dos o más de los isómeros estructurales ISO-A, ISO-B e ISO-C. Por razones de claridad, se hace referencia al isómero estructural ISO-A solo a lo largo de la especificación, pero su descripción también abarca la divulgación de los otros isómeros estructurales.

- 20 Los isómeros ISO-C se pueden obtener por alquilación de los compuestos I.B, en donde R<sup>1</sup> es hidrógeno. La reacción se puede realizar por analogía con la N-alquilación conocida de piridazinas. La N-alquilación de piridazinas es conocida en la literatura y puede encontrarse en, por ejemplo: J. Chem. Soc., Perkin Trans. Vol. 1, p. 401 (1988), y J. Org. Chem. Vol. 46, p. 2467 (1981). Por ejemplo, el siguiente compuesto I.B. puede ser utilizado como material de partida.



- 25 Los compuestos de fórmula I pueden formar tautómeros adicionales debido a las unidades estructurales de oxima. Por ejemplo, el tautomerismo de imina-enamina puede estar presente en los compuestos de fórmula I, si cualquiera de R<sup>4</sup> o R<sup>5</sup> proporciona un átomo de hidrógeno en el átomo de α-carbono. Los tautómeros, que se forman a causa de las unidades estructurales de oxima, también están cubiertos por los compuestos de fórmula I de acuerdo con la invención.

Los N-óxidos de los compuestos de fórmula I, se pueden preparar por oxidación de los compuestos I de acuerdo con los métodos estándar de preparación de N-óxidos heteroaromáticos, por ejemplo por el método descrito en Journal of Organometallic Chemistry 1989, 370, 17-31.

5 Si los compuestos individuales no pueden prepararse a través de las rutas descritas anteriormente, pueden prepararse por derivación de otros compuestos I o por modificaciones habituales de las rutas de síntesis descritas. Por ejemplo, en casos individuales, ciertos compuestos I pueden prepararse ventajosamente a partir de otros compuestos I mediante hidrólisis de ésteres, amidación, esterificación, escisión de éter, olefinación, reducción, oxidación y similares.

10 Las mezclas de reacción se manipulan de la manera habitual, por ejemplo, mezclando con agua, separando las fases y, si es apropiado, purificando los productos crudos por cromatografía, por ejemplo sobre alúmina o sobre sílica gel. Algunos de los productos intermedios y productos finales pueden obtenerse en forma de aceites viscosos incoloros o de color marrón pálido que se liberan o purifican a partir de componentes volátiles bajo presión reducida y a una temperatura moderadamente elevada. Si los productos intermedios y los productos finales se obtienen como sólidos, pueden purificarse por recristalización o trituración.

15 El término "compuesto(s) de acuerdo con la invención", o "compuestos de fórmula I" comprende los compuestos como se define aquí, así como un estereoisómero, sal, tautómero o N-óxido del mismo. El término "compuestos de la presente invención" debe entenderse como equivalente al término "compuestos de acuerdo con la invención", que por lo tanto también comprende un estereoisómero, sal, tautómero o N-óxido del mismo.

20 Los radicales unidos al esqueleto de la fórmula I pueden contener uno o más centros de quiralidad. En este caso, los compuestos de fórmula I están presentes en forma de diferentes enantiómeros o diastereómeros, dependiendo de los sustituyentes. La presente invención se refiere a todos los posibles estereoisómeros de la fórmula I, es decir, a enantiómeros o diastereómeros individuales, así como a mezclas de los mismos.

25 Como ya se indicó anteriormente, los compuestos de fórmula I pueden estar presentes en forma de diferentes isómeros geométricos dependiendo de la configuración de los sustituyentes en el doble enlace carbono-nitrógeno de la oxima, la tioxima o el grupo hidrazona. La presente invención se refiere a ambos, los isómeros E y Z de los compuestos de fórmula I. En realizaciones preferidas de la invención, los compuestos de fórmula I estarán presentes en forma de isómeros E.

30 Como ya se indicó anteriormente, los compuestos de fórmula I pueden estar presentes en forma de diferentes isómeros estructurales dependiendo de la posición de R<sup>1</sup>, siempre que R<sup>1</sup> sea diferente de H. La presente invención se refiere a todos los isómeros estructurales posibles como se indica en los compuestos de fórmula I.A (R<sup>1</sup>≠H): ISO-A, fórmula I.A (R<sup>1</sup>≠H): ISO-B, fórmula I.B (R<sup>1</sup>≠H): ISO-A, fórmula I.B (R<sup>1</sup>≠H): ISO-B, fórmula I.B(R<sup>1</sup>≠H): ISO-C, y mezclas de los mismos.

Como ya se indicó anteriormente, los compuestos de fórmula I también pueden estar presentes en forma de diferentes tautómeros, si R<sup>1</sup> es H, si V es NR<sup>1a</sup> con R<sup>1a</sup> H y/o si cualquiera de R<sup>4</sup> o R<sup>5</sup> proporciona un átomo de hidrógeno en el átomo de α-carbono. La presente invención se refiere a todos los tautómeros posibles de la fórmula I.

35 Los compuestos de fórmula I pueden ser amorfos o pueden existir en uno o más estados cristalinos diferentes (polimorfos) que pueden tener diferentes propiedades macroscópicas, tales como estabilidad, o mostrar diferentes propiedades biológicas, tal como las actividades. La presente invención se refiere a compuestos amorfos y cristalinos de fórmula I, mezclas de diferentes estados cristalinos del compuesto I respectivo, así como a sales amorfas o cristalinas de los mismos.

40 Las sales de los compuestos de la fórmula I son preferiblemente sales veterinarias y/o aceptables desde el punto de vista agrícola, preferiblemente sales aceptables desde el punto de vista agrícola. Se pueden formar de una manera habitual, por ejemplo haciendo reaccionar el compuesto con un ácido del anión en cuestión si el compuesto de fórmula I tiene una funcionalidad básica.

45 Las sales útiles desde el punto de vista veterinario y/o agrícola de los compuestos de fórmula I abarcan especialmente las sales de adición de ácido de aquellos ácidos cuyos cationes y aniones, respectivamente, no tienen efectos adversos sobre la acción plaguicida de los compuestos de fórmula I.

50 Los aniones de sales de adición de ácido útiles son principalmente cloruro, bromuro, fluoruro, hidrogenosulfato, sulfato, dihidrogenofosfato, hidrogenofosfato, fosfato, nitrato, bicarbonato, carbonato, hexafluorosilicato, hexafluorofosfato, benzoato y los aniones de ácidos C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcanoicos, preferiblemente formiato, acetato, propionato y butirato. Pueden formarse haciendo reaccionar compuestos de fórmula I con un ácido del correspondiente anión, preferiblemente ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico o ácido nítrico.

El término "N-óxido" incluye cualquier compuesto de fórmula I que tiene al menos un átomo de nitrógeno terciario que se oxida a una unidad estructural N-óxido.

Las unidades estructurales orgánicas mencionadas en las definiciones anteriores de las variables son - como el término halógeno- términos colectivos para listados individuales de los miembros de grupo individual. El prefijo C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub> indica en cada caso el número posible de átomos de carbono en el grupo.

El término "halógeno" denota en cada caso flúor, bromo, cloro o yodo, en particular flúor, cloro o bromo.

5 El término "alquilo" como se usa en el presente documento y en las unidades estructurales alquilo de alquilamino, alquilcarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo y alcoxialquilo denota en cada caso un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene usualmente de 1 a 10 átomos de carbono, frecuentemente de 1 a 6 átomos de carbono, preferiblemente de 1 a 4 átomos de carbono, más preferiblemente de 1 a 3 átomos de carbono. Ejemplos de un grupo alquilo son metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, 2-butilo, iso-butilo, tert-butilo, n-pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, n-hexilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1, 2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2- trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo y 1-etil-2-metilpropilo.

15 El término "haloalquilo" como se usa en el presente documento y en las unidades estructurales haloalquilo de haloalquilcarbonilo, haloalcoxycarbonilo, haloalquiltio, haloalquilsulfinilo, haloalquilsulfonilo, haloalcoxi y haloalcoxialquilo, se denomina en cada caso un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene usualmente de 1 de 1 a 6 átomos de carbono, preferiblemente de 1 a 4 átomos de carbono, en donde los átomos de hidrógeno de este grupo están parcial o totalmente reemplazados con átomos de halógeno. Las unidades estructurales haloalquilo preferidos se seleccionan de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilo, más preferiblemente de C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilo o C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> haloalquilo, en particular de C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> fluoroalquilo tal como fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, pentafluoroetilo y similares.

20 El término "alcoxi" como se usa en este documento denota en cada caso un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que se une a través de un átomo de oxígeno y usualmente tiene de 1 a 10 átomos de carbono, frecuentemente de 1 a 6 átomos de carbono, preferiblemente de 1 a 4 carbonos. átomos Ejemplos de un grupo alcoxi son metoxi, etoxi, n-propoxi, iso-propoxi, n-butiloxi, 2-butiloxi, iso-butiloxi, tert-butiloxi y similares.

25 El término "alcoxialquilo" como se usa en el presente documento se refiere a alquilo que usualmente comprende de 1 a 10, con frecuencia de 1 a 4, preferiblemente de 1 a 2 átomos de carbono, en donde 1 átomo de carbono lleva un radical alcoxi que usualmente comprende de 1 a 4, preferiblemente de 1 o 2 átomos de carbono como se definió anteriormente. Ejemplos son CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>-OC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, 2- (metoxi)etilo y 2-(etoxi) etilo.

30 El término "carbociclo" incluye en general un anillo no aromático monocíclico de 3 a 8 miembros o de 5 a 8 miembros, preferiblemente de 5 o 6 miembros, que comprende de 3 a 8 o de 5 a 8, preferiblemente 5 o 6 átomos de carbono.

35 El término "heterociclo" incluye en general un anillo no aromático monocíclico de 3 a 8 miembros o de 5 a 8 miembros, preferiblemente de 5 o 6 miembros como se describe para el "carbociclo" anterior, que comprende 1, 2, o 3 heteroátomos seleccionados de N, O y S como miembros del anillo, donde los átomos de S como miembros del anillo pueden estar presentes como S, SO o SO<sub>2</sub>.

Con respecto a las variables, las realizaciones particularmente preferidas de los intermedios corresponden a las de los compuestos de fórmula I.

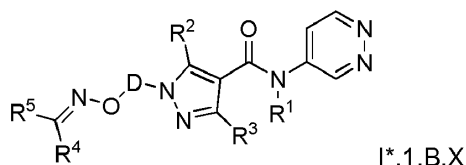
40 En una realización particular, las variables de los compuestos de la fórmula I tienen los siguientes significados, estos significados, tanto en sí mismos como en combinación entre sí, son realizaciones particulares de los compuestos de la fórmula I:

En una realización preferida de los compuestos de fórmula I, R<sup>1</sup> es C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alquilo.

45 En otra realización preferida de los compuestos de fórmula I, D es un C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alquileo ramificado, preferiblemente un C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alquileo ramificado alfa, en donde el C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alquileo puede estar no sustituido o puede estar parcial o totalmente sustituido con sustituyentes que, independientemente entre sí, se seleccionan de R<sup>A</sup>. Es particularmente preferido que D sea CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>, en donde preferiblemente el grupo CH<sub>2</sub> está unido a V y el grupo CH(CH<sub>3</sub>) está unido al átomo de nitrógeno de la unidad estructural pirazol, de manera que se obtiene una conectividad de V-CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)-N.

En vista de lo anterior, la invención se refiere a compuestos de fórmula I,

en donde T es O, U es N, V es O y R<sup>P1</sup>, R<sup>P2</sup> y R<sup>P3</sup> son H, es decir, compuestos de fórmula I \*.1.B.X.





- La presente invención también se refiere a una mezcla de al menos un compuesto de la presente invención con al menos un asociado de mezcla como se define aquí más adelante. Se prefieren las mezclas binarias de un compuesto de la presente invención como componente I con un asociado de mezcla como se define en este documento después como componente II. Las relaciones en peso preferidas para tales mezclas binarias son de 5000: 1 a 1: 5000, preferiblemente de 1000: 1 a 1: 1000, más preferiblemente de 100: 1 a 1: 100, en particular preferiblemente de 10: 1 a 1:10. En tales mezclas binarias, los componentes I y II se pueden usar en cantidades iguales, o un exceso de componente I, o un exceso de componente II.
- Los asociados de mezcla se pueden seleccionar de plaguicidas, en particular insecticidas, nematocidas y acaricidas, fungicidas, herbicidas, reguladores del crecimiento de plantas, fertilizantes y similares. Asociados de mezcla preferidos son insecticidas, nematocidas y fungicidas.
- Asociados de mezcla adecuados para los compuestos de la presente invención también incluyen bioplaguicidas. Los bioplaguicidas se han definido como una forma de plaguicidas basados en microorganismos (bacterias, hongos, virus, nematodos, etc.) o productos naturales (compuestos, tales como metabolitos, proteínas o extractos de fuentes biológicas u otras fuentes naturales) (U.S. Environmental Protection Agency: <http://www.epa.gov/pesticides/biopesticides/>). Los bioplaguicidas se clasifican en dos clases principales, plaguicidas microbianos y bioquímicos:
- (1) Los plaguicidas microbianos están formados por bacterias, hongos o virus (y con frecuencia incluyen los metabolitos que producen las bacterias y los hongos). Los nematodos entomopatógenos también se clasifican como plaguicidas microbianos, aunque son multicelulares.
  - (2) Los plaguicidas bioquímicos son sustancias de origen natural o estructuralmente similares y funcionalmente idénticas a una sustancia de origen natural y extractos de fuentes biológicas que controlan plagas o brindan otros usos de protección de cultivos como se define a continuación, pero tienen un modo de acción no tóxico (tales como el crecimiento o la regulación del desarrollo, agentes de atracción, repelentes o activadores de defensa (por ejemplo, resistencia inducida) y son relativamente no tóxicos para los mamíferos.
- Los bioplaguicidas para uso contra enfermedades de cultivos ya se han establecido en una variedad de cultivos. Por ejemplo, los bioplaguicidas ya desempeñan un papel importante en el control de las enfermedades por mildiú veloso. Sus beneficios incluyen: un intervalo de 0 días antes de la cosecha, la capacidad de uso bajo una presión de enfermedad moderada a grave y la capacidad de usar en mezcla o en un programa rotativo con otros plaguicidas registrados.
- Un área importante de crecimiento para los bioplaguicidas se encuentra en el área de tratamientos de semillas y enmiendas del suelo. Los tratamientos de semillas biopesticidas se utilizan, por ejemplo, para controlar patógenos fúngicos que se originan del suelo que causan putrefacción de las semillas, que pudren el pie, putrefacción de las raíces y añublos de las plántulas. También se pueden usar para controlar patógenos fúngicos que son de origen interno de las semillas, así como patógenos fúngicos que están en la superficie de la semilla. Muchos productos bioplaguicidas también muestran capacidades para estimular las defensas del huésped vegetal y otros procesos fisiológicos que pueden hacer que los cultivos tratados sean más resistentes a una variedad de estrés biótico y abiótico o que puedan regular el crecimiento de las plantas. Muchos productos bioplaguicidas también muestran capacidades para estimular la salud de las plantas, el crecimiento de las plantas y/o la actividad de mejora del rendimiento.
- De acuerdo con la invención, el material sólido (materia seca) de los bioplaguicidas (con la excepción de aceites como el aceite de Neem) se considera como componentes activos (por ejemplo, que se obtienen después del secado o la evaporación del medio de extracción o suspensión en caso de formulaciones líquidas de los plaguicidas microbianos).
- De acuerdo con la presente invención, las relaciones en peso y los porcentajes utilizados en el presente documento para un extracto biológico tal como el extracto de Quillay se basan en el peso total del contenido seco (material sólido) de los extractos respectivos.
- Las relaciones de peso total de las composiciones que comprenden al menos un plaguicida microbiano en forma de células microbianas viables que incluyen formas latentes, se pueden determinar usando la cantidad de CFU del microorganismo respectivo para calcular el peso total del componente activo respectivo con la siguiente ecuación que  $1 \times 10^{10}$  CFU equivale a un gramo de peso total del componente activo respectivo. La unidad formadora de colonias es una medida de células microbianas viables, en particular células fúngicas y bacterianas. Además, aquí "UFC" también puede entenderse como el número de nematodos individuales (juveniles) en el caso de bioplaguicidas nemátodos (entomopatógenos), como *Steinernema feltiae*.
- Cuando se emplean mezclas que comprenden plaguicidas microbianos en la protección de cultivos, las tasas de aplicación varían de aproximadamente  $1 \times 10^6$  a  $5 \times 10^{15}$  (o más) CFU/ha, preferiblemente de aproximadamente  $1 \times 10^8$  a aproximadamente  $1 \times 10^{13}$  CFU/ha, e incluso más preferiblemente de aproximadamente  $1 \times 10^9$  a aproximadamente  $1 \times 10^{12}$  UFC/ha. En el caso de nematodos (entomopatógenos) como plaguicidas microbianos (por ejemplo, *Steinernema feltiae*), las tasas de aplicación informan preferiblemente de  $1 \times 10^5$  a  $1 \times 10^{12}$  (o más), más preferiblemente de  $1 \times 10^8$  a  $1 \times 10^{11}$ , incluso más preferiblemente de  $5 \times 10^8$  a  $1 \times 10^{10}$  individuos (por ejemplo, en forma de huevos, juveniles o en cualquier otro estadio vivo, preferiblemente en un estadio juvenil infetivo) por hectárea.

