

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 710 217**

51 Int. Cl.:

C07D 409/12 (2006.01)
A01N 43/36 (2006.01)
A01N 43/40 (2006.01)
A01N 43/56 (2006.01)
A01N 43/80 (2006.01)
C07D 413/12 (2006.01)
C07D 417/12 (2006.01)
C07D 263/16 (2006.01)
C07D 207/22 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **25.02.2015 PCT/EP2015/053899**
- 87 Fecha y número de publicación internacional: **03.09.2015 WO15128358**
- 96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **25.02.2015 E 15706799 (2)**
- 97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **07.11.2018 EP 3110811**

54 Título: **Compuestos de azolina**

30 Prioridad:

26.02.2014 US 201461944588 P
19.12.2014 US 201462094091 P

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
23.04.2019

73 Titular/es:

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

72 Inventor/es:

BINDSCHÄDLER, PASCAL y
VON DEYN, WOLFGANG

74 Agente/Representante:

CARVAJAL Y URQUIJO, Isabel

Observaciones:

Véase nota informativa (Remarks, Remarques o Bemerkungen) en el folleto original publicado por la Oficina Europea de Patentes

ES 2 710 217 T3

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

DESCRIPCIÓN

Compuestos de azolina

5 La presente invención se refiere a compuestos de azolina que son útiles para combatir o controlar plagas de invertebrados, en particular plagas de artrópodos y nematodos. La invención también se refiere a un método para controlar plagas de invertebrados usando estos compuestos y al material de propagación de plantas y a una composición agrícola y veterinaria que comprende dichos compuestos.

10 Las plagas de invertebrados y en particular los artrópodos y los 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. Si bien se conoce un gran número de agentes pesticidas, debido a la capacidad de las plagas objetivo para desarrollar resistencia a dichos agentes, existe una necesidad continua de nuevos agentes para combatir plagas de invertebrados, en particular insectos, arácnidos y nematodos.

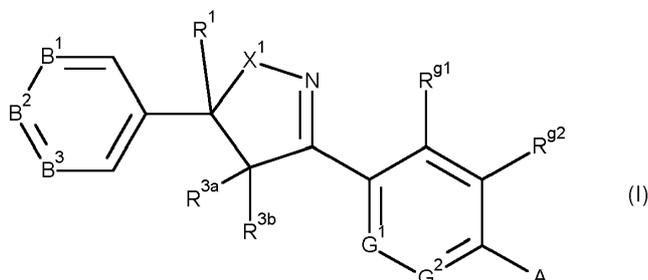
15 Los compuestos relacionados se describen en los documentos WO 2014/019951, WO 2013/026929, WO 2012/163959, WO 2012/007426, WO 2011/161130, WO 2011/073444, WO 2011/067272, WO 2010/149506, WO 2010/020522, WO 2009/080250, EP-A-1731512, EP-A-1932836, EP-A-2172448, JP-A-2007091708 y JP-A-2008133273. Sin embargo, estos documentos no describen compuestos que tengan los sustituyentes característicos y la disposición de sustituyentes como se reivindica en la presente invención.

Un objeto de la presente invención es proporcionar compuestos que tengan una buena actividad pesticida, en particular actividad insecticida, y mostrar un amplio espectro de actividad contra un gran número de plagas de invertebrados diferentes, especialmente contra plagas y/o nematodos de artrópodos difíciles de controlar.

20 El objeto de la presente invención es además proporcionar compuestos que sean menos persistentes, bioacumulativos y/o tóxicos que los compuestos de la técnica anterior. Especialmente los insecticidas isoxazolina de la técnica anterior muestran una alta persistencia en el suelo y, por lo tanto, se acumulan allí.

25 Se ha encontrado que estos objetivos pueden lograrse mediante compuestos de azolina de la fórmula I a continuación, por sus estereoisómeros y por sus sales, en particular sus sales aceptables desde el punto de vista agrícola o veterinario.

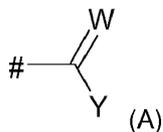
Por lo tanto, en un primer aspecto, la invención se refiere a compuestos de azolina de la fórmula I



en donde

X¹ es O o CH₂;

30 A es un grupo de la siguiente fórmula:



en donde

denota el enlace al anillo aromático de fórmula (I);

W se selecciona de O y S;

35 Y se selecciona de hidrógeno, -N(R⁵)R⁶ y -OR⁹;

B¹, B² y B³ son cada uno independientemente CR²;

G¹ y G² son cada uno independientemente CR⁴;

ES 2 710 217 T3

R⁹¹ y R⁹² formar juntos un grupo puente seleccionado de -CH₂CH₂CH₂CH₂- y -CH₂CH₂CH₂-;

R¹ es CF₃;

cada R² se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, C₁-C₂-haloalcoxi y C₁-C₂-haloalquilo;

- 5 R^{3a}, R^{3b} son cada uno independientemente seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, hidroxilo, -CO₂R^{3d}, C₁-C₃-alquilo, C₁-C₃-haloalquilo, C₂-C₃-alquenilo, C₂-C₃-alquinilo, C₁-C₃-alcoxi, C₁-C₃-haloalcoxi, C₁-C₃-alquiltio, C₁-C₃-haloalquiltio, C₁-C₃-alquilsulfonilo y C₁-C₃-haloalquilsulfonilo; o

R^{3a} y R^{3b} juntos forman un grupo =O, =C(R^{3c})₂, =NOH o =NOCH₃;

cada R^{3c} se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, CH₃ y CF₃;

- 10 R^{3d} se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, C₁-C₆-alquilo y C₁-C₃-alquilo-C₁-C₃-alquil-;

cada R⁴ se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno y ciano;

R⁵ se selecciona de hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₃-alquinilo y CH₂-CN;

- 15 R⁶ se selecciona de hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₄-alquilo que porta un radical R⁸, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo que pueden estar sustituidos con 1 o 2 sustituyentes seleccionados de F, CN y piridilo; -N(R^{101a})R^{101b},

en donde

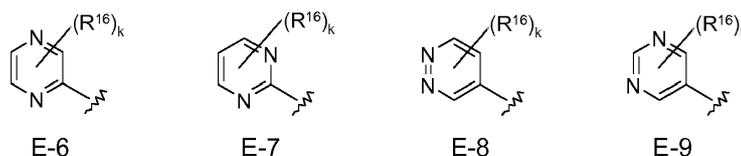
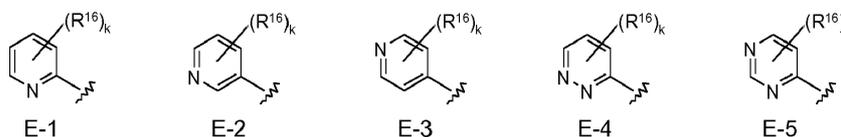
R^{101a} se selecciona de hidrógeno y C₁-C₆-alquilo; y

R^{101b} se selecciona de hidrógeno, -C(=O)N(R^{14a})R^{14b}, en donde

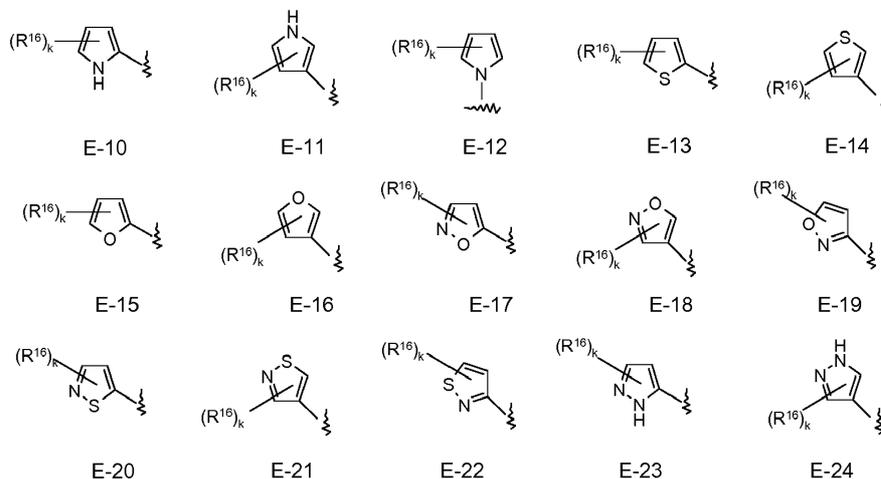
R^{14a} se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno y C₁-C₆-alquilo; y

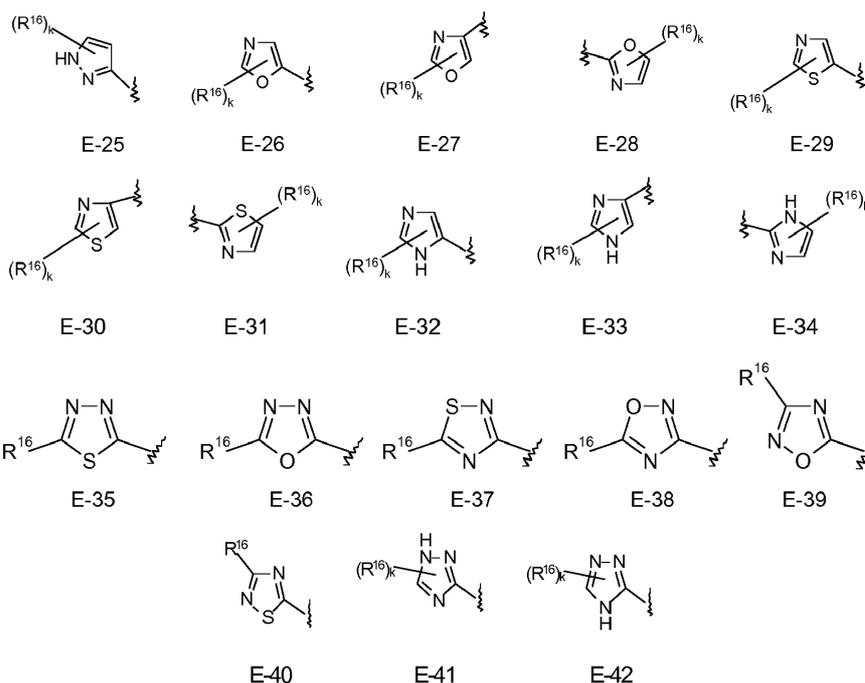
- 20 R^{14b} se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₄-alquinilo, CH₂-CN, C₁-C₆-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;

R^{101b} se selecciona además de fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R¹⁶, y un anillo heterocíclico seleccionado de anillos de fórmulas E-1 a E-42



25





5 en donde estos anillos E-1 a E-42 como un significado para R^{101b}

la línea en zigzag denota el punto de unión al resto de la molécula;

k es 0, 1, 2 o 3, y

10 cada R^{16} se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₂-C₄-haloalquino, C₁-C₄-alquilcarbonilo, C₁-C₄-haloalquilcarbonilo, aminocarbonilo, C₁-C₄-alquilaminocarbonilo y di-(C₁-C₄-alquil)amino-carbonilo;

R^6 se selecciona además de -CH=NOR^{9a}, en donde R^{9a} se selecciona de hidrógeno, C₁-C₆-alquilo y C₁-C₆-haloalquilo;

15 fenilo que puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R¹¹, y un anillo heteromonocíclico saturado, parcialmente insaturado o insaturado al máximo de 3, 4, 5 o 6 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados independientemente de N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heteromonocíclico puede estar sustituido con uno o más sustituyentes R¹¹; en donde

20 cada R¹¹ se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino y C₂-C₄-haloalquino; o dos R¹¹ presentes en el mismo átomo de carbono de un anillo heterocíclico saturado pueden formar juntos =O o =S; o

dos R¹¹ presentes en el mismo miembro de anillo S o SO de un anillo heterocíclico pueden formar juntos un grupo =N(C₁-C₆-alquil), =NO(C₁-C₆-alquil), =NN(H)(C₁-C₆-alquil) o =NN(C₁-C₆-alquil)₂;

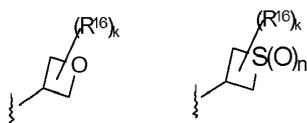
25 cada R⁸ se selecciona independientemente de OH, CN, C₃-C₈-cicloalquilo que porta opcionalmente un sustituyente CN o un C₁-C₂-haloalquilo; C₃-C₈-halocicloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-haloalquiltio, C₁-C₆-alquilsulfonilo, C₁-C₆-haloalquilsulfonilo, -C(=O)N(R^{102a})R^{102b}, fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R¹⁶, y un anillo heteromonocíclico saturado, parcialmente insaturado o insaturado al máximo de 3, 4, 5 o 6 miembros que contienen 1, 2, 3 o 4 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados independientemente de N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heteromonocíclico puede estar sustituido con uno o más sustituyentes R¹⁶;

30 en donde

R^{102a} se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₃-alquino y CH₂-CN;

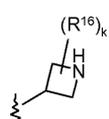
35 R^{102b} se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-alquino, CH₂-CN, C₁-C₆-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilmetilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, fenilo que está opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₂-C₄-haloalquino,

C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio y C₁-C₄-haloalquiltio; y un anillo heterocíclico seleccionado de anillos de fórmulas E-1 a E-42 como se define más arriba y E-43 a E-57:

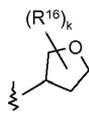


E-43

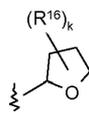
E-44



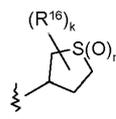
E-45



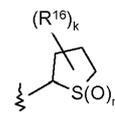
E-46



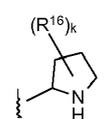
E-47



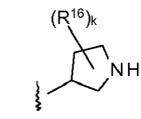
E-48



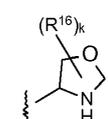
E-49



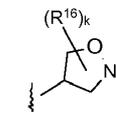
E-50



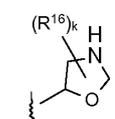
E-51



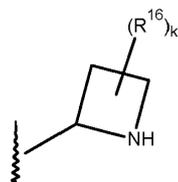
E-52



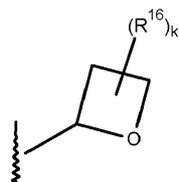
E-53



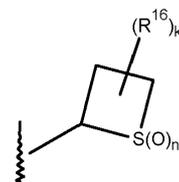
E-54



E-55



E-56



E-57

donde en estos anillos E-43 a E-57

la línea en zigzag denota el punto de unión al resto de la molécula;

k es 0, 1, 2 o 3,

10 n es 0, 1 o 2; y

15 cada R¹⁶ se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₂-C₄-haloalquino, C₁-C₄-alquilcarbonilo, C₁-C₄-haloalquilcarbonilo, aminocarbonilo, C₁-C₄-alquilaminocarbonilo y di-(C₁-C₄-alquil)amino-carbonilo; o

dos R¹⁶ presentes en el mismo átomo de carbono de un anillo saturado pueden formar juntos =O o =S; y

20 cada R¹⁶ como sustituyente en fenilo (como un significado de R⁸) o los anillos heterocíclicos (como un significado de R⁸) se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino y C₂-C₄-haloalquino; o

dos R¹⁶ presentes en el mismo átomo de carbono de un anillo heterocíclico saturado pueden formar juntos =O o =S; o

25 dos R¹⁶ presentes en el mismo miembro de anillo S o SO de un anillo heterocíclico pueden formar juntos un grupo =N(C₁-C₆-alquil), =NO(C₁-C₆-alquil), =NN(H)(C₁-C₆-alquil) o =NN(C₁-C₆-alquil)₂;

o

30 R⁵ y R⁶, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un anillo heterocíclico saturado de 5 o 6 miembros, donde el anillo puede contener además 1 o 2 heteroátomos o grupos que contienen heteroátomos seleccionados de O, S, SO, SO₂, NH y C=O como miembros de anillo, en donde el anillo heterocíclico puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi y C₁-C₆-haloalcoxi;

o

R⁵ y R⁶ juntos forman un grupo =S(R^{9b})₂, donde R^{9b} se selecciona de C₁-C₆-alquilo y C₁-C₆-haloalquilo;

R⁹ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo y C₁-C₆-alquilo sustituido por un radical R¹³; donde R¹³ se selecciona de CN, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-haloalquiltio, C₁-C₆-alquilsulfinilo, C₁-C₆-haloalquilsulfinilo, C₁-C₆-alquilsulfonilo, C₁-C₆-haloalquilsulfonilo y un anillo heterocíclico seleccionado de anillos de fórmulas E-1 a E-57 como se define más arriba;

5 donde en estos anillos E-1 a E-57 como un significado de R¹³

la línea en zigzag denota el punto de unión al resto de la molécula;

k es 0, 1, 2 o 3,

n es 0, 1 o 2; y

10 cada R¹⁶ se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinilo, C₁-C₄-haloalquilsulfinilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alquenilo, C₂-C₄-haloalquenilo, C₂-C₄-alquinilo, C₂-C₄-haloalquinilo, C₁-C₄-alquilcarbonilo, C₁-C₄-haloalquilcarbonilo, aminocarbonilo, C₁-C₄-alquilaminocarbonilo y di-(C₁-C₄-alquil)amino-carbonilo; o

dos R¹⁶ presentes en el mismo átomo de carbono de un anillo saturado pueden formar juntos =O o =S; y

15 cada R¹⁶ en todos los otros casos (es decir, como un sustituyente en fenilo como un significado para R^{101b}) se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, -OH, -SH, C₁-C₀-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-haloalquiltio, C₁-C₆-alquilsulfinilo, C₁-C₆-haloalquilsulfinilo, C₁-C₆-alquilsulfonilo, C₁-C₆-haloalquilsulfonilo, C₁-C₄-alquilcarbonilo, C₁-C₄-haloalquilcarbonilo, C₁-C₄-alcoxicarbonilo, C₁-C₄-haloalcoxicarbonilo, aminocarbonilo, C₁-C₄-alquilaminocarbonilo, di-(C₁-C₄-alquil)-aminocarbonilo, trimetilsililo, trietilsililo, *tert*-butildimetilsililo;

20 C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, en donde los tres radicales alifáticos mencionados en último lugar pueden estar sin sustituir, parcialmente o totalmente halogenados y/o pueden llevar 1 o 2 radicales seleccionados de ciano, C₃-C₄-cicloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi y oxo;

25 C₃-C₈-cicloalquilo que puede estar sin sustituir, parcial o totalmente halogenado y/o puede llevar 1 o 2 radicales seleccionados de ciano, C₁-C₄-alquilo, C₃-C₄-cicloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi y oxo;

fenilo, bencilo, piridilo y fenoxi, en donde los cuatro últimos radicales mencionados pueden estar sin sustituir, parcial o totalmente halogenados y/o portan 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados de C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi y (C₁-C₆-alcoxi)carbonilo;

o

30 dos R¹⁶ presentes juntos en el mismo átomo de un anillo insaturado o parcialmente insaturado pueden ser =O, =S, =N(C₁-C₆-alquil), =NO(C₁-C₆-alquil), =CH(C₁-C₄-alquil) o =C(C₁-C₄-alquil)C₁-C₄-alquilo; o

o dos R¹⁶ presentes en el mismo miembro de anillo S o SO de un anillo heterocíclico pueden formar juntos un grupo =N(C₁-C₆-alquil), =NO(C₁-C₆-alquil), =NN(H)(C₁-C₆-alquil) o =NN(C₁-C₆-alquil)₂;

o

35 dos R¹⁶ en dos átomos de carbono adyacentes se forman junto con los átomos de carbono que están unidos a un anillo saturado, parcialmente insaturado o insaturado al máximo de 4, 5, 6, 7 u 8 miembros, en donde el anillo puede contener 1 o 2 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados de N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros de anillo, y en donde el anillo lleva opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;

40 y los N-óxidos, estereoisómeros y sales agrícola o veterinariamente aceptables de los mismos.

En una realización particular, R¹¹, además de las definiciones anteriores, se selecciona además de C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo.

45 En una realización particular, la invención se refiere a compuestos I como se definen en la realización preferida anterior, los N-óxidos, estereoisómeros y sales de los mismos aceptables desde el punto de vista agrícola o veterinario., donde sin embargo

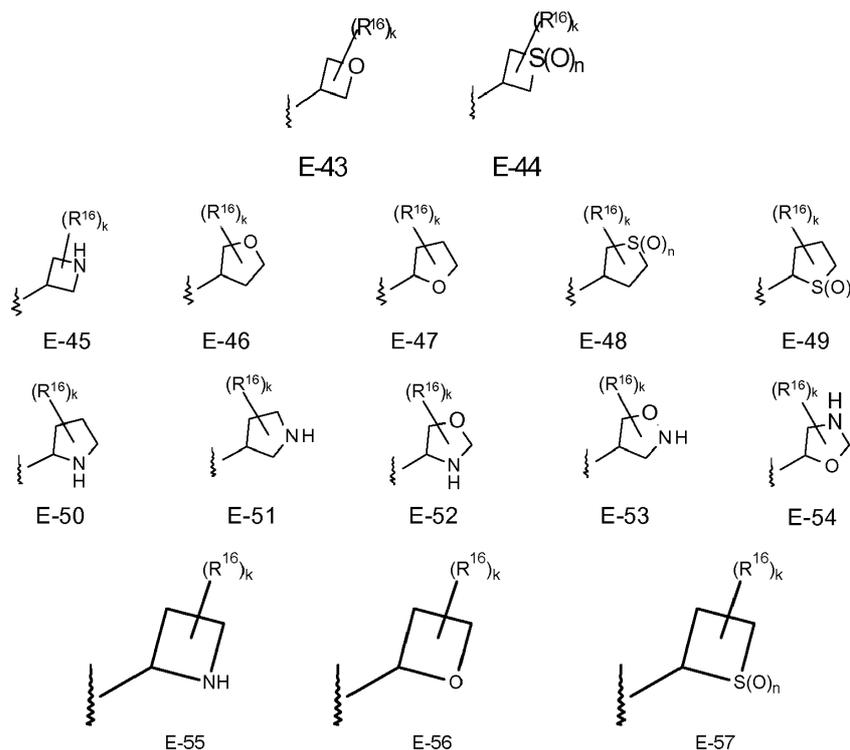
50 cada R⁸ se selecciona independientemente de OH, CN, C₃-C₈-cicloalquilo que porta opcionalmente un sustituyente CN o CF₃, C₃-C₈-halocicloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-haloalquiltio, C₁-C₆-alquilsulfinilo, C₁-C₆-haloalquilsulfinilo, -C(=O)N(R^{102a})R^{102b}, fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R¹⁶, y un anillo heteromonocíclico saturado, parcialmente insaturado o insaturado al máximo de 3, 4, 5 o 6 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados independientemente de

N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heteromonocíclico puede estar sustituido con uno o más sustituyentes R¹⁶;

en donde

R^{102a} se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₃-alquinilo y CH₂-CN;

- 5 R^{102b} se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₄-alquenilo, C₂-C₄-alquinilo, CH₂-CN, C₁-C₆-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilmetilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, fenilo que está opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₂-C₄-alquenilo, C₂-C₄-haloalquenilo, C₂-C₄-alquinilo, C₂-C₄-haloalquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio y C₁-C₄-haloalquiltio; y un
- 10 anillo heterocíclico seleccionado de anillos de fórmulas E-1 a E-42 como se define más arriba y E-43 a E-57:



- 15 donde en estos anillos E-43 a E-57

la línea en zigzag denota el punto de unión al resto de la molécula;

k es 0, 1, 2 o 3,

n es 0, 1 o 2; y

- 20 cada R¹⁶ se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinilo, C₁-C₄-haloalquilsulfinilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alquenilo, C₂-C₄-haloalquenilo, C₂-C₄-alquinilo, C₂-C₄-haloalquinilo, C₁-C₄-alquilcarbonilo, C₁-C₄-haloalquilcarbonilo, aminocarbonilo, C₁-C₄-alquilaminocarbonilo y di-(C₁-C₄-alquil)amino-carbonilo; o

dos R¹⁶ presentes en el mismo átomo de carbono de un anillo saturado pueden formar juntos =O o =S; y

- 25 cada R¹⁶ como sustituyente en fenilo (como un significado de R⁸) o los anillos heterocíclicos (como un significado de R⁸) se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alquenilo, C₂-C₄-haloalquenilo, C₂-C₄-alquinilo y C₂-C₄-haloalquinilo; o

- 30 dos R¹⁶ presentes en el mismo átomo de carbono de un anillo heterocíclico saturado pueden formar juntos =O o =S; o

dos R¹⁶ presentes en el mismo miembro de anillo S o SO de un anillo heterocíclico pueden formar juntos un grupo =N(C₁-C₆-alquil), =NO(C₁-C₆-alquil), =NN(H)(C₁-C₆-alquil) o =NN(C₁-C₆-alquil)₂.

La presente invención también proporciona una composición agrícola que comprende al menos un compuesto de la fórmula I como se define en el presente documento, un estereoisómero del mismo y/o al menos una sal agrícolamente aceptable del mismo y al menos un líquido inerte y/o un vehículo sólido aceptable en la agricultura.

5 La presente invención también proporciona una composición veterinaria que comprende al menos un compuesto de la fórmula I como se define en el presente documento, un estereoisómero del mismo y/o al menos una sal veterinariamente aceptable del mismo y al menos un vehículo inerte líquido y/o sólido veterinariamente aceptable.

10 La presente invención también proporciona un método para controlar plagas de invertebrados, cuyo método comprende tratar las plagas, su suministro de alimentos, su hábitat o su terreno de crianza o una planta cultivada, materiales de propagación de plantas (tales como semillas), suelo, área, material o entorno en que las plagas crecen o pueden crecer, o los materiales, las plantas cultivadas, los materiales de propagación de las plantas (tal como semillas), los suelos, las superficies o los espacios que deben protegerse contra el ataque de plagas o la infestación con una cantidad efectiva como pesticida de un compuesto de fórmula I, un estereoisómero del mismo y/o al menos una sal agrícolamente aceptable del mismo como se define en el presente documento.

15 El método sirve en particular para proteger las plantas del ataque o la infestación por plagas de invertebrados, y por lo tanto comprende tratar las plantas con una cantidad efectiva como pesticida de al menos un compuesto de la fórmula I como se definió anteriormente, un estereoisómero de los mismos y/o al menos una sal aceptable desde el punto de vista agrícola de los mismos. El método sirve además en particular para proteger el material de propagación de plantas y/o las plantas que crecen a partir de él de un ataque o infestación por plagas de invertebrados, y por lo tanto comprende tratar el material de propagación de plantas con una cantidad efectiva como pesticida de al menos un compuesto de fórmula I como se definió anteriormente, un estereoisómero del mismo y/o al menos una sal aceptable desde el punto de vista agrícola del mismo.

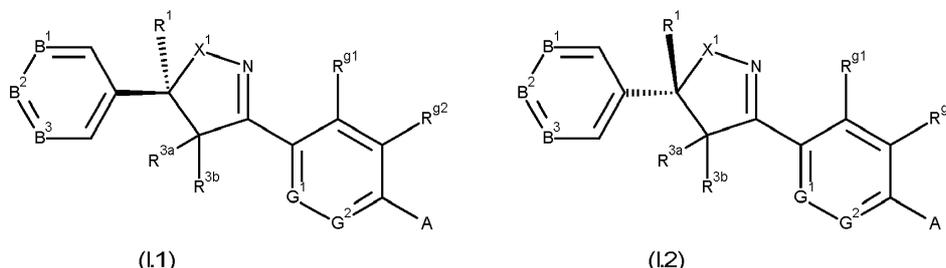
La presente invención también se refiere a material de propagación de plantas, en particular semillas, que comprende al menos un compuesto de fórmula I, un estereoisómero del mismo y/o al menos una sal aceptable desde el punto de vista agrícola del mismo como se define en el presente documento.