- 5 Cuando se emplean mezclas que comprenden plaguicidas microbianos en el tratamiento de semillas, las tasas de aplicación con respecto al material de propagación de plantas varían preferiblemente de aproximadamente  $1 \times 10^6$  a  $1 \times 10^{12}$  (o más) UFC/semilla. Preferiblemente, la concentración es de aproximadamente  $1 \times 10^6$  a aproximadamente  $1 \times 10^9$  UFC/semilla. En el caso de los plaguicidas microbianos II, las tasas de aplicación con respecto al material de propagación de plantas también varían preferiblemente de aproximadamente  $1 \times 10^7$  a  $1 \times 10^{14}$  (o más) CFU por 100 kg de semilla, preferiblemente de  $1 \times 10^9$  a aproximadamente  $1 \times 10^{12}$  UFC por 100 kg de semilla.
- La invención también se refiere a composiciones agroquímicas que comprenden un auxiliar y al menos un compuesto de la presente invención o una mezcla de los mismos.
- 10 Una composición agroquímica comprende una cantidad plaguicida efectiva de un compuesto de la presente invención o una mezcla de los mismos. El término "cantidad efectiva como plaguicida" se define a continuación.
- 15 Los compuestos de la presente invención o las mezclas de los mismos pueden convertirse en tipos habituales de composiciones agroquímicas, por ejemplo soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, polvos, pastas, gránulos, prensados, cápsulas y mezclas de los mismos. Ejemplos de tipos de composición son suspensiones (por ejemplo, SC, OD, FS), concentrados emulsionables (por ejemplo, EC), emulsiones (por ejemplo, EW, EO, ES, ME), cápsulas (por ejemplo, CS, ZC), pastas, pastillas, polvos o polvos humectables (por ejemplo, WP, SP, WS, DP, DS), prensados (por ejemplo, BR, TB, DT), gránulos (por ejemplo, WG, SG, GR, FG, GG, MG), artículos insecticidas (por ejemplo, LN), así como formulaciones en gel para el tratamiento de materiales de propagación de plantas tales como semillas (por ejemplo, GF). Estos y tipos de composiciones adicionales se definen en el "Catalogue of pesticide formulation types and international coding system", Technical Monograph No. 2, 6th Ed. May 2008, CropLife International.
- 20 Las composiciones se preparan de una manera conocida, tal como se describe por Mollet and Grubemann, Formulation technology, Wiley VCH, Weinheim, 2001; or Knowles, New developments in crop protection product formulation, Agrow Reports DS243, T&F Informa, London, 2005.
- 25 Ejemplos de agentes auxiliares adecuados son solventes, portadores líquidos, portadores sólidos o agentes de relleno, surfactantes, dispersantes, emulsionantes, humectantes, adyuvantes, solubilizantes, mejoradores de la penetración, coloides protectores, agentes de adhesión, espesantes, humectantes, repelentes, atrayentes, estimulantes de alimentación, compatibilizadores, bactericidas, agentes anticongelantes, agentes antiespumantes, colorantes, agentes de pegajosidad y aglutinantes.
- 30 Los disolventes y portadores líquidos adecuados son agua y disolventes orgánicos, tal como las fracciones de aceite mineral de punto de ebullición medio a alto, por ejemplo queroseno, aceite diesel; aceites de origen vegetal o animal; hidrocarburos alifáticos, cíclicos y aromáticos, por ejemplo tolueno, parafina, tetrahidronaftaleno, naftalenos alquilados; alcoholes, por ejemplo etanol, propanol, butanol, alcohol bencílico, ciclo, hexanol; glicoles; DMSO; cetonas, por ejemplo ciclohexanona; ésteres, por ejemplo lactatos, carbonatos, ésteres de ácidos grasos, gamma-butirolactona; ácidos grasos; fosfonatos; aminas, amidas, por ejemplo N-metilpirrolidona, dimetilamidas de ácidos grasos; y mezclas de los mismos.
- 35 Los portadores sólidos o agentes de relleno adecuados son tierras minerales, por ejemplo silicatos, geles de sílica, talco, caolines, piedra caliza, cal, tiza, arcillas, dolomita, tierra de diatomeas, bentonita, sulfato de calcio, sulfato de magnesio, óxido de magnesio; polvos de polisacáridos, por ejemplo celulosa, almidón; fertilizantes, por ejemplo sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, ureas; productos de origen vegetal, por ejemplo harina de cereal, harina de corteza de árbol, harina de madera, harina de cáscara de nuez y mezclas de los mismos.
- 40 Los surfactantes adecuados son compuestos con actividad de superficie, tales como surfactantes aniónicos, catiónicos, no iónicos y anfotéricos, polímeros de bloque, polielectrolitos y mezclas de los mismos. Tales surfactantes se pueden usar como emulsificantes, dispersantes, solubilizantes, humedecedores, mejoradores de la penetración, coloides protectores o adyuvantes. Ejemplos de surfactantes se listan en McCutcheon's, Vol.1: Emulsifiers & Detergents, McCutcheon's Directories, Glen Rock, USA, 2008 (International Ed. or North American Ed.).
- 45 Los surfactantes aniónicos adecuados son sales alcalinas, alcalinotérricas o de amonio de sulfonatos, sulfatos, fosfatos, carboxilatos y mezclas de los mismos. Ejemplos de sulfonatos son sulfatos de alquilarilo, sulfonatos de difenilo, sulfonatos de alfa-olefina, sulfonatos de lignina, sulfonatos de ácidos grasos y aceites, sulfonatos de alquilfenoles etoxilados, sulfonatos de arilfenoles alcoxilados, sulfonatos de naftalenos condensados, sulfonatos de dodecil y tridecibencenos, sulfonatos de naftalenos, y alquilnaftalenos, sulfosuccinatos o sulfosuccinamatos. Ejemplos de sulfatos son sulfatos de ácidos grasos y aceites, de alquilfenoles etoxilados, de alcoholes, de alcoholes etoxilados o de ésteres de ácidos grasos. Ejemplos de fosfatos son los ésteres de fosfato. Ejemplos de carboxilatos son carboxilatos de alquilo, y alcohol carboxilado o etiloxilatos de alquilfenol.
- 50 Los surfactantes no iónicos adecuados son alcoxilatos, amidas de ácidos grasos N-sustituidos, óxidos de amina, ésteres, surfactantes a base de azúcar, surfactantes poliméricos y mezclas de los mismos. Ejemplos de alcoxilatos son compuestos tales como alcoholes, alquilfenoles, aminas, amidas, arilfenoles, ácidos grasos o ésteres de ácidos grasos que han sido alcoxilados con 1 a 50 equivalentes. Se puede emplear óxido de etileno y/u óxido de propileno para la alcoxilación, preferiblemente óxido de etileno. Ejemplos de amidas de ácidos grasos N-sustituidas son glucamidas de ácidos grasos o alcanolamidas de ácidos grasos. Ejemplos de ésteres son ésteres de ácidos grasos,

ésteres de glicerol o monoglicéridos. Ejemplos de surfactantes basados en azúcares son sorbitanos, sorbitanos etoxilados, ésteres de sacarosa y glucosa o alquilpoliglucósidos. Ejemplos de surfactantes poliméricos son homo o copolímeros de vinilpirrolidona, vinilalcoholes o acetato de vinilo.

- 5 Los surfactantes catiónicos adecuados son surfactantes cuaternarios, por ejemplo compuestos de amonio cuaternario con uno o dos grupos hidrófobos, o sales de aminas primarias de cadena larga. Los surfactantes anfotéricos adecuados son alquilbetinas e imidazolininas. Los polímeros de bloque adecuados son polímeros de bloque del tipo A-B o A-B-A que comprenden bloques de óxido de polietileno y óxido de polipropileno, o del tipo A-B-C que comprenden alcohol, óxido de polietileno y óxido de polipropileno. Los polielectrolitos adecuados son poliacidos o polibases. Ejemplos de poliacidos son sales alcalinas de ácido poliacrílico o polímeros de peine poliacidos. Ejemplos de polibases son polivinilaminas o polietilenaminas.

Adyuvantes adecuados son compuestos, que tienen en sí mismos una actividad plaguicida despreciable o incluso nula, y que mejoran el rendimiento biológico de los compuestos de la presente invención sobre el objetivo. Algunos ejemplos son surfactantes, aceites minerales o vegetales y otros agentes auxiliares. Ejemplos adicionales son listados por Knowles, Adjuvants and additives, Agrow Reports DS256, T&F Informa UK, 2006, capítulo 5.

- 15 Espesantes adecuados son polisacáridos (por ejemplo, goma de xantano, carboximetilcelulosa), arcillas inorgánicas (orgánicamente modificadas o no modificadas), policarboxilatos y silicatos.

Los bactericidas adecuados son bronopol y derivados de isotiazolinona tales como alquilisotiazolinonas y benzisotiazolinonas.

Agentes anticongelantes adecuados son etilenglicol, propilenglicol, urea y glicerina.

- 20 Agentes antiespumantes adecuados son siliconas, alcoholes de cadena larga y sales de ácidos grasos.

Los colorantes adecuados (por ejemplo, en rojo, azul o verde) son pigmentos de baja solubilidad en agua y tintes solubles en agua. Ejemplos son colorantes inorgánicos (por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, hexacianoferrato de hierro) y colorantes orgánicos (por ejemplo, colorantes alizarina, azo y ftalocianina).

- 25 Agentes de pegajosidad o aglutinantes adecuados son polivinilpirrolidonas, polivinilacetatos, alcoholes polivinílicos, poliacrilatos, ceras biológicas o sintéticas y éteres de celulosa.

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

- 30 Pueden agregarse diversos tipos de aceites, humectantes, adyuvantes, fertilizantes o micronutrientes y otros plaguicidas (por ejemplo, herbicidas, insecticidas, fungicidas, reguladores del crecimiento, protectores) a las sustancias activas o las composiciones que los incluyen como premezcla o, si corresponde no hasta inmediatamente antes de usar (mezcla en tanque). Estos agentes pueden mezclarse con las composiciones de acuerdo con la invención en una relación en peso de 1:100 a 100:1, preferiblemente de 1:10 a 10:1.

- 35 El usuario aplica la composición de acuerdo con la invención, usualmente desde un dispositivo de predosificación, un aspersor de mochila, un tanque de aspersión, un plano de rociado o un sistema de irrigación. Usualmente, la composición agroquímica se compone de agua, regulador y/o agentes auxiliares adicionales para la concentración de aplicación deseada y se obtiene el licor de aspersión listo para usar o la composición agroquímica de acuerdo con la invención. Usualmente, se aplican de 20 a 2000 litros, preferiblemente de 50 a 400 litros, del licor de aspersión listo para usar por hectárea de área útil para la agricultura.

- 40 De acuerdo con una realización, los componentes individuales de la composición de acuerdo con la invención, tales como partes de un kit o partes de una mezcla binaria o ternaria, pueden ser mezclados por el propio usuario en un tanque de aspersión y se pueden agregar otros agentes auxiliares, si es apropiado.

- 45 En una realización adicional, ya sea componentes individuales de la composición de acuerdo con la invención o componentes parcialmente premezclados, por ejemplo el usuario puede mezclar componentes que comprenden los compuestos de la presente invención y/o los asociados de mezcla definidos anteriormente, en un tanque de aspersión y se pueden agregar otros agentes auxiliares y aditivos, si es apropiado.

- 50 En una realización adicional, ya sea componentes individuales de la composición de acuerdo con la invención o componentes parcialmente premezclados, por ejemplo los componentes que comprenden los compuestos de la presente invención y/o los asociados de mezcla como se definen anteriormente, se pueden aplicar conjuntamente (por ejemplo, después de la mezcla en tanque) o consecutivamente.

Los compuestos de la presente invención son adecuados para uso en la protección de cultivos, plantas, materiales de propagación de plantas, tales como semillas, o suelo o agua, en el que crecen las plantas, frente al ataque o la infestación por plagas animales. Por lo tanto, la presente invención también se refiere a un método de protección de plantas, que comprende poner en contacto los cultivos, plantas, materiales de propagación de plantas, tales como

semillas, o suelo o agua, en el que crecen las plantas, para ser protegidas del ataque o la infestación por plagas animales, con una cantidad efectiva como plaguicida de un compuesto de la presente invención.

Los compuestos de la presente invención también son adecuados para usar en combatir o controlar plagas animales. Por lo tanto, la presente invención también se refiere a un método para combatir o controlar plagas animales, que comprende poner en contacto las plagas animales, su hábitat, sus terrenos de crianza o el suministro de alimentos, o los cultivos, las plantas, los materiales de propagación de plantas, tales como las semillas o el suelo, o el área, material o ambiente en el que crecen o pueden crecer las plagas animales, con una cantidad efectiva como plaguicida de un compuesto de la presente invención.

Los compuestos de la presente invención son efectivos tanto por contacto como por ingestión. Adicionalmente, los compuestos de la presente invención se pueden aplicar a cualquiera y todas las etapas de desarrollo, tales como huevo, larva, pupa y adulto.

Los compuestos de la presente invención se pueden aplicar como tales o en forma de composiciones que los comprenden como se definió anteriormente. Adicionalmente, los compuestos de la presente invención se pueden aplicar junto con un asociado de mezcla como se definió anteriormente o en forma de composiciones que comprenden dichas mezclas como se definió anteriormente. Los componentes de dicha mezcla se pueden aplicar de forma simultánea, conjunta o por separado, o sucesivamente, es decir, uno tras otro y creando la mezcla "in situ" en la ubicación deseada, por ejemplo la planta, la secuencia, en el caso de una aplicación separada, generalmente no tienen ningún efecto sobre el resultado de las medidas de control.

La aplicación puede llevarse a cabo tanto antes como después de la infestación de los cultivos, plantas, materiales de propagación de plantas, tal como semillas, suelo o el área, material o medio ambiente por las plagas.

Los métodos de aplicación adecuados incluyen, pero no se limitan a, el tratamiento del suelo, el tratamiento de semillas, la aplicación en surcos y la aplicación foliar. Los métodos de tratamiento del suelo incluyen empapar el suelo, riego por goteo (aplicación de goteo en el suelo), raíces de inmersión, tubérculos o bulbos, o inyección de suelo. Las técnicas de tratamiento de semillas incluyen cubrimiento de semillas, recubrimiento de semillas, el espolvoreo de semillas, el remojo de semillas y la granulación de semillas. En aplicaciones de surcos, por lo general, se incluyen las etapas para hacer un surco en tierra cultivada, sembrar el surco con semillas, aplicar el compuesto plaguicida activo al surco y cerrar el surco. La aplicación foliar se refiere a la aplicación del compuesto plaguicida activo al follaje de la planta, por ejemplo a través de equipos de aspersión. Para aplicaciones foliares, puede ser ventajoso modificar el comportamiento de las plagas mediante el uso de feromonas en combinación con los compuestos de la presente invención. Las feromonas adecuadas para cultivos y plagas específicas son conocidas por un experto y están disponibles públicamente en bases de datos de feromonas y productos semioquímicos, tales como <http://www.pherobase.com>.

Tal como se usa en el presente documento, el término "poner en contacto" incluye tanto el contacto directo (aplicando los compuestos/composiciones directamente sobre la plaga animal o la planta - típicamente al follaje, el tallo o las raíces de la planta) como el contacto indirecto (aplicar los compuestos/composiciones al locus (es decir, hábitat, terrenos de crianza, planta, semilla, suelo, área, material o entorno en el que una plaga crece o puede crecer, de la plaga animal o planta).

El término "plaga animal" incluye artrópodos, gasterópodos y nematodos. Las plagas animales preferidas de acuerdo con la invención son artrópodos, preferiblemente insectos y arácnidos, en particular insectos. Los insectos, que son de particular relevancia para los cultivos, generalmente se conocen como plagas de insectos en los cultivos.

El término "cultivo" se refiere tanto a los cultivos en crecimiento como a los cosechados.

El término "planta" incluye cereales, por ejemplo, trigo durum y otros trigos, centeno, cebada, tritical, avena, arroz o maíz (maíz forrajero y maíz de azúcar/dulce y maíz de campo); remolacha, por ejemplo remolacha azucarera o remolacha forrajera; frutas, tal como pomes, frutas de hueso o frutas suaves, por ejemplo manzanas, peras, ciruelas, melocotones, nectarinas, almendras, cerezas, papayas, fresas, frambuesas, moras o grosellas; plantas leguminosas, tales como frijoles, lentejas, guisantes, alfalfa o soja; plantas de aceite, tales como semilla de colza (colza oleaginosa), colza nabina, mostaza, aceitunas, girasoles, coco, granos de cacao, plantas de aceite de ricino, palmas de aceite, nueces molidas o semillas de soja; cucurbitáceas, tales como calabazas, calabacines, pepinos o melones; plantas de fibra, tales como algodón, lino, cáñamo o yute; cítricos, tales como naranjas, limones, pomelos o mandarinas; vegetales, tales como berenjena, espinaca, lechuga (por ejemplo, lechuga iceberg), achicoria, col, espárragos, coles, zanahorias, cebollas, ajos, puerros, tomates, patatas, cucurbitáceas o pimientos dulces; plantas lauráceas, tales como aguacates, canela o alcanfor; plantas de energía y materia prima, como maíz, soja, colza, caña de azúcar o palma de aceite; tabaco; nueces, por ejemplo nueces pistachos; café; té; plátanos viñas (uvas de mesa y vides de uva para zumo de uva); lúpulo; hoja dulce (también llamada Stevia); plantas de caucho natural o plantas ornamentales y forestales, tales como flores (por ejemplo, claveles, petunias, geranios/pelargonios, pensamientos e impatiens), arbustos, árboles de hoja ancha (por ejemplo, álamo) o árboles de hoja perenne, por ejemplo, coníferas; eucalipto; turba; césped; pasto tal como pasto para la alimentación animal o usos ornamentales. Las plantas preferidas incluyen patatas, remolacha azucarera, tabaco, trigo, centeno, cebada, avena, arroz, maíz, algodón, soja, semilla de colza,

legumbres, girasoles, café o caña de azúcar; frutas; vides; ornamentales; o vegetales, como pepinos, tomates, frijoles o calabazas.

Debe entenderse que el término "planta" incluye plantas y plantas de tipo silvestre, que han sido modificadas por reproducción convencional, por mutagénesis o por ingeniería genética, o por una combinación de las mismas.

5 Las plantas, que han sido modificadas por mutagénesis o ingeniería genética, y son de particular importancia comercial, incluyen alfalfa, semilla de colza (por ejemplo, colza oleaginosa), frijol, clavel, achicoria, algodón, berenjena, eucalipto, lino, lenteja, maíz, melón, papaya, petunia, ciruela, álamo, patata, arroz, soja, calabaza, remolacha azucarera, caña de azúcar, girasol, pimiento dulce, tabaco, tomate y cereales (por ejemplo, trigo), en particular maíz, soja, algodón, trigo y arroz. En plantas, que han sido modificadas por mutagénesis o ingeniería genética, uno o más genes han sido mutagenizados o integrados en el material genético de la planta. El uno o más genes mutagenizados o integrados se seleccionan preferiblemente de pat, epsps, cry1Ab, bar, cry1Fa2, cry1Ac, cry34Ab1, cry35AB1, cry3A, cryF, cry1F, mcry3a, cry2Ab2, cry3Bb1, cry1A.105, dfr, barnase, vip3Aa20, barstar, als, bxn, bp40, asn1, y ppo5. La mutagénesis o integración del uno o más genes se realiza para mejorar ciertas propiedades de la planta. Tales propiedades, también conocidas como rasgos, incluyen tolerancia al estrés abiótico, crecimiento/rendimiento alterado, resistencia a enfermedades, tolerancia a herbicidas, resistencia a insectos, calidad de producto modificada y control de polinización. De estas propiedades, la tolerancia a los herbicidas, por ejemplo la tolerancia a la imidazolinona, la tolerancia al glifosato o la tolerancia al glufosinato es de particular importancia. Varias plantas se han vuelto tolerantes a los herbicidas por mutagénesis, por ejemplo, la colza Clearfield® es tolerante a las imidazolinonas, por ejemplo imazamox. Alternativamente, se han utilizado métodos de ingeniería genética para producir plantas, como la soja, el algodón, el maíz, la remolacha y la colza oleaginosa, tolerantes a los herbicidas, tales como el glifosato y el glufosinato, algunos de los cuales están disponibles comercialmente bajo los nombres comerciales RoundupReady® (glifosato) y LibertyLink® (glufosinato). Adicionalmente, la resistencia a los insectos es de importancia, en particular la resistencia a los insectos lepidópteros y la resistencia a los insectos coleópteros. La resistencia a los insectos se logra típicamente modificando las plantas al integrar los genes cry y/o vip, que se aislaron de *Bacillus thuringiensis* (Bt) y se codifican las toxinas Bt respectivas. Las plantas modificadas genéticamente con resistencia a los insectos están disponibles comercialmente con nombres comerciales que incluyen WideStrike®, Bollgard®, Agrisure®, Herculex®, YieldGard®, Genuity® e Intacta®. Las plantas pueden modificarse por mutagénesis o ingeniería genética, ya sea en términos de una propiedad (rasgos singulares) o en términos de una combinación de propiedades (rasgos apilados). Los rasgos apilados, por ejemplo, la combinación de tolerancia a herbicidas y resistencia a insectos, tiene una importancia creciente. En general, todas las plantas modificadas relevantes relacionadas con rasgos singulares o apilados, así como información detallada sobre los genes mutagenizados o integrados y los eventos respectivos, están disponibles en los sitios web de las organizaciones "International Service for the Acquisition of Agri-biotech Applications (ISAAA)" (<http://www.isaaa.org/gmaprovaldatabase>) and "Center for Environmental Risk Assessment (CERA)" (<http://ceragmc.org/GMCropDatabase>).

35 Se ha encontrado sorprendentemente que la actividad plaguicida de los compuestos de la presente invención puede potenciarse mediante el rasgo insecticida de una planta modificada. Además, se ha encontrado que los compuestos de la presente invención son adecuados para evitar que los insectos se vuelvan resistentes al rasgo insecticida o para combatir plagas, que ya se han hecho resistentes al rasgo insecticida de una planta modificada. Además, los compuestos de la presente invención son adecuados para combatir plagas, contra los cuales el rasgo insecticida no es efectivo, de tal manera que puede usarse ventajosamente una actividad insecticida complementaria.

45 El término "material de propagación de la planta" se refiere a todas las partes generativas de la planta, tales como semillas y material vegetal vegetativo, tales como esquejes y tubérculos (por ejemplo, patatas), que se pueden usar para la multiplicación de la planta. Esto incluye semillas, raíces, frutas, tubérculos, bulbos, rizomas, brotes, retoños y otras partes de las plantas. También se pueden incluir las plántulas y las plantas jóvenes, que se trasplantarán después de la germinación o después de la emergencia del suelo. Estos materiales de propagación de plantas pueden tratarse de manera profiláctica con un compuesto de protección para plantas ya sea en o antes de la siembra o trasplante.

El término "semilla" abarca semillas y propágulos de plantas de todo tipo, que incluyen pero no se limitan a semillas verdaderas, piezas de semillas, lechones, bulbos, frutos, tubérculos, granos, esquejes, brotes cortados y similares, y medios en una realización preferida semillas verdaderas.

50 En general, "cantidad efectiva como plaguicida" significa la cantidad de ingrediente activo necesaria para lograr un efecto observable en el crecimiento, incluidos los efectos de necrosis, muerte, retraso, prevención y eliminación, destrucción o, de lo contrario, disminución de la incidencia y actividad del organismo objetivo. La cantidad efectiva como plaguicida puede variar para los diversos compuestos/composiciones usados en la invención. Una cantidad efectiva como plaguicida de las composiciones también variará de acuerdo con las condiciones prevalecientes, tales como el efecto y duración plaguicidas deseados, el clima, las especies objetivo, el lugar, el modo de aplicación y similares.

En el caso del tratamiento del suelo, en aplicaciones de surcos o de aplicación en el lugar de morada o nido de las plagas, la cantidad de ingrediente activo varía de 0,0001 a 500 g por 100 m<sup>2</sup>, preferiblemente de 0,001 a 20 g por 100 m<sup>2</sup>.

## ES 2 707 751 T3

- 5 Para uso en el tratamiento de plantas de cultivo, por ejemplo por aplicación foliar, la tasa de aplicación de los ingredientes activos de esta invención puede estar en el rango de 0,0001 ga 4000 g por hectárea, por ejemplo de 1 g a 2 kg por hectárea o de 1 g a 750 g por hectárea, de manera deseable de 1 g a 100 g por hectárea, más deseablemente de 10 g a 50 g por hectárea, por ejemplo, de 10 a 20 g por hectárea, de 20 a 30 g por hectárea, 30 a 40 g por hectárea, o 40 a 50 g por hectárea.
- 10 Los compuestos de la presente invención son particularmente adecuados para uso en el tratamiento de semillas con el fin de proteger las semillas de plagas de insectos, en particular de plagas de insectos que viven en el suelo, y las raíces y brotes de plántulas resultantes contra plagas del suelo e insectos foliares. Por lo tanto, la presente invención también se refiere a un método para la protección de semillas a partir de insectos, en particular de insectos del suelo, y de las raíces y brotes de plántulas de los insectos, en particular de insectos del suelo y foliares, comprendiendo dicho método tratar las semillas antes de la siembra y/o después de la pregerminación con un compuesto de la presente invención. Se prefiere la protección de las raíces y brotes de las plántulas. Más preferida es la protección de los brotes de las plántulas de los insectos perforadores y chupadores, los insectos masticadores y los nematodos.
- 15 El término "tratamiento de semillas" comprende todas las técnicas de tratamiento de semillas adecuadas conocidas en la técnica, tales como el cubrimiento de semillas, el recubrimiento de semillas, el espolvoreo de semillas, el remojo de semillas, la granulación de semillas y los métodos de aplicación en surcos. Preferiblemente, la aplicación de tratamiento de semillas del compuesto activo se lleva a cabo asperjando o espolvoreando las semillas antes de sembrar las plantas y antes de la aparición de las plantas.
- 20 La presente invención también comprende semillas recubiertas con o que contienen el compuesto activo. El término "recubierto con y/o que contiene" generalmente significa que el ingrediente activo está en su mayor parte en la superficie del producto de propagación en el momento de la aplicación, aunque una mayor o menor parte del ingrediente puede penetrar en el producto de propagación, dependiendo del método de aplicación. Cuando dicho producto de propagación es (re)plantado, puede absorber el ingrediente activo.
- 25 Semillas adecuadas son, por ejemplo, semillas de cereales, cultivos de raíces, cultivos oleaginosos, hortalizas, especias, plantas ornamentales, por ejemplo, semillas de trigo durum y de otros trigos, cebada, avena, centeno, maíz (maíz forrajero y maíz azucarero/dulce y maíz de campo), soja, cultivos oleaginosos, crucíferas, algodón, girasoles, plátanos, arroz, semilla oleaginosa, colza, remolacha azucarera, remolacha forrajera, berenjenas, patatas, pasto, césped, turba, pasto de forraje, tomates, puerro, calabacines/calabaza, lechuga iceberg, pimiento, pepinos, melones, especies de Brassica, melones, frijoles, guisantes, ajos, cebollas, zanahorias, plantas tuberosas tal como patatas, caña de azúcar, tabaco, uvas, petunias, geranios/pelargonios, pensamientos e impatiens.
- 30 Además, el compuesto activo también se puede usar para el tratamiento de semillas de plantas, que se han modificado por mutagenesis o ingeniería genética, y que, por ejemplo, toleran la acción de herbicidas, fungicidas o insecticidas. Tales plantas modificadas se han descrito en detalle anteriormente.
- 35 Las formulaciones convencionales para el tratamiento de semillas incluyen, por ejemplo, concentrados fluidos FS, soluciones LS, suspoemulsiones (SE), polvos para el tratamiento en seco DS, polvos dispersables en agua para el tratamiento en pasta WS, polvos solubles en agua SS y emulsión ES y EC y formulación en gel GF. Estas formulaciones pueden aplicarse a la semilla diluida o no diluida. La aplicación a las semillas se lleva a cabo antes de la siembra, ya sea directamente sobre las semillas o después de haber pregerminado estas últimas. Preferiblemente, las formulaciones se aplican de manera que no se incluya la germinación.
- 40 Las concentraciones de sustancia activa en formulaciones listas para usar, que se pueden obtener después de una dilución de dos a diez veces, son preferiblemente de 0,01 a 60% en peso, más preferiblemente de 0,1 a 40% en peso.
- En una realización preferida, se usa una formulación de FS para el tratamiento de semillas. Normalmente, una formulación de FS puede comprender 1-800 g/l de ingrediente activo, 1-200 g/l de surfactante, 0 a 200 g/l de agente anticongelante, 0 a 400 g/l de aglutinante, 0 a 200 g/l de un pigmento y hasta 1 litro de solvente, preferiblemente agua.
- 45 Las formulaciones FS especialmente preferidas de los compuestos de la presente invención para el tratamiento de semillas generalmente comprenden de 0,1 a 80% en peso (1 a 800 g/l) del ingrediente activo, de 0,1 a 20% en peso (1 a 200 g/l) de al menos un surfactante, por ejemplo de 0,05 a 5% en peso de un humidificante y de 0,5 a 15% en peso de un agente dispersante, hasta un 20% en peso, por ejemplo de 5 a 20% de un agente anticongelante, de 0 a 15% en peso, por ejemplo 1 a 15% en peso de un pigmento y/o un tinte, de 0 a 40% en peso, por ejemplo 1 a 40% en peso de un aglutinante (adhesivo/agente de adhesión), opcionalmente hasta 5% en peso, por ejemplo de 0,1 a 5% en peso de un espesante, opcionalmente de 0,1 a 2% de un agente antiespumante, y opcionalmente un conservante tal como un biocida, antioxidante o similares, por ejemplo, en una cantidad de 0,01 a 1% en peso y un agente de relleno/vehículo de hasta 100% en peso.
- 50 En el tratamiento de semillas, las tasas de aplicación de los compuestos de la invención son generalmente de 0,1 g a 10 kg por 100 kg de semilla, preferiblemente de 1 g a 5 kg por 100 kg de semilla, más preferiblemente de 1 g a 1000 g por 100 kg de semilla y en particular de 1 g a 200 g por 100 kg de semilla, por ejemplo de 1 g a 100 g, o de 5 g a 100 g por 100 kg de semilla.
- 55

- 5 Por lo tanto, la invención también se refiere a semillas que comprenden un compuesto de la presente invención, o una sal del mismo útil en agricultura, como se define en el presente documento. La cantidad del compuesto de la presente invención o la sal útil en agricultura del mismo variará en general de 0,1 g a 10 kg por 100 kg de semilla, preferiblemente de 1 g a 5 kg por 100 kg de semilla, en particular de 1 g a 1000 g por 100 kg de semilla. Para cultivos específicos tal como la lechuga, la tasa puede ser mayor.
- Los compuestos de la presente invención también pueden usarse para mejorar la salud de una planta. Por lo tanto, la presente invención también se refiere a un método para mejorar la salud de las plantas mediante el tratamiento de una planta, material de propagación de la planta y/o el locus donde la planta está creciendo o ha de crecer con una cantidad efectiva y no fitotóxica de un compuesto de la presente invención.
- 10 Como se usa en este documento, "una cantidad efectiva y no fitotóxica" significa que el compuesto se usa en una cantidad que permite obtener el efecto deseado pero que no da lugar a ningún síntoma fitotóxico en la planta tratada o en la planta cultivada a partir del propágulo o suelo tratado.
- Los términos "planta" y "material de propagación de la planta" se definen anteriormente.
- 15 La "salud de la planta" se define como una condición de la planta y/o sus productos que está determinada por varios aspectos, solos o en combinación entre sí, tal como el rendimiento (por ejemplo, mayor biomasa y/o mayor contenido de ingredientes valiosos), calidad (por ejemplo, contenido o composición mejorados de ciertos ingredientes o vida útil), vigor de la planta (por ejemplo, crecimiento de la planta mejorado y/u hojas más verdes ("efecto de enverdecimiento"), tolerancia a abióticos (por ejemplo, sequía) y/o estrés biótico (por ejemplo, enfermedad) y eficiencia de producción (por ejemplo, eficiencia de cosecha, procesabilidad).
- 20 Los indicadores identificados anteriormente para el estado de salud de una planta pueden ser interdependientes y pueden resultar el uno del otro. Cada indicador se define en la técnica y puede determinarse mediante métodos conocidos por un experto.
- 25 Los compuestos de la invención también son adecuados para uso contra plagas de insectos que no afectan cultivos. Para el uso contra dichas plagas que no afectan cultivos, los compuestos de la presente invención se pueden usar como composición de cebo, gel, rociado general de insectos, aerosol, como aplicación de volumen ultra bajo y red de cama (impregnada o aplicada en la superficie). Adicionalmente, se pueden utilizar métodos de empapado y en varillas.
- Tal como se usa en el presente documento, el término "plaga de insectos que no afectan cultivos" se refiere a plagas, que son particularmente relevantes para objetivos que no afectan cultivos, tales como hormigas, termitas, avispas, moscas, garrapatas, mosquitos, grillos o cucarachas.
- 30 El cebo puede ser un líquido, un sólido o una preparación semisólida (por ejemplo, un gel). El cebo empleado en la composición es un producto que es lo suficientemente atractivo como para incitar a los insectos tales como hormigas, termitas, avispas, moscas, mosquitos, grillos, etc., o cucarachas para que lo coman. El atractivo se puede manipular mediante el uso de estimulantes de alimentación o feromonas sexuales. Los estimulantes alimenticios se eligen, por ejemplo, pero no exclusivamente, de proteínas animales y/o vegetales (harina de carne, pescado o sangre, partes de insectos, yema de huevo), de grasas y aceites de origen animal y/o vegetal, o mono-, oligo- o poliorganosacáridos, especialmente de sacarosa, lactosa, fructosa, dextrosa, glucosa, almidón, pectina o incluso melaza o miel. Las partes frescas o en descomposición de las frutas, cultivos, plantas, animales, insectos o partes específicas de las mismas también pueden servir como un estimulante de la alimentación. Se sabe que las feromonas sexuales son más específicas para los insectos. Las feromonas específicas se describen en la literatura (por ejemplo, <http://www.pherobase.com>) y son conocidas por los expertos en la técnica.
- 35 40 Para uso en composiciones de cebo, el contenido típico de ingrediente activo es de 0,001% en peso a 15% en peso, deseablemente de 0,001% en peso a 5% en peso de compuesto activo.
- 45 Las formulaciones de los compuestos de la presente invención como aerosoles (por ejemplo, en botes de aspersión), aspersiones de aceite o aspersiones de bomba son muy adecuadas para el usuario no profesional para controlar plagas tales como moscas, pulgas, garrapatas, mosquitos o cucarachas. Las recetas de aerosoles están compuestas preferiblemente por el compuesto activo, disolventes, adicionalmente auxiliares tales como emulsionantes, aceites de perfume, si es apropiado, estabilizantes y, si es necesario, propelentes.
- Las formulaciones de aspersiones de aceite difieren de las recetas de aerosol en que no se usan propelentes.
- 50 Para uso en composiciones de aspersión, el contenido de ingrediente activo es de 0,001 a 80% en peso, preferiblemente de 0,01 a 50% en peso y lo más preferiblemente de 0,01 a 15% en peso.
- Los compuestos de la presente invención y sus composiciones respectivas también pueden utilizarse en mosquiteros y alambres de fumigación, cartuchos de humo, placas vaporizadoras o vaporizadores a largo plazo y también en papeles para polillas, paños para polillas u otros sistemas vaporizadores independientes del calor.