25 La presente invención se refiere además a compuestos de la fórmula I, a estereoisómeros de los mismos y/o a sales aceptables desde el punto de vista veterinario de los mismos como se define en el presente documento para su uso como un medicamento, especialmente para su uso como un medicamento para tratar o proteger a un animal de la infestación o infección por parásitos (plagas de invertebrados).

30 El término "estereoisómeros" abarca ambos isómeros ópticos, tales como enantiómeros o diastereómeros, los últimos existentes debido a más de un centro de quiralidad en la molécula, así como isómeros geométricos (isómeros cis/trans).

35 Dependiendo del patrón de sustitución, los compuestos de la fórmula I pueden tener uno o más centros de quiralidad, en cuyo caso están presentes como mezclas de enantiómeros o diastereómeros. Un centro de quiralidad es el átomo del anillo de carbono de la isoxazolina o el anillo de pirrolina que lleva el radical R¹. La invención proporciona tanto los enantiómeros o diastereómeros puros como sus mezclas y el uso de acuerdo con la invención de los enantiómeros o diastereómeros puros del compuesto I o sus mezclas. Los compuestos adecuados de fórmula I también incluyen todos los estereoisómeros geométricos posibles (isómeros cis/trans) y mezclas de los mismos.

En una realización específica, los compuestos I están presentes en forma de una mezcla de compuestos I.1 y I.2



40 donde el compuesto I.1 está presente en una cantidad de más del 50% en peso, en particular de al menos el 70% en peso, específicamente de al menos el 90% en peso, con base en el peso total de los compuestos I.1 y I.2.

45 El término N-óxidos se refiere a una forma de compuestos I en la que al menos un átomo de nitrógeno está presente en forma oxidada (como NO). Para ser más precisos, se refiere a cualquier compuesto de la presente invención que tenga al menos un átomo de nitrógeno terciario que se oxida a una unidad estructural N-óxido. Los N-óxidos de los compuestos I se pueden preparar en particular mediante oxidación, por ejemplo el átomo de nitrógeno del anillo de la unidad estructural isoxazolina/pirrolina y/o, si G¹ o G² es N, este átomo de nitrógeno y/o del grupo puente formado por R⁹¹ y R⁹² y/o de cualquier grupo heterocíclico que contenga nitrógeno presente en el grupo A con un agente oxidante adecuado, tal como ácidos peroxo carboxílicos u otros peróxidos. El experto en la técnica sabe si y en qué posiciones los compuestos de la presente invención pueden formar N-óxidos.

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

5

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

10 Las sales adecuadas desde el punto de vista agrícola son especialmente las sales de aquellos cationes o las sales de adición de ácido de aquellos ácidos cuyos cationes y aniones, respectivamente, no tienen ningún efecto adverso sobre la acción de los compuestos de acuerdo con la presente invención. Cationes adecuados son en particular los iones de los metales alcalinos, preferiblemente litio, sodio y potasio, de los metales alcalinotérreos, preferiblemente calcio, magnesio y bario, y de los metales de transición, preferiblemente manganeso, cobre, zinc y hierro, y también amonio.

15 (NH⁴⁺) y amonio sustituido en el que uno a cuatro de los átomos de hidrógeno están reemplazados por C₁-C₄ alquilo, C₁-C₄ hidroxialquilo, C₁-C₄ alcoxi, C₁-C₄ alcoxi-C₁-C₄ alquilo, hidroxí C₁-C₄- alcoxi C₁-C₄ alquilo, fenilo o bencilo. Ejemplos de iones de amonio sustituidos comprenden metilamonio, isopropilamonio, dimetilamonio, diisopropilamonio, trimetilamonio, tetrametilamonio, tetraetilamonio, tetrabutilamonio, 2-hidroxietilamonio, 2-(2-hidroxietoxi)etilamonio, bis(2-hidroxietil)amonio, benciltrimetilamonio y benciltrietilamonio, además iones de fosfonio,

20 iones de sulfonio, preferiblemente tri(C₁-C₄-alquil)sulfonio, y iones de sulfoxonio, preferiblemente tri(C₁-C₄-alquil)sulfoxonio.

Los aniones de sales de adición de ácido útiles son principalmente cloruro, bromuro, fluoruro, sulfato de hidrógeno, sulfato, fosfato de dihidrógeno, fosfato de hidrógeno, fosfato, nitrato, carbonato de hidrógeno, carbonato, hexafluorosilicato, hexafluorofosfato, benzoato y los aniones de los ácidos C₁-C₄ alcanóicos, preferiblemente formiato,

25 acetato, propionato y butirato. Se pueden formar haciendo reaccionar un compuesto de fórmula I con un ácido del correspondiente anión, preferiblemente ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico o ácido nítrico.

Por el término "sales veterinariamente aceptables" se entiende sales de aquellos cationes o aniones que son conocidos y aceptados en la técnica para la formación de sales para uso veterinario. Sales de adición de ácido adecuadas, por ejemplo formado por compuestos de fórmula I que contienen un átomo de nitrógeno básico, por ejemplo un grupo

30 amino, incluye sales con ácidos inorgánicos, por ejemplo clorhidratos, sulfatos, fosfatos y nitratos y sales de ácidos orgánicos, por ejemplo ácido acético, ácido maleico, ácido dimaleico, ácido fumárico, ácido difumárico, ácido metanosulfónico, ácido metanosulfónico, y ácido succínico.

El término "plaga de invertebrados", como se usa en este documento, abarca poblaciones de animales, tales como insectos, arácnidos y nematodos, que pueden atacar a las plantas, causando así un daño sustancial a las plantas atacadas, así como ectoparásitos que pueden infestar a animales, en particular animales de sangre caliente, tales como por ejemplo mamíferos o aves, u otros animales superiores tales como reptiles, anfibios o peces, causando

35 daños sustanciales a los animales infestados.

Debe entenderse que el término "material de propagación de la planta" denota todas las partes generativas de la planta, tales como semillas y material de la planta vegetativo tales como esquejes y tubérculos (por ejemplo, patatas), que se pueden usar para la multiplicación de la planta. Estos incluyen semillas, raíces, frutos, tubérculos, bulbos, rizomas, tallos, brotes y otras partes de las plantas, incluidas las plántulas y plantas jóvenes, que se trasplantan después de la germinación o después de emerger de la tierra. Los materiales de propagación de plantas pueden tratarse profilácticamente con un compuesto de protección de plantas ya sea en o antes de la siembra o trasplante.

40 Dichas plantas jóvenes también pueden protegerse antes del trasplante mediante un tratamiento total o parcial mediante inmersión o vertido.

El término "plantas" comprende cualquier tipo de plantas, incluidas las "plantas no cultivadas" y en particular las "plantas cultivadas".

El término "plantas no cultivadas" se refiere a cualquier especie de tipo silvestre o especies relacionadas o géneros relacionados de una planta cultivada.

50

Debe entenderse que el término "plantas cultivadas" incluye las plantas que han sido modificadas por cruzamiento, mutagénesis o ingeniería genética, incluyendo, pero no limitado a, productos de biotecnología agrícola en el mercado o en desarrollo (cf. http://www.bio.org/speeches/pubs/er/agri_products.asp). Las plantas modificadas genéticamente son plantas, cuyo material genético se ha modificado tanto mediante el uso de técnicas de ADN recombinante que, bajo circunstancias naturales, no pueden obtenerse fácilmente mediante cruzamiento, mutaciones o recombinación natural. Típicamente, uno o más genes se han integrado en el material genético de una planta modificada genéticamente para mejorar ciertas propiedades de la planta. Tales modificaciones genéticas también incluyen, pero no se limitan a, modificaciones post-traduccionales dirigidas de proteínas, oligo o polipéptidos por ejemplo por

55

glicosilación o adiciones de polímeros tales como unidades estructurales preniladas, acetiladas o farnesiladas o unidades estructurales de PEG.

Plantas que han sido modificadas por cruzamiento, mutagénesis o ingeniería genética, por ejemplo se han vuelto tolerantes a las aplicaciones de clases específicas de herbicidas, tales como los herbicidas auxina tales como el dicamba o 2,4-D; herbicidas blanqueadores tales como los inhibidores de la hidroxifenilpiruvato dioxigenasa (HPPD) o inhibidores de la fitoeno desaturasa (PDS); inhibidores de la acetolactato sintasa (ALS), tales como sulfonilureas o imidazolinonas; inhibidores de enolpiruvilshikimato-3-fosfato sintasa (EPSPS), tales como glifosato; inhibidores de la glutamina sintetasa (GS) tales como glufosinato; inhibidores de la protoporfirinógeno-IX oxidasa; inhibidores de la biosíntesis de lípidos, tales como inhibidores de acetil CoA carboxilasa (ACCase); o los herbicidas oxinil (es decir, bromoxinil o ioxinil) como resultado de los métodos convencionales del cruzamiento o ingeniería genética. Adicionalmente, las plantas se han hecho resistentes a múltiples clases de herbicidas a través de múltiples modificaciones genéticas, tales como la resistencia tanto al glifosato como al glufosinato o al glifosato y a un herbicida de otra clase tal como los inhibidores de la ALS, los inhibidores de la HPPD, los herbicidas auxina o los inhibidores de la ACCase. Estas tecnologías de resistencia a herbicidas son por ejemplo descritas en Pest Managem. Sci. 61, 2005, 246; 61, 2005, 258; 61, 2005, 277; 61, 2005, 269; 61, 2005, 286; 64, 2008, 326; 64, 2008, 332; Weed Sci. 57, 2009, 108; Austral. J. Agricult. Res. 58, 2007, 708; Science 316, 2007, 1185; y referencias citadas en el mismo. Varias plantas cultivadas se han vuelto tolerantes a los herbicidas por métodos convencionales de cruzamiento (mutagénesis), por ejemplo la colza de verano Clearfield® (Canola, BASF SE, Alemania) es tolerante a las imidazolinonas, por ejemplo Imazamox, o girasoles ExpressSun® (DuPont, EE. UU.) que son tolerantes a las sulfonilureas, por ejemplo tribenuron Los métodos de ingeniería genética se han utilizado para producir plantas cultivadas como la soja, el algodón, el maíz, la remolacha y la colza, tolerantes a herbicidas tales como el glifosato y el glufosinato, algunos de los cuales están disponibles comercialmente bajo los nombres comerciales RoundupReady® (tolerante al glifosato, Monsanto, USA), Cultivance® (tolerante a la imidazolinona, BASF SE, Alemania) y LibertyLink® (tolerante al glufosinato, Bayer CropScience, Alemania).

Adicionalmente, también se cubren plantas mediante el uso de técnicas de ADN recombinante capaces de sintetizar una o más proteínas insecticidas, especialmente las conocidas del género bacteriano *Bacillus*, particularmente de *Bacillus thuringiensis*, tal como las δ -endotoxinas, por ejemplo CryIA (b), CryIA (c), CryIF, CryIF (a2), CryIIA (b), CryIIIA, CryIIIB (b1) o Cry9c; proteínas insecticidas vegetativas (VIP), por ejemplo VIP1, VIP2, VIP3 o VIP3A; proteínas insecticidas de bacterias que colonizan nematodos, por ejemplo *Photorhabdus* spp. o *Xenorhabdus* spp.; toxinas producidas por animales, tales como toxinas de escorpión, toxinas arácnidas, toxinas de avispa u otras neurotoxinas específicas de insectos; toxinas producidas por hongos, tales como toxinas de estreptomicetos, lectinas de plantas, tales como lectinas de guisantes o de cebada; aglutininas; inhibidores de proteinasa, tales como inhibidores de tripsina, inhibidores de serina proteasa, inhibidores de patatina, cistatina o papaína; proteínas inactivadoras de ribosomas (RIP), tal como ricina, RIP de maíz, abrina, luffin, saporina o briodina; enzimas del metabolismo de los esteroides, tal como la 3-hidroxiesteroide oxidasa, ecdisteroide-IDP-glicosil-transferasa, colesterol oxidasa, inhibidores de la ecdisona o HMG-CoA-reductasa; bloqueadores de los canales iónicos, tal como los bloqueadores de los canales de sodio o calcio; hormona juvenil esterasa; receptores de hormonas diuréticas (receptores de helicoquinina); stilben sintasa, bibenzil sintasa, quitinasas o glucanasas. En el contexto de la presente invención, estas proteínas o toxinas insecticidas deben entenderse expresamente también como pre-toxinas, proteínas híbridas, proteínas truncadas o modificadas de otra manera. Las proteínas híbridas se caracterizan por una nueva combinación de dominios de proteínas (véase, por ejemplo, el documento WO 02/015701). Ejemplos adicionales de tales toxinas o plantas modificadas genéticamente capaces de sintetizar tales toxinas se divulgan, por ejemplo, en los documentos EP-A 374 753, WO 93/007278, WO 95/34656, EP-A 427 529, EP-A 451 878, WO 03/18810 y WO 03/52073. Los métodos para producir tales plantas modificadas genéticamente son generalmente conocidos por el experto en la técnica y se describen, por ejemplo en las publicaciones mencionadas anteriormente. Estas proteínas insecticidas contenidas en las plantas modificadas genéticamente transmiten a las plantas que producen estas proteínas tolerancia a las plagas dañinas de todos los grupos taxonómicos de artrópodos, especialmente a los escarabajos (Coleoptera), insectos de dos alas (Diptera) y polillas (Lepidoptera) y a nematodos (Nematoda). Las plantas modificadas genéticamente capaces de sintetizar una o más proteínas insecticidas son, por ejemplo, descritas en las publicaciones mencionadas anteriormente, y algunas de las cuales están disponibles comercialmente, tales como YieldGard® (cultivares de maíz que producen la toxina Cry1Ab), YieldGard® Plus (cultivares de maíz que producen las toxinas Cry1Ab y Cry3Bb1), Starlink® (cultivares de maíz que producen la toxina Cry9c), Herculex® RW (cultivares de maíz que producen Cry34Ab1, Cry35Ab1 y la enzima Fosfinotricina-N-Acetiltransferasa [PAT]); NuCOTN® 33B (cultivares de algodón que producen la toxina Cry1Ac), Bollgard® I (cultivares de algodón que producen la toxina Cry1Ac), Bollgard® II (cultivares de algodón que producen las toxinas Cry1Ac y Cry2Ab2); VINCOT® (cultivares de algodón que producen una toxina VIP); NewLeaf® (cultivares de patata que producen la toxina Cry3A); Bt-Xtra®, NatureGard®, KnockOut®, BiteGard®, Protecta®, Bt11 (por ejemplo, Agrisure® CB) y Bt176 de Syngenta Seeds SAS, Francia, (cultivares de maíz que producen la toxina Cry1Ab y PAT enzime), MIR604 de Syngenta Seeds SAS, Francia (cultivares de maíz que producen una versión modificada de la toxina Cry3A, cf WO 03/018810), MON 863 de Monsanto Europe SA, Bélgica (cultivares de maíz que producen la toxina Cry3Bb1), IPC 531 de Monsanto Europe SA, Bélgica (cultivares de algodón que producen una versión modificada de la toxina Cry1Ac) y 1507 de Pioneer Overseas Corporation, Bélgica (cultivares de maíz que producen la toxina Cry1F y la enzima PAT).

- Además, las plantas también están cubiertas por el uso de técnicas de ADN recombinante capaces de sintetizar una o más proteínas para aumentar la resistencia o tolerancia de esas plantas a patógenos bacterianos, virales o fúngicos. Ejemplos de tales proteínas son las llamadas "proteínas relacionadas con la patogénesis" (proteínas PR, véase, por ejemplo, EP-A 392 225), genes de resistencia a enfermedades de las plantas (por ejemplo, cultivares de patata, que expresan genes de resistencia que actúan contra *Phytophthora infestans* derivados del mexicano). *Solanum bulbocastanum* (patata silvestre) o T4-lisoizimo (por ejemplo, cultivares de patata capaces de sintetizar estas proteínas con mayor resistencia contra bacterias como *Erwinia amylovora*). Los métodos para producir tales plantas modificadas genéticamente son generalmente conocidos por los expertos en la técnica y se describen, por ejemplo en las publicaciones mencionadas anteriormente.
- 5
- 10 Adicionalmente, las plantas también están cubiertas por el uso de técnicas de ADN recombinante capaces de sintetizar una o más proteínas para aumentar la productividad (por ejemplo, producción de biomasa, rendimiento de grano, contenido de almidón, contenido de aceite o contenido de proteína), tolerancia a la sequía, salinidad u otros factores ambientales que limitan el crecimiento o la tolerancia a plagas y patógenos fúngicos, bacterianos o virales de esas plantas.
- 15 Adicionalmente, también se cubren plantas que contienen mediante el uso de técnicas de ADN recombinante una cantidad modificada de sustancias de contenido o nuevas sustancias de contenido, específicamente para mejorar la nutrición humana o animal, por ejemplo cultivos oleaginosos que producen ácidos grasos omega-3 de cadena larga que promueven la salud o ácidos grasos omega-9 insaturados (por ejemplo, colza Nexera®, DOW Agro Sciences, Canadá).
- 20 Adicionalmente, también se cubren plantas que contienen mediante el uso de técnicas de ADN recombinante una cantidad modificada de sustancias de contenido o nuevas sustancias de contenido, específicamente para mejorar la producción de materia prima, por ejemplo patatas que producen mayores cantidades de amilopectina (por ejemplo, patatas Amflora®, BASF SE, Alemania).

25 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 individuales del grupo. El prefijo C_n-C_m 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.

30 El término "alquilo" como se usa aquí y en las unidades estructurales alquilo de alcoxi, alquiltio, alquilsulfino, alquilsulfonilo, alquilcarbonilo, alcocarbonilo y similares se refiere a radicales hidrocarbonados saturados de cadena lineal o ramificada que tienen 1 a 2 ("C₁-C₂-alquilo"), 1 a 3 ("C₁-C₃-alquilo"), 1 a 4 ("C₁-C₄-alquilo"), 1 a 6 ("C₁-C₆-alquilo"), 1 a 8 ("C₁-C₈-alquilo") o 1 a 10 ("C₁-C₁₀-alquilo") átomos de carbono. C₁-C₂-Alquilo es metilo o etilo. C₁-C₃-Alquilo es adicionalmente propilo e isopropilo. C₁-C₄-Alquilo es adicionalmente n-butilo, 1-metilpropilo (sec-butil), 2-metilpropilo (isobutil) o 1,1-dimetiletilo (tert-butil). C₁-C₆-Alquilo es adicionalmente también, por ejemplo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, hexilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo, o 1-etil-2-metilpropilo. C₁-C₈-Alquilo es adicionalmente también, por ejemplo, heptilo, octilo, 2-etilhexilo y sus isómeros posicionales. C₁-C₁₀-Alquilo es adicionalmente también, por ejemplo, nonilo, decilo y sus isómeros posicionales. C₂-C₄-Alquilo es etilo, propilo, isopropilo, n-butilo, 1-metilpropilo (sec-butil), 2-metilpropilo (isobutil) o 1,1-dimetiletilo (tert-butil).

35

40

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

50

55 "Halometilo" es metilo en el que 1, 2 o 3 de los átomos de hidrógeno son reemplazados por átomos de halógeno. Ejemplos son bromometilo, clorometilo, fluorometilo, diclorometilo, triclorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorodifluorometilo y similares.

El término "alqueno" como se usa aquí se refiere a radicales hidrocarburo de cadena lineal o ramificada monoinsaturados que tienen 2 a 3 ("C₂-C₃-alqueno"), 2 a 4 ("C₂-C₄-alqueno"), 2 a 6 ("C₂-C₆-alqueno"), 2 a 8 ("C₂-C₈-alqueno") o 2 a 10 ("C₂-C₁₀-alqueno") átomos de carbono y un doble enlace en cualquier posición, por ejemplo C₂-C₃-alqueno, tal como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo o 1-metilenilo; C₂-C₄-alqueno, tal como etenilo, 1-

propenilo, 2-propenilo, 1-metiletenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo o 2-metil-2-propenilo; C₂-C₆-alqueno, tal como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metiletenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-2-propenilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-metil-1-butenilo, 2-metil-1-butenilo, 3-metil-1-butenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1,2-dimetil-1-propenilo, 1,2-dimetil-2-propenilo, 1-etil-1-propenilo, 1-etil-2-propenilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1-metil-1-pentenilo, 2-metil-1-pentenilo, 3-metil-1-pentenilo, 4-metil-1-pentenilo, 1-metil-2-pentenilo, 2-metil-2-pentenilo, 3-metil-2-pentenilo, 4-metil-2-pentenilo, 1-metil-3-pentenilo, 2-metil-3-pentenilo, 3-metil-3-pentenilo, 4-metil-3-pentenilo, 1-metil-4-pentenilo, 2-metil-4-pentenilo, 3-metil-4-pentenilo, 4-metil-4-pentenilo, 1,1-dimetil-2-butenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, 1,2-dimetil-1-butenilo, 1,2-dimetil-2-butenilo, 1,2-dimetil-3-butenilo, 1,3-dimetil-1-butenilo, 1,3-dimetil-2-butenilo, 1,3-dimetil-3-butenilo, 2,2-dimetil-3-butenilo, 2,3-dimetil-1-butenilo, 2,3-dimetil-2-butenilo, 2,3-dimetil-3-butenilo, 3,3-dimetil-1-butenilo, 3,3-dimetil-2-butenilo, 1-etil-1-butenilo, 1-etil-2-butenilo, 1-etil-3-butenilo, 2-etil-1-butenilo, 2-etil-2-butenilo, 2-etil-3-butenilo, 1,1,2-trimetil-2-propenilo, 1-etil-1-metil-2-propenilo, 1-etil-2-metil-1-propenilo, 1-etil-2-metil-2-propenilo y similares, o C₂-C₁₀-alqueno, tal como los radicales mencionados para C₂-C₆-alqueno y adicionalmente 1-heptenilo, 2-heptenilo, 3-heptenilo, 1-octenilo, 2-octenilo, 3-octenilo, 4-octenilo, 1-nonenilo, 2-nonenilo, 3-nonenilo, 4-nonenilo, 1-decenilo, 2-decenilo, 3-decenilo, 4-decenilo, 5-decenilo y los isómeros posicionales de los mismos..

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

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

El término "haloalquino" como se usa aquí, que también se expresa como "alquino el cual es parcial o totalmente halogenado", se refiere a radicales hidrocarburo de cadena lineal o ramificada insaturados que tienen 2 a 3 ("C₂-C₃-haloalquino"), 2 a 4 ("C₂-C₄-haloalquino"), 3 a 4 ("C₃-C₄-haloalquino"), 2 a 6 ("C₂-C₆-haloalquino"), 2 a 8 ("C₂-C₈-haloalquino") o 2 a 10 ("C₂-C₁₀-haloalquino") átomos de carbono y uno o dos enlaces triples en cualquier posición. (como se ha mencionado más arriba), donde algunos o todos los átomos de hidrógeno en estos grupos son reemplazados por átomos de halógeno como se ha mencionado más arriba, en particular flúor, cloro y bromo.;

El término "cicloalquilo" como se usa aquí se refiere a radicales hidrocarburo saturados mono- o bicíclicos o policíclicos que tienen 3 a 8 ("C₃-C₈-cicloalquilo"), en particular 3 a 6 ("C₃-C₆-cicloalquilo") o 3 a 5 ("C₃-C₅-cicloalquilo") o 3 a 4 ("C₃-C₄-cicloalquilo") átomos de carbono. Ejemplos de radicales monocíclicos que tienen 3 a 4 átomos de carbono comprenden ciclopropilo y ciclobutilo. Ejemplos de radicales monocíclicos que tienen 3 a 5 átomos de carbono comprenden ciclopropilo, ciclobutilo y ciclopentilo. Ejemplos de radicales monocíclicos que tienen 3 a 6 átomos de carbono comprenden ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexil. Ejemplos de radicales monocíclicos que tienen 3 a 8 átomos de carbono comprenden ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo y ciclooctilo. Ejemplos de radicales bicíclicos que tienen 7 o 8 átomos de carbono comprenden biciclo[2.2.1]heptilo, biciclo[3.1.1]heptilo, biciclo[2.2.2]octilo y biciclo[3.2.1]octilo. Preferiblemente, el término cicloalquilo denota un radical hidrocarburo saturado monocíclico.

El término "halocicloalquilo" como se usa aquí, que también se expresa como "cicloalquilo el cual es parcial o totalmente halogenado", se refiere a grupos hidrocarburo saturados mono- o bi- o policíclicos que tienen 3 a 8 ("C₃-C₈-halocicloalquilo") o preferiblemente 3 a 6 ("C₃-C₆-halocicloalquilo") o 3 a 5 ("C₃-C₅-halocicloalquilo") o 3 a 4 ("C₃-C₄-halocicloalquilo") miembros del anillo de carbono (como se ha mencionado más arriba) en los que algunos o todos de los átomos de hidrógeno son reemplazados por átomos de halógeno como se ha mencionado más arriba, en particular flúor, cloro y bromo..

El término "cicloalquil-C₁-C₄-alquilo" se refiere a un grupo C₃-C₈-cicloalquilo ("C₃-C₈-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo"), preferiblemente un grupo C₃-C₆-cicloalquilo ("C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo"), más preferiblemente un grupo C₃-C₄-cicloalquilo ("C₃-C₄-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo") como se define más arriba (preferiblemente un grupo cicloalquilo monocíclico) que está unido al resto de la molécula a través de un grupo C₁-C₄-alquilo, como se define más arriba.