- Los métodos para controlar las enfermedades infecciosas transmitidas por insectos (por ejemplo, malaria, dengue y fiebre amarilla, filariasis linfática y leishmaniasis) con compuestos de la presente invención y sus respectivas composiciones también incluyen el tratamiento de superficies de cabañas y casas, aspersión en aire e impregnación de cortinas, tiendas de campaña, prendas de vestir, mosquitero, trampas de mosca tsetse o similares. Las composiciones insecticidas para aplicación a fibras, telas, tejidos, telas no tejidas, material de red o láminas y lonas impermeables comprenden preferiblemente una mezcla que incluye el insecticida, opcionalmente un repelente y al menos un aglutinante.
- Los compuestos de la presente invención y sus composiciones se pueden usar para proteger materiales de madera tales como árboles, cercas de tableros, durmientes, marcos, artefactos artísticos, etc., y edificios, pero también materiales de construcción, muebles, pieles, fibras, artículos de vinilo, alambres y cables eléctricos, etc., de las hormigas y/o termitas, y para evitar que las hormigas y las termitas dañen los cultivos o el ser humano (por ejemplo, cuando las plagas invaden las casas y las instalaciones públicas).
- Las tasas de aplicación habituales en la protección de materiales son, por ejemplo, de 0,001 g a 2000 g o de 0,01 g a 1000 g de compuesto activo por m<sup>2</sup> de material tratado, deseablemente de 0,1 g a 50 g por m<sup>2</sup>.
- Las composiciones insecticidas para uso en la impregnación de materiales contienen típicamente de 0,001 a 95% en peso, preferiblemente de 0,1 a 45% en peso, y más preferiblemente de 1 a 25% en peso de al menos un repelente y/o insecticida.
- Los compuestos de la presente invención son especialmente adecuados para combatir eficazmente plagas animales tales como artrópodos, gasterópodos y nematodos, que incluyen, pero no se limitan a:
- Insectos del orden de los lepidópteros, por ejemplo *Achroia grisella*, *Acleris* spp. tales como *A. fimbriana*, *A. gloverana*, *A. variana*; *Acrolepiopsis assectella*, *Acrionicta major*, *Adoxophyes* spp. tales como *A. cyrtosema*, *A. orana*; *Aedia leucomelas*, *Agrotis* spp. tales como *A. exclamationis*, *A. fucosa*, *A. ipsilon*, *A. orthogoma*, *A. segetum*, *A. subterranea*; *Alabama argillacea*, *Aleurodicus dispersus*, *Alsophila pometaria*, *Ampelophaga rubiginosa*, *Amyelois transitella*, *Anacamptis sarcitella*, *Anagasta kuehniella*, *Anarsia lineatella*, *Anisota senatoria*, *Antheraea pernyi*, *Anticarsia* (= *Thermesia*) spp. tales como *A. gemmatalis*; *Apamea* spp., *Aproaerema modicella*, *Archips* spp. tales como *A. argyrospila*, *A. fuscocupreanus*, *A. rosana*, *A. xyloseanus*; *Argyresthia conjugella*, *Argyroplote* spp., *Argyrotaenia* spp. tales como *A. velutinana*; *Athetis mindara*, *Austroasca viridigrisea*, *Autographa gamma*, *Autographa nigrisigna*, *Barathra brassicae*, *Bedellia* spp., *Bonagota salubricola*, *Borbo cinnara*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Busseola* spp., *Cacoecia* spp. tales como *C. murinana*, *C. podana*; *Cactoblastis cactorum*, *Cadra cautella*, *Calingo braziliensis*, *Caloptilis theivora*, *Capua reticulana*, *Carposina* spp. tales como *C. niponensis*, *C. sasakii*; *Cephus* spp., *Chaetocnema aridula*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo* spp. tales como *C. Indicus*, *C. suppressalis*, *C. partellus*; *Choreutis pariana*, *Choristoneura* spp. tales como *C. conflictana*, *C. fumiferana*, *C. longicellana*, *C. murinana*, *C. occidentalis*, *C. rosaceana*; *Chrysodeixis* (= *Pseudoplusia*) spp. tales como *C. eriosoma*, *C. includens*; *Cirphis unipuncta*, *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocerus* spp., *Cnaphalocrocis medinalis*, *Cnephasia* spp., *Cochylys hospes*, *Coleophora* spp., *Colias eurytheme*, *Conopomorpha* spp., *Conotrachelus* spp., *Copitarsia* spp., *Corcyra cephalonica*, *Crambus caliginosellus*, *Crambus teterrellus*, *Crociosema* (= *Epinotia*) *aporema*, *Cydalima* (= *Diaphania*) *perspectalis*, *Cydia* (= *Carpocapsa*) spp. tales como *C. pomonella*, *C. latiferreana*; *Dalaca noctuides*, *Datana integerrima*, *Dasychira pinicola*, *Dendrolimus* spp. tales como *D. pini*, *D. spectabilis*, *D. sibiricus*; *Desmia funeralis*, *Diaphania* spp. tales como *D. nitidalis*, *D. hyalinata*; *Diatraea grandiosella*, *Diatraea saccharalis*, *Diphthera festiva*, *Earias* spp. tales como *E. insulana*, *E. vittella*; *Ecdytolopha aurantianu*, *Egira* (= *Xylomyges*) *curialis*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Eldana saccharina*, *Endopiza viteana*, *Ennomos subsignaria*, *Eoreuma loftini*, *Ephestia* spp. tales como *E. cautella*, *E. elutella*, *E. kuehniella*; *Epinotia aporema*, *Epiphyas postvittana*, *Erannis tiliaria*, *Erionota thrax*, *Etiella* spp., *Eulia* spp., *Eupoecilia ambiguella*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Euxoa* spp., *Evetria bouliana*, *Faronta albilinea*, *Feltia* spp. tales como *F. subterranean*; *Galleria mellonella*, *Gracillaria* spp., *Grapholita* spp. tales como *G. funebrana*, *G. molesta*, *G. inopinata*; *Halysidota* spp., *Harrisina americana*, *Hedylepta* spp., *Helicoverpa* spp. tales como *H. armigera* (= *Heliothis armigera*), *H. zea* (= *Heliothis zea*); *Heliothis* spp. tales como *H. assulta*, *H. subflexa*, *H. virescens*; *Hellula* spp. tales como *H. undalis*, *H. rogatalis*; *Helocoverpa gelotopoeon*, *Hemileuca oliviae*, *Herpetogramma licarsisalis*, *Hibernia defoliaria*, *Hofmannophila pseudospretella*, *Homoeosoma electellum*, *Homona magnanima*, *Hypena scabra*, *Hyphantria cunea*, *Hyponomeuta padella*, *Hyponomeuta malinellus*, *Kakivoria flavofasciata*, *Keiferia lycopersicella*, *Lambdina fiscellaria fiscellaria*, *Lambdina fiscellaria lugubrosa*, *Lamprosema indicata*, *Laspeyresia molesta*, *Leguminivora glycinivorella*, *Lerodea eufala*, *Leucinodes orbonalis*, *Leucoma salicis*, *Leucoptera* spp. tales como *L. coffeella*, *L. scitella*; *Leuminivora lycinivorella*, *Lithocolletis blancardella*, *Lithophane antennata*, *Llattia octo* (= *Amyna axis*), *Lobesia botrana*, *Lophocampa* spp., *Loxagrotis albicosta*, *Loxostege* spp. tales como *L. sticticalis*, *L. cerealis*; *Lymantria* spp. tales como *L. dispar*, *L. monacha*; *Lyonetia clerkei*, *Lyonetia prunifoliella*, *Malacosoma* spp. tales como *M. americanum*, *M. californicum*, *M. constrictum*, *M. neustria*; *Mamestra* spp. tales como *M. brassicae*, *M. configurata*; *Mamstra brassicae*, *Manduca* spp. tales como *M. quinquemaculata*, *M. sexta*; *Marasmia* spp., *Marmara* spp., *Maruca testulalis*, *Megalopyge lanata*, *Melanchnra picta*, *Melanitis leda*, *Mocis* spp. tales como *M. lapites*, *M. repanda*; *Mocis latipes*, *Monochroa fragariae*, *Mythimna separata*, *Nemapogon cloacella*, *Neoleucinodes elegantalis*, *Nepytia* spp., *Nymphula* spp., *Oiketicus* spp., *Omiodes indicata*, *Omphisa anastomosalis*, *Operophtera brumata*, *Orgyia pseudotsugata*, *Oria* spp., *Orthaga thyrsalis*, *Ostrinia* spp. tales como *O. nubilalis*; *Oulema oryzae*, *Paleacrita vernata*, *Panolis flammea*, *Parnara* spp., *Papaipema nebris*, *Papilio cresphontes*, *Paramyelois transitella*, *Paranthrene regalis*, *Paysandisia archon*, *Pectinophora* spp. tales como *P. gossypiella*; *Peridroma saucia*, *Perileucoptera* spp., tales como



5 *P. coffeella*; *Phalera bucephala*, *Phryganidia californica*, *Phthorimaea* spp. tales como *P. operculella*; *Phyllocnistis citrella*, *Phyllonorycter* spp. tales como *P. blancardella*, *P. crataegella*, *P. issikii*, *P. ringoniella*; *Pieris* spp. tales como *P. brassicae*, *P. rapae*, *P. napi*; *Pilocrocis tripunctata*, *Plathypena scabra*, *Platynota* spp. tales como *P. flavedana*, *P. idaeusalis*, *P. stultana*; *Platyptilia carduidactyla*, *Plebejus argus*, *Plodia interpunctella*, *Plusia* spp., *Plutella maculipennis*, *Plutella xylostella*, *Pontia protodica*, *Praysspp.*, *Prodenia* spp., *Proxenus lepigone*, *Pseudaletia* spp. tales como *P. sequax*, *P. unipuncta*; *Pyrausta nubilalis*, *Rachiplusia nu*, *Richia albicosta*, *Rhizobius ventralis*, *Rhyacionia frustrana*, *Sabulodes aegrotata*, *Schizura concinna*, *Schoenobius* spp., *Schreckensteinia festaliella*, *Scirpophaga* spp. tales como *S. incertulas*, *S. innotata*; *Scotia segetum*, *Sesamia* spp. tales como *S. inferens*, *Seudyra subflava*, *Sitotroga cerealella*, *Sparganothis pilleriana*, *Spilonota lechriaspis*, *S. ocellana*, *Spodoptera (=Lamphygma)* spp. tales como *S. eridania*, *S. exigua*, *S. frugiperda*, *S. latifascia*, *S. littoralis*, *S. litura*, *S. omithogalli*; *Stigmella* spp., *Stomopteryx subsecivella*, *Strymon bazochii*, *Sylepta derogata*, *Synanthedon* spp. tales como *S. exitiosa*, *Tecia solanivora*, *Telehin licus*, *Thaumatopoea pityocampa*, *Thaumatotibia (=Cryptophlebia) leucotreta*, *Thaumetopoea pityocampa*, *Thecla* spp., *Theresimima ampelophaga*, *Thyrintina* spp., *Tieldenia inconspicua*, *Tinea* spp. tales como *T. cloacella*, *T. pellionella*; *Tineola bisselliella*, *Tortrix* spp. tales como *T. viridana*; *Trichophaga tapetzella*, *Trichoplusia* spp. tales como *T. ni*; *Tuta (=Scrobipalpa) absoluta*, *Udea* spp. tales como *U. rubigalis*, *U. rubigalis*; *Virachola* spp., *Yponomeuta padella*, y *Zeiraphera canadensis*;

20 insectos del orden de los Coleópteros, por ejemplo *Acalymma vittatum*, *Acanthoscehdes obtectus*, *Adoretus* spp., *Agelastica alni*, *Agrilus* spp. tales como *A. anxius*, *A. planipennis*, *A. sinuatus*; *Agriotus* spp. tales como *A. fuscicollis*, *A. lineatus*, *A. obscurus*; *Alphitobius diaperinus*, *Amphimallus solstitialis*, *Anisandrus dispar*, *Anisoplia austriaca*, *Anobium punctatum*, *Anomala corpulenta*, *Anomala rufocuprea*, *Anoplophora* spp. tales como *A. glabripennis*; *Anthonomus* spp. tales como *A. eugenii*, *A. grandis*, *A. pomorum*; *Anthrenus* spp., *Aphthona euphoridae*, *Apion* spp., *Apogonia* spp., *Athous haemorrhoidalis*, *Atomaria* spp. tales como *A. linearis*; *Attagenus* spp., *Aulacophora femoralis*, *Blastophagus piniperda*, *Blitophaga undata*, *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp. tales como *B. lentis*, *B. pisorum*, *B. rufimanus*; *Byctiscus betulae*, *Callidiellum rufipenne*, *Callopietria floridensis*, *Callosobruchus chinensis*, *Cameraria ohridella*, *Cassida nebulosa*, *Cerotoma trifurcata*, *Cetonia aurata*, *Ceuthorhynchus* spp. tales como *C. assimilis*, *C. napi*; *Chaetocnema tibialis*, *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp. tales como *C. vespertinus*; *Conotrachelus nenuphar*, *Cosmopolites* spp., *Costelytra zealandica*, *Crioceris asparagi*, *Cryptolestes ferrugineus*, *Cryptorhynchus lapathi*, *Ctenicera* spp. tales como *C. destructor*; *Curculio* spp., *Cylindrocopturus* spp., *Ciclocephala* spp., *Dactylispa balyi*, *Dectes texanus*, *Dermestesspp.*, *Diabrotica* spp. tales como *D. undecimpunctata*, *D. speciosa*, *D. longicornis*, *D. semipunctata*, *D. virgifera*; *Diaprepes abbreviatus*, *Dichocrocis* spp., *Diadisa armigera*, *Diloboderus abderus*, *Diocalandra frumenti (Diocalandra stigmaticollis)*, *Enaphalodes rufulus*, *Epilachna* spp. tales como *E. varivestis*, *E. vigintioctomaculata*; *Epitrix* spp. tales como *E. hirtipennis*, *E. similaris*; *Eutheola humilis*, *Eutinobothrus brasiliensis*, *Faustinus cubae*, *Gibbium psylloides*, *Gnathocerus cornutus*, *Hellula undalis*, *Heteronychus arator*, *Hylamorpha elegans*, *Hylotrupes abietis*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera* spp. tales como *H. brunneipennis*, *H. postica*; *Hypomeces squamosus*, *Hypothenemus* spp., *Ips typographus*, *Lachnosterna consanguinea*, *Lasioderma serricornis*, *Latheticus oryzae*, *Lathridius* spp., *Lema* spp. tales como *L. bilineata*, *L. melanopus*; *Leptinotarsa* spp. tales como *L. decemlineata*; *Leptispa pygmaea*, *Limonijs californicus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lixus* spp., *Luperodes* spp., *Lyctus* spp. tales como *L. brunneus*; *Liogenys fuscus*, *Macroductylus* spp. tales como *M. subspinosus*; *Maladera matrida*, *Megaplatus mutatus*, *Megascelis* spp., *Melanotus communis*, *Meligethes* spp. tales como *M. aeneus*; *Melolontha* spp. tales como *M. hippocastani*, *M. melolontha*; *Metamasius hemipterus*, *Microthecasp.*, *Migdolus* spp. tales como *M. fryanus*, *Monoctonus* spp. tales como *M. alternatus*; *Naupactus xanthographus*, *Niptus hololeucus*, *Oberia brevis*, *Oemona hirta*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Oryzaphagus oryzae*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Otiorrhynchus ovatus*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Oulema melanopus*, *Oulema oryzae*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon* spp. tales como *P. brassicae*, *P. cochleariae*; *Phoracantha recurva*, *Phyllobius pyri*, *Phyllopertha horticola*, *Phyllophaga* spp. tales como *P. helleri*; *Phyllotreta* spp. tales como *P. chrysocephala*, *P. nemorum*, *P. striolata*, *P. vittula*; *Phyllopertha horticola*, *Popillia japonica*, *Premnotrypes* spp., *Psacotha hilaris*, *Psylliodes chrysocephala*, *Prostephanus truncatus*, *Psylliodes* spp., *Ptinus* spp., *Pulga saltana*, *Rhizopertha dominica*, *Rhynchophorus* spp. tales como *R. billineatus*, *R. ferrugineus*, *R. palmarum*, *R. phoenicis*, *R. vulneratus*; *Saperda candida*, *Scolytus schevyrewi*, *Scyphophorus acupunctatus*, *Sitona lineatus*, *Sitophilus* spp. tales como *S. granaria*, *S. oryzae*, *S. zeamais*; *Sphenophorus* spp. tales como *S. levis*; *Stegobium paniceum*, *Sternechus* spp. tales como *S. subsignatus*; *Strophomorphus ctenotus*, *Symphyletes* spp., *Tanymecus* spp., *Tenebrio molitor*, *Tenebrioides mauretanicus*, *Tribolium* spp. tales como *T. castaneum*; *Trogoderma* spp., *Tychius* spp., *Xylotrechus* spp. tales como *X. pyrrhoderus*; y *Zabrus* spp. tales como *Z. tenebrioides*;

55 insectos del orden de los Dípteros por ejemplo *Aedes* spp. tales como *A. aegypti*, *A. albopictus*, *A. vexans*; *Anastrepha ludens*, *Anopheles* spp. tales como *A. albimanus*, *A. crucians*, *A. freeborni*, *A. gambiae*, *A. leucosphyrus*, *A. maculipennis*, *A. minimus*, *A. quadrimaculatus*, *A. sinensis*; *Bactrocera invadens*, *Bibio hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*, *Calliphora vicina*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomyia* spp. tales como *C. bezziana*, *C. hominivorax*, *C. macellaria*; *Chrysops atlanticus*, *Chrysops discalis*, *Chrysops silacea*, *Cochliomyia* spp. tales como *C. hominivorax*; *Contarinia* spp. tales como *C. sorghicola*; *Cordylobia anthropophaga*, *Culex* spp. tales como *C. nigripalpus*, *C. pipiens*, *C. quinquefasciatus*, *C. tarsalis*, *C. tritaeniorhynchus*; *Culicoides furens*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Cuterebra* spp., *Dacus cucurbitae*, *Dacus oleae*, *Dasineura brassicae*, *Dasineura oxycoccana*, *Delia* spp. tales como *D. antique*, *D. coarctata*, *D. platyura*, *D. radicum*; *Dermatobia hominis*, *Drosophila* spp. tales como *D. sukukii*, *Fanniaspp.* tales como *F. canicularis*; *Gastrophilus* spp. tales como *G. intestinalis*; *Geomyza tipunctata*, *Glossina* spp. tales como *G. fuscipes*, *G. morsitans*, *G. palpalis*, *G. tachinoides*; *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hippelates* spp., *Hylemyia* spp. tales como *H. platyura*; *Hypoderma* spp. tales como *H. lineata*; *Hyppobosca* spp., *Hydrellia philippina*,

- Leptoconops torrens*, *Liriomyza* spp. tales como *L. sativae*, *L. trifolii*; *Lucilia* spp. tales como *L. caprina*, *L. cuprina*, *L. sericata*; *Lycoria pectoralis*, *Mansonia titillanus*, *Mayetiola* spp. tales como *M. destructor*; *Musca* spp. tales como *M. autumnalis*, *M. domestica*; *Muscina stabulans*, *Oestrus* spp. tales como *O. ovis*; *Opomyza florum*, *Oscinella* spp. tales como *O. frit*; *Orseolia oryzae*, *Pegomya hysocyami*, *Phlebotomus argentipes*, *Phorbia* spp. tales como *P. antiqua*, *P. brassicae*, *P. coarctata*; *Phytomyza gymnostoma*, *Prosimulium mixtum*, *Psila rosae*, *Psorophora columbiae*, *Psorophora discolor*, *Rhagoletis* spp. tales como *R. cerasi*, *R. cingulate*, *R. indifferens*, *R. mendax*, *R. pomonella*; *Rivellia quadrifasciata*, *Sarcophaga* spp. tales como *S. haemorrhoidalis*; *Simulium vittatum*, *Sitodiplosis mosellana*, *Stomoxys* spp. tales como *S. calcitrans*; *Tabanus* spp. tales como *T. atratus*, *T. bovinus*, *T. lineola*, *T. similis*; *Tannia* spp., *Thecodiplosis japonensis*, *Tipula oleracea*, *Tipula paludosa*, y *Wohlfahrtiaspp*;
- 5 insectos del orden de los Tisanópteros por ejemplo, *Baliothrips biformis*, *Dichromothrips corbetti*, *Dichromothrips* ssp., *Echinothrips americanus*, *Enneothrips flavens*, *Frankliniella* spp. tales como *F. fusca*, *F. occidentalis*, *F. tritici*; *Heliethrips* spp., *Hercinothrips femoralis*, *Kakothrips* spp., *Microcephalothrips abdominalis*, *Neohydatothrips samayunkur*, *Pezothrips kellyanus*, *Rhipiphorotherips cruentatus*, *Scirtothrips* spp. tales como *S. citri*, *S. dorsalis*, *S. perseae*; *Stenchaetothrips* spp., *Taeniothrips cardamoni*, *Taeniothrips inconsequens*, *Thrips* spp. tales como *T. imagines*, *T. hawaiiensis*, *T. oryzae*, *T. palmi*, *T. parvispinus*, *T. tabaci*;
- 10 insectos del orden de los Hemípteros por ejemplo, *Acizzia jamatonica*, *Acrosternum* spp. tales como *A. hilare*; *Acyrtosipon* spp. tales como *A. onobrychis*, *A. pisum*; *Adelges laricis*, *Adelges tsugae*, *Adelphocoris* spp., tales como *A. rapidus*, *A. superbus*; *Aeneolamia* spp., *Agonosцена* spp., *Aulacorthum solani*, *Aleurocanthus woglumi*, *Aleurodes* spp., *Aleurodicus disperses*, *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus* spp., *Amrasca* spp., *Anasa tristis*, *Antestiopsis* spp., *Anuraphis cardui*, *Aonidiella* spp., *Aphanostigma piri*, *Aphidula nasturtii*, *Aphis* spp. tales como *A. craccivora*, *A. fabae*, *A. forbesi*, *A. gossypii*, *A. grossulariae*, *A. maidiradicis*, *A. pomi*, *A. sambuci*, *A. schneideri*, *A. spiraeicola*; *Arboridia apicalis*, *Arilus critatus*, *Aspidiella* spp., *Aspidiotus* spp., *Atanus* spp., *Aulacaspis yasumatsui*, *Aulacorthum solani*, *Bactericera cockerelli* (*Paratrioza cockerelli*), *Bemisia* spp. tales como *B. argentifolii*, *B. tabaci* (*Aleurodes tabaci*); *Blissus* spp. tales como *B. leucopterus*; *Brachycaudus* spp. tales como *B. cardui*, *B. helichrysi*, *B. persicae*, *B. prunicola*; *Brachycolus* spp., *Brachycorynella asparagi*, *Brevicoryne brassicae*, *Cacopsylla* spp. tales como *C. fulguralis*, *C. pyricola* (*Psylla piri*); *Calligypona marginata*, *Calocoris* spp., *Campylomma livida*, *Capitophorus horni*, *Carneiocephala fulgida*, *Cavelerius* spp., *Ceraplastes* spp., *Ceratovacuna lanigera*, *Ceroplastes ceriferus*, *Cerosipha gossypii*, *Chaetosiphon fragaefolii*, *Chionaspis tegalensis*, *Chlorita onukii*, *Chromaphis juglandicola*, *Chrysomphalus ficus*, *Cicadulina mbila*, *Cimex* spp. tales como *C. hemipterus*, *C. lectularius*; *Coccomytilus halli*, *Coccus* spp. tales como *C. hesperidum*, *C. pseudomagnoliarum*; *Corythucha arcuata*, *Creontiades dilutus*, *Cryptomyzus ribis*, *Chrysomphalus aonidum*, *Cryptomyzus ribis*, *Ctenarytaina spatulata*, *Cyrtopeltis notatus*, *Dalbulus* spp., *Dasynus piperis*, *Dialeurodes* spp. tales como *D. citrifolii*; *Dalbulus maidis*, *Diaphorina* spp. tales como *D. citri*; *Diaspis* spp. tales como *D. bromeliae*; *Dichelops furcatus*, *Diconocoris hewetti*, *Doralis* spp., *Dreyfusia nordmanniana*, *Dreyfusia piceae*, *Drosicha* spp., *Dysaphis* spp. tales como *D. plantaginea*, *D. pyri*, *D. radicola*; *Dysaulacorthum pseudosolani*, *Dysdercus* spp. tales como *D. cingulatus*, *D. intermedius*; *Dysmicoccus* spp., *Edessa* spp., *Geocoris* spp., *Empoasca* spp. tales como *E. fabae*, *E. solana*; *Epidiaspis leperii*, *Eriosoma* spp. tales como *E. lanigerum*, *E. pyricola*; *Erythroneura* spp., *Eurygaster* spp. tales como *E. integriceps*; *Euscelis bilobatus*, *Euschistus* spp. tales como *E. heros*, *E. impictiventris*, *E. servus*; *Fiorinia theae*, *Geococcus coffeae*, *Glycaspis brimblecombei*, *Halyomorpha* spp. tales como *H. halys*; *Heliopeltis* spp., *Homalodisca vitripennis* (= *H. coagulata*), *Horcias nobilellus*, *Hyalopterus pruni*, *Hyperomyzus lactucae*, *Icerya* spp. tales como *I. purchase*; *Idiocerus* spp., *Idioscopus* spp., *Laodelphax striatellus*, *Lecanium* spp., *Lecanoideus floccissimus*, *Lepidosaphes* spp. tales como *L. ulmi*; *Leptocoris* spp., *Leptoglossus phyllopus*, *Lipaphis erysimi*, *Lygus* spp. tales como *L. hesperus*, *L. lineolaris*, *L. pratensis*; *Maconellicoccus hirsutus*, *Marchalina hellenica*, *Macropes excavatus*, *Macrosiphum* spp. tales como *M. rosae*, *M. avenae*, *M. euphorbiae*; *Macrosteles quadrilineatus*, *Mahanarva fimbriolata*, *Megacopta cribraria*, *Megoura viciae*, *Melanaphis pyriarius*, *Melanaphis sacchari*, *Melanocallis* (= *Tinocallis*) *caryaefoliae*, *Metcafiella* spp., *Metopolophium dirhodum*, *Monellia costalis*, *Monelliopsis pecanis*, *Myzocallis coryli*, *Murgantia* spp., *Myzus* spp. tales como *M. ascalonicus*, *M. cerasi*, *M. nicotianae*, *M. persicae*, *M. varians*; *Nasonovia ribis-nigri*, *Neotoxoptera formosana*, *Neomegalotomus* spp., *Nephotettix* spp. tales como *N. malayanus*, *N. nigropictus*, *N. parvus*, *N. virescens*; *Nezara* spp. tales como *N. viridula*; *Nilaparvata lugens*, *Nysius huttoni*, *Oebalus* spp. tales como *O. pugnax*; *Oncometopia* spp., *Orthezia praelonga*, *Oxycaraenus hyalinipennis*, *Parabemisia myricae*, *Parlatoria* spp., *Parthenolecanium* spp. tales como *P. corni*, *P. persicae*; *Pemphigus* spp. tales como *P. bursarius*, *P. populivenae*; *Peregrinus maidis*, *Perkinsiella saccharicida*, *Phenacoccus* spp. tales como *P. aceris*, *P. gossypii*; *Phloeomyzus passerinii*, *Phorodon humuli*, *Phylloxera* spp. tales como *P. devastatrix*, *Piesma quadrata*, *Piezodorus* spp. tales como *P. guildinii*; *Pinnaspis aspidistrae*, *Planococcus* spp. tales como *P. citri*, *P. ficus*; *Prosapia bicincta*, *Protospulvinaria pyriformis*, *Psallus seriatus*, *Pseudacysta perseae*, *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pseudococcus* spp. tales como *P. comstocki*; *Psylla* spp. tales como *P. mali*; *Pteromalus* spp., *Pulvinaria amygdali*, *Pyrillaspp.*, *Quadraspidotus* spp., tales como *Q. perniciosus*; *Quesada gigas*, *Rastrococcus* spp., *Reduvius senilis*, *Rhizoecus americanus*, *Rhodnius* spp., *Rhopalomyzus ascalonicus*, *Rhopalosiphum* spp. tales como *R. pseudobrassicae*, *R. insertum*, *R. maidis*, *R. padi*; *Sagatodes* spp., *Sahlbergella singularis*, *Saissetiaspp.*, *Sappaphis mala*, *Sappaphis mali*, *Scaptocoris* spp., *Scaphoides titanus*, *Schizaphis graminum*, *Schizoneura lanuginosa*, *Scotinophora* spp., *Selenaspis articulatus*, *Sitobion avenae*, *Sogata* spp., *Sogatella furcifera*, *Solubea insularis*, *Spissistilus festinus* (= *Stictocephala festina*), *Stephanitis nashi*, *Stephanitis pyrioides*, *Stephanitis takeyai*, *Tenalaphara malayensis*, *Tetraleurodes perseae*, *Therioaphis maculate*, *Thyanta* spp. tales como *T. accerra*, *T. perditor*; *Tibraca* spp., *Tomaspsis* spp., *Toxoptera* spp. tales como *T. aurantii*; *Trialeurodes* spp. tales como *T. abutilonea*, *T. ricini*, *T.*

vaporariorum; *Triatomasp.*, *Trioza* spp., *Typhlocyba* spp., *Unaspis* spp. tales como *U. citri*, *U. yanonensis*; y *Viteus vitifolii*,

Insectos del orden de los Himenópteros por ejemplo *Acanthomyops interjectus*, *Athalia rosae*, *Atta* spp. tales como *A. capiguara*, *A. cephalotes*, *A. cephalotes*, *A. laevigata*, *A. robusta*, *A. sexdens*, *A. texana*, *Bombus* spp., *Brachymyrmex* spp., *Camponotus* spp. tales como *C. floridanus*, *C. pennsylvanicus*, *C. modoc*; *Cardiocondyla nuda*, *Chalibion* sp, *Crematogaster* spp., *Dasyutilla occidentalis*, *Diprion* spp., *Dolichovespula maculata*, *Dorymyrmex* spp., *Dryocosmus kuriphilus*, *Formica* spp., *Hoplocampa* spp. tales como *H. minuta*, *H. testudinea*; *Iridomyrmex humilis*, *Lasius* spp. tales como *L. niger*, *Linepithema humile*, *Liometopum* spp., *Leptocybe invasa*, *Monomorium* spp. tales como *M. pharaonis*, *Monomorium*, *Nylandria fulva*, *Pachycondyla chinensis*, *Paratrechina longicornis*, *Paravespula* spp., tales como *P. germanica*, *P. pennsylvanica*, *P. vulgaris*; *Pheidole* spp. tales como *P. megacephala*; *Pogonomymex* spp. tales como *P. barbatus*, *P. californicus*, *Polistes rubiginosa*, *Prenolepis imparis*, *Pseudomyrmex gracilis*, *Schelipron* spp., *Sirex cyaneus*, *Solenopsis* spp. tales como *S. geminata*, *S. invicta*, *S. molesta*, *S. richteri*, *S. xyloni*, *Sphecius speciosus*, *Sphex* spp., *Tapinoma* spp. tales como *T. melanocephalum*, *T. sessile*; *Tetramorium* spp. tales como *T. caespitum*, *T. bicarinatum*, *Vespa* spp. tales como *V. crabro*; *Vespula* spp. tales como *V. squamosa*; *Wasmannia auropunctata*, *Xylocopa* sp;

Insectos del orden de los Ortópteros por ejemplo *Acheta domesticus*, *Calliptamus italicus*, *Chortoicetes terminifera*, *Ceuthophilus* spp., *Diastramma asynamora*, *Doclostaurus maroccanus*, *Gryllotalpas* spp. tales como *G. africana*, *G. gryllotalpa*; *Gryllus* spp., *Hieroglyphus daganensis*, *Kraussaria angulifera*, *Locusta* spp. tales como *L. migratoria*, *L. pardalina*; *Melanoplus* spp. tales como *M. bivittatus*, *M. femurrubrum*, *M. mexicanus*, *M. sanguinipes*, *M. spretus*; *Nomadacris septemfasciata*, *Oedaleus senegalensis*, *Scapteriscus* spp., *Schistocerca* spp. tales como *S. americana*, *S. gregaria*, *Stemopelmatus* spp., *Tachycines asynamorus*, y *Zonozerus variegatus*;