- Ejemplos para C₃-C₄-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo son ciclopropilometilo, ciclopropiloetilo, ciclopropilopropilo, ciclobutilometilo, ciclobutiloetilo y ciclobutilopropilo. Ejemplos para C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo, aparte de los mencionados para C₃-C₄-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo, son ciclopentilometilo, ciclopentiloetilo, ciclopentilopropilo, ciclohexilmetilo, ciclohexiletilo y ciclohexilpropilo. Ejemplos para C₃-C₈-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo, aparte de los mencionados para C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo, son cicloheptilmetilo, cicloheptiletilo, ciclooctilometilo y similares.
- El término "C₃-C₆ cicloalquil-metilo" se refiere a un grupo C₃-C₆ cicloalquilo que está unido al resto de la molécula a través de un grupo metileno (CH₂). Ejemplos son ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo y ciclohexilmetilo.
- El término "C₃-C₈- halocicloalquil-C₁-C₄- alquilo" se refiere a un grupo C₃-C₈- halocicloalquilo como se definió anteriormente, que está unido al resto de la molécula a través de un grupo C₁-C₄alquilo, como se definió anteriormente.
- El término "C₁-C₂-alcoxi" es un grupo C₁-C₂-alquilo, como se define más arriba, unido a través de un átomo de oxígeno. El término "C₁-C₃-alcoxi" es un grupo C₁-C₃-alquilo, como se define más arriba, unido a través de un átomo de oxígeno. El término "C₁-C₄-alcoxi" es un grupo C₁-C₄-alquilo, como se define más arriba, unido a través de un átomo de oxígeno. El término "C₁-C₆-alcoxi" es un grupo C₁-C₆-alquilo, como se define más arriba, unido a través de un átomo de oxígeno. El término "C₁-C₁₀-alcoxi" es un grupo C₁-C₁₀-alquilo, como se define más arriba, unido a través de un átomo de oxígeno.
- C₁-C₂-Alcoxi es metoxi o etoxi. C₁-C₃-Alcoxi es adicionalmente, por ejemplo, n-propoxi y 1-metiletoxi (isopropoxi). C₁-C₄-Alcoxi es adicionalmente, por ejemplo, butoxi, 1-metilpropoxi (sec-butoxi), 2-metilpropoxi (isobutoxi) o 1,1-dimetiletoxi (tert-butoxi). C₁-C₆-Alcoxi es adicionalmente, por ejemplo, pentoxi, 1-metilbutoxi, 2-metilbutoxi, 3-metilbutoxi, 1,1-dimetilpropoxi, 1,2-dimetilpropoxi, 2,2-dimetilpropoxi, 1-etilpropoxi, hexoxi, 1-metilpentoxi, 2-metilpentoxi, 3-metilpentoxi, 4-metilpentoxi, 1,1-dimetilbutoxi, 1,2-dimetilbutoxi, 1,3-dimetilbutoxi, 2,2-dimetilbutoxi, 2,3-dimetilbutoxi, 3,3-dimetilbutoxi, 1-etilbutoxi, 2-etilbutoxi, 1,1,2-trimetilpropoxi, 1,2,2-trimetilpropoxi, 1-etil-1-metilpropoxi o 1-etil-2-metilpropoxi. C₁-C₈-Alcoxi es adicionalmente, por ejemplo, heptiloxi, octiloxi, 2-etilhexiloxi y sus isómeros posicionales. C₁-C₁₀-Alcoxi es adicionalmente, por ejemplo, noniloxi, deciloxi y sus isómeros posicionales.
- El término "C₁-C₂-haloalcoxi" es un grupo C₁-C₂-haloalquilo, como se define más arriba, unido a través de un átomo de oxígeno. El término "C₁-C₃-haloalcoxi" es un grupo C₁-C₃-haloalquilo, como se define más arriba, unido a través de un átomo de oxígeno. El término "C₁-C₄-haloalcoxi" es un grupo C₁-C₄-haloalquilo, como se define más arriba, unido a través de un átomo de oxígeno. El término "C₁-C₆-haloalcoxi" es un grupo C₁-C₆-haloalquilo, como se define más arriba, unido a través de un átomo de oxígeno. El término "C₁-C₁₀-haloalcoxi" es un grupo C₁-C₁₀-haloalquilo, como se define más arriba, unido a través de un átomo de oxígeno. C₁-C₂-Haloalcoxi es, por ejemplo, OCH₂F, OCHF₂, OCF₃, OCH₂Cl, OCHCl₂, OCCl₃, clorofluorometoxi, diclorofluorometoxi, clorodifluorometoxi, 2-fluoroetoxi, 2-cloroetoxi, 2-bromoetoxi, 2-yodoetoxi, 2,2-difluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2-fluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, 2,2-dicloro-2-fluoroetoxi, 2,2,2-tricloroetoxi o OC₂F₅. C₁-C₃-Haloalcoxi es adicionalmente, por ejemplo, 2-fluoropropoxi, 3-fluoropropoxi, 2,2-difluoropropoxi, 2,3-difluoropropoxi, 2-cloropropoxi, 3-cloropropoxi, 2,3-dicloropropoxi, 2-bromopropoxi, 3-bromopropoxi, 3,3,3-trifluoropropoxi, 3,3,3-tricloropropoxi, OCH₂-C₂F₅, OCF₂-C₂F₅, 1-(CH₂F)-2-fluoroetoxi, 1-(CH₂Cl)-2-cloroetoxi o 1-(CH₂Br)-2-bromoetoxi. C₁-C₄-Haloalcoxi es adicionalmente, por ejemplo, 4-fluorobutoxi, 4-clorobutoxi, 4-bromobutoxi o nonafluorobutoxi. C₁-C₆-Haloalcoxi es adicionalmente, por ejemplo, 5-fluoropentoxi, 5-cloropentoxi, 5-bromopentoxi, 5-yodopentoxi, undecafluoropentoxi, 6-fluorohexoxi, 6-clorohexoxi, 6-bromohexoxi, 6-yodohexoxi o dodecafluorohexoxi.
- El término "C₁-C₃-alcoxi-C₁-C₃-alquilo" como se usa aquí, se refiere a un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene 1 a 3 átomos de carbono, como se define más arriba, donde un átomo de hidrógeno es reemplazado por un grupo C₁-C₃-alcoxi, como se define más arriba. El término "C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo" como se usa aquí, se refiere a un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene 1 a 4 átomos de carbono, como se define más arriba, donde un átomo de hidrógeno es reemplazado por un grupo C₁-C₄-alcoxi, como se define más arriba. El término "C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo" como se usa aquí, se refiere a un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene 1 a 6 átomos de carbono, como se define más arriba, donde un átomo de hidrógeno es reemplazado por un grupo C₁-C₆-alcoxi, como se define más arriba. Ejemplos son metoximetilo, etoximetilo, propoximetilo, isopropoximetilo, n-butoximetilo, sec-butoximetilo, isobutoximetilo, tert-butoximetilo, 1-metoxietilo, 1-etoxietilo, 1-propoxietilo, 1-isopropoxietilo, 1-n-butoxietilo, 1-sec-butoxietilo, 1-isobutoxietilo, 1-tert-butoxietilo, 2-metoxietilo, 2-etoxietilo, 2-propoxietilo, 2-isopropoxietilo, 2-n-butoxietilo, 2-sec-butoxietilo, 2-isobutoxietilo, 2-tert-butoxietilo, 1-metoxipropilo, 1-etoxipropilo, 1-propoxipropilo, 1-isopropoxipropilo, 1-n-butoxipropilo, 1-sec-butoxipropilo, 1-isobutoxipropilo, 1-tert-butoxipropilo, 2-metoxipropilo, 2-etoxipropilo, 2-propoxipropilo, 2-isopropoxipropilo, 2-n-butoxipropilo, 2-sec-butoxipropilo, 2-isobutoxipropilo, 2-tert-butoxipropilo, 3-metoxipropilo, 3-etoxipropilo, 3-propoxipropilo, 3-isopropoxipropilo, 3-n-butoxipropilo, 3-sec-butoxipropilo, 3-isobutoxipropilo, 3-tert-butoxipropilo y similares.
- El término "C₁-C₄-alcoxi-metil" como se usa aquí, se refiere a metilo en el que un átomo de hidrógeno es reemplazado por un grupo C₁-C₄-alcoxi, como se define más arriba. El término "C₁-C₆-alcoxi-metil" como se usa aquí, se refiere a metilo en la que un átomo de hidrógeno es reemplazado por un grupo C₁-C₆-alcoxi, como se define más arriba. Ejemplos son metoximetilo, etoximetilo, propoximetilo, isopropoximetilo, n-butoximetilo, sec-butoximetilo, isobutoximetilo, tert-butoximetilo, pentiloximetilo, hexiloximetilo y similares.
- C₁-C₆-Haloalcoxi-C₁-C₆-alquilo es un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 6, especialmente de 1 a 4 átomos de carbono (= C₁-C₆-haloalcoxi-C₁-C₄-alquil), en donde uno de los átomos de hidrógeno es reemplazado

por un grupo C₁-C₆-alcoxi y en donde al menos uno, por ejemplo 1, 2, 3, 4 o todos los átomos de hidrógeno restantes (ya sea en la unidad estructural alcoxi o en la unidad estructural alquilo o en ambas) se reemplazan por átomos de halógeno. C₁-C₄-Haloalcoxi-C₁-C₄-alquilo es un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene 1 a 4 átomos de carbono, en donde uno de los átomos de hidrógeno es reemplazado por un grupo C₁-C₄-alcoxi y en donde al menos uno, por ejemplo 1, 2, 3, 4 o todos los átomos de hidrógeno restantes (ya sea en la unidad estructural alcoxi o en la unidad estructural alquilo o en ambas) se reemplazan por átomos de halógeno. Ejemplos son difluorometoximetilo (CHF₂OCH₂), trifluorometoximetilo, 1-difluorometoxietilo, 1-trifluorometoxietilo, 2-difluorometoxietilo, 2-trifluorometoxietilo, difluoro-metoxi-metilo (CH₃OCF₂), 1,1-difluoro-2-metoxietilo, 2,2-difluoro-2-metoxietilo y similares.

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

El término "C₁-C₂-haloalquiltio" es un grupo C₁-C₂-haloalquilo, como se define más arriba, unido a través de un átomo de azufre. El término "C₁-C₃-haloalquiltio" es un grupo C₁-C₃-haloalquilo, como se define más arriba, unido a través de un átomo de azufre. El término "C₁-C₄-haloalquiltio" es un grupo C₁-C₄-haloalquilo, como se define más arriba, unido a través de un átomo de azufre. El término "C₁-C₆-haloalquiltio" es un grupo C₁-C₆-haloalquilo, como se define más arriba, unido a través de un átomo de azufre. El término "C₁-C₁₀-haloalquiltio" es un grupo C₁-C₁₀-haloalquilo, como se define más arriba, unido a través de un átomo de azufre. C₁-C₂-Haloalquiltio es, por ejemplo, SCH₂F, SCHF₂, SCF₃, SCH₂Cl, SCHCl₂, SCl₃, clorofluorometiltio, diclorofluorometiltio, clorodifluorometiltio, 2-fluoroetiltio, 2-cloroetiltio, 2-bromoetiltio, 2-yodoetiltio, 2,2-difluoroetiltio, 2,2,2-trifluoroetiltio, 2-cloro-2-fluoroetiltio, 2-cloro-2,2-difluoroetiltio, 2,2-dicloro-2-fluoroetiltio, 2,2,2-tricloroetiltio o SC₂F₅. C₁-C₃-Haloalquiltio es adicionalmente, por ejemplo, 2-fluoropropiltio, 3-fluoropropiltio, 2,2-difluoropropiltio, 2,3-difluoropropiltio, 2-cloropropiltio, 3-cloropropiltio, 2,3-dicloropropiltio, 2-bromopropiltio, 3-bromopropiltio, 3,3,3-trifluoropropiltio, 3,3,3-tricloropropiltio, SCH₂-C₂F₅, SCF₂-C₂F₅, 1-(CH₂F)-2-fluoroetiltio, 1-(CH₂Cl)-2-cloroetiltio o 1-(CH₂Br)-2-bromoetiltio. C₁-C₄-Haloalquiltio es adicionalmente, por ejemplo, 4-fluorobutiltio, 4-clorobutiltio, 4-bromobutiltio o nonafluorobutiltio. C₁-C₆-Haloalquiltio es adicionalmente, por ejemplo, 5-fluoropentiltio, 5-cloropentiltio, 5-bromopentiltio, 5-yodopentiltio, undecafluoropentiltio, 6-fluorohexiltio, 6-clorohexiltio, 6-bromohexiltio, 6-yodohexiltio o dodecafluorohexiltio.

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

El término "C₁-C₂-haloalquilsulfinito" es un grupo C₁-C₂-haloalquilo, como se define más arriba, unido a través de un grupo [S(O)]. El término "C₁-C₄-haloalquilsulfinito" es un grupo C₁-C₄-haloalquilo, como se define más arriba, unido a través de un grupo [S(O)]. El término "C₁-C₆-haloalquilsulfinito" es un grupo C₁-C₆-haloalquilo, como se define más arriba, unido a través de un grupo [S(O)]. El término "C₁-C₁₀-haloalquilsulfinito" es un grupo C₁-C₁₀-haloalquilo, como se define más arriba, unido a través de un grupo [S(O)]. C₁-C₂-Haloalquilsulfinito es, por ejemplo, S(O)CH₂F, S(O)CHF₂, S(O)CF₃, S(O)CH₂Cl, S(O)CHCl₂, S(O)CCl₃, clorofluorometilsulfinito, diclorofluorometilsulfinito, clorodifluorometilsulfinito, 2-fluoroetilsulfinito, 2-cloroetilsulfinito, 2-bromoetilsulfinito, 2-yodoetilsulfinito, 2,2-difluoroetilsulfinito, 2,2,2-trifluoroetilsulfinito, 2-cloro-2-fluoroetilsulfinito, 2-cloro-2,2-difluoroetilsulfinito, 2,2-dicloro-2-fluoroetilsulfinito, 2,2,2-tricloroetilsulfinito o S(O)C₂F₅. C₁-C₄-Haloalquilsulfinito es adicionalmente, por ejemplo, 2-fluoropropilsulfinito, 3-fluoropropilsulfinito, 2,2-difluoropropilsulfinito, 2,3-difluoropropilsulfinito, 2-cloropropilsulfinito, 3-cloropropilsulfinito, 2-bromopropilsulfinito, 3-bromopropilsulfinito,

3,3,3-trifluoropropilosulfonilo, 3,3,3-tricloropropilosulfonilo, S(O)CH₂-C₂F₅, S(O)CF₂-C₂F₅, 1-(CH₂F)-2-fluoroetilsulfonilo, 1-(CH₂Cl)-2-cloroetilsulfonilo, 1-(CH₂Br)-2-bromoetilsulfonilo, 4-fluorobutilosulfonilo, 4-clorobutilosulfonilo, 4-bromobutilosulfonilo o nonafluorobutilosulfonilo. C₁-C₆-Haloalquilsulfonilo es adicionalmente, por ejemplo, 5-fluoropentilsulfonilo, 5-cloropentilsulfonilo, 5-bromopentilsulfonilo, 5-yodopentilsulfonilo, undecafluoropentilsulfonilo, 6-fluorohexilsulfonilo, 6-clorohexilsulfonilo, 6-bromohexilsulfonilo, 6-yodohexilsulfonilo o dodecafluorohexilsulfonilo.

El término "C₁-C₂-alquilsulfonilo" es un grupo C₁-C₂-alquilo, como se define más arriba, unido a través de un grupo sulfonilo [S(O)₂]. El término "C₁-C₃-alquilsulfonilo" es un grupo C₁-C₃-alquilo, como se define más arriba, unido a través de un grupo sulfonilo [S(O)₂]. El término "C₁-C₄-alquilsulfonilo" es un grupo C₁-C₄-alquilo, como se define más arriba, unido a través de un grupo sulfonilo [S(O)₂]. El término "C₁-C₆-alquilsulfonilo" es un grupo C₁-C₆-alquilo, como se define más arriba, unido a través de un grupo sulfonilo [S(O)₂]. El término "C₁-C₁₀-alquilsulfonilo" es un grupo C₁-C₁₀-alquilo, como se define más arriba, unido a través de un grupo sulfonilo [S(O)₂]. C₁-C₂-Alquilsulfonilo es metilsulfonilo o etilsulfonilo. C₁-C₃-Alquilsulfonilo es adicionalmente, por ejemplo, n-propilosulfonilo o 1-metiletilsulfonilo (isopropilosulfonilo). C₁-C₄-Alquilsulfonilo es adicionalmente, por ejemplo, butilosulfonilo, 1-metilpropilosulfonilo (sec-butilosulfonil), 2-metilpropilosulfonilo (isobutilosulfonil) o 1,1-dimetiletilsulfonilo (tert-butilosulfonil). C₁-C₆-Alquilsulfonilo es adicionalmente, por ejemplo, pentilsulfonilo, 1-metilbutilosulfonilo, 2-metilbutilosulfonilo, 3-metilbutilosulfonilo, 1,1-dimetilpropilosulfonilo, 1,2-dimetilpropilosulfonilo, 2,2-dimetilpropilosulfonilo, 1-etilpropilosulfonilo, hexilsulfonilo, 1-metilpentilsulfonilo, 2-metilpentilsulfonilo, 3-metilpentilsulfonilo, 4-metilpentilsulfonilo, 1,1-dimetilbutilosulfonilo, 1,2-dimetilbutilosulfonilo, 1,3-dimetilbutilosulfonilo, 2,2-dimetilbutilosulfonilo, 2,3-dimetilbutilosulfonilo, 3,3-dimetilbutilosulfonilo, 1-etilbutilosulfonilo, 2-etilbutilosulfonilo, 1,1,2-trimetilpropilosulfonilo, 1,2,2-trimetilpropilosulfonilo, 1-etil-1-metilpropilosulfonilo o 1-etil-2-metilpropilosulfonilo. C₁-C₈-Alquilsulfonilo es adicionalmente, por ejemplo, heptilsulfonilo, octilosulfonilo, 2-etilhexilsulfonilo e isómeros posicionales de los mismos. C₁-C₁₀-Alquilsulfonilo es adicionalmente, por ejemplo, nonilsulfonilo, decilsulfonilo e isómeros posicionales de los mismos.

El término "C₁-C₂-haloalquilsulfonilo" es un grupo C₁-C₂-haloalquilo, como se define más arriba, unido a través de un grupo sulfonilo [S(O)₂]. El término "C₁-C₃-haloalquilsulfonilo" es un grupo C₁-C₃-haloalquilo, como se define más arriba, unido a través de un grupo sulfonilo [S(O)₂]. El término "C₁-C₄-haloalquilsulfonilo" es un grupo C₁-C₄-haloalquilo, como se define más arriba, unido a través de un grupo sulfonilo [S(O)₂]. El término "C₁-C₆-haloalquilsulfonilo" es un grupo C₁-C₆-haloalquilo, como se define más arriba, unido a través de un grupo sulfonilo [S(O)₂]. El término "C₁-C₁₀-haloalquilsulfonilo" es un grupo C₁-C₁₀-haloalquilo, como se define más arriba, unido a través de un grupo sulfonilo [S(O)₂]. C₁-C₂-Haloalquilsulfonilo es, por ejemplo, S(O)₂CH₂F, S(O)₂CHF₂, S(O)₂CF₃, S(O)₂CH₂Cl, S(O)₂CHCl₂, S(O)₂CCl₃, clorofluorometilsulfonilo, diclorofluorometilsulfonilo, clorodifluorometilsulfonilo, 2-fluoroetilsulfonilo, 2-cloroetilsulfonilo, 2-bromoetilsulfonilo, 2-yodoetilsulfonilo, 2,2-difluoroetilsulfonilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfonilo, 2-cloro-2-fluoroetilsulfonilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilsulfonilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilsulfonilo, 2,2,2-tricloroetilsulfonilo o S(O)₂C₂F₅. C₁-C₃-Haloalquilsulfonilo es adicionalmente, por ejemplo, 2-fluoropropilosulfonilo, 3-fluoropropilosulfonilo, 2,2-difluoropropilosulfonilo, 2,3-difluoropropilosulfonilo, 2-cloropropilosulfonilo, 3-cloropropilosulfonilo, 2,3-dicloropropilosulfonilo, 2-bromopropilosulfonilo, 3-bromopropilosulfonilo, 3,3,3-trifluoropropilosulfonilo, 3,3,3-tricloropropilosulfonilo, S(O)₂CH₂-C₂F₅, S(O)₂CF₂-C₂F₅, 1-(CH₂F)-2-fluoroetilsulfonilo, 1-(CH₂Cl)-2-cloroetilsulfonilo o 1-(CH₂Br)-2-bromoetilsulfonilo. C₁-C₄-Haloalquilsulfonilo es adicionalmente, por ejemplo, 4-fluorobutilosulfonilo, 4-clorobutilosulfonilo, 4-bromobutilosulfonilo o nonafluorobutilosulfonilo. C₁-C₆-Haloalquilsulfonilo es adicionalmente, por ejemplo, 5-fluoropentilsulfonilo, 5-cloropentilsulfonilo, 5-bromopentilsulfonilo, 5-yodopentilsulfonilo, undecafluoropentilsulfonilo, 6-fluorohexilsulfonilo, 6-clorohexilsulfonilo, 6-bromohexilsulfonilo, 6-yodohexilsulfonilo o dodecafluorohexilsulfonilo.

El sustituyente "oxo" reemplaza un grupo CH₂ por un grupo C(=O).

El término "alquilcarbonilo" es un grupo C₁-C₆-alquilo ("C₁-C₆-alquilcarbonilo"), preferiblemente un C₁-C₄-alquilo ("C₁-C₄-alquilcarbonilo"), como se define más arriba, unido a través de un grupo carbonilo [C(=O)]. Ejemplos son acetilo (metilcarbonilo), propionilo (etilcarbonilo), propilcarbonilo, isopropilcarbonilo, n-butilcarbonilo y similares.

El término "haloalquilcarbonilo" es un grupo C₁-C₆-haloalquilo ("C₁-C₆-haloalquilcarbonilo"), preferiblemente un C₁-C₄-haloalquilo ("C₁-C₄-haloalquilcarbonilo"), como se define más arriba, unido a través de un grupo carbonilo [C(=O)]. Ejemplos son trifluorometilcarbonilo, 2,2,2-trifluoroetilcarbonilo y similares.

El término "alcoxicarbonilo" es un grupo C₁-C₆-alcoxi ("C₁-C₆-alcoxicarbonilo"), preferiblemente un C₁-C₄-alcoxi ("C₁-C₄-alcoxicarbonilo"), como se define más arriba, unido a través de un grupo carbonilo [C(=O)]. Ejemplos son metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, propoxicarbonilo, isopropoxicarbonilo, n-butoxicarbonilo y similares.

El término "haloalcoxicarbonilo" es un grupo C₁-C₆-haloalcoxi ("C₁-C₆-haloalcoxicarbonilo"), preferiblemente un C₁-C₄-haloalcoxi ("C₁-C₄-haloalcoxicarbonilo"), como se define más arriba, unido a través de un grupo carbonilo [C(=O)]. Ejemplos son trifluorometoxicarbonilo, 2,2,2-trifluoroetoxicarbonilo y similares.

El término "C₁-C₆-alquiloamino" es un grupo -N(H)C₁-C₆-alquilo. Ejemplos son metilamino, etilamino, propiloamino, isopropiloamino, butiloamino y similares.

El término "di-(C₁-C₆-alquil)amino" es un grupo -N(C₁-C₆-alquil)₂. Ejemplos son dimetilamino, dietilamino, etilmetilamino, dipropiloamino, diisopropiloamino, metilpropiloamino, metilisopropiloamino, etilpropiloamino, etilisopropiloamino, dibutiloamino y similares.

El término "aminocarbonilo" es un grupo $-C(=O)-NH_2$.

El término "C₁-C₄-alquilaminocarbonilo" es un grupo $-C(=O)-N(H)C_1-C_4$ -alquilo. El término "C₁-C₆-alquilaminocarbonilo" es un grupo $-C(=O)-N(H)C_1-C_6$ -alquilo. Ejemplos son metilaminocarbonilo, etilaminocarbonilo, propiloaminocarbonilo, isopropiloaminocarbonilo, butiloaminocarbonilo y similares.

5 El término "di-(C₁-C₄-alquil)aminocarbonilo" es un grupo $-C(=O)-N(C_1-C_4\text{-alquil})_2$. El término "di-(C₁-C₆-alquil)aminocarbonilo" es un grupo $-C(=O)-N(C_1-C_6\text{-alquil})_2$. Ejemplos son dimetilaminocarbonilo, dietilaminocarbonilo, etilmetilaminocarbonilo, dipropiloaminocarbonilo, diisopropiloaminocarbonilo, metilpropiloaminocarbonilo, metilisopropiloaminocarbonilo, etilpropiloaminocarbonilo, etilisopropiloaminocarbonilo, dibutiloaminocarbonilo y similares.

10 El término "anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o insaturado al máximo de 3, 4, 5, 7, 8, 8 o 9 o 10 miembros que contiene 1, 2 o 3 (o 4) heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionado de N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo" denota un anillo heteromonocíclico saturado, parcialmente insaturado o insaturado al máximo de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros o un anillo heterobícíclico saturado, parcialmente insaturado o insaturado al máximo de 8, 9 o 10 miembros que contiene 1, 2 o 3 (o 4) heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados de N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo.

15 Los anillos insaturados contienen al menos un doble enlace (s) C-C y/o C-N y/o N-N. Los anillos insaturados al máximo contienen tantos enlaces dobles C-C y/o C-N y/o N-N conjugados como lo permite el tamaño del anillo. Los anillos heterocíclicos de 5 o 6 miembros con insaturación al máximo son aromáticos. El anillo heterocíclico puede unirse al resto de la molécula a través de un miembro de anillo de carbono o a través de un miembro de anillo de nitrógeno.

20 Como una cuestión de rutina, el anillo heterocíclico contiene al menos un átomo de anillo de carbono. Si el anillo contiene más de un átomo de anillo O, estos no son adyacentes.

El término "anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o insaturado al máximo de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que contiene 1, 2 o 3 (o 4) heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados de N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo "[en donde "insaturado al máximo" incluye también "aromático"] como se usa aquí denota radicales monocíclicos, siendo los radicales monocíclicos saturados, parcialmente insaturados o insaturados al máximo (incluyendo aromáticos). El término "anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o insaturado al máximo de 3, 4, 5, 6, 7 u 8 miembros que contiene 1, 2 o 3 (o 4) heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados de N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo "[en donde "insaturado al máximo" incluye también "aromático"] como se usa en este documento también abarca radicales heteromonocíclicos de 8 miembros que contienen 1, 2 o 3 (o 4) heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados de N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, siendo los radicales monocíclicos saturados, parcialmente insaturados o insaturados al máximo (incluyendo aromáticos). Los anillos insaturados contienen al menos un doble enlace C-C y/o C-N y/o N-N. Los anillos insaturados al máximo contienen tantos enlaces dobles C-C y/o C-N y/o N-N conjugados según lo permitido por el tamaño del anillo. Los anillos heterocíclicos de 5 o 6 miembros insaturados máximos son aromáticos. Los anillos de 7 y 8 miembros no pueden ser aromáticos. Son homoaromáticos (anillo de 7 miembros, 3 dobles enlaces) o tienen 4 enlaces dobles (anillo de 8 miembros). El anillo heterocíclico puede unirse al resto de la molécula a través de un miembro de anillo de carbono o a través de un miembro de anillo de nitrógeno. Por supuesto, el anillo heterocíclico contiene al menos un átomo de anillo de carbono. Si el anillo contiene más de un átomo de anillo O, estos no son adyacentes.