Plagas de la clase de los Arácnidos por ejemplo Acari, por ejemplo de las familias de Argasidae, Ixodidae y Sarcoptidae, tales como *Amblyomma* spp. (por ejemplo *A. americanum*, *A. variegatum*, *A. maculatum*), *Argas* spp. tales como *A. persicu*), *Boophilus* spp. tales como *B. annulatus*, *B. decoloratus*, *B. microplus*, *Dermacentor* spp. tales como *D. silvarum*, *D. andersoni*, *D. variabilis*, *Hyalomma* spp. tales como *H. truncatum*, *Ixodes* spp. tales como *I. ricinus*, *I. rubicundus*, *I. scapularis*, *I. holocyclus*, *I. pacificus*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Ornithodoros* spp. tales como *O. moubata*, *O. hermsi*, *O. turicata*, *Ornithonyssus bacoti*, *Otobius megnini*, *Dermanyssus gallinae*, *Psoroptes* spp. tales como *P. ovis*, *Rhipicephalus* spp. tales como *R. sanguineus*, *R. appendiculatus*, *Rhipicephalus evertsi*, *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp. tales como *S. Scabiei*; y Familia de los Eriophyidae incluyendo *Aceria* spp. tales como *A. sheldoni*, *A. anthocoptes*, *Acallitus* spp., *Aculops* spp. tales como *A. lycopersici*, *A. pelekassi*; *Aculus* spp. tales como *A. schlechtendali*; *Colomerus vitis*, *Epitrimerus pyri*, *Phyllocoptera oleivora*; *Eriophytes ribis* y *Eriophytes* spp. tales como *Eriophytes sheldoni*; Familia de los Tarsonemidae incluyendo *Hemitarsonemus* spp., *Phytonemus pallidus* y *Polyphagotarsonemus latus*, *Stenotarsonemus* spp. *Stenotarsonemus spinki*; Familia de los Tenuipalpidae incluyendo *Brevipalpus* spp. tales como *B. phoenicis*; Familia de los Tetranychidae incluyendo *Eotetranychus* spp., *Eutetranychus* spp., *Oligonychusspp.*, *Petrobia latens*, *Tetranychus* spp. tales como *T. cinnabarinus*, *T. evansi*, *T. kanzawai*, *T. pacificus*, *T. phaseulus*, *T. telarius* y *T. urticae*; *Bryobia praetiosa*; *Panonychus* spp. tales como *P. ulmi*, *P. citri*; *Metatetranychus* spp. y *Oligonychus* spp. tales como *O. pratensis*, *O. perseae*, *Vasates lycopersici*; *Raoiella indica*, Familia de los Carpoglyphidae incluyendo *Carpoglyphus* spp.; *Penthaleidae* spp. tales como *Halotydeus destructor*, Familia de los Demodicidae with species tales como *Demodex* spp.; Familia de los Trombicidae incluyendo *Trombiculaspp.*; Familia de los Macronyssidae incluyendo *Ornithonyssus* spp.; Familia de los Pyemotidae incluyendo *Pyemotes tritici*; *Tyrophagus putrescentiae*; Familia de los Acaridae incluyendo *Acarus siro*; Familia de los Araneida incluyendo *Latrodectus mactans*, *Tegenaria agrestis*, *Chiracanthium sp*, *Lycosa sp* *Achaearanea tepidariorum* y *Loxosceles reclusa*;

Plagas del Phylum Nematoda, por ejemplo, nematodos parásitos de plantas tales como nematodos de los nodos radiculares, *Meloidogyne* spp. tales como *M. hapla*, *M. incognita*, *M. javanica*; nematodos formadores de quistes, *Globodera* spp. tales como *G. rostochiensis*; *Heterodera* spp. tales como *H. avenae*, *H. glycines*, *H. schachtii*, *H. trifolii*; nemátodos carcomedores de semillas, *Anguina* spp.; nemátodos de tallos y foliares, *Aphelenchoides* spp. tales como *A. besseyi*; nematodos de aguijón, *Belonolaimus* spp. tales como *B. longicaudatus*; nematodos del pino, *Bursaphelenchus* spp. tales como *B. lignicolus*, *B. xylophilus*; nematodos de anillo, *Criconema* spp., *Criconemella* spp. tales como *C. xenoplax* y *C. ornata*; y, *Criconemoides* spp. tales como *Criconemoides informis*; *Mesocriconema* spp.; nematodos de tallos y bulbos, *Ditylenchus* spp. tales como *D. destructor*, *D. dipsaci*; nematodos de punzón, *Dolichodorus* spp.; nematodos espirales, *Helicotylenchus multincinctus*; nematodos de vaina y vainoides, *Hemicyclophora* spp. y *Hemicriconemoides* spp.; *Hirshmanniella* spp.; nematodos de lanza, *Hoploaimus* spp.; nematodos falsos de nódulo radicular, *Nacobbus* spp.; nematodos de aguja, *Longidorus* spp. tales como *L. elongatus*; nematodos de Lesiones, *Pratylenchus* spp. tales como *P. brachyurus*, *P. neglectus*, *P. penetrans*, *P. curvatus*, *P. goodeyi*; nematodos excavadores, *Radopholus* spp. tales como *R. similis*; *Rhadopholus* spp.; *Rhadopholus* spp.; nematodos Reniformes, *Rotylenchus* spp. tales como *R. robustus*, *R. reniformis*; *Scutellonema* spp.; nematodos de raíces achaparrados, *Trichodorus* spp. tales como *T. obtusus*, *T. primitivus*; *Paratrichodorus* spp. tales como *P. minor*; nematodos atrofiados, *Tylenchorhynchus* spp. tales como *T. claytoni*, *T. dubius*; nematodos Cítricos, *Tylenchulus* spp. tales como *T. semipenetrans*; nematodos de daga, *Xiphinema* spp.; y otras especies de nematodos parasíticos de las plantas;

- Insectos del orden de los Isópteros por ejemplo *Calotermes flavicollis*, *Coptotermes* spp. tales como *C. formosanus*, *C. gestroi*, *C. acinaciformis*; *Cornitermes cumulans*, *Cryptotermes* spp. tales como *C. brevis*, *C. cavifrons*; *Globitermes sulfureus*, *Heterotermes* spp. tales como *H. aureus*, *H. longiceps*, *H. tenuis*; *Leucotermes flavipes*, *Odontotermes* spp., *Incisitermes* spp. tales como *I. minor*, *I. Snyder*, *Marginitermes hubbardi*, *Mastotermes* spp. tales como *M. darwiniensis*
- 5 *Neocapritermes* spp. tales como *N. opacus*, *N. parvus*; *Neotermes* spp., *Procornitermes* spp., *Zootermopsis* spp. tales como *Z. angusticollis*, *Z. nevadensis*, *Reticulitermes* spp. tales como *R. hesperus*, *R. tibialis*, *R. speratus*, *R. flavipes*, *R. grassei*, *R. lucifugus*, *R. santonensis*, *R. virginicus*; *Termes natalensis*,
- Insectos del orden de los Blattaria por ejemplo *Blatta* spp. tales como *B. orientalis*, *B. lateralis*; *Blattella* spp. tales como *B. asahinae*, *B. germanica*; *Leucophaea maderae*, *Panchlora nivea*, *Periplanetaspp.* tales como *P. americana*, *P. australasiae*, *P. brunnea*, *P. fuliginosa*, *P. japonica*; *Supella longipalpa*, *Parcoblatta pennsylvanica*, *Eurycotis floridana*, *Pycnoscelus surinamensis*,
- 10 Insectos del orden de los Sinópteros, por ejemplo *Cediopsylla simples*, *Ceratophyllus* spp., *Ctenocephalides* spp. tales como *C. felis*, *C. canis*, *Xenopsylla cheopis*, *Pulex irritans*, *Trichodectes canis*, *Tunga penetrans*, y *Nosopsyllus fasciatus*,
- 15 Insectos del orden de los Thysanura por ejemplo *Lepisma saccharina*, *Ctenolepisma urbana*, y *Thermobia domestica*,
- Plagas de la clase Chilopoda por ejemplo *Geophilus* spp., *Scutigera* spp. tales como *Scutigera coleoptrata*;
- Plagas de la clase Diplopoda por ejemplo *Blaniulus guttulatus*, *Julus* spp., *Narceus* spp.,
- Plagas de la clase Symphyla por ejemplo *Scutigera* spp.,
- Insectos del orden Dermaptera, por ejemplo *Forficula auricularia*,
- 20 Insectos del orden de los Collembola, por ejemplo *Onychiurus* spp., tales como *Onychiurus armatus*,
- Plagas del orden Isopoda por ejemplo, *Armadillidium vulgare*, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*,
- Insectos del orden Phthiraptera, por ejemplo *Damalinia* spp., *Pediculus* spp. tales como *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pediculus humanus humanus*; *Pthirus pubis*, *Haematopinus* spp. tales como *Haematopinus eurytarnus*, *Haematopinus suis*; *Linognathus* spp. tales como *Linognathus vituli*; *Bovicola bovis*,
- 25 *Menopon gallinae*, *Menacanthus stramineus* y *Solenopotes capillatus*, *Trichodectes* spp.,
- Ejemplos de especies de plagas adicionales que pueden ser controladas por compuestos de fórmula (I) incluyen: del Phylum Mollusca, clase Bivalvia, por ejemplo, *Dreissena* spp.; clase Gastropoda, por ejemplo, *Arion* spp., *Biomphalaria* spp., *Bulinus* spp., *Deroceras* spp., *Galba* spp., *Lymnaea* spp., *Oncomelania* spp., *Pomacea canaliculata*, *Succinea* spp.;
- 30 de la clase de los helmintos, por ejemplo, *Ancylostoma duodenale*, *Ancylostoma ceylanicum*, *Ancylostoma braziliense*, *Ancylostoma* spp., *Ascaris lubricoides*, *Ascaris* spp., *Brugia malayi*, *Brugia timori*, *Bunostomum* spp., *Chabertia* spp., *Clonorchis* spp., *Cooperia* spp., *Dicrocoelium* spp., *Dictyocaulus filaria*, *Dipyllobothrium latum*, *Dracunculus medinensis*, *Echinococcus granulosus*, *Echinococcus multilocularis*, *Enterobius vermicularis*, *Faciola* spp., *Haemonchus* spp. tales como *Haemonchus contortus*; *Heterakis* spp., *Hymenolepis nana*, *Hyostrongylus* spp., *Loa Loa*, *Nematodirus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Opisthorchis* spp., *Onchocerca volvulus*, *Ostertagia* spp.,
- 35 *Paragonimus* spp., *Schistosoma* spp., *Strongyloides fuelleborni*, *Strongyloides stercoralis*, *Strongyloides* spp., *Taenia saginata*, *Taenia solium*, *Trichinella spiralis*, *Trichinella nativa*, *Trichinella britovi*, *Trichinella nelsoni*, *Trichinella pseudopsiralis*, *Trichostrongylus* spp., *Trichuris trichuria*, *Wuchereria bancrofti*.
- Los compuestos de la presente invención son adecuados para uso en el tratamiento o protección de animales contra la infestación o infección por parásitos. Por lo tanto, la presente invención también se refiere al uso de un compuesto
- 40 de la presente invención para la fabricación de un medicamento para el tratamiento o protección de animales contra la infestación o infección por parásitos. Además, la presente invención se refiere a un método para tratar o proteger animales contra la infestación e infección por parásitos, que comprende administrar o aplicar por vía oral, tópica o parenteral a los animales una cantidad efectiva como parasiticida de un compuesto de la presente invención.
- La presente invención también se refiere al uso no terapéutico de compuestos de la presente invención para tratar o proteger animales contra la infestación e infección por parásitos. Además, la presente invención se refiere a un método
- 45 no terapéutico para tratar o proteger animales contra la infestación e infección por parásitos, que comprende aplicar a un lugar una cantidad parasiticida efectiva de un compuesto de la presente invención.
- Los compuestos de la presente invención son además adecuados para usar en combatir o controlar parásitos en y sobre animales. Adicionalmente, la presente invención se refiere a un método para combatir o controlar parásitos en
- 50 y sobre animales, que comprende poner en contacto los parásitos con una cantidad efectiva como parasiticida de un compuesto de la presente invención.
- La presente invención también se refiere al uso no terapéutico de compuestos de la presente invención para controlar o combatir parásitos. Además, la presente invención se refiere a un método no terapéutico para combatir o controlar

- parásitos, que comprende aplicar a un locus una cantidad efectiva como parasiticida de un compuesto de la presente invención.
- 5 Los compuestos de la presente invención pueden ser efectivos a través del contacto (a través del suelo, vidrio, pared, mosquitero, alfombra, mantas o partes de animales) y la ingestión (por ejemplo, cebos). Adicionalmente, los compuestos de la presente invención se pueden aplicar a cualquiera y a todas las etapas de desarrollo.
- Los compuestos de la presente invención se pueden aplicar como tales o en forma de composiciones que comprenden los compuestos de la presente invención.
- 10 Los compuestos de la presente invención también pueden aplicarse junto con un asociado de mezcla, que actúa contra parásitos patógenos, por ejemplo con compuestos de coccidiosis sintéticos, politerantibióticos tales como Amprolium, Robenidin, Toltrazuril, Monensin, Salinomycin, Maduramicin, Lasalocid, Narasin o Semduramicin, o con otras mezclas como se define anteriormente, o en forma de composiciones que comprenden dichas mezclas.
- Los compuestos de la presente invención y las composiciones que los comprenden pueden aplicarse por vía oral, parenteral o tópica, por ejemplo dérmicamente. Los compuestos de la presente invención pueden ser sistémicamente o no sistémicamente efectivos.
- 15 La aplicación puede llevarse a cabo de manera profiláctica, terapéutica o no terapéutica. Además, la aplicación puede llevarse a cabo de forma preventiva en lugares en los que se espera la aparición de parásitos.
- Como se usa en el presente documento, el término "poner en contacto" incluye tanto el contacto directo (aplicando los compuestos/composiciones directamente sobre el parásito, incluida la aplicación directamente sobre el animal o excluyendo la aplicación directamente sobre el animal, por ejemplo, en su locus para este último) y contacto indirecto (aplicando los compuestos/composiciones al locus del parásito). El contacto del parásito a través de la aplicación a su locus es un ejemplo de un uso no terapéutico de los compuestos de la presente invención.
- 20 El término "locus" significa el hábitat, el suministro de alimentos, el terreno de crianza, el área, material o el entorno en el que un parásito está creciendo o puede crecer fuera del animal.
- Como se usa en el presente documento, el término "parásitos" incluye endo y ectoparásitos. En algunas realizaciones de la presente invención, pueden preferirse los endoparásitos. En otras realizaciones, los ectoparásitos pueden ser preferidos. Las infestaciones en animales de sangre caliente y peces incluyen, pero no se limitan a, piojos, piojos mordedores, garrapatas, lombrices nasales, keds, moscas picadoras, moscas muscoides, moscas, larvas de moscas miasóticas, niguas, jejenes, mosquitos y pulgas.
- 25 Los compuestos de la presente invención son especialmente útiles para combatir parásitos de los siguientes órdenes y especies, respectivamente:
- 30 pulgas (Siphonaptera), por ejemplo *Ctenocephalides felis*, *Ctenocephalides canis*, *Xenopsylla cheopis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, y *Nosopsyllus fasciatus*; cucarachas (Blattaria - Blattodea), por ejemplo *Blattella germanica*, *Blattella asahinae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta japonica*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta australasiae*, y *Blatta orientalis*;
- 35 moscas, mosquitos (Diptera), por ejemplo *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Anopheles crucians*, *Anopheles albimanus*, *Anopheles gambiae*, *Anopheles freeborni*, *Anopheles leucosphyrus*, *Anopheles minimus*, *Anopheles quadrimaculatus*, *Calliphora vicina*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Chrysops discalis*, *Chrysops silacea*, *Chrysops atlanticus*, *Cochliomyia hominivorax*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culicoides furens*, *Culex pipiens*, *Culex nigripalpus*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex tarsalis*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Dermatobia hominis*, *Fannia canicularis*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Glossina palpalis*, *Glossina fuscipes*, *Glossina tachinoides*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hippelates spp.*, *Hypoderma lineata*, *Leptoconops torrens*, *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Lycoria pectoralis*, *Mansonia spp.*, *Musca domestica*, *Muscina stabulans*, *Oestrus ovis*, *Phlebotomus argentipes*, *Psorophora columbiae*, *Psorophora discolor*, *Prosimulium mixtum*, *Sarcophaga haemorrhoidalis*, *Sarcophaga sp.*, *Simulium vittatum*, *Stomoxys calcitrans*, *Tabanus bovinus*, *Tabanus atratus*, *Tabanus lineola*, y *Tabanus similis*;
- 40 piojos (Phthiraptera), por ejemplo *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pthirus pubis*, *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus suis*, *Linognathus vituli*, *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*, *Menacanthus stramineus* y *Solenopotes capillatus*; ticks y parasitic mites (Parasitiformes):
- 45 garrapatas (Ixodida), por ejemplo *Ixodes scapularis*, *Ixodes holocyclus*, *Ixodes pacificus*, *Rhiphicephalus sanguineus*, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor variabilis*, *Amblyomma americanum*, *Amblyomma maculatum*, *Ornithodoros hermsi*, *Ornithodoros turicata* y ácaros parásitos (Mesostigmata), por ejemplo *Ornithonyssus bacoti* y *Dermanyssus gallinae*;
- 50