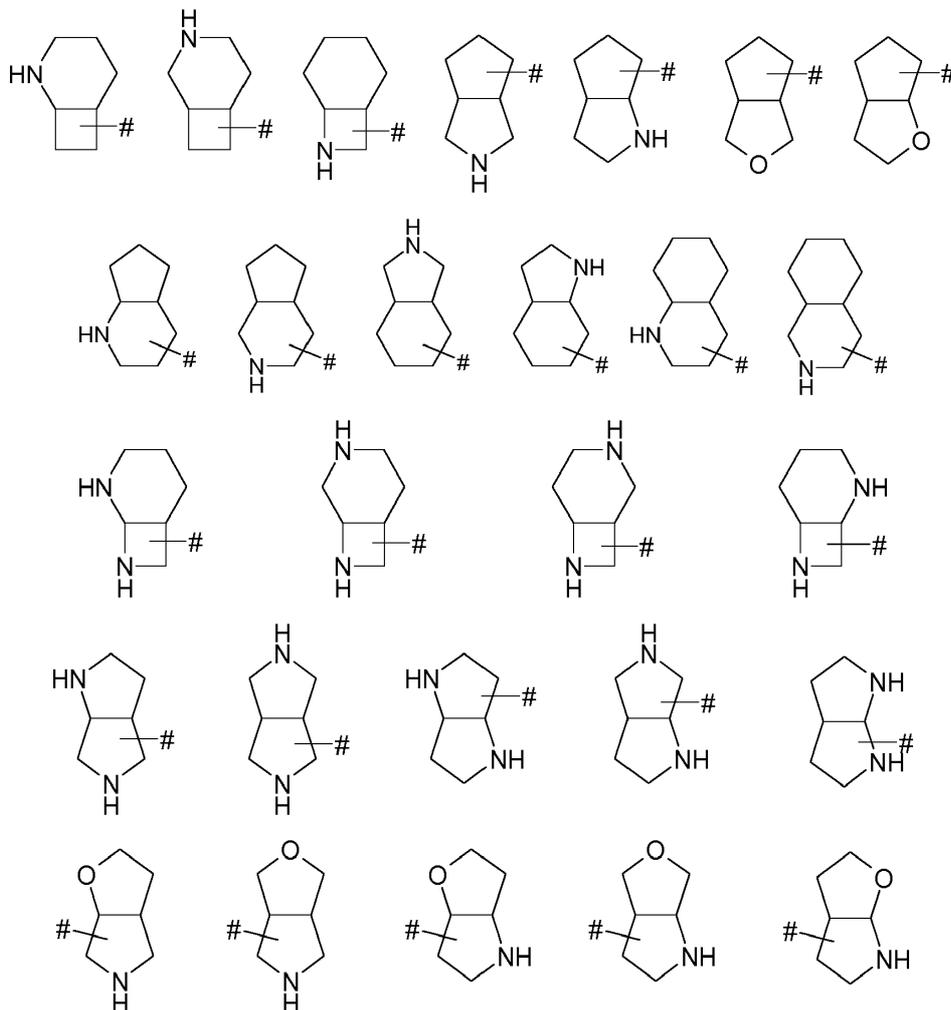
Los ejemplos de un anillo heterocíclico saturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros incluyen: Oxiraniilo, tiiraniilo, aziridinilo, oxetaniilo, thietaniilo, azetidiniilo, tetrahidrofuran-2-ilo, tetrahidrofuran-3-ilo, tetrahidrotien-2-ilo, tetrahidrotien-3-ilo, pirrolidin-1-ilo, pirrolidin-2-ilo, pirrolidin-3-ilo, pirazolidin-1-ilo, pirazolidin-3-ilo, pirazolidin-4-ilo, pirazolidin-5-ilo, imidazolidin-1-ilo, imidazolidin-2-ilo, imidazolidin-4-ilo, oxazolidin-2-ilo, oxazolidin-3-ilo, oxazolidin-4-ilo, oxazolidin-5-ilo, isoxazolidin-2-ilo, isoxazolidin-3-ilo, isoxazolidin-4-ilo, isoxazolidin-5-ilo, tiazolidin-2-ilo, tiazolidin-3-ilo, tiazolidin-4-ilo, tiazolidin-5-ilo, isotiazolidin-2-ilo, isotiazolidin-3-ilo, isotiazolidin-4-ilo, isotiazolidin-5-ilo, 1,2,4-oxadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-oxadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-triazolidin-3-ilo, 1,3,4-oxadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-tiadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-triazolidin-1-ilo, 1,3,4-triazolidin-2-ilo, 1,2,3,4-tetrazolidin-1-ilo, 1,2,3,4-tetrazolidin-2-ilo, 1,2,3,4-tetrazolidin-5-ilo, 2-tetrahidropiranilo, 4-tetrahidropiranilo, 1,3-dioxan-5-ilo, 1,4-dioxan-2-ilo, piperidin-1-ilo, piperidin-2-ilo, piperidin-3-ilo, piperidin-4-ilo, hexahidropiridazin-3-ilo, hexahidropiridazin-4-ilo, hexahidropirimidin-2-ilo, hexahidropirimidin-4-ilo, hexahidropirimidin-5-ilo, piperazin-1-ilo, piperazin-2-ilo, 1,3,5-hexahidrotiazin-1-ilo, 1,3,5-hexahidrotiazin-2-ilo y 1,2,4-hexahidrotiazin-3-ilo, morfolin-2-ilo, morfolin-3-ilo, morfolin-4-ilo, tiomorfolin-2-ilo, tiomorfolin-3-ilo, tiomorfolin-4-ilo, 1-oxotiomorfolin-2-ilo, 1-oxotiomorfolin-3-ilo, 1-oxotiomorfolin-4-ilo, 1,1-dioxotiomorfolin-2-ilo, 1,1-dioxotiomorfolin-3-ilo, 1,1-dioxotiomorfolin-4-ilo, azepan-1-, -2-, -3- o -4-ilo, oxepan-2-, -3-, -4- o -5-ilo, hexahidro-1,3-diazepinilo, hexahidro-1,4-diazepinilo, hexahidro-1,3-oxazepinilo, hexahidro-1,4-oxazepinilo, hexahidro-1,3-dioxepinilo, hexahidro-1,4-dioxepinilo y similares.

Los ejemplos de un anillo heterocíclico parcialmente insaturado de 3, 4, 5, 6 ó 7 miembros incluyen: 2,3-dihidrofur-2-ilo, 2,3-dihidrofur-3-ilo, 2,4-dihidrofur-2-ilo, 2,4-dihidrofur-3-ilo, 2,3-dihidrotien-2-ilo, 2,3-dihidrotien-3-ilo, 2,4-dihidrotien-2-ilo, 2,4-dihidrotien-3-ilo, 2-pirrolin-2-ilo, 2-pirrolin-3-ilo, 3-pirrolin-2-ilo, 3-pirrolin-3-ilo, 2-isoxazolin-3-ilo, 3-isoxazolin-3-ilo, 4-isoxazolin-3-ilo, 2-isoxazolin-4-ilo, 3-isoxazolin-4-ilo, 4-isoxazolin-4-ilo, 2-isoxazolin-5-ilo, 3-isoxazolin-5-ilo, 4-isoxazolin-5-ilo, 2-isotiazolin-3-ilo, 3-isotiazolin-3-ilo, 4-isotiazolin-3-ilo, 2-isotiazolin-4-ilo, 3-isotiazolin-4-ilo, 4-isotiazolin-4-ilo, 2-isotiazolin-5-ilo, 3-isotiazolin-5-ilo, 4-isotiazolin-5-ilo, 2,3-dihidropirazol-1-ilo, 2,3-

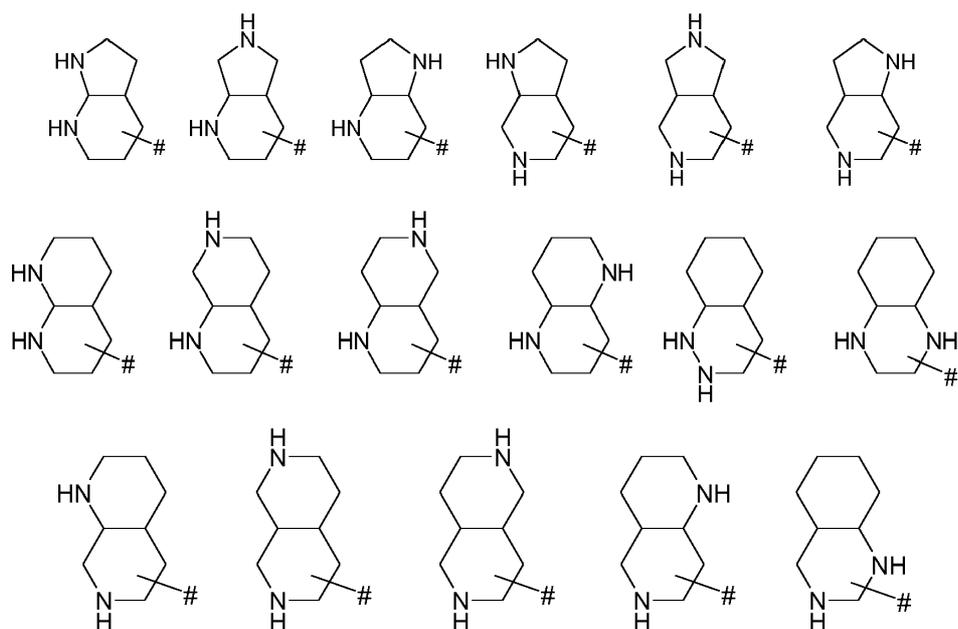
5 dihidropirazol-2-ilo, 2,3-dihidropirazol-3-ilo, 2,3-dihidropirazol-4-ilo, 2,3-dihidropirazol-5-ilo, 3,4-dihidropirazol-1-ilo, 3,4-dihidropirazol-3-ilo, 3,4-dihidropirazol-4-ilo, 3,4-dihidropirazol-5-ilo, 4,5-dihidropirazol-1-ilo, 4,5-dihidropirazol-3-ilo, 4,5-dihidropirazol-4-ilo, 4,5-dihidropirazol-5-ilo, 2,3-dihidrooxazol-2-ilo, 2,3-dihidrooxazol-3-ilo, 2,3-dihidrooxazol-4-ilo, 2,3-dihidrooxazol-5-ilo, 3,4-dihidrooxazol-2-ilo, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-4-ilo, 3,4-dihidrooxazol-5-ilo, 3,4-dihidrooxazol-2-ilo, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-4-ilo, 2,3-dihidro-1,2,4-triazol-1-, -2-, -3- o-5-ilo, 4,5-dihidro-1,3,4-triazol-1-, -2-, -4- o -5-ilo, 2,5-dihidro-1,3,4-triazol-1-, -2- o -5-ilo, 4,5-dihidro-1,2,3-triazol-1-, -4- o -5-ilo, 2,5-dihidro-1,2,3-triazol-1-, -2- o -5-ilo, 2,3-dihidro-1,2,3-triazol-1-, -2-, -3-, -4- o -5-ilo, 2,3-dihidro-1,2,3,4-tetrazol-1-, -2-, -3- o -5-ilo, 2,5-dihidro-1,2,3,4-tetrazol-1-, -2- o -5-ilo, 4,5-dihidro-1,2,3,4-tetrazol-1-, -4- o-5-ilo, 2-, 3-, 4-, 5- o 6-di- o tetrahidropiridinilo, 3-di- o tetrahidropiridazinilo, 4-di- o tetrahidropiridazinilo, 2-di- o tetrahidropirimidinilo, 4-di- o tetrahidropirimidinilo, 5-di- o tetrahidropirimidinilo, di- o tetrahidropirazinilo, 1,3,5-di- o tetrahidrotriazin-2-ilo, 1,2,4-di- o tetrahidrotriazin-3-ilo, 2,3,4,5-tetrahidro[1H]azepin-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, 3,4,5,6-tetrahidro[2H]azepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, 2,3,4,7-tetrahidro[1H]azepin-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, 2,3,6,7-tetrahidro[1H]azepin-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, tetrahidrooxepinilo, tal como 2,3,4,5-tetrahidro[1H]oxepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, 2,3,4,7-tetrahidro[1H]oxepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, 2,3,6,7-tetrahidro[1H]oxepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, tetrahidro-1,3-diazepinilo, tetrahidro-1,4-diazepinilo, tetrahidro-1,3-oxazepinilo, tetrahidro-1,4-oxazepinilo, tetrahidro-1,3-dioxepinilo y tetrahidro-1,4-dioxepinilo.

20 Ejemplos para un anillo heterocíclico de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros insaturado al máximo (incluyendo aromático) son anillos heteroaromáticos de 5 o 6 miembros, tal como 2-furilo, 3-furilo, 2-tienilo, 3-tienilo, 1-pirrolilo, 2-pirrolilo, 3-pirrolilo, 1-pirazolilo, 3-pirazolilo, 4-pirazolilo, 5-pirazolilo, 2-oxazolilo, 4-oxazolilo, 5-oxazolilo, 2-tiazolilo, 4-tiazolilo, 5-tiazolilo, 1-imidazolilo, 2-imidazolilo, 4-imidazolilo, 1,3,4-triazol-1-ilo, 1,3,4-triazol-2-ilo, 1,2,3,4-1H-tetrazol-1-ilo, 1,2,3,4-1H-tetrazol-5-ilo, 1,2,3,4-2H-tetrazol-2-ilo, 1,2,3,4-2H-tetrazol-5-ilo, 2-piridinilo, 3-piridinilo, 4-piridinilo, 1-oxopiridin-2-ilo, 1-oxopiridin-3-ilo, 1-oxopiridin-4-ilo, 3-piridazinilo, 4-piridazinilo, 2-pirimidinilo, 4-pirimidinilo, 5-pirimidinilo y 2-pirazinilo, y también radicales homoaromáticos, tal como 1H-azepina, 1H-[1,3]-diazepina y 1H-[1,4]-diazepina.

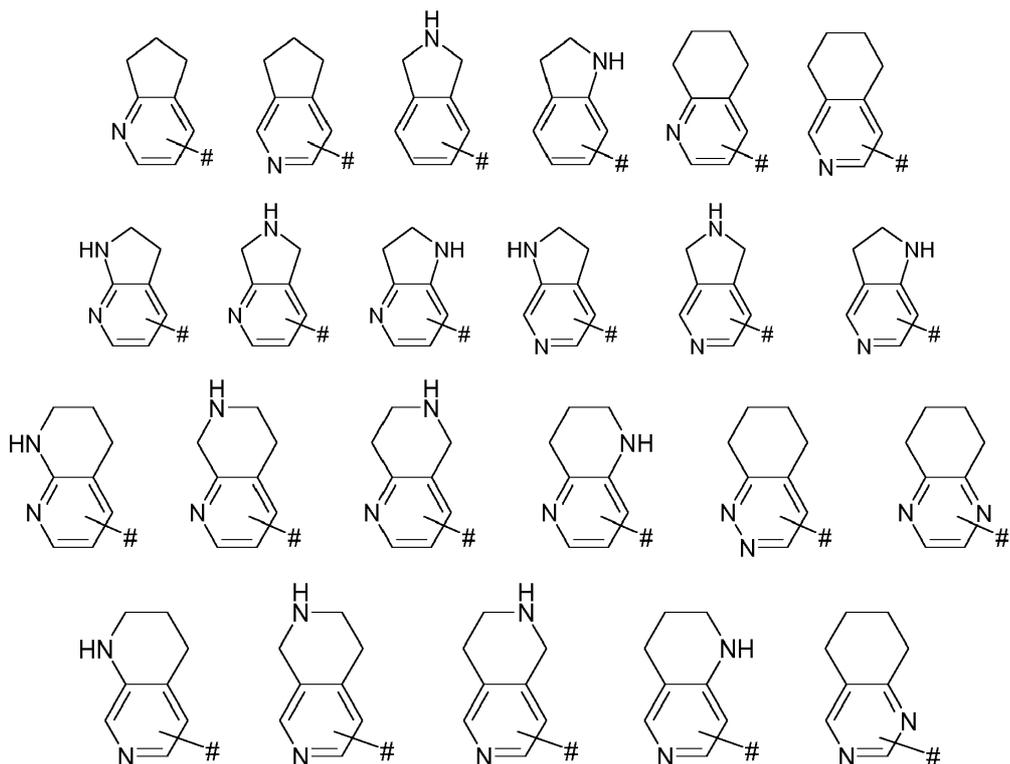
25 Ejemplos de un anillo heterobíciclico saturado de 8, 9 o 10 miembros que contiene 1, 2 o 3 (o 4) heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados de N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo son:



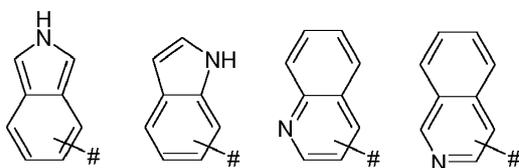
30

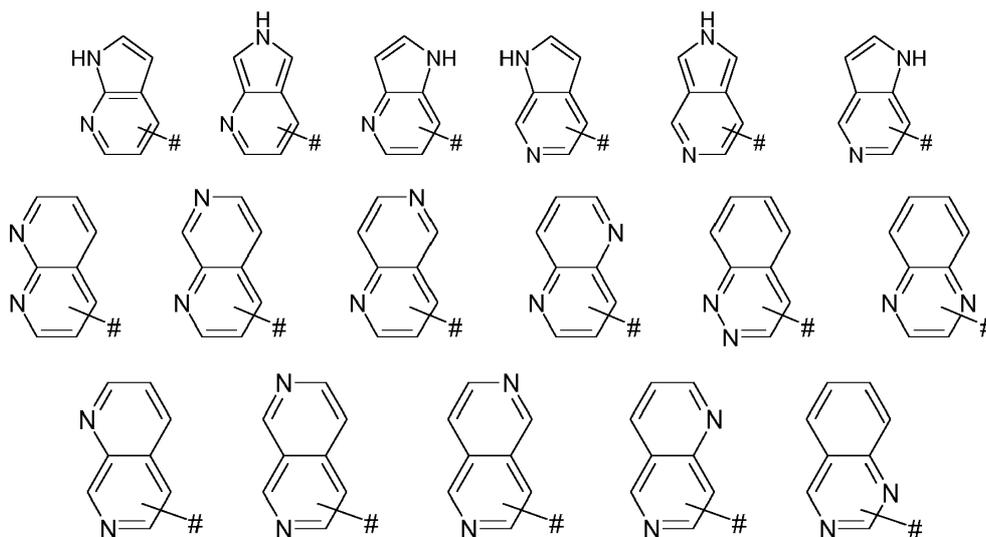


5 Ejemplos de un anillo heterobíciclico parcialmente insaturado de 8, 9 o 10 miembros que contiene 1, 2 o 3 (o 4) heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados de N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo son:



10 Ejemplos de un anillo heterobíciclico con el máximo insaturado de 8, 9 o 10 miembros que contiene 1, 2 o 3 (o 4) heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados de N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo son:





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

- 10 Un anillo saturado de 3, 4, 5, 6, 7, 8 o 9 miembros., en donde el anillo puede contener 1 o 2 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados de O, S, N, NR¹⁴, NO, SO y SO₂ y/o 1 o 2 grupos seleccionados de C=O, C=S y C=NR¹⁴ como miembros del anillo es carbocíclico o heterocíclico. Ejemplos son, además de los anillos heteromonocíclicos saturados mencionados más arriba, anillos carbocíclicos, tal como ciclopropilo, ciclopropanonilo, ciclobutilo, ciclobutanonilo, ciclopentilo, ciclopentanonilo, ciclohexilo, ciclohexanonilo, ciclohexadienonilo, cicloheptilo, cicloheptanonilo, ciclooctilo, ciclooctanonilo, furan-2-onilo, pirrolidin-2-onilo, pirrolidin-2,5-dionilo, piperidin-2-onilo, piperidin-2,6-dionilo y similares.

- 15 Las observaciones hechas a continuación concernientes a realizaciones preferidas de las variables de los compuestos de fórmula I, Especialmente con respecto a sus sustituyentes A, X¹, B¹, B², B³, G¹, G², R⁹¹, R⁹², R¹, R², R^{3a}, R^{3b}, R^{3c}, R^{3d}, R⁴, R⁵, R⁶, R⁸, R⁹, R^{9a}, R^{9b}, R^{101a}, R^{101b}, R^{102a}, R^{102b}, R¹¹, R¹³, R^{14a}, R^{14b}, R¹⁶, m y n, Las características del uso y el método de acuerdo con la invención y de la composición de la invención son válidas por sí solas y, en particular, en cada combinación posible entre sí.

- 20 En los anillos heterocíclicos, R¹¹ y R¹⁶ se pueden unir a un átomo del anillo de carbono o a un átomo del anillo de nitrógeno secundario (en este último caso, reemplazando así, por ejemplo, el átomo de hidrógeno mostrado en los anillos E-x o F-x). Si R¹¹ o R¹⁶ están unidos a un átomo de anillo de nitrógeno, R¹¹ y R¹⁶ son preferiblemente no halógeno, ciano, nitro o un radical unido por O o S, tal como -OH, -SH, alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, haloalquiltio, alquilsulfinilo, haloalquilsulfinilo, alquilsulfonilo o haloalquilsulfonilo.

- 25 En una realización de la invención, X¹ es O.

En otra realización de la invención, X¹ es CH₂.

W es preferiblemente O.

En una realización de la invención (realización 1) Y es -OR⁹, en donde R⁹ tiene uno de los significados anteriores generales, o, en particular, uno de los significados preferidos a continuación.

- 30 En una realización preferida de la realización 1 (realización 1a), R⁹ se selecciona de hidrógeno, C₁-C₆ alquilo y C₁-C₆ haloalquilo.

Los compuestos I en donde Y es -OR⁹ tienen actividad biológica, pero son especialmente útiles como compuestos intermedios en la preparación de compuestos I en los que Y es -N (R⁵) R⁶. Por lo tanto, la invención también se refiere a compuestos intermedios I en donde Y es -OR⁹, en donde R⁹ tiene uno de los significados generales definidos anteriormente o, preferiblemente, uno de los significados preferidos definidos anteriormente; y al uso de tales compuestos en la preparación de compuestos I en donde Y es -N (R⁵) R⁶.

- 40 Los compuestos I en los que Y es H también tienen actividad biológica, pero son especialmente útiles como compuestos intermedios en la preparación de compuestos I en los que Y es -N (R⁵) R⁶. Por lo tanto, la invención también se refiere a compuestos intermedios I en los que Y es hidrógeno; y al uso de tales compuestos en la preparación de compuestos I en donde Y es -N (R⁵) R⁶.

En otra realización de la invención (realización 2) Y es- N(R⁵)R⁶; en donde R⁵ y R⁶ tienen uno de los términos generales anteriores o, en particular, uno de los siguientes significados preferidos.

En una realización preferida de la realización 2 (realización 2a)

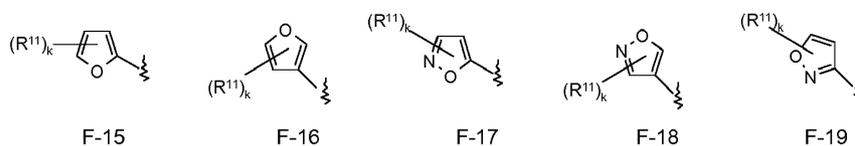
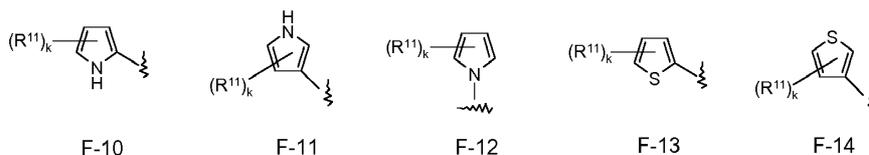
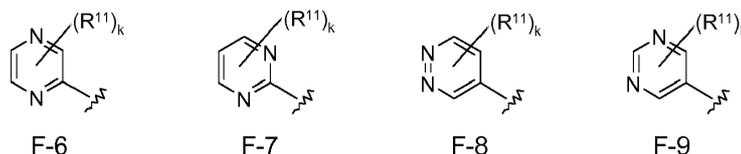
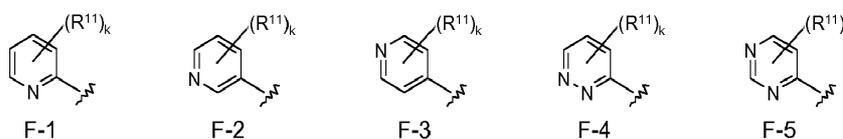
R⁵ es hidrógeno o C₁-C₃-alquilo;

- 5 R⁶ se selecciona de hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₄-alquilo que porta un radical R⁸, en donde R⁸ es como se define más abajo; C₂-C₆-alquenoilo, C₂-C₆-haloalquenoilo, C₂-C₆-alquinoilo, C₃-C₆-cicloalquilo que pueden estar sustituidos con 1 o 2 sustituyentes seleccionados de F, CN y piridilo;

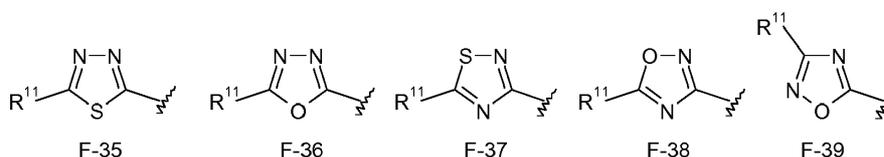
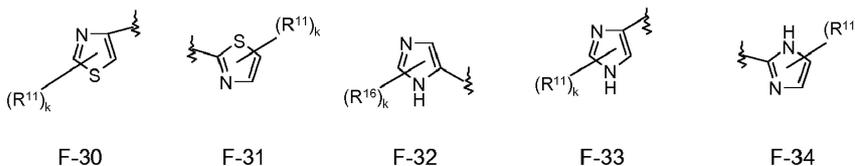
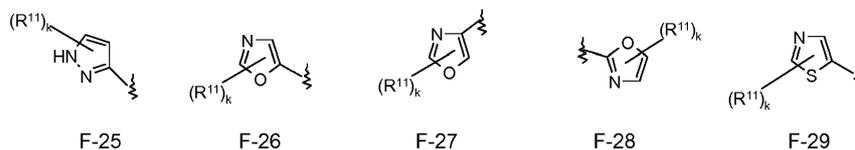
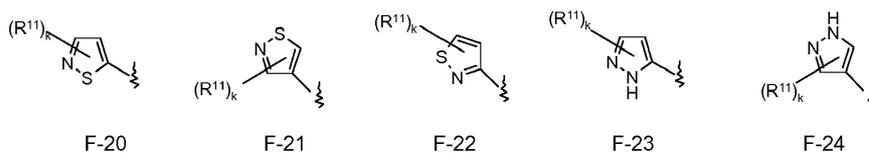
-N(R^{101a})R^{101b}, en donde R^{101a} y R^{101b} son como se definen más adelante;

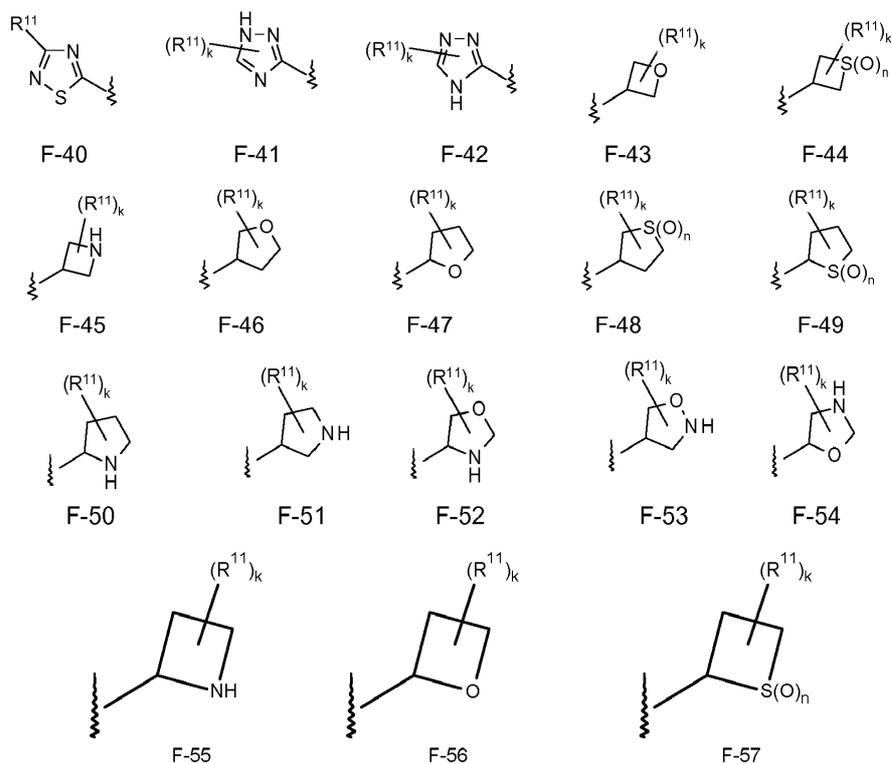
-CH=NOR^{9a}, en donde R^{9a} se selecciona de hidrógeno, C₁-C₆-alquilo y C₁-C₆-haloalquilo;

- 10 fenilo que puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R¹¹, en donde R¹¹ es como se define más abajo; y un anillo heteromonocíclico seleccionado de anillos de fórmulas F-1 a F-57



15





5 donde en F-1 a F-57

la línea en zigzag denota el punto de unión al resto de la molécula;

k es 0, 1, 2 o 3,

n es 0, 1 o 2, y

R^{11} es como se define más abajo;