Actiniedida (Prostigmata) y Acaridida (Astigmata), por ejemplo *Acarapis spp.*, *Cheyletiella spp.*, *Ornithocheyletia spp.*, *Myobia spp.*, *Psorergates spp.*, *Demodex spp.*, *Trombicula spp.*, *Listrophorus spp.*, *Acarus spp.*, *Tyrophagus spp.*, *Caloglyphus spp.*, *Hypodectes spp.*, *Pterolichus spp.*, *Psoroptes spp.*, *Chorioptes spp.*, *Otodectes spp.*, *Sarcoptes spp.*, *Notoedres spp.*, *Knemidocoptes spp.*, *Cytodites spp.*, y *Laminosioptes spp.*; Bichos (Heteroptera): *Cimex lectularius*, *Cimex hemipterus*, *Reduvius senilis*, *Triatoma spp.*, *Rhodnius spp.*, *Panstrongylus spp.*, y *Arilus critatus*; Anoplurida, por ejemplo *Haematopinus spp.*, *Linognathus spp.*, *Pediculus spp.*, *Phtirus spp.*, y *Solenopotes spp.*; Mallophagida (subórdenes Armblycerina e Ischnocera), por ejemplo *Trimenopon spp.*, *Menopon spp.*, *Trinoton spp.*, *Bovicola spp.*, *Werneckiella spp.*, *Lepikentron spp.*, *Trichodectes spp.*, y *Felicola spp.*; Gusanos redondos Nematoda: Gusanos frotadores y Trichinosis (Trichosyringida), por ejemplo Trichinellidae (*Trichinella spp.*), (Trichuridae) *Trichuris spp.*, *Capillaria spp.*; Rhabditida, por ejemplo *Rhabditis spp.*, *Strongyloides spp.*, *Helicephalobus spp.*; Strongylida, por ejemplo *Strongylus spp.*, *Ancylostoma spp.*, *Necator americanus*, *Bunostomum spp.* (*Anquilostoma*), *Trichostrongylus spp.*, *Haemonchus contortus*, *Ostertagia spp.*, *Cooperia spp.*, *Nematodirus spp.*, *Dictyocaulus spp.*, *Cyathostoma spp.*, *Oesophagostomum spp.*, *Stephanurus dentatus*, *Ollulanus spp.*, *Chabertia spp.*, *Stephanurus dentatus*, *Syngamus trachea*, *Ancylostoma spp.*, *Uncinaria spp.*, *Globocephalus spp.*, *Necator spp.*, *Metastrongylus spp.*, *Muellerius capillaris*, *Protostrongylus spp.*, *Angiostrongylus spp.*, *Parelaphostrongylus spp.*, *Aleurostrongylus abstrusus*, y *Dioctophyma renale*; gusanos redondos intestinales (Ascaridida), por ejemplo *Ascaris lumbricoides*, *Ascaris suum*, *Ascaridia galli*, *Parascaris equorum*, *Enterobius vermicularis* (*Threadworm*), *Toxocara canis*, *Toxascaris leonine*, *Skrjabinema spp.*, y *Oxyuris equi*; Camallanida, por ejemplo *Dracunculus medinensis* (gusano de guinea); Spirurida, por ejemplo *Thelazia spp.*, *Wuchereria spp.*, *Brugia spp.*, *Onchocerca spp.*, *Dirofilaria spp.*, *Dipetalonema spp.*, *Setaria spp.*, *Elaeophora spp.*, *Spirocerca lupi*, y *Habronema spp.*; Gusanos de cabeza espinosa (Acanthocephala), por ejemplo *Acanthocephalus spp.*, *Macracanthorhynchus hirudinaceus* y *Oncicola spp.*; Planarians (Plathelminthes): Lombrices del ganado (Trematoda), por ejemplo *Faciola spp.*, *Fascioloides magna*, *Paragonimus spp.*, *Dicrocoelium spp.*, *Fasciolopsis buski*, *Clonorchis sinensis*, *Schistosoma spp.*, *Trichobilharzia spp.*, *Alaria alata*, *Paragonimus spp.*, y *Nanocyetes spp.*; Cercomeromorpha, en particular Cestoda (lombriz solitaria), por ejemplo *Diphyllobothrium spp.*, *Tenia spp.*, *Echinococcus spp.*, *Dipylidium caninum*, *Multiceps spp.*, *Hymenolepis spp.*, *Mesocestoides spp.*, *Vampirolepis spp.*, *Moniezia spp.*, *Anoplocephala spp.*, *Sirometra spp.*, *Anoplocephala spp.*, e *Hymenolepis spp.*.

Como se usa en este documento, el término "animal" incluye animales de sangre caliente (incluidos los humanos) y peces. Se prefieren los mamíferos, como el ganado vacuno, ovejas, puercos, camellos, ciervos, caballos, cerdos, aves de corral, conejos, cabras, perros y gatos, búfalos de agua, burros, corzos y renos, y también en animales de piel tales como mink, chinchilla y mapache, aves tales como gallinas, gansos, pavos y patos y peces tales como peces de agua dulce y agua salada tales como trucha, carpa y anguilas. Particularmente preferidos son los animales domésticos, tales como perros o gatos.

En general, "cantidad efectiva como parasitocida" significa la cantidad de ingrediente activo necesaria para lograr un efecto observable en el crecimiento, incluidos los efectos de necrosis, muerte, retraso, prevención y eliminación, destrucción o, de otra manera, disminución de la incidencia y actividad del organismo objetivo. La cantidad efectiva como parasitocida puede variar para los diversos compuestos/composiciones usados en la invención. Una cantidad efectiva como parasitocida de las composiciones también variará de acuerdo con las condiciones prevalecientes tales como el efecto parasitocida deseado y la duración, la especie objetivo, el modo de aplicación y similares.

En general, es favorable aplicar los compuestos de la presente invención en cantidades totales de 0,5 mg/kg a 100 mg/kg por día, preferiblemente de 1 mg/kg a 50 mg/kg por día.

Para la administración oral a animales de sangre caliente, los compuestos de fórmula I pueden formularse como alimentos para animales, premezclas de alimentos para animales, concentrados de alimentos para animales, píldoras, soluciones, pastas, suspensiones, artículos empapados, geles, tabletas, bolos y cápsulas. Además, los compuestos de fórmula I pueden administrarse a los animales en su agua potable. Para la administración oral, la forma de dosificación elegida debe proporcionar al animal de 0.01 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal del animal por día del compuesto de fórmula I, preferiblemente de 0.5 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal del animal por día.

Alternativamente, los compuestos de fórmula I pueden administrarse a animales por vía parenteral, por ejemplo, mediante inyección intraruminal, intramuscular, intravenosa o subcutánea. Los compuestos de fórmula I pueden dispersarse o disolverse en un vehículo fisiológicamente aceptable para inyección subcutánea. Alternativamente, los compuestos de fórmula I pueden formularse en un implante para administración subcutánea. Además, el compuesto de fórmula I puede administrarse por vía transdérmica a animales. Para la administración parenteral, la forma de dosificación elegida debe proporcionar al animal de 0.01 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal del animal por día del compuesto de fórmula I.

Los compuestos de fórmula I también se pueden aplicar por vía tópica a los animales en forma de inmersiones, polvos, pulverizables, collares, medallones, aspersiones, champús, formulaciones para colocar y verter y en ungüentos o emulsiones de aceite en agua o agua en aceite. Para la aplicación tópica, las inmersiones y las aspersiones usualmente contienen de 0,5 ppm a 5,000 ppm y preferiblemente de 1 ppm a 3,000 ppm del compuesto de fórmula I. Además, los compuestos de fórmula I pueden formularse como etiquetas de oreja para animales, particularmente cuadrúpedos tales como el ganado vacuno y ovejas.

60

Las preparaciones adecuadas son:

Soluciones tales como soluciones orales, concentrados para administración oral después de la dilución, soluciones para uso en la piel o en cavidades corporales, formulaciones para verter, geles;

Emulsiones y suspensiones para administración oral o dérmica; preparaciones semisólidas;

- 5 Formulaciones en las que el compuesto activo se procesa en una base de ungüento o en una base de emulsión de aceite en agua o agua en aceite;

Preparaciones sólidas tales como polvos, premezclas o concentrados, gránulos, pellas, tabletas, bolos, cápsulas; aerosoles e inhalantes, y artículos conformados que contienen compuestos activos.

- 10 Las composiciones adecuadas para inyección se preparan disolviendo el ingrediente activo en un disolvente adecuado y opcionalmente, añadiendo agentes auxiliares adicinales tales como ácidos, bases, sales reguladoras, conservantes y solubilizantes. Los agentes auxiliares adecuados para soluciones de inyección son conocidos en la técnica. Las soluciones se filtran y se llenan estériles.

- 15 Las soluciones orales se administran directamente. Los concentrados se administran por vía oral después de la dilución previa a la concentración de uso. Las soluciones y concentrados orales se preparan de acuerdo con el estado de la técnica y como se describe anteriormente para soluciones de inyección, no siendo necesarios procedimientos estériles.

Las soluciones para el uso sobre la piel son rociadas, esparcidas, frotadas, pulverizadas o asperjadas. Las soluciones para uso en la piel se preparan de acuerdo con el estado de la técnica y de acuerdo con lo que se describe anteriormente para soluciones de inyección, no siendo necesarios procedimientos estériles.

- 20 Los geles se aplican a o se esparcen sobre la piel o se introducen en las cavidades del cuerpo. Los geles se preparan tratando soluciones que se han preparado como se describe en el caso de las soluciones de inyección con un espesante suficiente para obtener un material transparente con una consistencia similar al ungüento. Los espesantes adecuados son conocidos en la técnica.

- 25 Las formulaciones para vertido se vierten o asperjan en áreas limitadas de la piel, penetrando el compuesto activo la piel y actuando sistémicamente. Las formulaciones para vertido se preparan disolviendo, suspendiendo o emulsionando el compuesto activo en disolventes o mezclas de disolventes adecuados compatibles con la piel. Si es apropiado, se agregan otros agentes auxiliares tales como colorantes, sustancias que promueven la bioabsorción, antioxidantes, estabilizadores frente a la luz, adhesivos. Tales agentes auxiliares adecuados son conocidos en la técnica.

- 30 Las emulsiones se pueden administrar por vía oral, dérmica o como inyecciones. Las emulsiones son del tipo agua en aceite o del tipo aceite en agua. Se preparan disolviendo el compuesto activo en la fase hidrófoba o en la fase hidrófila y homogeneizando este con el disolvente de la otra fase con la ayuda de emulsionantes adecuados y, si corresponde, otros agentes auxiliares tales como colorantes, sustancias promotoras de la absorción y conservantes, antioxidantes, estabilizadores frente a la luz, sustancias que aumentan la viscosidad. Las fases hidrófobas adecuadas (aceites), las fases hidrófilas adecuadas, emulsionantes adecuados y agentes auxiliares adicionales adecuados para emulsiones son conocidos en la técnica.

- 35 Las suspensiones se pueden administrar por vía oral o tópica/dérmica. Se preparan suspendiendo el compuesto activo en un agente de suspensión, si es apropiado con la adición de otros agentes auxiliares como agentes humectantes, colorantes, sustancias que promueven la bioabsorción, conservantes, antioxidantes y estabilizadores frente a la luz. Los agentes de suspensión adecuados y otros agentes auxiliares adecuados para suspensiones que incluyen agentes humectantes son conocidos en la técnica.

Las preparaciones semisólidas se pueden administrar por vía oral o tópica/dérmica. Se diferencian de las suspensiones y emulsiones descritas anteriormente solamente por su mayor viscosidad.

- 45 Para la producción de preparaciones sólidas, el compuesto activo se mezcla con excipientes adecuados, si es apropiado con la adición de agentes auxiliares, y se lleva a la forma deseada. Los agentes auxiliares adecuados para este propósito son conocidos en la técnica.

Las composiciones que se pueden usar en la invención pueden comprender generalmente de aproximadamente 0,001 a 95% del compuesto de la presente invención.

- 50 Las preparaciones listas para usar contienen los compuestos que actúan contra los parásitos, preferiblemente ectoparásitos, en concentraciones de 10 ppm a 80 por ciento en peso, preferiblemente de 0,1 a 65 por ciento en peso, más preferiblemente de 1 a 50 por ciento en peso, lo más preferiblemente de 5 a 40 por ciento en peso.

Las preparaciones que se diluyen antes de su uso contienen los compuestos que actúan contra los ectoparásitos en concentraciones de 0,5 a 90 por ciento en peso, preferiblemente de 1 a 50 por ciento en peso.

Adicionalmente, las preparaciones comprenden los compuestos de fórmula I contra endoparásitos en concentraciones de 10 ppm a 2 por ciento en peso, preferiblemente de 0,05 a 0,9 por ciento en peso, muy particularmente de manera preferible de 0,005 a 0,25 por ciento en peso.

5 La aplicación tópica se puede realizar con artículos conformados que contienen compuestos tales como collares, medallones, etiquetas para orejas, bandas para fijar en partes del cuerpo y tiras adhesivas y láminas.

En general, es favorable aplicar formulaciones sólidas que liberen compuestos de la presente invención en cantidades totales de 10 mg/kg a 300 mg/kg, preferiblemente de 20 mg/kg a 200 mg/kg, lo más preferiblemente de 25 mg/kg a 160 mg/kg de peso corporal del animal tratado en el transcurso de tres semanas.

### Ejemplos

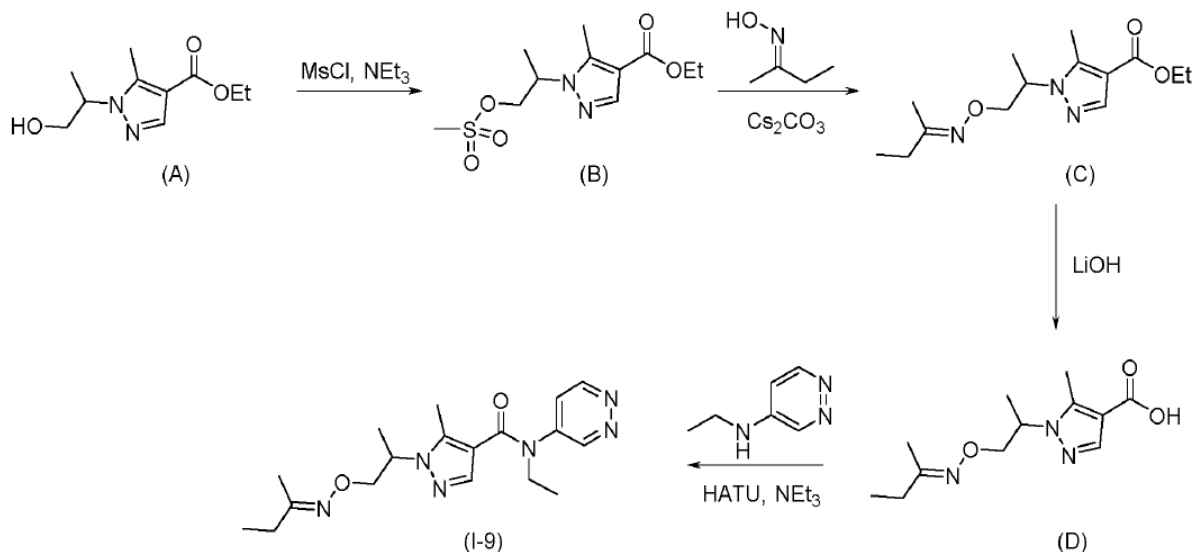
#### 10 A. Ejemplos de preparación

Con la modificación apropiada de los materiales de partida, se utilizaron los procedimientos descritos en el Esquema 1 y los siguientes ejemplos de síntesis para obtener compuestos I adicionales. Los compuestos obtenidos de esta manera se listan en la siguiente tabla, junto con los datos físicos.

15 Los productos que se muestran a continuación se caracterizaron por la determinación del punto de fusión, por espectroscopia de RMN o por las masas ([m/z] o el tiempo de retención (RT; [min.]) A través de HPLC-MS o espectrometría por HPLC.

HPLC-MS = espectrometría de masas acoplada a cromatografía líquida de alto rendimiento

20 Método 1 de HPLC: Phenomenex Kinetex 1,7  $\mu$ m XB-C<sub>18</sub> 100A; 50 x 2,1 mm; fase móvil: A: agua + 0,1% de ácido trifluoroacético (TFA); B: acetonitrilo + 0,1% de TFA; gradiente: 5-100% B en 1,50 minutos; 100% B 0,20 min; Flujo: 0,8-1,0 ml/min en 1,50 minutos a 60 °C. MS: ionización por electroaspersión cuadrupolar, 80 V (modo positivo).



Esquema 1: Síntesis del compuesto I-9

Ejemplo 1: Preparación de etil éster del ácido 5-metil-1-(1-metil-2-metilsulfoniloxi-etil)pirazol-4-carboxílico (B)

25 A una solución agitada de etil éster del ácido 1-(2-hidroxi-1-metil-etil)-5-metil-pirazol-4-carboxílico A (16 g, pureza 92%, 69,2 mmol) en 150 ml de diclorometano se añadió gota a gota cloruro de metanosulfonilo (24 g, 208 mmol). La mezcla se enfrió hasta -40°C y se añadió gota a gota trietilamina (21 g, 208 mmol) en 50 ml de diclorometano. Se continuó la agitación y la mezcla se calentó gradualmente hasta 0°C. Se añadieron gota a gota 100 ml de agua y se separaron las capas. La fase orgánica se lavó con agua (100 ml), se secó sobre sulfato de sodio y el disolvente se eliminó bajo presión reducida para dar el mesilato B (25 g, pureza del 80%) que se usó sin purificación adicional.