10 R^8 se selecciona de OH, CN, C_3 - C_8 -cicloalquilo que porta opcionalmente un sustituyente CN o CF_3 , C_3 - C_8 -halocicloalquilo, C_1 - C_6 -alcoxi, C_1 - C_6 -haloalcoxi, C_1 - C_6 -alquiltio, C_1 - C_6 -haloalquiltio, C_1 - C_6 -alquilsulfinilo, C_1 - C_6 -haloalquilsulfinilo, C_1 - C_6 -alquilsulfonilo, C_1 - C_6 -haloalquilsulfonilo, $-C(=O)N(R^{102a})R^{102b}$, fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R^{16} , y un anillo heterocíclico seleccionado de anillos de fórmulas E-1 a E-57 como se define más arriba; en donde

15 R^{102a} en $-C(=O)N(R^{102a})R^{102b}$ como un significado para R^8 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno y C_1 - C_6 -alquilo; y

R^{102b} en $-C(=O)N(R^{102a})R^{102b}$ como un significado para R^8 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -haloalquilo, C_2 - C_4 -alquinilo, C_3 - C_6 -cicloalquilo, C_3 - C_6 -halocicloalquilo, CH_2 -CN, C_1 - C_6 -alcoxi y C_1 - C_6 -haloalcoxi;

20 R^{101a} en $-N(R^{101a})R^{101b}$ como un significado para R^6 se selecciona de hidrógeno y C_1 - C_6 -alquilo; y

R^{101b} en $-N(R^{101a})R^{101b}$ como un significado para R^6 se selecciona de hidrógeno, $-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}$, fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R^{16} , en donde R^{16} es como se define más abajo; y un anillo heteroaromático seleccionado de anillos de fórmulas E-1 a E-42 como se define más arriba;

25 cada R^{11} se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -haloalquilo, C_1 - C_4 -alcoxi, C_1 - C_4 -haloalcoxi, C_1 - C_4 -alquiltio, C_1 - C_4 -haloalquiltio, C_1 - C_4 -alquilsulfinilo, C_1 - C_4 -haloalquilsulfinilo, C_1 - C_4 -alquilsulfonilo, C_1 - C_4 -haloalquilsulfonilo, C_3 - C_6 -cicloalquilo, C_3 - C_6 -halocicloalquilo, C_2 - C_4 -alqueno, C_2 - C_4 -haloalqueno, C_2 - C_4 -alquinilo, C_2 - C_4 -haloalquinilo, C_1 - C_4 -alquilcarbonilo, C_1 - C_4 -haloalquilcarbonilo, aminocarbonilo, C_1 - C_4 -alquilaminocarbonilo y di- $(C_1$ - C_4 -alquil)-aminocarbonilo; o

30 dos R^{11} presentes en el mismo átomo de carbono de un anillo heterocíclico saturado pueden formar juntos =O o =S; o

dos R^{11} presentes en el mismo miembro de anillo S o SO de un anillo heterocíclico pueden formar juntos un grupo =N(C_1 - C_6 -alquil), =NO(C_1 - C_6 -alquil), =NN(H)(C_1 - C_6 -alquil) o =NN(C_1 - C_6 -alquil)₂;

R^{14a} en -C(=O)N(R^{14a})R^{14b} como un significado para R^{102b} se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno y C₁-C₆-alquilo; y

R^{14b} en -C(=O)N(R^{14a})R^{14b} como un significado para R^{102b} se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₄-alquinilo, CH₂-CN, C₁-C₆-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi; y

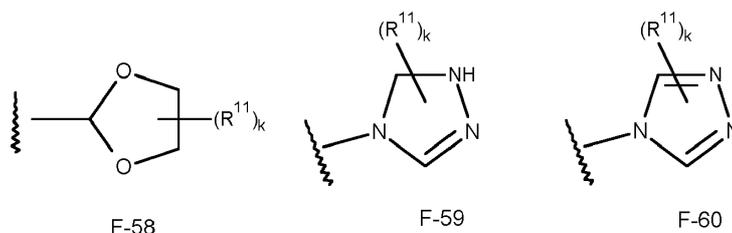
cada R¹⁶ como sustituyente en fenilo o anillos heterocíclicos de fórmulas E-1 a E-57 se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinilo, C₁-C₄-haloalquilsulfinilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alquenilo, C₂-C₄-haloalquenilo, C₂-C₄-alquinilo, C₂-C₄-haloalquinilo, C₁-C₄-alquilcarbonilo, C₁-C₄-haloalquilcarbonilo, aminocarbonilo, C₁-C₄-alquilaminocarbonilo y di-(C₁-C₄-alquil)-aminocarbonilo; o

dos R¹⁶ presentes en el mismo átomo de carbono de un anillo heterocíclico saturado pueden formar juntos =O o =S; o

dos R¹⁶ presentes en el mismo miembro de anillo S o SO de un anillo heterocíclico pueden formar juntos un grupo =N(C₁-C₆-alquil), =NO(C₁-C₆-alquil), =NN(H)(C₁-C₆-alquil) o =NN(C₁-C₆-alquil)₂.

En una realización preferida de la realización 2a, R¹¹, además de las definiciones anteriores, también se selecciona de C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo.

En una realización particular de la realización 2a (realización 2aa), R⁶, además de las definiciones anteriores en la realización 2a, también se selecciona de los anillos F-58 a F-60



donde k y R¹¹ son como se definen para anillos F-1 a F-57, donde sin embargo adicionalmente, dos R¹¹ presentes en el mismo átomo de carbono de un anillo heterocíclico parcialmente insaturado (similar al anillo F-59) pueden formar juntos =O o =S;

y R⁸, además de las definiciones anteriores en la realización 2a, también se selecciona de C₃-C₈-cicloalquilo que porta opcionalmente un sustituyente CHF₂, y de 1,3-dioxolan-2-ilo que puede portar 1, 2 o 3 sustituyentes R¹⁶ como se define más arriba.

En una realización preferida de la realización 2aa, R¹¹, además de las definiciones anteriores, también se selecciona de C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo.

En otra realización preferida de la realización 2 (realización 2b)

R⁵ es hidrógeno o C₁-C₃-alquilo;

R⁶ se selecciona de hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₄-alquilo que porta un radical R⁸, en donde R⁸ es como se define más abajo; C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo que pueden estar sustituidos con 1 o 2 sustituyentes seleccionados de F, CN y piridilo;

-N(R^{101a})R^{101b}, en donde R^{101a} y R^{101b} son como se definen más adelante;

-CH=NOR^{9a}, en donde R^{9a} se selecciona de hidrógeno, C₁-C₆-alquilo y C₁-C₆-haloalquilo;

fenilo que puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R¹¹, en donde R¹¹ es como se define más abajo; y un anillo heteromonocíclico seleccionado de anillos de fórmulas F-1 a F-57 como se define más arriba;

donde

en F-1 a F-57

la línea en zigzag denota el punto de unión al resto de la molécula;

k es 0, 1, 2 o 3,

n es 0, 1 o 2, y

R¹¹ es como se define más abajo;

5 R⁸ se selecciona de OH, CN, C₃-C₈-cicloalquilo que porta opcionalmente un sustituyente CN o CF₃, C₃-C₈-halocicloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-haloalquiltio, C₁-C₆-alquilsulfinilo, C₁-C₆-haloalquilsulfinilo, C₁-C₆-alquilsulfonilo, C₁-C₆-haloalquilsulfonilo, -C(=O)N(R^{102a})R^{102b}, fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R¹⁶, y un anillo heterocíclico seleccionado de anillos de fórmulas E-1 a E-57 como se define más arriba;

en donde

R^{102a} en -C(=O)N(R^{102a})R^{102b} como un significado para R⁸ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno y C₁-C₆-alquilo; y

10 R^{102b} en -C(=O)N(R^{102a})R^{102b} como un significado para R⁸ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₂-C₄-alquenilo, C₂-C₄-alquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilmetilo, CH₂-CN, C₁-C₆-alcoxi y C₁-C₆-haloalcoxi;

R^{101a} en -N(R^{101a})R^{101b} como un significado para R⁶ se selecciona de hidrógeno y C₁-C₆-alquilo; y

15 R^{101b} en -N(R^{101a})R^{101b} como un significado para R⁶ se selecciona de hidrógeno, -C(=O)N(R^{14a})R^{14b}, fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R¹⁶, en donde R¹⁶ es como se define más abajo; y un anillo heteroaromático seleccionado de anillos de fórmulas E-1 a E-42 como se define más arriba;

20 cada R¹¹ se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alquenilo, C₂-C₄-haloalquenilo, C₂-C₄-alquinilo y C₂-C₄-haloalquinilo; o dos R¹¹ presentes en el mismo átomo de carbono de un anillo heterocíclico saturado pueden formar juntos =O o =S; o dos R¹¹ presentes en el mismo miembro de anillo S o SO de un anillo heterocíclico pueden formar juntos un grupo =N(C₁-C₆-alquil), =NO(C₁-C₆-alquil), =NN(H)(C₁-C₆-alquil) o =NN(C₁-C₆-alquil)₂;

R^{14a} en -C(=O)N(R^{14a})R^{14b} como un significado para R^{102b} se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno y C₁-C₆-alquilo; y

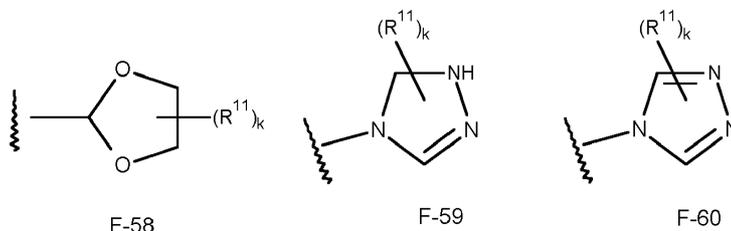
25 R^{14b} en -C(=O)N(R^{14a})R^{14b} como un significado para R^{102b} se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₄-alquinilo, CH₂-CN, C₁-C₆-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi; y

30 cada R¹⁶ como sustituyente en fenilo o anillos heterocíclicos de fórmulas E-1 a E-57 se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinilo, C₁-C₄-haloalquilsulfinilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alquenilo, C₂-C₄-haloalquenilo, C₂-C₄-alquinilo, C₂-C₄-haloalquinilo, C₁-C₄-alquilcarbonilo, C₁-C₄-haloalquilcarbonilo, aminocarbonilo, C₁-C₄-alquilaminocarbonilo y di-(C₁-C₄-alquil)-aminocarbonilo; o

dos R¹⁶ presentes en el mismo átomo de carbono de un anillo heterocíclico saturado pueden formar juntos =O o =S.

35 En una realización preferida de la realización 2b, R¹¹, además de las definiciones anteriores, también se selecciona de C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo.

En una realización particular de la realización 2b (realización 2bb), R⁶, además de las definiciones anteriores en la realización 2b, también se selecciona de los anillos F-58 a F-60



40 donde k y R¹¹ son como se definen para anillos F-1 a F-57, donde sin embargo adicionalmente, dos R¹¹ presentes en el mismo átomo de carbono de un anillo heterocíclico parcialmente insaturado (similar al anillo F-59) pueden formar juntos =O o =S;

45 y R⁸, además de las definiciones anteriores en la realización 2b, también se selecciona de C₃-C₈-cicloalquilo que porta opcionalmente un sustituyente CHF₂, y de 1,3-dioxolan-2-ilo que puede portar 1, 2 o 3 sustituyentes R¹⁶ como se define más arriba.

En una realización preferida de la realización 2bb, R¹¹, además de las definiciones anteriores, también se selecciona de C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo.

En una realización particular de la realización 2 (realización 2c),

R⁵ es hidrógeno o C₁-C₃-alquilo, y en particular hidrógeno;

- 5 R⁶ se selecciona de hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₄-alquilo que porta un radical R⁸, en donde R⁸ es como se define más abajo; C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo que puede ser sustituido por 1 grupo ciano;

-N(R^{101a})R^{101b}, en donde R^{101a} y R^{101b} son como se definen más adelante;

y un anillo heteromonocíclico seleccionado de anillos de fórmulas F-1 a F-57 como se define más arriba;

- 10 donde en F-1 a F-57

la línea en zigzag denota el punto de unión al resto de la molécula;

k es 0 o 1 preferably 0,

n es 0, 1 o 2, y

R¹¹ es como se define más abajo;

- 15 R⁸ se selecciona de CN, C₃-C₈-cicloalquilo que porta opcionalmente un sustituyente CN o CF₃, C₃-C₈-halocicloalquilo, -C(=O)N(R^{102a})R^{102b}, y un anillo heterocíclico seleccionado de anillos de fórmulas E-1 a E-57 como se define más arriba; en donde

R^{102a} en -C(=O)N(R^{102a})R^{102b} como un significado para R⁸ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno y C₁-C₆-alquilo; y

- 20 R^{102b} en -C(=O)N(R^{102a})R^{102b} como un significado para R⁸ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₂-C₄-alquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, CH₂-CN, C₁-C₆-alcoxi y C₁-C₆-haloalcoxi;

R^{101a} en -N(R^{101a})R^{101b} como un significado para R⁶ se selecciona de hidrógeno y C₁-C₆-alquilo;

- 25 R^{101b} en -N(R^{101a})R^{101b} como un significado para R⁶ se selecciona de hidrógeno, y un anillo heteroaromático seleccionado de anillos de fórmulas F-1 a F-42 como se define más arriba;

cada R¹¹ se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinilo, C₁-C₄-haloalquilsulfinilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alquenilo, C₂-C₄-haloalquenilo, C₂-C₄-alquinilo, C₂-C₄-haloalquinilo, C₁-C₄-alquilcarbonilo, C₁-C₄-haloalquilcarbonilo, aminocarbonilo, C₁-C₄-alquilaminocarbonilo y di-(C₁-C₄-alquil)-aminocarbonilo; o

- 30 dos R¹¹ presentes en el mismo átomo de carbono de un anillo heterocíclico saturado pueden formar juntos =O o =S; o

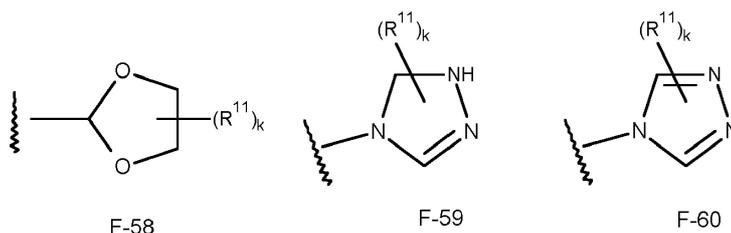
dos R¹¹ presentes en el mismo miembro de anillo S o SO de un anillo heterocíclico pueden formar juntos un grupo =N(C₁-C₆-alquil), =NO(C₁-C₆-alquil), =NN(H)(C₁-C₆-alquil) o =NN(C₁-C₆-alquil)₂; y

- 35 cada R¹⁶ como sustituyente en fenilo o anillos heterocíclicos de fórmulas E-1 a E-57 se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinilo, C₁-C₄-haloalquilsulfinilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alquenilo, C₂-C₄-haloalquenilo, C₂-C₄-alquinilo, C₂-C₄-haloalquinilo, C₁-C₄-alquilcarbonilo, C₁-C₄-haloalquilcarbonilo, aminocarbonilo, C₁-C₄-alquilaminocarbonilo y di-(C₁-C₄-alquil)-aminocarbonilo; o dos R¹⁶ presentes en el mismo átomo de carbono de un anillo heterocíclico saturado pueden formar juntos =O o =S; o

dos R¹⁶ presentes en el mismo miembro de anillo S o SO de un anillo heterocíclico pueden formar juntos un grupo =N(C₁-C₆-alquil), =NO(C₁-C₆-alquil), =NN(H)(C₁-C₆-alquil) o =NN(C₁-C₆-alquil)₂.

- 45 En una realización preferida de la realización 2c, R¹¹, además de las definiciones anteriores, también se selecciona de C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo.

En una realización particular de la realización 2c (realización 2cc), R⁶, además de las definiciones anteriores en la realización 2c, también se selecciona de los anillos F-58 a F-60



donde k y R^{11} son como se definen para anillos F-1 a F-57, donde sin embargo adicionalmente, dos R^{11} presentes en el mismo átomo de carbono de un anillo heterocíclico parcialmente insaturado (similar al anillo F-59) pueden formar juntos $=O$ o $=S$;

- 5 y R^8 , además de las definiciones anteriores en la realización 2a, también se selecciona de C_3 - C_8 -cicloalquilo que porta opcionalmente un sustituyente CHF_2 , y de 1,3-dioxolan-2-ilo que puede portar 1, 2 o 3 sustituyentes R^{16} como se define más arriba.

En una realización preferida de la realización 2cc, R^{11} , además de las definiciones anteriores, también se selecciona de C_3 - C_6 -cicloalquil- C_1 - C_4 -alquilo.

- 10 En otra realización incluso más particular de la realización 2 (realización 2d),

R^5 es hidrógeno o C_1 - C_3 -alquilo;

R^6 se selecciona de C_1 - C_4 -alquilo que porta un radical R^8 , y un anillo heteromonocíclico saturado seleccionado de anillos de fórmulas. F-43 a F-57 como se define más arriba; en donde

R^8 es Un anillo heterocíclico saturado seleccionado de anillos de fórmulas. E-43 a E-57 como se define más arriba;

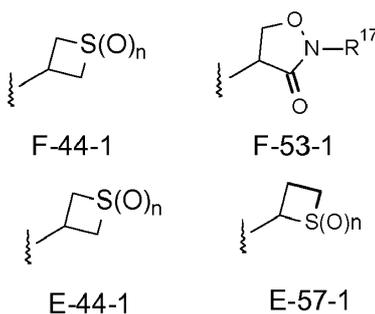
- 15 R^{11} como sustituyente en anillos heterocíclicos de fórmulas F-43 a F-57 se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -haloalquilo, C_1 - C_4 -alcoxi, C_1 - C_4 -haloalcoxi, C_1 - C_4 -alquiltio, C_1 - C_4 -haloalquiltio, C_1 - C_4 -alquilsulfonilo, C_1 - C_4 -haloalquilsulfonilo, C_1 - C_4 -alquilsulfonilo, C_1 - C_4 -haloalquilsulfonilo, C_3 - C_6 -cicloalquilo, C_3 - C_6 -halocicloalquilo, C_2 - C_4 -alquenilo, C_2 - C_4 -haloalquenilo, C_2 - C_4 -alquinilo, C_2 - C_4 -haloalquinilo, C_1 - C_4 -alquilcarbonilo, C_1 - C_4 -haloalquilcarbonilo, aminocarbonilo, C_1 - C_4 -alquilaminocarbonilo y di- $(C_1$ - C_4 -alquil)-aminocarbonilo; o dos R^{11} presentes en el mismo átomo de carbono de un anillo heterocíclico saturado pueden formar juntos $=O$ o $=S$;

25 cada R^{16} como sustituyente en anillos heterocíclicos de fórmulas E-43 a E-57 se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -haloalquilo, C_1 - C_4 -alcoxi, C_1 - C_4 -haloalcoxi, C_1 - C_4 -alquiltio, C_1 - C_4 -haloalquiltio, C_1 - C_4 -alquilsulfonilo, C_1 - C_4 -haloalquilsulfonilo, C_1 - C_4 -alquilsulfonilo, C_1 - C_4 -haloalquilsulfonilo, C_3 - C_6 -cicloalquilo, C_3 - C_6 -halocicloalquilo, C_2 - C_4 -alquenilo, C_2 - C_4 -haloalquenilo, C_2 - C_4 -alquinilo, C_2 - C_4 -haloalquinilo, C_1 - C_4 -alquilcarbonilo, C_1 - C_4 -haloalquilcarbonilo, aminocarbonilo, C_1 - C_4 -alquilaminocarbonilo y di- $(C_1$ - C_4 -alquil)-aminocarbonilo; o dos R^{16} presentes en el mismo átomo de carbono de un anillo heterocíclico saturado pueden formar juntos $=O$ o $=S$.

- 30 En una realización preferida de la realización 2d, R^{11} , además de las definiciones anteriores, también se selecciona de C_3 - C_6 -cicloalquil- C_1 - C_4 -alquilo.

En la realización 2c, y también 2cc y también 2d, el anillo heteromonocíclico R^6 se selecciona preferiblemente de anillos de fórmulas F-44-1 y F-53-1 (véase a continuación), y el anillo heterocíclico R^8 se selecciona preferiblemente de anillos de fórmulas E-1, E-2, E-3, E-5, E-7, E-44-1 y E-57-1 (véase a continuación), específicamente de E-1, E-7, E-44-1 y E-57-1 y muy específicamente de E-44-1 y E-57-1.

- 35 En las realizaciones 2, 2a, 2aa, 2b, 2bb, 2c, 2cc y 2d, el anillo heteromonocíclico R^6 se selecciona preferiblemente de anillos de fórmulas F-44-1 y F-53-1, y el anillo heterocíclico R^8 se selecciona preferiblemente de anillos de fórmulas E-44-1 y E-57-1



en donde

n es 0, 1 o 2; y

R¹⁷ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₂-C₄-haloalquino y CH₂-C₃-C₆-cicloalquilo.

5 En una realización especialmente preferida de la realización 2 (realización 2e)

R⁵ es hidrógeno o C₁-C₃-alquilo, en particular hidrógeno; y

R⁶ se selecciona de C₁-C₄-alquilo (especialmente metilo) que porta un radical R⁸; un anillo de fórmula F-44-1, y un anillo de fórmula F-53-1 como se define más arriba; en donde

R⁸ se selecciona de un anillo de fórmula E-44-1 y un anillo de fórmula E-57-1 como se define más arriba.

10 En otra realización preferida de la realización 2 (realización 2f), R⁵ y R⁶ juntos forman un grupo =S(R^{9b})₂, donde R^{9b} se selecciona de C₁-C₄-alquilo y C₁-C₂-haloalquilo y en particular de C₁-C₄-alquilo.

En otra realización preferida de la realización 2 (realización 2g), R⁵ y R⁶, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un anillo heterocíclico saturado de 5 miembros, donde el anillo puede contener además 1 o 2 heteroátomos o grupos que contienen heteroátomos seleccionados de NH y C=O como miembros de anillo, en donde el anillo heterocíclico puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente de C₁-C₆-alquilo y C₁-C₆-haloalquilo. En una realización particular de la realización 2g (realización 2gg), R⁵ y R⁶, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un anillo imidazolidinon-1-ilo, especialmente un anillo imidazolidin-4-on-ilo que puede estar sustituido con 1 o 2 sustituyentes seleccionados independientemente de C₁-C₆-alquilo y C₁-C₆-haloalquilo.

15 Preferiblemente, B¹ es CR², donde R² no es hidrógeno, y B² y B³ son CR², donde R² tiene uno de los significados anteriores generales, o, en particular, uno de los significados preferidos a continuación. En una realización particular (realización 3a), en los compuestos I, B¹ es CR², donde R² no es hidrógeno, y B² y B³ son CR², donde R² tiene uno de los significados anteriores generales o, en particular, uno de los significados preferidos a continuación; W es O; y Y es como se define en cualquiera de las realizaciones anteriores 1a, 2a, 2aa, 2b, 2bb, 2c, 2cc, 2d, 2e, 2f, 2g o 2gg.

20 Preferiblemente, R² se selecciona de hidrógeno, F, Cl, Br, OCF₃ y CF₃; y es específicamente F o Cl.

En una realización particular (realización 3b), en los compuestos I, B¹ es CR², donde R² no es hidrógeno, y B² y B³ son CR², donde R² se selecciona de hidrógeno, F, Cl, Br, OCF₃ y CF₃; y es específicamente F o Cl; W es O; y Y es como se define en cualquiera de las realizaciones anteriores 1a, 2a, 2aa, 2b, 2bb, 2c, 2cc, 2d, 2e, 2f, 2g o 2gg.

25 Preferiblemente, G¹ y G² son CR⁴, donde R⁴ tiene uno de los significados anteriores generales o, en particular, uno de los significados preferidos a continuación.

R⁴ es en particular hidrógeno.

En una realización particular (realización 4a), en los compuestos I, R⁴ tiene uno de los significados anteriores generales o, en particular, uno de los significados preferidos a continuación, y es en particular hidrógeno; B¹, B² y B³ som como se define en las realizaciones 3a o 3b, W es O; y Y es como se define en cualquiera de las realizaciones anteriores 1a, 2a, 2aa, 2b, 2bb, 2c, 2cc, 2d, 2e, 2f, 2g o 2gg.

30 En una realización, R⁹¹ y R⁹² formar juntos un grupo puente -CH₂-CH₂-CH₂-.

En otra realización, R⁹¹ y R⁹² formar juntos un grupo puente -CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-.

Preferiblemente, R^{3a} y R^{3b} se seleccionan independientemente de hidrógeno y halógeno, más preferiblemente de hidrógeno y flúor, y son en particular hidrógeno.

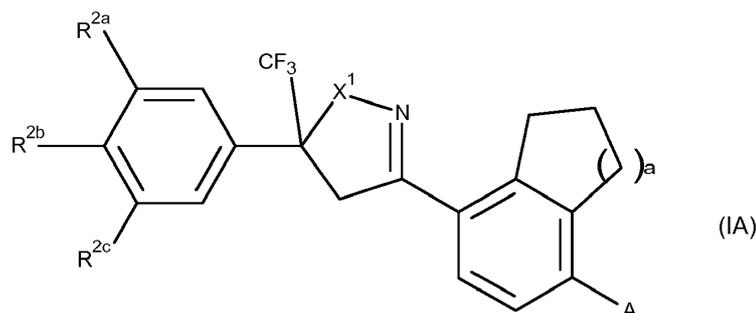
35 En una realización particular (realización 5a), en los compuestos I, R^{3a} y R^{3b} son hidrógeno, R⁴ es como se define en la realización 4a; B¹, B² and B³ som como se define en las realizaciones 3a o 3b, W es O; y Y es como se define en cualquiera de las realizaciones anteriores 1a, 2a, 2aa, 2b, 2bb, 2c, 2cc, 2d, 2e, 2f, 2g o 2gg.

Si no se especifica otra cosa arriba, R¹⁶ tiene los siguientes significados preferidos:

R¹⁶ es independientemente de cada aparición e independientemente de cada uno, preferiblemente seleccionado de

40 halógeno, CN, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinilo, C₁-C₄-haloalquilsulfinilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, y más preferiblemente de halógeno, CN, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi. Si está unido a un átomo de nitrógeno, R¹⁶ no es halógeno.

45 En una realización particular, el compuesto de fórmula I es un compuesto de fórmula IA o un N-óxido, un estereoisómero o una sal agrícola o veterinariamente aceptable del mismo



en donde

X¹ es O or CH₂;

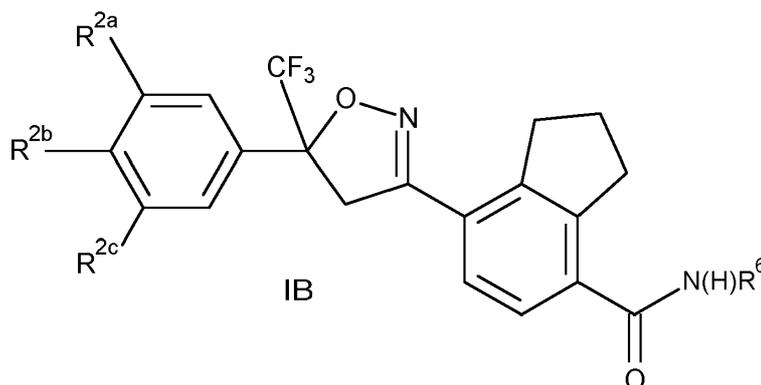
5 R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} tienen uno de los anteriores términos generales o, en particular, uno de los significados preferidos anteriores de R²;

A tiene uno de los términos generales anteriores o, en particular, uno de los significados preferidos anteriores; y

a es 1 o 2.

En particular, en los compuestos IA, en A, W es O y Y es como se define en cualquiera de las realizaciones 1a, 2a, 2aa, 2b, 2bb, 2c, 2cc, 2d, 2e, 2f, 2g o 2gg, y especialmente 2c, 2cc, 2d o 2e.

10 En una realización más particular, el compuesto de fórmula I es un compuesto de fórmula IB o un estereoisómero o una sal agrícola o veterinariamente aceptable del mismo.



en donde

R^{2a} es Cl, R^{2b} es F, R^{2c} es Cl, y

15 R⁶ es CH₂-C(O)-N(H)-R^{102b}, en donde

R^{102b} se selecciona del grupo que consiste en C₁-C₄-alquilo, C₂-C₄-alquilo sustituido con 1 o 2 átomos de flúor, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-alquino, CH₂-CN, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo y C₃-C₆-cicloalquilmetilo.

En otra realización más particular, el compuesto de fórmula I es un compuesto de fórmula IB, como se define más arriba, o un estereoisómero o una sal agrícola o veterinariamente aceptable del mismo, donde sin embargo

20 R^{2a} es Cl, R^{2b} es F, R^{2c} es Cl, y

R⁶ es -CH₂-R⁸, en donde

R⁸ se selecciona de los anillos E-5, E-6, E-7, E-19, E-25, E-27, E-44 y E-57 como se define más arriba, donde los anillos E-5, E-6, E-7, E-19, E-27, E-44 y E-57 están sin sustituir (k es 0) o portan 1 o 2 sustituyentes R¹⁶ (k es 1 o 2); y en particular se selecciona de los anillos E-5, E-6, E-7, E-19, E-25, E-27, E-44-1 y E-57-1, donde los anillos E-5, E-6, E-7, E-19 y E-27 están sin sustituir (k es 0) o portan 1 o 2 sustituyentes R¹⁶ (k es 1 o 2),

25

en donde

cada R¹⁶ se selecciona independientemente de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₂-alquilo, C₁-C₂-haloalquilo, C₁-C₂-alcoxi, C₁-C₂-haloalcoxi, C₁-C₂-alquiltio, C₁-C₂-haloalquiltio, C₁-C₂-alquilsulfonilo, C₁-C₂-haloalquilsulfonilo, C₁-C₂-alquilsulfonilo, C₁-C₂-haloalquilsulfonilo, C₃-C₄-cicloalquilo, C₃-C₄-halocicloalquilo, C₂-C₃-alqueno, C₂-C₃-alquino; y

donde el anillo E-25 lleva un sustituyente R¹⁶ como se define más arriba en el átomo de nitrógeno en la posición 1 (que sin embargo no es halógeno, ciano, nitro, C₁-C₂-alcoxi, C₁-C₂-haloalcoxi, C₁-C₂-alquiltio, C₁-C₂-haloalquiltio, C₁-C₂-alquilsulfinilo, C₁-C₂-haloalquilsulfinilo, C₁-C₂-alquilsulfonilo o C₁-C₂-haloalquilsulfonilo) y opcionalmente porta 1 o 2 sustituyentes R¹⁶ adicionales, donde R¹⁶ es como se define más arriba.

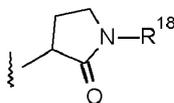
- 5 En aún otra realización más particular, el compuesto de fórmula I es un compuesto de fórmula IB, como se define más arriba, o un estereoisómero o una sal agrícola o veterinariamente aceptable del mismo, donde sin embargo

R^{2a} es Cl, R^{2b} es F, R^{2c} es Cl, y

- 10 R⁶ se selecciona de los anillos F-2, F-4, F-6, F-8, F-9, F-44, F-46, F-51 y F-53 como se define más arriba, donde los anillos F-2, F-4, F-6, F-8, F-9, F-44, F-46 y F-53 están sin sustituir (k es 0) o portan 1 o 2 sustituyentes R¹¹ (k es 1 o 2),

en donde cada R¹¹ se selecciona independientemente de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₂-alquilo, C₁-C₂-haloalquilo, C₁-C₂-alcoxi, C₁-C₂-haloalcoxi, C₁-C₂-alquiltio, C₁-C₂-haloalquiltio, C₁-C₂-alquilsulfinilo, C₁-C₂-haloalquilsulfinilo, C₁-C₂-alquilsulfonilo, C₁-C₂-haloalquilsulfonilo, C₃-C₄-cicloalquilo, C₃-C₄-halocicloalquilo, C₂-C₃-alqueno y C₂-C₃-alquinilo; y

donde el anillo F-51 es un anillo de fórmula F-51-1



F-51-1

- 15 en donde

R¹⁸ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, C₁-C₂-alquilo, C₁-C₂-haloalquilo, C₃-C₄-cicloalquilo, C₃-C₄-halocicloalquilo, C₂-C₃-alqueno y C₂-C₃-alquinilo;

y

- 20 donde anillos F-44 y F-53 son preferiblemente anillos F-44-1 y F-53-1 como se define más arriba.

En aún otra realización más particular, el compuesto de fórmula I es un compuesto de fórmula IB, como se define más arriba, o un estereoisómero o una sal agrícola o veterinariamente aceptable del mismo, donde sin embargo

R^{2a} es Cl, R^{2b} es F, R^{2c} es Cl, y

- 25 R⁶ se selecciona de C₂-C₄-alquilo que puede estar sustituido con 1 o 2 átomos de flúor, ciclopropilo, C₃-C₅-halocicloalquilo, CH₂-(C₃-C₅-halocicloalquil), CH₂-(1-ciano-(C₃-C₅-cicloalquil)), C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-alquinilo, CH₂-CN y -CH=NOR^{9a}, en donde R^{9a} se selecciona de C₁-C₃-alquilo y C₁-C₃-haloalquilo.

En aún otra realización más particular, el compuesto de fórmula I es un compuesto de fórmula IB, como se define más arriba, o un estereoisómero o una sal agrícola o veterinariamente aceptable del mismo, donde sin embargo

R^{2a} es Cl, R^{2b} es F, R^{2c} es Cl, y

- 30 R⁶ es N(H)R^{101b}, en donde

R^{101b} se selecciona de -C(O)-N(H)R^{14b} y los anillos E-1 y E-7 como se define más arriba;

donde

R^{14b} se selecciona de C₁-C₃-alquilo, C₁-C₃-haloalquilo y ciclopropilo; y donde en los anillos E-1 y E-7

k es 0, 1 o 2; y

- 35 cada R¹⁶ se selecciona independientemente de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₂-alquilo, C₁-C₂-haloalquilo, C₁-C₂-alcoxi, C₁-C₂-haloalcoxi, C₁-C₂-alquiltio, C₁-C₂-haloalquiltio, C₁-C₂-alquilsulfinilo, C₁-C₂-haloalquilsulfinilo, C₁-C₂-alquilsulfonilo, C₁-C₂-haloalquilsulfonilo, C₃-C₄-cicloalquilo, C₃-C₄-halocicloalquilo, C₂-C₃-alqueno, C₂-C₃-alquinilo.

En otra realización más particular, el compuesto de fórmula I es un compuesto de fórmula IB, como se define más arriba, o un estereoisómero o una sal agrícola o veterinariamente aceptable del mismo, donde sin embargo

- 40 R^{2a} es Cl, R^{2b} es H, R^{2c} es Cl, y

R⁶ es CH₂-C(O)-N(H)-R^{102b}, en donde

R^{102b} se selecciona del grupo que consiste en 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, ciclopropilo, ciclopropilometilo, alilo y propargilo.

En otra realización más particular, el compuesto de fórmula I es un compuesto de fórmula IB, como se define más arriba, o un estereoisómero o una sal agrícola o veterinariamente aceptable del mismo, donde sin embargo

5 R^{2a} es Cl, R^{2b} es H, R^{2c} es Cl, y

R⁶ es -CH₂-R⁸, en donde

R⁸ se selecciona de los siguientes anillos: E-1, E-7, E-19, E-44, E-47 y E-57, donde en los anillos E-1, E-7, E-19, E-44, E-47 y E-57 k es 0.

10 En otra realización más particular, el compuesto de fórmula I es un compuesto de fórmula IB, como se define más arriba, o un estereoisómero o una sal agrícola o veterinariamente aceptable del mismo, donde sin embargo

R^{2a} es Cl, R^{2b} es H, R^{2c} es Cl, y

R⁶ se selecciona de los anillos F-9, F-44, F-46 y F-53; donde en los anillos F-9, F-44 y F-46 k es 0; y en particular se selecciona de los anillos F-9, F-44, F-46 y F-53-1 con R¹⁷ = H, metilo, etilo o 2,2,2-trifluoroetilo; donde en los anillos F-9, F-44 y F-46 k es 0.

15 En otra realización más particular, el compuesto de fórmula I es un compuesto de fórmula IB, como se define más arriba, o un estereoisómero o una sal agrícola o veterinariamente aceptable del mismo, donde sin embargo

R^{2a} es Cl, R^{2b} es H, R^{2c} es Cl, y

20 R⁶ se selecciona de 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, ciclopropilo, 2,2-difluorociclopropilo, 1-cianociclopropilo, ciclobutilo, 3,3-difluorociclobutilo, ciclopropilometilo, 2,2-difluorociclopropilometilo, 1-cianociclopropilometilo, ciclobutilometilo, 3,3-difluorociclobutilometilo, alilo, propargilo y -CH=NOCH₃.

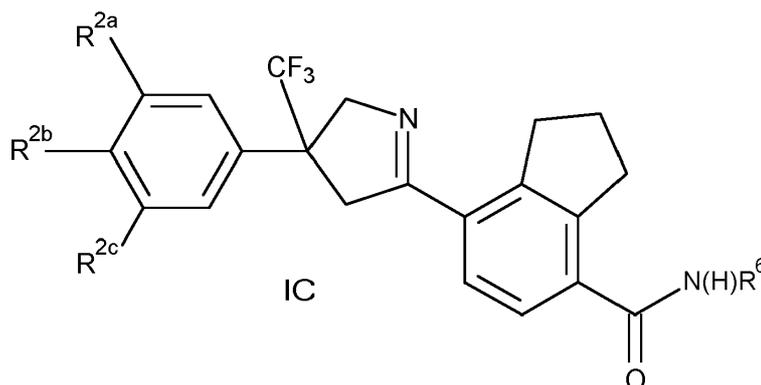
En otra realización más particular, el compuesto de fórmula I es un compuesto de fórmula IB, como se define más arriba, o un estereoisómero o una sal agrícola o veterinariamente aceptable del mismo, donde sin embargo

R^{2a} es Cl, R^{2b} es H, R^{2c} es Cl, y

R⁶ es N(H)R^{101b}, en donde

25 R^{101b} se selecciona de -C(O)-N(H)-CH₂CF₃ y los anillos E-1 y E-7, donde en los anillos E-1 y E-7 k es 0.

En otra realización más particular, el compuesto de fórmula I es un compuesto de fórmula IC o un N-óxido, un estereoisómero o una sal agrícola o veterinariamente aceptable del mismo



en donde

30 R^{2a} es Cl, R^{2b} es F, R^{2c} es Cl, y

R⁶ es CH₂-C(O)-N(H)-R^{102b}, en donde

R^{102b} se selecciona del grupo que consiste en 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, ciclopropilo, ciclopropilometilo, alilo y propargilo.

35 En otra realización más particular, el compuesto de fórmula I es un compuesto de fórmula IC, como se define más arriba, o un N-óxido, un estereoisómero o una sal agrícola o veterinariamente aceptable del mismo, donde sin embargo

R^{2a} es Cl, R^{2b} es F, R^{2c} es Cl, y

R⁶ es -CH₂-R⁸, en donde

R⁸ se selecciona de los siguientes anillos: E-1, E-7, E-19, E-44, E-47 y E-57, donde en los anillos E-1, E-7, E-19, E-44, E-47 y E-57 k es 0.

5 En otra realización más particular, el compuesto de fórmula I es un compuesto de fórmula IC, como se define más arriba, o un N-óxido, un estereoisómero o una sal agrícola o veterinariamente aceptable del mismo, donde sin embargo

R^{2a} es Cl, R^{2b} es F, R^{2c} es Cl, y

R⁶ se selecciona de los anillos F-9, F-44, F-46 y F-53, donde en los anillos F-9, F-44 y F-46 k es 0, y en particular se selecciona de los anillos F-9, F-44, F-46 y F-53-1 con R¹⁷ = H, metilo, etilo o 2,2,2-trifluoroetilo; donde en los anillos F-9, F-44 y F-46 k es 0.

10 En otra realización más particular, el compuesto de fórmula I es un compuesto de fórmula IC, como se define más arriba, o un N-óxido, un estereoisómero o una sal agrícola o veterinariamente aceptable del mismo, donde sin embargo

R^{2a} es Cl, R^{2b} es F, R^{2c} es Cl, y

15 R⁶ se selecciona de 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, ciclopropilo, 2,2-difluorociclopropilo, 1-cianociclopropilo, ciclobutilo, 3,3-difluorociclobutilo, ciclopropilometilo, 2,2-difluorociclopropilometilo, 1-cianociclopropilometilo, ciclobutilometilo, 3,3-difluorociclobutilometilo, alilo, propargilo y -CH=NOCH₃.

En otra realización más particular, el compuesto de fórmula I es un compuesto de fórmula IC, como se define más arriba, o un N-óxido, un estereoisómero o una sal agrícola o veterinariamente aceptable del mismo, donde sin embargo

R^{2a} es Cl, R^{2b} es F, R^{2c} es Cl, y

R⁶ es N(H)R^{101b}, en donde

20 R^{101b} se selecciona de -C(O)-N(H)-CH₂CF₃ y los anillos E-1 y E-7, donde en los anillos E-1 y E-7 k es 0.

En otra realización más particular, el compuesto de fórmula I es un compuesto de fórmula IC, como se define más arriba, o un N-óxido, un estereoisómero o una sal agrícola o veterinariamente aceptable del mismo, donde sin embargo

R^{2a} es Cl, R^{2b} es H, R^{2c} es Cl, y

R⁶ es CH₂-C(O)-N(H)-R^{102b}, en donde

25 R^{102b} se selecciona del grupo que consiste en 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, ciclopropilo, ciclopropilometilo, alilo y propargilo.

En otra realización más particular, el compuesto de fórmula I es un compuesto de fórmula IC, como se define más arriba, o un N-óxido, un estereoisómero o una sal agrícola o veterinariamente aceptable del mismo, donde sin embargo

R^{2a} es Cl, R^{2b} es H, R^{2c} es Cl, y

30 R⁶ es -CH₂-R⁸, en donde

R⁸ se selecciona de los siguientes anillos: E-1, E-7, E-19, E-44, E-47 y E-57, donde en los anillos E-1, E-7, E-19, E-44, E-47 y E-57 k es 0.

En otra realización más particular, el compuesto de fórmula I es un compuesto de fórmula IC, como se define más arriba, o un N-óxido, un estereoisómero o una sal agrícola o veterinariamente aceptable del mismo, donde sin embargo

35 R^{2a} es Cl, R^{2b} es H, R^{2c} es Cl, y

R⁶ se selecciona de los anillos F-9, F-44, F-46 y F-53, donde en los anillos F-9, F-44 y F-46 k es 0, y en particular se selecciona de los anillos F-9, F-44, F-46 y F-53-1 con R¹⁷ = H, metilo, etilo o 2,2,2-trifluoroetilo; donde en los anillos F-9, F-44 y F-46 k es 0.

40 En otra realización más particular, el compuesto de fórmula I es un compuesto de fórmula IC, como se define más arriba, o un N-óxido, un estereoisómero o una sal agrícola o veterinariamente aceptable del mismo, donde sin embargo

R^{2a} es Cl, R^{2b} es H, R^{2c} es Cl, y

R⁶ se selecciona de 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, ciclopropilo, 2,2-difluorociclopropilo, 1-cianociclopropilo, ciclobutilo, 3,3-difluorociclobutilo, ciclopropilometilo, 2,2-difluorociclopropilometilo, 1-cianociclopropilometilo, ciclobutilometilo, 3,3-difluorociclobutilometilo, alilo, propargilo y -CH=NOCH₃.

45 En otra realización más particular, el compuesto de fórmula I es un compuesto de fórmula IC, como se define más arriba, o un N-óxido, un estereoisómero o una sal agrícola o veterinariamente aceptable del mismo, donde sin embargo

R^{2a} es Cl, R^{2b} es H, R^{2c} es Cl, y

R⁶ es N(H)R^{101b}, en donde

R^{101b} se selecciona de -C(O)-N(H)-CH₂CF₃ y los anillos E-1 y E-7, donde en los anillos E-1 y E-7 k es 0.

5 Los Ejemplos de compuestos preferidos son los compuestos de las siguientes fórmulas la.1 a la.4, donde R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} tienen uno de los significados generales o preferidos dados anteriormente para R₂ y las otras variables tienen uno de los significados generales o preferidos dados anteriormente. Ejemplos de compuestos preferidos son los compuestos individuales compilados en las tablas 1 a 7292 a continuación. Además, los significados mencionados a continuación para las variables individuales en las tablas son per se, independientemente de la combinación en la que se mencionan, una realización particularmente preferida de los sustituyentes en cuestión.

10

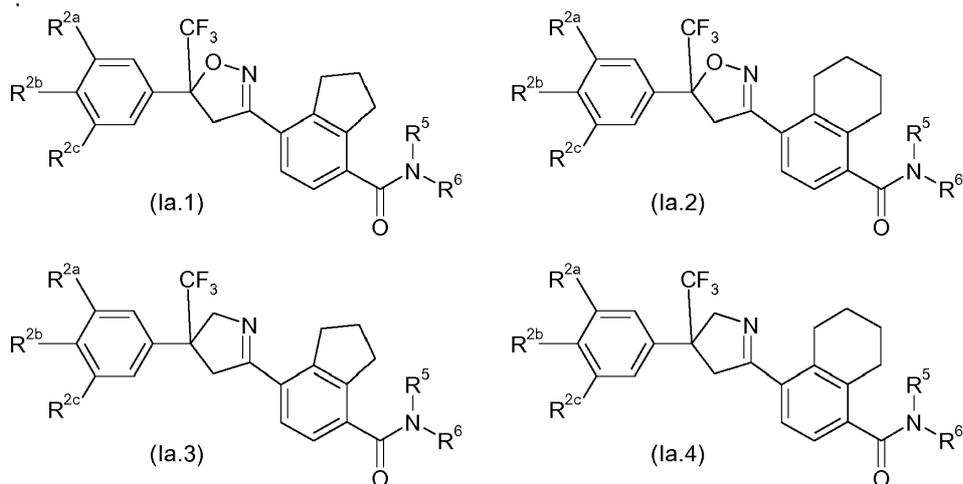


Tabla 1

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es hidrógeno, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

15 Tabla 2

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CN, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 3

20 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 4

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es etilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 5

25 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es n-propilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 6

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es isopropilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

30 Tabla 7

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es n-butilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 8

35 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es sec-butilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 9

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es isobutilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 10

- 5 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es tert-butilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 11

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es CH₂-C(CH₃)₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 10 Tabla 12

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂CN, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 13

- 15 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH=CH₂, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 14

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-CH=CH₂, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 15

- 20 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-CH₂-CH=CH₂, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 16

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-CH=CH-CH₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 25 Tabla 17

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-CCl=CCl₂, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 18

- 30 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -C≡CH, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 19

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂C≡CH, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 20

- 35 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂CH₂C≡CH, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 21

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂CH₂OH, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 40 Tabla 22

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂CH₂OCH₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 23

ES 2 710 217 T3

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂CH₂OCH₂CH₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 24

- 5 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂CH₂OCH₂CH=CH₂, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 25

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂CH₂OCH₂C≡CH, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 26

- 10 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂CH₂OCH₂-ciclopropilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 27

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂CH₂OCF₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 15 Tabla 28

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂CH₂OCH₂CF₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 29

- 20 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂CH₂SCH₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 30

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂CH₂S(O)CH₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 31

- 25 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂CH₂S(O)₂CH₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 32

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂CH₂SCH₂CH₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 30 Tabla 33

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂CH₂S(O)CH₂CH₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 34

- 35 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂CH₂S(O)₂CH₂CH₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 35

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂CH₂S(O)₂CH₂CH=CH₂, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 36

- 40 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂CH₂S(O)₂CH₂C≡CH, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 37

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂CH₂S(O)₂CH₂-ciclopropilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 38

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂CH₂SCF₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 39

- 5 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂CH₂S(O)CF₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 40

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es CH₂CH₂F, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 10 Tabla 41

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es CH₂CHF₂, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 42

- 15 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es CH₂CF₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 43

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es CH₂CH₂CHF₂, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 44

- 20 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es CH₂CH₂CF₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 45

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es CH(CH₃)CF₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 25 Tabla 46

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es CH(CF₃)₂, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 47

- 30 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es CH₂CH₂CH₂CF₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 48

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es ciclopropilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 49

- 35 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 1-ciano-ciclopropilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 50

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 1-(piridin-2-il)-ciclopropilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 40 Tabla 51

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 2,2-difluoro-ciclopropilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 52

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es ciclobutilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 53

- 5 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 1-ciano-ciclobutilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 54

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 3,3-difluorociclobutilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 55

- 10 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es ciclopentilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 56

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 1-ciano-ciclopentilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 15 Tabla 57

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es ciclohexilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 58

- 20 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 1-ciano-ciclohexilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 59

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-ciclopropilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 60

- 25 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-(1-ciano-ciclopropil), R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 61

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-(1-fluoro-ciclopropil), R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 30 Tabla 62

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-(1-cloro-ciclopropil), R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 63

- 35 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-(1-bromo-ciclopropil), R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 64

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-(2,2-difluorociclopropil), R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 65

- 40 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-(2,2-diclorociclopropil), R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 66

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-(2,2-dibromociclopropil), R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 67

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-(1-(difluorometil)-ciclopropil), R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 68

- 5 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-(1-(trifluorometil)-ciclopropil), R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 69

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-ciclobutilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 10 Tabla 70

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-(1-ciano-ciclobutil), R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 71

- 15 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-(1-fluoro-ciclobutil), R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 72

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-(1-cloro-ciclobutil), R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 73

- 20 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-(2,2-difluorociclobutil), R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 74

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-(3,3-difluorociclobutil), R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 25 Tabla 75

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-(2,2,3,3-tetrafluorociclobutil), R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 76

- 30 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-(2,2,3,3,4,4-hexafluorociclobutil), R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 77

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-ciclopentilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 78

- 35 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-(1-fluoro-ciclopentil), R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 79

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-(1-cloro-ciclopentil), R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 40 Tabla 80

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-(1-ciano-ciclopentil), R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 81

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-(2,2-difluorociclopentil), R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 82

- 5 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-(3,3-difluorociclopentil), R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 83

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-ciclohexilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 84

- 10 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-(1-fluorociclohexil), R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 85

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-(1-clorociclohexil), R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 15 Tabla 86

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-(1-cianociclohexil), R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 87

- 20 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es tietan-3-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 88

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 1-oxo-tietan-3-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 89

- 25 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 1,1-dioxo-tietan-3-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 90

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 3-metil-tietan-3-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 30 Tabla 91

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 2,2-dimetil-tietan-3-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 92

- 35 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 3-metil-1-oxo-tietan-3-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 93

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 2,2-dimetil-1-oxo-tietan-3-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 94

- 40 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 3-metil-1,1-dioxo-tietan-3-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 95

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 2,2-dimetil-1,1-dioxo-tietan-3-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 96

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-tietan-3-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 97

- 5 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-(1-oxo-tietan-3-il), R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 98

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-(1,1-dioxo-tietan-3-il), R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 10 Tabla 99

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-tietan-2-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 100

- 15 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-(1-oxo-tietan-2-il), R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 101

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-(1,1-dioxo-tietan-2-il), R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 102

- 20 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es tetrahidrotiofen-3-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 103

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 1-oxo-tetrahidrotiofen-3-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 25 Tabla 104

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 1,1-dioxo-tetrahidrotiofen-3-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 105

- 30 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es fenilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 106

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 2-fluorofenilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 107

- 35 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es piridin-2-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 108

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es piridin-3-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 40 Tabla 109

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es piridin-4-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 110

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es pirimidin-2-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 111

5 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es pirimidin-4-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 112

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es pirimidin-5-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 113

10 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es pirazin-2-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 114

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es piridazin-3-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

15 Tabla 115

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es piridazin-4-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 116

20 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es pirazol-3-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 117

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 1-metilpirazol-3-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 118

25 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es tiazol-2-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 119

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 3-metilisotiazol-5-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

30 Tabla 120

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es oxetan-3-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 121

35 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es tetrahidrofuran-2-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 122

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es tetrahidrofuran-3-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 123

40 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 2-oxotetrahidrofuran-3-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 124

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 1-etil-pirrolidin-3-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 125

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 2-oxopirrolidin-3-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 126

- 5 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 1-metil-2-oxopirrolidin-3-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 127

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 1-etil-2-oxopirrolidin-3-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 10 Tabla 128

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 2-oxo-1-(2,2,2-trifluoroetil)-pirrolidin-3-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 129

- 15 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 3-oxo-isoxazolidin-4-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 130

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 2-metil-3-oxo-isoxazolidin-4-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 131

- 20 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 2-etil-3-oxo-isoxazolidin-4-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 132

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 2-propilo-3-oxo-isoxazolidin-4-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 25 Tabla 133

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 2-butilo-3-oxo-isoxazolidin-4-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 134

- 30 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 2-(but-2-il)-3-oxo-isoxazolidin-4-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 135

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 2-(2-fluoroetil)-3-oxo-isoxazolidin-4-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 136

- 35 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 2-(2,2-difluoroetil)-3-oxo-isoxazolidin-4-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 137

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 2-(2,2,2-trifluoroetil)-3-oxo-isoxazolidin-4-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 40 Tabla 138

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 2-(3,3,3-trifluoropropil)-3-oxo-isoxazolidin-4-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 139

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 1-metil-5-oxo-1,2,4-triazol-4-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 140

- 5 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es azetidín-3-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 141

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 1-acetil-azetidín-3-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 142

- 10 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es NH₂, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 143

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -NH-fenilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 15 Tabla 144

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -NH-piridin-2-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 145

- 20 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -NH-piridin-3-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 146

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -NH-piridin-4-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 147

- 25 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -NH-pirimidin-2-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 148

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -NH-pirimidin-4-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 30 Tabla 149

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -NH-pirimidin-5-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 150

- 35 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -N(CH₃)-pirimidín-2-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 151

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-COOCH₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 152

- 40 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-COO-CH₂CH₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 153

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-CONH₂, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 154

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-CONH-CH₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 155

- 5 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-CONH-CH₂CH₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 156

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-CONH-CH₂CH₂CH₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 10 Tabla 157

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-CONH-isopropilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 158

- 15 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-CONH-CH₂CH₂F, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 159

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-CONH-CH₂CHF₂, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 160

- 20 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-CONH-CH₂CF₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 161

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-CONH-CH(CF₃)CH₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 25 Tabla 162

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-CONH-CH(CF₃)₂, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 163

- 30 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-CONH-CH₂CH₂CHF₂, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 164

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-CONH-CH₂CH₂CF₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 165

- 35 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH(CH₃)-CONH-CH₂CF₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 166

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-CONH-ciclopropilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 40 Tabla 167

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-CONH-CH₂CN, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 168

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-CONH-CH₂CH=CH₂, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 169