30 **Ejemplo 2: Preparación de etil éster del ácido etil 5-metil-1-[1-metil-2-[1-metilpropiliden-amino]oxietil]pirazol-4-carboxílico (C)**

A una solución de oxima de butan-2-ona (3,92 g, 45 mmol) en 70 ml de acetonitrilo se añadió carbonato de cesio (14,7 g, 45 mmol) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 20 min. Luego se añadió gota a gota una solución



de mesilato B (5,4 g, 15 mmol) en 20 ml de acetonitrilo y se continuó la agitación durante 48 h. La mezcla de reacción se filtró y el disolvente se eliminó bajo presión reducida. La purificación por cromatografía instantánea en fase reversa (H<sub>2</sub>O/MeOH, 100: 0 → 0: 100) dio 1,18 g de oxima C (28%, 4,2 mmol). HPLC-MS: RT 1,118 min, m/z [MH]<sup>+</sup> 282,2

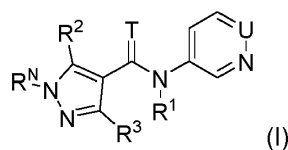
### Ejemplo 3: Preparación de ácido 5-metil-1-[1-metil-2-[1-metilpropiliden-amino]oxi-etil]pirazol-4-carboxílico (D)

5 A una solución de éster del ácido pirazol carboxílico C (715 mg, 2,54 mmol) en 25 ml de etanol se le añadió LiOH (183 mg, 7,64 mmol) en 5 ml de agua y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante la noche. Se añadieron LiOH adicionales (150 mg, 6,26 mmol) y la mezcla se agitó a 50°C durante 8 h. El disolvente se eliminó bajo presión reducida y el residuo se diluyó con agua. La mezcla se lavó con acetato de etilo (3 x 20 ml), se acidificó a pH 1 mediante la adición de una solución acuosa de HCl 2N y se filtró el ácido D precipitado. Además, la solución se extrajo con acetato de etilo (2 x 20 ml) y las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio, se filtraron y el disolvente se eliminó bajo presión reducida. El ácido carboxílico combinado D (572 mg, 2,26 mmol, 89%) se usó sin purificación adicional. <sup>1</sup>H-RMN (MeOD, 500 MHz) δ = 1.04 (t, 3H), 1.46 (d, 3H), 1.68 (s, 3H), 2.15 (q, 2H), 2.50 (s, 3H), 4.16-4.28 (m, 2H), 4.71-4.81 (m, 1H), 7.87 (s, 1H) ppm.

### 15 Ejemplo 4: Preparación de N-etil-5-metil-1-[1-metil-2-[1-metil-propilidenamino]oxietil]-N-piridazin-4-il-pirazol-4-carboxamida (I-9)

20 A una solución de 258 mg (1,0 mmol) de ácido 5-metil-1-[1-metil-2-[1-metilpropiliden-amino]oxi-etil]pirazol-4-carboxílico en 10 ml de DMF se le añadió etilaminopiridazina (370 mg, 3.0 mmol), HATU [O-(7-Azabenzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio-hexafluorofosfato] (1.52 g, 4.0 mmol) y trietilamina (606 mg, 6.0 mmol). La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante la noche y el disolvente se eliminó bajo presión reducida. La purificación por cromatografía instantánea (ciclohexano/EtOAc/MeOH, 100: 0: 0 → 0: 100: 0 → 0: 0: 100) dio 190 mg del compuesto del título I-9 (53%). HPLC-MS: RT 0,872 min, m/z [MH]<sup>+</sup> + 358,9

Los siguientes compuestos de fórmula I se obtuvieron de la misma manera.



Comp.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>N</sup> (A)(B)	T	U	Datos físicos (H PLC-MS)	
							RT [min]	m/z [MH] <sup>+</sup>
I-1	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H		O	N	0.941	385.1
I-2	H	CH <sub>3</sub>	H		O	N	0.893	357.2
I-3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H		O	N	0.910	371.3
I-4	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H		O	N	0.815	374.9
I-5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H		O	N	0.768	360.9

Comp.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>N</sup> (A)(B)	T	U	Datos físicos (H PLC-MS)	
							RT [min]	m/z [MH] <sup>+</sup>
I-6	H	CH <sub>3</sub>	H		O	N	0.751	347.6
I-7	H	CH <sub>3</sub>	H		O	N	0.810	331.5
I-8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H		O	N	0.821	344.9
I-9	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H		O	N	0.872	358.9
(A) En el caso de los compuestos I-4 a I-9: isómero individual, E o Z no determinado								
(B) "}" en cada caso, marca la conexión con el átomo de N del anillo de pirazol de fórmula I*								

## B. Ejemplos biológicos

La actividad de los compuestos de fórmula I de la presente invención podría demostrarse y evaluarse en las pruebas biológicas que se describen a continuación.

5 Si no se especifica otra cosa, las soluciones de prueba se prepararon de la siguiente manera:

El compuesto activo se disolvió a la concentración deseada en una mezcla de 1: (vol: vol) de agua destilada: acetona. La solución de prueba se preparó el día de uso y en general a concentraciones de ppm (peso/volumen).

### B.1 Áfido del caupí (*Aphis craccivora*)

10 Las plantas de caupí en maceta colonizadas con 100-150 áfidos de diversas etapas se asperjaron después de que se registró la población de la plaga. La reducción de la población se evaluó después de 24, 72 y 120 horas.

En esta prueba, los compuestos 1-1, I-2, I-3, I-4, I-5, I-6, I-7, I-8 y I-9, respectivamente, a 500 ppm mostraron una mortalidad de al menos el 75% en comparación con los controles no tratados.

### B.2 Áfido del algodón (*Aphis gossypii*, etapas de vida mixtas)

15 Los compuestos activos se formularon en ciclohexanona como una solución de 10.000 ppm suministrada en tubos de 1,3 ml ABgene®. Estos tubos se insertaron en un aspersor electrostático automatizado equipado con una boquilla atomizadora y sirvieron como soluciones de reserva para las cuales se hicieron diluciones más bajas en agua: acetona 1:1 (vol: vol). Se incluyó un surfactante no iónico (Kinetic®) en la solución a un volumen de 0,01% (v/v).

Las plantas de algodón en la etapa de cotiledón se infestaron con áfidos antes del tratamiento al colocar una hoja muy infestada de la colonia principal de áfidos en la parte superior de cada cotiledón. Se dejó que los áfidos se transfirieran

5 durante la noche para lograr una infestación de 80-100 áfidos por planta y se eliminó la hoja huésped. Las plantas infestadas se asperjaron luego con un aspersor automático de plantas electrostático equipado con una boquilla de asperjado atomizador. Las plantas se secaron en la cabina de extracción del aspersor, se retiraron del aspersor y luego se mantuvieron en una sala de cultivo bajo iluminación fluorescente en un fotoperíodo de 24 horas a 25 °C y 20-40% de humedad relativa. La mortalidad de áfidos en las plantas tratadas, en relación con la mortalidad en las plantas de control no tratadas, se determinó después de 5 días.

En esta prueba, los compuestos I-3, I-4, I-5, I-6, I-7, I-8 y I-9, respectivamente, a 300 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con controles no tratados.

#### B.3 Mosca blanca de hoja plateada (*Bemisia argentifolii*, adulto)

10 Los compuestos activos se formularon en ciclohexanona como una solución de 10.000 ppm suministrada en tubos de 1,3 ml ABgene®. Estos tubos se insertaron en un aspersor electrostático automatizado equipado con una boquilla atomizadora y sirvieron como soluciones de reserva para las cuales se hicieron diluciones más bajas en agua 1:1 (vol: vol): acetona. Se incluyó un surfactante no iónico (Kinetic®) en la solución a un volumen de 0,01% (v/v).

15 Las plantas de algodón en la etapa de cotiledón (una planta por maceta) se asperjaron con un aspersor automático electrostático de plantas equipado con una boquilla aspersora. Las plantas se secaron en la cabina de extracción y luego se retiraron del aspersor. Cada maceta se colocó en una taza de plástico y se introdujeron de 10 a 12 adultos de mosca blanca (aproximadamente 3-5 días 2). Los insectos se recolectaron utilizando un aspirador y un tubo no tóxico Tygon® de 0,6 cm (R-3603) conectado a una punta de pipeta de barrera. La punta, que contenía los insectos recolectados, luego se insertó suavemente en el suelo que contenía la planta tratada, lo que permitió que los insectos salieran de la punta para alcanzar el follaje y alimentarse. Las tazas se cubrieron con una tapa apantallada reutilizable (pantalla de poliéster con malla de 150 micrones PeCap de Tetko, Inc.). Las plantas de prueba se mantuvieron en una sala de cultivo a 25 °C y con una humedad relativa del 20-40% durante 3 días, evitando la exposición directa a la luz fluorescente (fotoperíodo de 24 horas) para evitar el atrapamiento de calor dentro de la taza. La mortalidad se evaluó 3 días después del tratamiento, en comparación con las plantas de control sin tratar.

25 En esta prueba, los compuestos I-2, I-3, I-4, I-5, I-6, I-7, I-8 y I-9, respectivamente, a 300 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

#### B.4 Áfido del algarrobo (*Megoura viciae*)

Los compuestos activos se formularon en agua: DMSO 3:1 (vol: vol) con diferentes concentraciones de compuestos formulados.

30 Los discos de hojas de frijol se colocaron en placas de microtitulación llenas con agar-agar al 0,8% y 2,5 ppm de OPUS™. Los discos de hojas se asperjaron con 2,5 µl de la solución de prueba y se colocaron de 5 a 8 áfidos adultos en las placas de microtitulación que luego se cerraron y se mantuvieron a 23 ± 1 °C y 50 ± 5% de humedad relativa bajo luz fluorescente durante 6 días. La mortalidad se evaluó sobre la base de áfidos vitales reproducidos. Luego se evaluó visualmente la mortalidad y fecundidad de áfidos.

35 En esta prueba, los compuestos I-1, I-2, I-3, I-4, I-5, I-6, I-7 y I-9, respectivamente, a 2500 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

#### B.5 Áfido verde del durazno (*Myzus persicae*)

40 Los compuestos activos se formularon en ciclohexanona como una solución de 10.000 ppm suministrada en tubos de 1.3 ml ABgene®. Estos tubos se insertaron en un aspersor electrostático automatizado equipado con una boquilla atomizadora y sirvieron como soluciones de reserva para las cuales se hicieron diluciones más bajas en agua: acetona 1: 1 (vol:vol). Se incluyó un surfactante no iónico (Kinetic®) en la solución a un volumen de 0,01% (v/v).

45 Las plantas de pimentón en la primera etapa de hoja verdadera se infestaron antes del tratamiento colocando hojas muy infestadas de la colonia principal encima de las plantas de tratamiento. Se dejó que los áfidos se transfirieran durante la noche para lograr una infestación de 30-50 áfidos por planta y se eliminaron las hojas huésped. Las plantas infestadas luego se asperjaron con un aspersor automático de plantas electrostático equipado con una boquilla de asperjado atomizador. Las plantas se secaron en la cabina de extracción, se retiraron y luego se mantuvieron en una sala de cultivo con iluminación fluorescente en un fotoperíodo de 24 horas a 25 °C y 20-40% de humedad relativa. La mortalidad de áfidos en las plantas tratadas, con respecto a la mortalidad en las plantas de control no tratadas, se determinó después de 5 días.

50 En esta prueba, los compuestos I-2, I-3, I-4, I-5, I-6, I-7, I-8 y I-9, respectivamente, a 300 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

#### B.6 Gorgojo de baya (*Anthonomus grandis*)

Los compuestos se formularon en agua: DMSO 3: 1 (vol: vol).

5 Para evaluar el control del gorgojo de baya (*Anthonomus grandis*), la unidad de prueba consistió en placas de microtitulación de 24 pozos que contenían una dieta para insectos y 20-30 huevos de *A. grandis*. Se asperjaron diferentes concentraciones de compuestos formulados sobre la dieta de insectos a 20 µl, utilizando un microatomizador hecho a la medida, en dos repeticiones. Después de la aplicación, las placas de microtitulación se incubaron a 23 ± 1 °C y 50 ± 5% de humedad relativa durante 5 días. Luego se evaluó visualmente la mortalidad de huevos y larvas.

En esta prueba, los compuestos I-2 y I-6, respectivamente, a 2500 ppm mostraron una mortalidad de al menos el 75% en comparación con los controles no tratados.

#### B.7 Thrips de orquídeas (*Dichromothrips corbetti*)

10 Los compuestos activos se formularon como una solución de agua: acetona 1:1 (vol: vol). Se añadió surfactante (Al-kamuls EL 620) a una tasa del 0,1% (vol/vol). Los pétalos de las orquídeas *Vanda* se limpiaron, lavaron y secaron al aire antes de asperjar. Los pétalos se sumergieron en la solución de prueba durante 3 segundos, se secaron al aire, se colocaron dentro de un plástico resellable y se inocularon con 20 adultos. Los pétalos tratados se mantuvieron dentro de la sala e cultivo a 28-29 °C y una humedad relativa de 50-60%. El porcentaje de mortalidad se registró después de 72 horas.

15 En esta prueba, los compuestos I-4 y I-6, respectivamente, a 500 ppm mostraron una mortalidad de al menos el 75% en comparación con los controles no tratados.

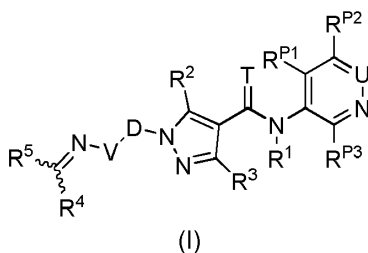
#### B.8 Polilla dorso de diamante (*Plutella xylostella*)

20 Los compuestos activos se formularon en agua: acetona 1:1 (vol: vol) y 0,1% (vol/vol) de surfactante Al-kamuls EL 620. Se sumergió un disco de 6 cm de hojas de repollo en la solución de prueba durante 3 segundos y se dejó secar al aire en una placa de Petri revestida con papel de filtro húmedo. El disco de la hoja se inoculó con 10 larvas de tercer estadio y se mantuvo a 25-27 °C y 50-60% de humedad durante 3 días. La mortalidad fue evaluada después de 72 h de tratamiento.

25 En esta prueba, los compuestos I-4 y I-6, respectivamente, a 500 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

## REIVINDICACIONES

1. Compuestos de pirazol de fórmula I



en donde

5 V es O;

D es alquileo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, en donde D puede estar no sustituido o puede estar parcial o totalmente sustituido con sustituyentes que, independientemente uno de otro, se seleccionan de R<sup>A</sup>;

U es N;

T es O;

10 R<sup>P1</sup>, R<sup>P2</sup>, y R<sup>P3</sup> son H;

R<sup>1</sup> es H, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alquilo;

R<sup>2</sup> es CH<sub>3</sub> o halometilo, y

R<sup>3</sup> es H, y en donde

R<sup>4</sup> es H, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cicloalquilo o C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cilcoalquilmetilo; y

15 R<sup>5</sup> es C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cicloalquilo o C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cilcoalquilmetilo, en donde en cada caso C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cicloalquilo o C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cilcoalquilmetilo pueden estar sin sustituir o pueden estar parcial o totalmente sustituidos por sustituyentes que, independientemente entre sí, se seleccionan de R<sup>A</sup>, o en donde

20 R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un carbo o heterociclo no aromático de 5 a 6 miembros, que pueden contener 1 o 2 heteroátomos que, independientemente entre sí, se seleccionan de NR<sup>B</sup>, O, y S, en donde S puede estar oxidado, y/o en donde el carbo- o heterociclo pueden estar sin sustituir o pueden estar parcial o totalmente sustituidos por sustituyentes que, independientemente entre sí, se seleccionan de R<sup>A</sup>;

y en donde

R<sup>A</sup> es halógeno, CN, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alcoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-haloalcoxi, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-cicloalquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-halocicloalquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-cicloalcoxi, o C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-halocicloalcoxi; o en donde

25 dos R<sup>A</sup> están unidos al mismo átomo de carbono y junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un ciclopropano;

y en donde

R<sup>B</sup> es H, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alquilcarbonilo, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-haloalquilcarbonilo, o C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alcoxycarbonilo;

y las sales, estereoisómeros, tautómeros, y N-óxidos de los mismos.

30 2. Los compuestos de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde D es un C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alquileo ramificado, preferiblemente un C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alquileo ramificado alfa, en donde el C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alquileo ramificado puede estar sin sustituir o puede estar parcialmente o totalmente sustituidos por sustituyentes que, independientemente uno de otro, se seleccionan de R<sup>A</sup>.

35 3. Los compuestos de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, en donde D es CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>, en donde preferiblemente el grupo CH<sub>2</sub> está unido a V y el grupo CH(CH<sub>3</sub>) está unido al átomo de nitrógeno de la unidad estructural pirazol, de tal manera que se obtenga una conectividad de V-CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)-N.

4. Una composición que comprende al menos un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 y al menos un portador líquido y/o sólido inerte.

5. Una composición agrícola adecuada para combatir plagas animales que comprende al menos un compuesto como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 y al menos un portador aceptable inerte líquido y/o sólido y, si se desea, al menos un surfactante.
- 5 6. Un compuesto como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 o una sal aceptable desde el punto de vista veterinario, o un N-óxido del mismo para uso en el tratamiento terapéutico, o la protección de un animal contra la infestación, o la infección por parásitos.
7. Un método para proteger las plantas en crecimiento del ataque o la infestación por plagas de invertebrados, método que comprende poner en contacto una planta, o el suelo o el agua en que la planta está creciendo, con una cantidad efectiva como plaguicida de al menos un compuesto como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3.
- 10 8. Semilla que comprende un compuesto como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, o los enantiómeros, diastereómeros o sales de los mismos, en una cantidad de 0,1 g a 10 kg por 100 kg de semilla.
9. El uso de los compuestos como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 para proteger a las plantas en crecimiento de ataques o infestaciones por plagas de invertebrados.