- 5 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-CONH-CH₂C≡CH, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 170

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-CONH-CH₂-ciclopropilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 171

- 10 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-CONH-CH₂-(1-ciano-ciclopropil), R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 172

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-CONH-tietan-3-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 15 Tabla 173

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-CONH-1-oxo-tietan-3-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 174

- 20 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH₂-CONH-1,1-dioxo-tietan-3-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 175

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es bencilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 176

- 25 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es piridin-2-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 177

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es piridin-3-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 30 Tabla 178

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es piridin-4-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 179

- 35 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 6-(trifluorometil)-piridin-4-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 180

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es pirimidin-2-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 181

- 40 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es pirimidin-4-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 182

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es pirimidin-5-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 183

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es (4-fluoropirimidin-2-il)-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 184

- 5 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es (5-fluoropirimidin-2-il)-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 185

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es (4-cloropirimidin-2-il)-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 10 Tabla 186

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es (5-cloropirimidin-2-il)-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 187

- 15 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es (4-bromopirimidin-2-il)-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 188

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es (5-bromopirimidin-2-il)-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 189

- 20 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es (4-metilpirimidin-2-il)-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 190

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es (5-metilpirimidin-2-il)-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 25 Tabla 191

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es (4,6-dimetilpirimidin-2-il)-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 192

- 30 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es (4-(trifluorometil)-pirimidin-2-il)-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 193

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es (5-(trifluorometil)-pirimidin-2-il)-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 194

- 35 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es (4,6-bis(trifluorometil)-pirimidin-2-il)-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 195

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es (4-metil-6-(trifluorometil)-pirimidin-2-il)-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 40 Tabla 196

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es piridazin-3-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 197

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es piridazin-4-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 198

- 5 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es pirazin-2-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 199

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es pirazol-3-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 200

- 10 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 1-metilpirazol-3-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 201

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 2-metilpirazol-3-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 15 Tabla 202

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es tien-2-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 203

- 20 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es tien-3-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 204

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es tiazol-2-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 205

- 25 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es tiazol-4-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 206

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es tiazol-5-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 30 Tabla 207

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es isotiazol-3-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 208

- 35 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es isotiazol-4-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 209

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es isotiazol-5-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 210

- 40 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es oxazol-2-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 211

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es oxazol-4-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 212

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es oxazol-5-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 213

- 5 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es isoxazol-3-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 214

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es isoxazol-4-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 10 Tabla 215

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es isoxazol-5-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 216

- 15 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 1,2,3-1H-triazol-4-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 217

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 1-metil-1,2,3-triazol-4-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 218

- 20 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 1,2,4-1H-triazol-3-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 219

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 1-metil-1,2,4-triazol-3-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 25 Tabla 220

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 4-metil-1,2,4-triazol-3-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 221

- 30 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 1,2,4-oxadiazol-3-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 222

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 1,3,4-tiadiazol-2-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 223

- 35 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 1,2,3,4-1H-tetrazol-5-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 224

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 1-metil-1,2,3,4-tetrazol-5-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 40 Tabla 225

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 1,2,3,4-2H-tetrazol-5-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 226

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 2-metil-1,2,3,4-tetrazol-5-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 227

- 5 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es tetrahidrofuran-2-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 228

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es tetrahidrofuran-3-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 229

- 10 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 1,3-dioxolan-2-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 230

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 2-(1,3-dioxolan-2-il)-etilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 15 Tabla 231

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 2-piridilo-eth-1-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 232

- 20 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es (1R)-2-piridilo-eth-1-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 233

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es (1S)-2-piridilo-eth-1-ilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 234

- 25 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es 1,3-dioxan-2-ilo-metilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 235

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CONH₂, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 30 Tabla 236

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CONH-CH₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 237

- 35 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CONH-CH₂CH₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 238

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CONH-ciclopropilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 239

- 40 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -NHCO-NH-CH₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 240

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -NHCO-NH-CH₂CH₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 241

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -NHCO-NH-CH₂CH₂CH₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 242

- 5 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -NHCO-NH-CH(CH₃)₂, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 243

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -NHCO-NH-CH₂CF₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 10 Tabla 244

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -NHCO-NH-CH₂CHF₂, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 245

- 15 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -NHCO-NH-CH(CH₃)CF₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 246

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -NHCO-NH-CH(CF₃)₂, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 247

- 20 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -NHCO-NH-CH₂CN, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 248

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -NHCO-NH-CH₂-CH=CH₂, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 25 Tabla 249

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -NHCO-NH-CH₂-CH≡CH, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 250

- 30 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -NHCO-NH-ciclopropilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 251

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -NHCO-NH-(1-cianociclopropil), R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 252

- 35 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -NHCO-NH-ciclobutilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 253

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -NHCO-NH-(1-cianociclobutil), R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 40 Tabla 254

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -NHCO-NH-CH₂-ciclopropilo, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 255

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -NHCO-NH-CH₂-(1-cianociclopropil), R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 256

- 5 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH=NOCH₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 257

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH=NOCH₂CH₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 258

- 10 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH=NOCH₂CF₃, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 259

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH=NOCH₂CH=CH₂, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 15 Tabla 260

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es -CH=NOCH₂C≡CH, R⁵ es hidrógeno, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tablas 261 a 520

- 20 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es como se define en las tablas 1 a 260, R⁵ es metilo, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tablas 521 a 780

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es como se define en las tablas 1 a 260, R⁵ es etilo, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tablas 781 a 1040

- 25 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es como se define en las tablas 1 a 260, R⁵ es alilo, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tablas 1041 a 1300

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es como se define en las tablas 1 a 260, R⁵ es propargilo, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 30 Tablas 1301 a 1560

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es como se define en las tablas 1 a 260, R⁵ es -CH₂-CN, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tablas 1561 a 1820

- 35 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁶ es como se define en las tablas 1 a 260, R⁵ es -CH₂-OCH₃, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 1821

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁵ y R⁶ forman juntos =S(CH₂CH₃)₂ y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 1822

- 40 Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁵, R⁶ y el átomo de nitrógeno al que están unidos forman juntos 3-etil-4-oxoimidazolidin-1-ilo y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla 1823

ES 2 710 217 T3

Compuestos de la fórmula la.1 en la que R⁵, R⁶ y el átomo de nitrógeno al que están unidos forman juntos 4-oxo-3-(2,2,2-trifluoroetil)-imidazolidin-1-ilo y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tablas 1824 a 3646

- 5 Compuestos de la fórmula la.2 en R⁵ y R⁶ son como se definen en las tablas 1 a 1823, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tablas 3647 a 5469

Compuestos de la fórmula la.3 en R⁵ y R⁶ son como se definen en las tablas 1 a 1823, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- 10 Tablas 5470 a 7292

Compuestos de la fórmula la.4 en R⁵ y R⁶ son como se definen en las tablas 1 a 1823, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

Tabla A

No.	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}
A-1	F	H	F
A-2	F	F	F
A-3	F	Cl	F
A-4	F	Br	F
A-5	F	H	Cl
A-6	F	H	Br
A-7	Cl	H	Cl
A-8	Cl	Cl	Cl
A-9	Cl	F	Cl
A-10	Cl	Br	Cl
A-11	Cl	H	Br
A-12	Br	H	Br
A-13	Br	F	Br
A-14	Br	Cl	Br
A-15	CF ₃	H	F
A-16	CF ₃	H	Cl
A-17	CF ₃	H	Br
A-18	CF ₃	H	CF ₃

No.	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}
A-19	CF ₃	F	F
A-20	CF ₃	Cl	Cl
A-21	CF ₃	Br	Br
A-22	OCF ₃	H	F
A-23	OCF ₃	H	Cl
A-24	OCF ₃	H	Br
A-25	OCF ₃	H	CF ₃
A-26	OCF ₃	H	H
A-27	CF ₃	H	H
A-28	Br	H	H
A-29	Cl	H	H
A-30	F	H	H
A-31	Cl	F	H

Entre los compuestos anteriores, se da preferencia a los compuestos la.1 y la.3.

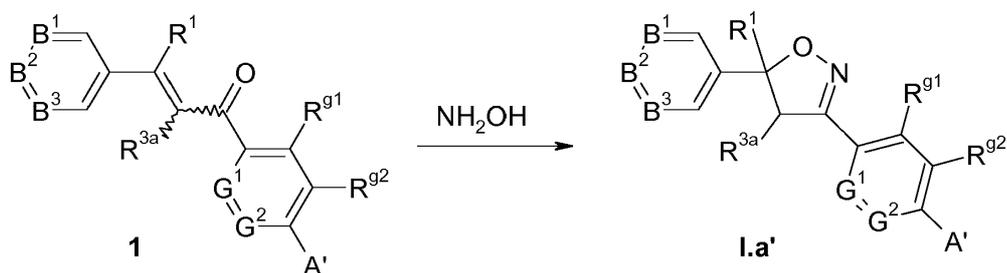
En una realización específica, los compuestos I se seleccionan de los compuestos especificados en los ejemplos, ya sea como una base libre o en forma de una sal agrícola o veterinariamente aceptable, un N-óxido o un estereoisómero de los mismos.

5

Los compuestos de la fórmula (I) pueden prepararse mediante los métodos descritos en los esquemas a continuación o en las descripciones de síntesis de los ejemplos de trabajo, o mediante métodos estándar de química orgánica. Los sustituyentes, variables e índices son como se definieron anteriormente para la fórmula (I), si no se especifica otra cosa.

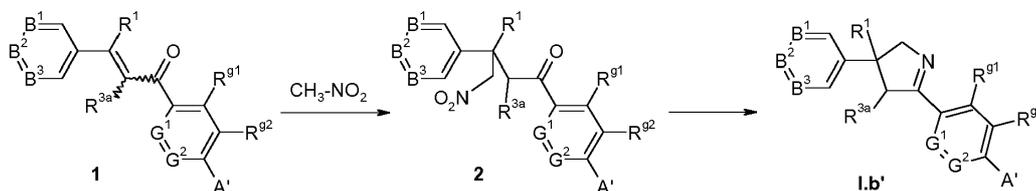
- 10 Los compuestos de fórmula I en donde X¹ es O y en donde R^{3b} es hidrógeno (denominado a continuación como compuestos I.a) pueden prepararse haciendo reaccionar un compuesto de fórmula 1 como se muestra en el esquema 1 a continuación en una reacción de iminación /adición Michael con hidroxilamina. A' es A o un precursor de A. Los precursores típicos de A son un átomo de halógeno, CN, carboxi, C(O) OR^{z1} (carboxi y C(O)OR^{z1} son, por supuesto, solo "precursores" si en el compuesto I deseado W es S y/o R^{z1} no es el radical deseado R⁹ y/o si Y debe ser -NR⁵R⁶)
- 15 o -OSO₂-R^{z1}, donde R^{z1} es C₁-C₄ alquilo, C₁-C₄ haloalquilo o fenilo que puede estar sustituido por 1, 2 o 3 radicales seleccionados de C₁-C₄ alquilo, C₁-C₄ haloalquilo C₁-C₄ alcoxi o C₁-C₄ haloalcoxi. Los compuestos I' corresponden a los compuestos I cuando A' es A. Los compuestos I.a' corresponden a los compuestos I.a cuando A' es A. Las condiciones de reacción adecuadas se describen, por ejemplo, en el documento WO 2012/158396. Adecuadamente, se usa hidroxilamina como la sal de hidrocloreuro. La reacción se lleva a cabo generalmente en presencia de una base, tal como NaOH, KOH, Na₂CO₃ y similares. Los disolventes adecuados son acuosos, tales como agua o mezclas de agua con disolventes polares, tales como tetrahidrofurano, dioxano y alcoholes inferiores. Si es necesario (es decir, si A' es un precursor de A), A' se convierte en un grupo A.
- 20

Scheme 1



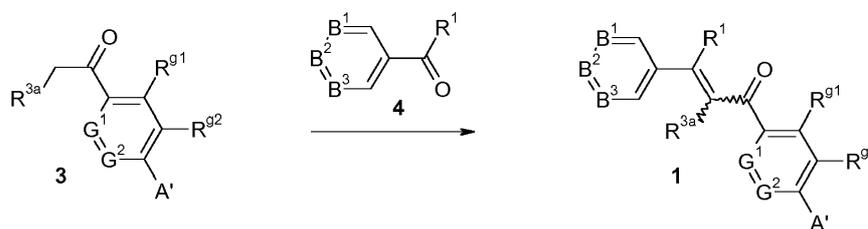
Los compuestos de fórmula I en la que X¹ es CH₂ y en la que R^{3b} es hidrógeno (denominado a continuación como compuestos Ib) se pueden preparar sometiendo primero un compuesto de fórmula 1 a una adición de Michael con nitrometano a 2, luego reduciendo el grupo nitro de 2 a un grupo amino. La aminocetona resultante reacciona espontáneamente a la pirrolina I.b', como se muestra en el esquema 2 a continuación. Los compuestos I.b' corresponden a los compuestos I.b cuando A' es A. Las condiciones de reacción adecuadas se describen, por ejemplo, en el documento US 2010/0298558. La adición de Michael de nitrometano a 1 se lleva a cabo en presencia de una base. Las bases adecuadas son, por ejemplo, hidróxidos alcalinos y alcoholatos, pero preferiblemente se usan bases no nucleófilas, tales como DBN o DBU. Los disolventes adecuados dependen de i.a. en la base utilizada. Si se usa un hidróxido alcalino, adecuadamente se usa un medio acuoso, tal como agua de mezclas de los mismos con alcoholes inferiores, mientras que los alcóxidos se usan en el alcohol respectivo. Si se usan bases no nucleófilas, se prefieren los disolventes polares, no próticos, tales como acetonitrilo, tetrahidrofurano, dioxano y similares. Si es necesario (es decir, si A' es un precursor de A), A' se convierte en un grupo A. La reducción de 2 se realiza con un agente de reducción adecuado, tal como las sales de Zn, Sn, Sn(II), Fe o agentes productores de hidrógeno, tales como formiato de amonio en presencia de Zn o Pd.

Scheme 2



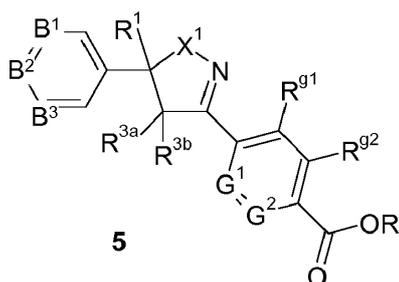
El compuesto 1 se puede preparar de forma análoga al método descrito en el documento EP-A-2172462 y como se muestra en el esquema 3 a continuación, sometiendo las cetonas 3 y 4 a una condensación aldólica.

Scheme 3



La cetona 3 se puede obtener en analogía con el método descrito en el documento US 2011/0152246.

Los compuestos I en los que W es O se pueden preparar haciendo reaccionar un compuesto I' en donde A' es Cl, Br, I o triflato con monóxido de carbono en presencia de un catalizador de paladio y un alcohol ROH, en donde R es alquilo C₁-C₄, a un compuesto de fórmula 5. Catalizadores de paladio adecuados son, por ejemplo, los descritos en el documento WO 2011/161130.



Si se desea, este éster es entonces hidrolizado al ácido carboxílico respectivo, que luego se hace reaccionar bajo condiciones de amidación estándar con una amina NHR^6 . La hidrolización se puede llevar a cabo bajo condiciones estándar, por ejemplo bajo condiciones ácidas utilizando, por ejemplo, ácido clorhídrico, ácido sulfúrico o ácido trifluoroacético, o bajo condiciones básicas utilizando, por ejemplo, un hidróxido de metal alcalino, tal como LiOH, NaOH o KOH. La amidación se lleva a cabo preferiblemente mediante la activación de los ácidos carboxílicos con cloruro de oxalilo $[(\text{COCl})_2]$ o cloruro de tionilo (SOCl_2) a los respectivos cloruros de ácido, seguido de reacción con una amina NHR^6 . Alternativamente, la amidación se lleva a cabo en presencia de un reactivo de acoplamiento. Los reactivos de acoplamiento adecuados (activadores) son bien conocidos y, por ejemplo, se seleccionan de carbodiimidias, tal como DCC (diciclohexilcarbodiimida) y DCI (diisopropilcarbodiimida), derivados de benzotriazol, tal como HATU (hexafluorofosfato de O-(7-azabenzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio), HBTU (hexafluorofosfato de (O-benzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio) y HCTU (tetrafluoroborato de 1H-benzotriazol-1-[bis(dimetilamino)metileno]-5-cloro) y activadores derivados de fosfonio, tal como BOP (hexafluorofosfato de (benzotriazol-1-iloxi)-tris (dimetil-amino)fosfonio), y Py-BOP (hexafluorofosfato de (benzotriazol-1-iloxi)-tripirrolidinofosfonio) y Py-BrOP (hexafluorofosfato de bromotripirrolidinofosfonio). Generalmente, el activador se utiliza en exceso. Los reactivos de acoplamiento de benzotriazol y fosfonio se utilizan generalmente en un medio básico.

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

Los compuestos I en los que Y es OH se pueden preparar a partir de los compuestos I en donde Y es hidrógeno a través de la oxidación de este grupo aldehído A. Las condiciones adecuadas son, por ejemplo, las de la oxidación de Pinnick o Lindgren usando un clorito, como el clorito de sodio NaClO_2 como agente de oxidación. Como eliminador del hipoclorito (HOCl) formado en la reacción, se puede usar 2-metil-2-buteno o peróxido de hidrógeno. La oxidación de Pinnick o Lindgren generalmente se lleva a cabo en un solvente que contiene agua en condiciones amortiguadas ligeramente ácidas (pH aprox. 3-5; uso de un fosfato de hidrógeno, por ejemplo, NaH_2PO_4). Otras condiciones de oxidación adecuadas se describen, por ejemplo, en el documento WO 2011/022337. El ácido carboxílico resultante puede luego esterificarse adicionalmente para dar compuestos I en donde Y es OR^9 , en donde R^9 no es hidrógeno, o someterse a una amidación como se describe anteriormente para proporcionar compuestos I en donde Y es NR^5R^6 .

Los compuestos I en los que R^{3b} no es hidrógeno se pueden preparar a partir de los compuestos I.a' o I.b' en analogía con los métodos descritos en el documento WO 2010/020521 haciendo reaccionar éstos con una base, tal como diisopropilamina de litio, seguido de la adición de un electrófilo, por ejemplo un agente halogenante, tal como difluoruro de 4-yodotolueno, N-fluorobencenosulfonimida ("NFSI"), N-clorosuccinimida ("NCS"), N-bromosuccinimida ("NBS") o N-yodosuccinimida ("NIS"), un agente alquilante, tal como un haluro de alquilo, por ejemplo, yoduro de metilo, un agente de sulfanilación, tal como cloruro de metanosulfenilo ($\text{CH}_3\text{S}-\text{Cl}$), metanotiosulfonato de S-metilo ($\text{CH}_3\text{SO}_2-\text{SCH}_3$) o dimetildisulfuro ($\text{CH}_3\text{S}-\text{SCH}_3$), o, para la introducción de OH, un agente de hidroxilación, tal como oxaziridinas (por ejemplo), N-sulfonil oxaziridinas u oxodiperoximolibdenio (piridina)-(hexametil-fosfórico triamida) ("MoOPH").

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

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 mediante cromatografía, por ejemplo sobre alúmina o sobre sílica gel. Algunos de los productos intermedios y productos finales se pueden obtener en forma de aceites viscosos incoloros o de color marrón pálido que se liberan o purifican a partir de componentes volátiles bajo presión reducida y a una temperatura moderadamente elevada. Si los productos intermedios y los productos finales se obtienen como sólidos, se pueden purificar por recristalización o trituración.

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

En consecuencia, la presente invención también proporciona un método para controlar plagas de invertebrados, cuyo método comprende tratar las plagas, su suministro de alimentos, su hábitat o sus terrenos de crianza o una planta cultivada, materiales de propagación de plantas (tales como semillas), suelo, área, material o entorno en el cual las plagas crecen o pueden crecer, o los materiales, las plantas cultivadas, los materiales de propagación de las plantas (tal como semillas), los suelos, las superficies o los espacios que deben protegerse contra el ataque o la infestación de plagas con una cantidad efectiva como pesticida de un compuesto de la presente invención o una composición como se define anteriormente. La invención también se refiere al uso de un compuesto de la invención, de un estereoisómero y/o de una sal agrícola o veterinariamente aceptable del mismo para combatir plagas de invertebrados.

Preferiblemente, el método de la invención sirve para proteger el material de propagación de la planta (como la semilla) y la planta que crece a partir del ataque de plagas de invertebrados o infestación y comprende tratar el material de propagación de la planta (como la semilla) con una cantidad efectiva como pesticida de un compuesto de la presente invención como se define anteriormente o con una cantidad efectiva como pesticida de una composición agrícola como se define más atrás y más adelante. El método de la invención no se limita a la protección del "sustrato" (planta, materiales de propagación de plantas, material del suelo, etc.) que se ha tratado de acuerdo con la invención, sino que también tiene un efecto preventivo, por lo tanto, por ejemplo, de acuerdo con protección a una planta que crece a partir de materiales de propagación de plantas tratadas (como semillas), la planta en sí no ha sido tratada.

Alternativamente, preferiblemente, el método de la invención sirve para proteger a las plantas del ataque o la infestación por plagas de invertebrados, método que comprende tratar las plantas con una cantidad efectiva como pesticida de al menos un compuesto de la invención, uno de sus estereoisómeros y/o al menos una sal aceptable desde el punto de vista agrícola de los mismos.

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

La invención proporciona además una composición agrícola para combatir plagas de invertebrados, que comprende una cantidad tal de al menos un compuesto de acuerdo con la invención y al menos un vehículo inerte líquido y/o sólido agrónomicamente aceptable que tiene una acción pesticida y, si se desea, a menos un surfactante. Tal composición puede comprender un solo compuesto activo de la presente invención o una mezcla de varios compuestos activos de la presente invención. La composición de acuerdo con la presente invención puede comprender un isómero individual o mezclas de isómeros o una sal, así como tautómeros individuales o mezclas de tautómeros.

Los compuestos de la presente invención, incluyendo sus sales, estereoisómeros y tautómeros, son en particular adecuados para controlar eficientemente plagas artrópodas tales como arácnidos, mirípedos e insectos, así como nematodos. Son especialmente adecuados para combatir o controlar eficientemente las siguientes plagas:

insectos del orden de los lepidopterans (Lepidoptera), por ejemplo *Acronicta major*, *Adoxophyes orana*, *Aedia leucomelas*, *Agrotis* spp. tal como *Agrotis fucosa*, *Agrotis segetum*, *Agrotis ypsilon*; *Alabama argillacea*, *Anticarsia gemmatalis*, *Anticarsia* spp., *Argyrestia conjugella*, *Autographa gamma*, *Barathra brassicae*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia murinana*, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Carpocapsa pomonella*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo* spp. tal como *Chilo suppressalis*; *Choristoneura fumiferana*, *Choristoneura occidentalis*, *Cirphis unipuncta*, *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocerus* spp., *Cydia pomonella*, *Dendrolimus pini*, *Diaphania nitidalis*, *Diatraea grandiosella*, *Earias insulana*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Ephestia cautella*, *Ephestia kuehniella*, *Eupoecilia ambiguella*, *Euproctis chryorrhoea*, *Euxoa* spp., *Evetria bouliana*, *Feltia* spp. tal como *Feltia subterranean*; *Galleria mellonella*, *Grapholitha funebrana*, *Grapholitha molesta*, *Helicoverpa* spp. tal como *Helicoverpa armigera*, *Helicoverpa zea*; *Heliothis* spp. tal como *Heliothis armigera*, *Heliothis virescens*, *Heliothis zea*; *Hellula undalis*, *Hibernia defoliaria*, *Hofmannophila pseudospretella*, *Homona magnanima*, *Hyphantria cunea*, *Hyponomeuta padella*, *Hyponomeuta malinellus*, *Keiferia lycopersicella*, *Lambdina fiscellaria*, *Laphygma* spp. tal como *Laphygma exigua*; *Leucoptera coffeella*, *Leucoptera scitella*, *Lithocolletis blancardella*, *Lithophane antennata*, *Lobesia botrana*, *Loxagrotis albicosta*, *Loxostege sticticalis*, *Lymantria* spp. tal como *Lymantria dispar*, *Lymantria monacha*; *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*, *Mamestra* spp. tal como *Mamestra brassicae*; *Mocis repanda*, *Mythimna separata*, *Orgyia pseudotsugata*, *Oria* spp., *Ostrinia* spp. tal como *Ostrinia nubilalis*; *Oulema oryzae*, *Panolis flammea*, *Pectinophora* spp. tal como *Pectinophora gossypiella*; *Peridroma saucia*, *Phalera bucephala*, *Phthorimaea* spp. tal como *Phthorimaea operculella*; *Phyllocnistis citrella*, *Pieris* spp. tal como *Pieris brassicae*, *Pieris rapae*; *Plathypena scabra*, *Plutella maculipennis*, *Plutella xylostella*, *Prodenia* spp., *Pseudaletia* spp., *Pseudoplenia includens*, *Pyrausta nubilalis*, *Rhyacionia frustrana*, *Scrobipalpa absoluta*, *Sitotroga cerealella*, *Sparganothis pilleriana*, *Spodoptera* spp. tal como *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera littoralis*, *Spodoptera litura*; *Thaumtopoea pityocampa*, *Thermesia gemmatalis*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia* spp. tal como *Trichoplusia ni*; *Tuta absoluta*, y *Zeiraphera canadensis*,

escarabajos (Coleoptera), por ejemplo *Acanthoscehdus obtectus*, *Adoretus* spp., *Agelastica alni*, *Agrilus sinuatus*, *Agriotes* spp. tal como *Agriotes fuscicollis*, *Agriotes lineatus*, *Agriotes obscurus*; *Amphimallus solstitialis*, *Anisandrus dispar*, *Anobium punctatum*, *Anomala rufocuprea*, *Anoplophora* spp. tal como *Anoplophora glabripennis*; *Anthonomus*

- spp. tal como *Anthonomus grandis*, *Anthonomus pomorum*; *Anthrenus* spp., *Aphthona euphoridae*, *Apogonia* spp., *Athous haemorrhoidalis*, *Atomaria* spp. tal como *Atomaria linearis*; *Attagenus* spp., *Aulacophora femoralis*, *Blastophagus piniperda*, *Blitophaga undata*, *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp. tal como *Bruchus lentis*, *Bruchus pisorum*, *Bruchus rufimanus*; *Byctiscus betulae*, *Callosobruchus chinensis*, *Cassida nebulosa*, *Cerotoma trifurcata*,
5 *Cetonia aurata*, *Ceuthorrhynchus* spp. tal como *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Ceuthorrhynchus napi*; *Chaetocnema tibialis*, *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp. tal como *Conoderus vespertinus*; *Cosmopolites* spp., *Costelytra zealandica*, *Crioceris asparagi*, *Cryptorhynchus lapathi*, *Ctenicera* spp. tal como *Ctenicera destructor*; *Curculio* spp., *Dectes texanus*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp. tal como *Diabrotica 12-punctata* *Diabrotica speciosa*, *Diabrotica longicornis*, *Diabrotica semipunctata*, *Diabrotica virgifera*; *Epilachna* spp. tal como *Epilachna varivestis*, *Epilachna vigintioctomaculata*; *Epitrix* spp. tal como *Epitrix hirtipennis*; *Eutinobothrus brasiliensis*, *Faustinus cubae*, *Gibbium psylloides*, *Heteronychus arator*, *Hylamorpha elegans*, *Hyllobius abietis*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera brunneipennis*, *Hypera postica*, *Hypothenemus* spp., *Ips typographus*, *Lachnosterna consanguinea*, *Lema bilineata*, *Lema melanopus*, *Leptinotarsa* spp. tal como *Leptinotarsa decemlineata*; *Limonius californicus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lixus* spp., *Lyctus* spp. tal como *Lyctus bruneus*; *Melanotus communis*, *Meligetes* spp. tal como *Meligetes aeneus*; *Melolontha hippocastani*, *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp. tal como *Monochamus alternatus*; *Naupactus xanthographus*, *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Otiorrhynchus ovatus*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Oulema oryzae*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllobius piri*, *Phyllopertha horticola*, *Phyllophaga* spp., *Phyllotreta* spp. tal como *Phyllotreta chrysocephala*, *Phyllotreta nemorum*, *Phyllotreta striolata*; *Phyllophaga* spp., *Phyllopertha horticola*, *Popillia japonica*,
10 *Premnotypes* spp., *Psylliodes chrysocephala*, *Ptinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizopertha dominica*, *Sitona lineatus*, *Sitophilus* spp. tal como *Sitophilus granaria*, *Sitophilus zeamais*; *Sphenophorus* spp. tal como *Sphenophorus levis*; *Sternechus* spp. tal como *Sternechus subsignatus*; *Symphyletes* spp., *Tenebrio molitor*, *Tribolium* spp. tal como *Tribolium castaneum*; *Trogoderma* spp., *Tychius* spp., *Xylotrechus* spp., y *Zabrus* spp. tal como *Zabrus tenebrioides*,
15 moscas, mosquitos (Diptera), por ejemplo *Aedes* spp. tal como *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes vexans*; *Anastrepha ludens*, *Anopheles* spp. tal como *Anopheles albimanus*, *Anopheles crucians*, *Anopheles freeborni*, *Anopheles gambiae*, *Anopheles leucosphyrus*, *Anopheles maculipennis*, *Anopheles minimus*, *Anopheles quadrimaculatus*, *Anopheles sinensis*; *Bibio hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*, *Calliphora vicina*, *Ceratitis capitata*, *Ceratitidis capitata*, *Chrysomya* spp. tal como *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*; *Chrysops atlanticus*, *Chrysops discalis*, *Chrysops silacea*, *Cochliomyia* spp. tal como *Cochliomyia hominivorax*;
20 *Contarinia* spp. tal como *Contarinia sorghicola*; *Cordylobia anthropophaga*, *Culex* spp. tal como *Culex nigripalpus*, *Culex pipiens*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex tarsalis*, *Culex tritaeniorhynchus*; *Culicoides furens*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Cuterebra* spp., *Dacus cucurbitae*, *Dacus oleae*, *Dasineura brassicae*, *Delia* spp. tal como *Delia antiqua*, *Delia coarctata*, *Delia platura*, *Delia radicum*; *Dermatobia hominis*, *Drosophila* spp., *Fannia* spp. tal como *Fannia canicularis*; *Gastrophilus* spp. tal como *Gasterophilus intestinalis*; *Geomyza tripunctata*, *Glossina fuscipes*,
25 *Glossina morsitans*, *Glossina palpalis*, *Glossina tachinoides*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hippelates* spp., *Hylemyia* spp. tal como *Hylemyia platura*; *Hypoderma* spp. tal como *Hypoderma lineata*; *Hyppobosca* spp., *Leptoconops torrens*, *Liriomyza* spp. tal como *Liriomyza sativae*, *Liriomyza trifolii*; *Lucilia* spp. tal como *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*; *Lycoria pectoralis*, *Mansonina titillanus*, *Mayetiola* spp. tal como *Mayetiola destructor*;
30 *Musca* spp. tal como *Musca autumnalis*, *Musca domestica*; *Muscina stabulans*, *Oestrus* spp. tal como *Oestrus ovis*; *Opomyza florum*, *Oscinella* spp. tal como *Oscinella frit*; *Pegomya hysocyami*, *Phlebotomus argentipes*, *Phorbia* spp. tal como *Phorbia antiqua*, *Phorbia brassicae*, *Phorbia coarctata*; *Prosimulium mixtum*, *Psila rosae*, *Psorophora columbiae*, *Psorophora discolor*, *Rhagoletis cerasi*, *Rhagoletis pomonella*, *Sarcophaga* spp. tal como *Sarcophaga haemorrhoidalis*; *Simulium vittatum*, *Stomoxis* spp. tal como *Stomoxis calcitrans*; *Tabanus* spp. tal como *Tabanus atratus*, *Tabanus bovinus*, *Tabanus lineola*, *Tabanus similis*; *Tannia* spp., *Tipula oleracea*, *Tipula paludosa*, y
35 *Wohlfahrtia* spp.,
trips (Thysanoptera), por ejemplo *Baliothrips biformis*, *Dichromothrips corbetti*, *Dichromothrips* ssp., *Enneothrips flavens*, *Frankliniella* spp. tal como *Frankliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella tritici*; *Heliothrips* spp., *Hercinothrips femoralis*, *Kakothrips* spp., *Rhipiphorothrips cruentatus*, *Scirtothrips* spp. tal como *Scirtothrips citri*; *Taeniothrips cardamoni*, *Thrips* spp. tal como *Thrips oryzae*, *Thrips palmi*, *Thrips tabaci*;
40 termitas (Isoptera), por ejemplo *Calotermes flavicollis*, *Coptotermes formosanus*, *Heterotermes aureus*, *Heterotermes longiceps*, *Heterotermes tenuis*, *Leucotermes flavipes*, *Odontotermes* spp., *Reticulitermes* spp. tal como *Reticulitermes speratus*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes grassei*, *Reticulitermes lucifugus*, *Reticulitermes santonensis*, *Reticulitermes virginicus*; *Termes natalensis*,
cucarachas (Blattaria-Blattodea), por ejemplo *Acheta domesticus*, *Blatta orientalis*, *Blattella asahinae*, *Blattella germanica*, *Grylotalpa* spp., *Leucophaea maderae*, *Locusta* spp., *Melanoplus* spp., *Periplaneta americana*, *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta japonica*,
45 bichos, áfidos, saltamontes, moscas blancas, insectos escamosos, cigarras (Hemiptera), por ejemplo *Acrosternum* spp. tal como *Acrosternum hilare*; *Acyrtosiphon* spp. tal como *Acyrtosiphon onobrychis*, *Acyrtosiphon pisum*; *Adelges laricis*, *Aeneolamia* spp., *Agonosceca* spp., *Aleurodes* spp., *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus* spp.,
50 *Amrasca* spp., *Anasa tristis*, *Antestiopsis* spp., *Anuraphis cardui*, *Aonidiella* spp., *Aphanostigma piri*, *Aphidula nasturtii*, *Aphis* spp. tal como *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis gossypii*, *Aphis grossulariae*, *Aphis pomi*, *Aphis sambuci*, *Aphis schneideri*, *Aphis spiraeicola*; *Arboridia apicalis*, *Arilus critatus*, *Aspidiella* spp., *Aspidiotus* spp., *Atanus* spp.,

- 5
10
15
20
25
30
35
- Aulacorthum solani, Bemisia spp. tal como Bemisia argentifolii, Bemisia tabaci; Blissus spp. tal como Blissus leucopterus; Brachycaudus cardui, Brachycaudus helichrysi, Brachycaudus persicae, Brachycaudus prunicola, Brachycolus spp., Brevicoryne brassicae, Calligypona marginata, Calocoris spp., Campylomma livida, Capitophorus horni, Carnecephala fulgida, Cavellerius spp., Ceraplastes spp., Ceratovacuna lanigera, Cercopidae, Cerosipha gossypii, Chaetosiphon fragaefolii, Chionaspis tegalensis, Chlorita onukii, Chromaphis juglandicola, Chrysomphalus ficus, Cicadulina mbila, Cimex spp. tal como Cimex hemipterus, Cimex lectularius; Coccomytilus halli, Coccus spp., Creontiades dilutus, Cryptomyzus ribis, Cryptomyzus ribis, Cyrtopeltino esatus, Dalbulus spp., Dasynus piperis, Dialeurades spp., Diaphorina spp., Diaspis spp., Dichelops furcatus, Diconocoris hewetti, Doralis spp., Dreyfusia nordmanniana, Dreyfusia piceae, Drosicha spp., Dysaphis spp. tal como Dysaphis plantaginea, Dysaphis piri, Dysaphis radicola; Dysaulacorthum pseudosolani, Dysdercus spp. tal como Dysdercus cingulatus, Dysdercus intermedius; Dysmicoccus spp., Empoasca spp. tal como Empoasca fabae, Empoasca solana; Eriosoma spp., Erythroneura spp., Eurygaster spp. tal como Eurygaster integriceps; Euscelis bilobatus, Euschistus spp. tal como Euschistus heros, Euschistus impictiventris, Euschistus servus; Geococcus coffeae, Halyomorpha spp. tal como Halyomorpha halys; Heliopeltis spp., Homalodisca coagulata, Horcias nobilellus, Hyalopterus pruni, Hyperomyzus lactucae, Icerya spp., Idiocerus spp., Idioscopus spp., Laodelphax striatellus, Lecanospila spp., Lepidosaphes spp., Leptocoris spp., Leptoglossus phyllopus, Lipaphis erysimi, Lygus spp. tal como Lygus hesperus, Lygus lineolaris, Lygus pratensis; Macropes excavatus, Macrosiphum spp. tal como Macrosiphum rosae, Macrosiphum avenae, Macrosiphum euphorbiae; Mahanarva fimbriolata, Megacocta cribraria, Megoura viciae, Melanaphis pirarius, Melanaphis sacchari, Metcafiella spp., Metopolophium dirhodum, Miridae spp., Monellia costalis, Monelliopsis pecanis, Myzus spp. tal como Myzus ascalonicus, Myzus cerasi, Myzus persicae, Myzus varians; Nasonovia ribis-nigri, Nephrotettix spp. tal como Nephrotettix malayanus, Nephrotettix nigropictus, Nephrotettix parvus, Nephrotettix virescens; Nezara spp. tal como Nezara viridula; Nilaparvata lugens, Oebalus spp., Oncometopia spp., Orthezia praelonga, Parabemisia myricae, Paratrioza spp., Parlatoria spp., Pemphigus spp. tal como Pemphigus bursarius; Pentomidae, Peregrinus maidis, Perkinsiella saccharicida, Phenacoccus spp., Phloeomyzus passerinii, Phorodon humuli, Phylloxera spp., Piesma quadrata, Piezodorus spp. tal como Piezodorus guildinii, Pinnaspis aspidistrae, Planococcus spp., Protopulvinaria pyriformis, Psallus seriatus, Pseudacysta perseae, Pseudaulacaspis pentagona, Pseudococcus spp. tal como Pseudococcus comstocki; Psylla spp. tal como Psylla mali, Psylla piri; Pteromalus spp., Pyrilla spp., Quadraspidotus spp., Quesada gigas, Rastrococcus spp., Reduvius senilis, Rhodnius spp., Rhopalomyzus ascalonicus, Rhopalosiphum spp. tal como Rhopalosiphum pseudobrassicae, Rhopalosiphum insertum, Rhopalosiphum maidis, Rhopalosiphum padi; Sagatodes spp., Sahlbergella singularis, Saissetia spp., Sappaphis mala, Sappaphis mali, Scaphoides titanus, Schizaphis graminum, Schizoneura lanuginosa, Scotinophora spp., Selenaspis articulatus, Sitobion avenae, Sogata spp., Sogatella furcifera, Solubea insularis, Stephanitis nashi, Stictocephala festina, Tenalaphara malayensis, Thyanta spp. tal como Thyanta perditor; Tibraca spp., Tinocallis caryaefoliae, Tomaspis spp., Toxoptera spp. tal como Toxoptera aurantii; Trialeurodes spp. tal como Trialeurodes vaporariorum; Triatoma spp., Trioza spp., Typhlocyba spp., Unaspis spp. tal como Unaspis yanonensis; y Viteus vitifolii,
- hormigas, abejas, avispa, moscas de sierra (Hymenoptera), por ejemplo Athalia rosae, Atta capiguara, Atta cephalotes, Atta cephalotes, Atta laevigata, Atta robusta, Atta sexdens, Atta texana, Bombus spp., Camponotus floridanus, Crematogaster spp., Dasymutilla occidentalis, Diprion spp., Dolichovespula maculata, Hoplocampa spp. tal como Hoplocampa minuta, Hoplocampa testudinea; Lasius spp. tal como Lasius niger, Linepithema humile, Monomorium pharaonis, Paravespula germanica, Paravespula pennsylvanica, Paravespula vulgaris, Pheidole megacephala, Pogonomyrmex barbatus, Pogonomyrmex californicus, Polistes rubiginosa, Solenopsis geminata, Solenopsis invicta, Solenopsis richteri, Solenopsis xyloni, Vespa spp. tal como Vespa crabro, y Vespula squamosa,
- grillos, saltamontes, langostas (Orthoptera), por ejemplo Acheta domestica, Calliptamus italicus, Chortoicetes terminifera, Dociostaurus maroccanus, Gryllotalpa africana, Gryllotalpa gryllotalpa, Hieroglyphus daganensis, Kraussaria angulifera, Locusta migratoria, Locustana pardalina, Melanoplus bivittatus, Melanoplus femurrubrum, Melanoplus mexicanus, Melanoplus sanguinipes, Melanoplus spretus, Nomadacris septemfasciata, Oedaleus senegalensis, Schistocerca americana, Schistocerca gregaria, Tachycines asynamorus, y Zonozelus variegatus,
- arácnidos (Arachnida), tal como acari, por ejemplo de las familias Argasidae, Ixodidae y Sarcoptidae, tal como Amblyomma spp. (por ejemplo Amblyomma americanum, Amblyomma variegatum, Amblyomma maculatum), Argas spp. (por ejemplo Argas persicus), Boophilus spp. (por ejemplo Boophilus annulatus, Boophilus decoloratus, Boophilus microplus), Dermacentor silvarum, Dermacentor andersoni, Dermacentor variabilis, Hyalomma spp. (por ejemplo Hyalomma truncatum), Ixodes spp. (por ejemplo Ixodes ricinus, Ixodes rubicundus, Ixodes scapularis, Ixodes holocyclus, Ixodes pacificus), Ornithodoros spp. (por ejemplo Ornithodoros moubata, Ornithodoros hermsi, Ornithodoros turicata), Ornithonyssus bacoti, Otobius megnini, Dermanyssus gallinae, Psoroptes spp. (por ejemplo Psoroptes ovis), Rhipicephalus spp. (por ejemplo Rhipicephalus sanguineus, Rhipicephalus appendiculatus, Rhipicephalus evertsi), Rhizoglyphus spp., Sarcoptes spp. (por ejemplo Sarcoptes scabiei), y Eriophyidae spp. tal como Acaria sheldoni, Aculops spp. (por ejemplo Aculops pelekassi) Aculus spp. (por ejemplo Aculus schlehtendali), Eptrimerus piri, Phyllocoptruta oleivora y Eriophyes spp. (por ejemplo Eriophyes sheldoni); Tarsonemidae spp. tal como Hemitarsonemus spp., Phytonemus pallidus y Polyphagotarsonemus latus, Stenotarsonemus spp.; Tenuipalpidae spp. tal como Brevipalpus spp. (por ejemplo Brevipalpus phoenicis); Tetranychidae spp. tal como Eotetranychus spp., Eutetranychus spp., Oligonychus spp., Tetranychus cinnabarinus, Tetranychus kanzawai, Tetranychus pacificus, Tetranychus telarius y Tetranychus urticae; Bryobia praetiosa, Panonychus spp. (por ejemplo Panonychus ulmi, Panonychus citri), Metatetranychus spp. y Oligonychus spp. (por ejemplo Oligonychus pratensis),
- 50
55
60

Vasates lycopersici; Araneida, por ejemplo Latrodectus mactans, y Loxosceles reclusa. And Acarus siro, Chorioptes spp., Scorpio maurus

pulgas (Siphonaptera), por ejemplo Ceratophyllus spp., Ctenocephalides felis, Ctenocephalides canis, Xenopsylla cheopis, Pulex irritans, Tunga penetrans, y Nosopsyllus fasciatus,

5 pez plateado, firebrat (Thysanura), por ejemplo Lepisma saccharina y Thermobia domestica,

ciempiés (Chilopoda), por ejemplo Geophilus spp., Scutigera spp. tal como Scutigera coleoptrata;

milpiés (Diplopoda), por ejemplo Blaniulus guttulatus, Narceus spp.,

Tijeretas (Dermaptera), por ejemplo forficula auricularia,

10 piojos (Phthiraptera), por ejemplo Damalinia spp., Pediculus spp. tal como Pediculus humanus capitis, Pediculus humanus corporis; Pthirus pubis, Haematopinus spp. tal como Haematopinus eurysternus, Haematopinus suis; Linognathus spp. tal como Linognathus vituli; Bovicola bovis, Menopon gallinae, Menacanthus stramineus y Solenopotes capillatus, Trichodectes spp.,

colémbolos (Collembola), por ejemplo Onychiurus ssp. tal como Onychiurus armatus,

15 También son adecuados para controlar nematodos: nematodos parásitos de plantas tales como nematodos de nudo de la raíz, Meloidogyne hapla, Meloidogyne incognita, Meloidogyne javanica y otras especies de Meloidogyne; nematodos formadores de quistes, Globodera rostochiensis y otras especies de Globodera; Heterodera avenae, Heterodera glycines, Heterodera schachtii, Heterodera trifolii y otras especies de Heterodera; Nematodos de las agallas de la semilla, especies de Anguina; Nematodos del tallo y foliares, especies de Aphelenchoides tales como Aphelenchoides besseyi; Nemátodos picados, Belonolaimus longicaudatus y otras especies de Belonolaimus; 20 Nematodos de pino, Bursaphelenchus lignicolus Mamiya et Kiyohara, Bursaphelenchus xylophilus y otras especies de Bursaphelenchus; Nematodos de anillo, especies de Criconema, especies de Criconemella, especies de Criconemoides, especies de Mesocriconema; Nematodos de tallo y bulbo, Ditylenchus destructor, Ditylenchus dipsaci y otras especies de Ditylenchus; Nemátodos de campanillas, especies de Dolichodorus; Nematodos espirales, Helicotylenchus multicinctus y otras especies de Helicotylenchus; Nematodos de la vaina y de la vaina, especies de Hemicycliophora y Hemicriconemoides; Especie hirshmanniella; Lematodos, especies de Hoploaimus; nematodos falsos de rootknot, especies de Nacobbus; Nematodos de aguja, Longidorus elongatus y otras especies de Longidorus; Nematodos de lesión, Pratylenchus brachyurus, Pratylenchus neglectus, Pratylenchus penetrans, Pratylenchus curvatus, Pratylenchus goodeyi y otras especies de Pratylenchus; Nematodos excavadores, Radopholus similis y otras especies de Radopholus; Nematodos reniformes, Rotylenchus robustus, Rotylenchus reniformis y otras especies de Rotylenchus; Especies de scutellonema; Nematodos de la raíz rechoncha, Trichodorus primitivus y otras especies de Trichodorus, especies de Paratrichodorus; Nematodos de truco, Tylenchorhynchus claytoni, Tylenchorhynchus dubius y otras especies de Tylenchorhynchus; Nematodos de los cítricos, especies de Tylenchulus tales como Tylenchulus semipenetrans; Nematodos de daga, especies de Xiphinema; y otras especies de nematodos parásitos de plantas.

35 Ejemplos de otras especies de plagas que pueden ser controladas por compuestos de fórmula (I) incluyen: de la clase de los Bivalva, por ejemplo, Dreissena spp.; de la clase de los Gastropoda, por ejemplo, Arion spp., Biomphalaria spp., Bulinus spp., Deroceras spp., Galba spp., Lymnaea spp., Oncomelania spp., Succinea spp.; de la clase de los helminths, por ejemplo, Ancylostoma duodenale, Ancylostoma ceylanicum, Ancylostoma braziliense, Ancylostoma spp., Ascaris lubricoides, Ascaris spp., Brugia malayi, Brugia timori, Bunostomum spp., Chabertia spp., Clonorchis spp., 40 Cooperia spp., Dicrocoelium spp., Dictyocaulus filaria, Diphyllbothrium latum, Dracunculus medinensis, Echinococcus granulosus, Echinococcus multilocularis, Enterobius vermicularis, Fasciola spp., Haemonchus spp. tal como Haemonchus contortus; Heterakis spp., Hymenolepis nana, Hyostrogylus spp., Loa Loa, Nematodirus spp., Oesophagostomum spp., Opisthorchis spp., Onchocerca volvulus, Ostertagia spp., Paragonimus spp., Schistosomen spp., Strongyloides fuelleborni, Strongyloides stercora lis, Strongyloides spp., Taenia saginata, Taenia solium, 45 Trichinella spiralis, Trichinella nativa, Trichinella britovi, Trichinella nelsoni, Trichinella pseudospiralis, Trichostrongylus spp., Trichuris trichuria, Wuchereria bancrofti; del orden de las Isopoda, por ejemplo, Armadillidium vulgare, Oniscus asellus, Porcellio scaber; del orden de las Symphyla, por ejemplo, Scutigera immaculata;

Otros ejemplos de especies de plagas que pueden ser controladas por los compuestos de fórmula (I) incluyen: 50 Anisoplia austriaca, Apamea spp., Austroasca viridigrisea, Baliothrips biformis, Caenorhabditis elegans, Cephus spp., Ceutorhynchus napi, Chaetocnema aridula, Chilo auricilius, Chilo indicus, Chilo polychrysus, Chortiocetes terminifera, Cnaphalocroci medinalis, Cnaphalocrosis spp., Colias eurytheme, Collops spp., Cornitermes cumulans, Creontiades spp., Ciclocephala spp., Dalbulus maidis, Deraceras reticulatum, Diatrea saccharalis, Dichelops furcatus, Di cladispa armigera, Diloboderus spp. tal como Diloboderus abderus; Edessa spp., Epinotia spp., Formicidae, Geocoris spp., Globitermes sulfureus, Gryllotalpidae, Halotydeus destructor, Hipnodes bicolor, Hydrellia philippina, Julus spp., Laodelphax spp., Leptocorsia acuta, Leptocorsia oratorius, Liogenys fuscus, Lucillia spp., Lyogenys fuscus, Mahanarva spp., Maladera matrida, Marasmia spp., Mastotermes spp., Mealybugs, Megascelis ssp, Metamasius hemipterus, Microtheca spp., Mocis latipes, Murgantia spp., Mythemina separata, Neocapritermes opacus, Neocapritermes parvus, Neomegalotomus spp., Neotermes spp., Nymphula depunctalis, Oebalus pugnax, Orseolia

spp. tal como *Orseolia oryzae*; *Oxycaraenus hyalinipennis*, *Plusia* spp., *Pomacea canaliculata*, *Procornitermes* spp., *Procornitermes triacifer*, *Psylloides* spp., *Rachiplusia* spp., *Rhodopholus* spp., *Scaptocoris castanea*, *Scaptocoris* spp., *Scirpophaga* spp. tal como *Scirpophaga incertulas*, *Scirpophaga innotata*; *Scotinophara* spp. tal como *Scotinophara coarctata*; *Sesamia* spp. tal como *Sesamia inferens*, *Sogaella frucifera*, *Solenopsis geminata*, *Spissistilus* spp., *Stalk borer*, *Stenchaetothrips biformis*, *Steneotarsonemus spinki*, *Sylepta derogata*, *Telehin licus*, *Trichostrongylus* spp.

Los compuestos de la presente invención, incluyendo sus sales, estereoisómeros y tautómeros, son particularmente útiles para controlar insectos, preferiblemente insectos chupadores o perforadores e insectos masticadores y mordedores tales como insectos del género *Lepidoptera*, *Coleoptera* y *Hemiptera*, en particular *Lepidoptera*, *Coleoptera* y ciertos chinches. Los compuestos de la presente invención, incluidas sus sales, estereoisómeros y tautómeros, son además útiles para controlar insectos de los órdenes *Thysanoptera*, *Diptera* (especialmente moscas, mosquitos), *Hymenoptera* (especialmente hormigas) e *Isoptera* (especialmente termitas).

Los compuestos de la presente invención, incluidas sus sales, estereoisómeros y tautómeros, son particularmente útiles para controlar insectos de los órdenes *Lepidoptera* y *Coleoptera*.

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

Una composición agroquímica comprende una cantidad efectiva como pesticida de un compuesto I. El término "cantidad efectiva" denota una cantidad de la composición o de los compuestos I, que es suficiente para controlar los hongos dañinos en plantas cultivadas o en la protección de materiales y que no da lugar a un daño sustancial a las plantas tratadas. Tal cantidad puede variar en un amplio rango y depende de diversos factores, tal como la especie que se va a controlar, la planta o material cultivado tratado, las condiciones climáticas y el compuesto I específico utilizado.

Los compuestos I, sus N-óxidos y sales se pueden convertir en tipos habituales de composiciones agroquímicas, por ejemplo soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, pulverizables, 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, pulverizables humectables o polvos (por ejemplo, WP, SP, WS, DP, DS), prensados (por ejemplo, BR, TB, DT), gránulos (por ejemplo, WG, SG, GR, FG, GG, MG), artículos insecticidas (por ejemplo, LN), 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 y international coding system", Technical Monograph No. 2, 6th Ed. May 2008, CropLife International.

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

Agentes auxiliares adecuados son solventes, vehículos líquidos, vehículos o agentes de relleno sólidos, 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, antiespumantes, colorantes, agentes de pegajosidad y aglutinantes.

Los disolventes y vehículos 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, ciclohexanol; glicoles; DMSO; cetonas, por ejemplo ciclohexanona; ésteres, por ejemplo lactatos, carbonatos, ésteres de ácidos grasos, gamma-butirolactona; ácidos grasos; fosfonatos; aminas; amidas, por ejemplo N-metilpirrolidona, dimetilamidas de ácidos grasos; y mezclas de los mismos.

Los portadores sólidos o agentes de relleno adecuados son tierras minerales, por ejemplo silicatos, sílica gel, talco, caolines, piedra caliza, cal, tiza, arcillas, dolomita, tierra de diatomeas, bentonita, sulfato de calcio, sulfato de magnesio, óxido de magnesio; polisacáridos, por ejemplo, celulosa, almidón; fertilizantes, por ejemplo sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, ureas; productos de origen vegetal, por ejemplo harina de cereal, harina de corteza de árbol, harina de madera, harina de cáscara de nuez y mezclas de los mismos.

Surfactantes adecuados son compuestos con actividad de superficie, tales como surfactantes aniónicos, catiónicos, no iónicos y anfotéricos, polímeros de bloques, polielectrolitos y mezclas de los mismos. Tales surfactantes pueden usarse como emusificantes, 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. o North American Ed.).

Surfactantes aniónicos adecuados son sales alcalinas, alcalinotérreas o de amonio de sulfonatos, sulfatos, fosfatos, carboxilatos y mezclas de los mismos. Ejemplos de sulfonatos son: alquilarilsulfonatos, difenilsulfonatos, 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 etoxilatos de alquilfenol.
- 5
- Surfactantes no iónicos adecuados son alcoxilatos, amidas de ácidos grasos N-sustituídos, 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-sustituídas 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 a base de azúcar son sorbitanos, sorbitanos etoxilados, ésteres de sacarosa y glucosa o alquilpoliglucósidos. Ejemplos de agentes surfactantes poliméricos son los compuestos caseros o copolímeros de vinilpirrolidona, vinilalcoholes o acetato de vinilo.
- 10
- 15
- 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. Surfactantes anfotéricos adecuados son alquilbetinas e imidazolininas. 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. Polielectrolitos adecuados son poliácidos o polibases. Ejemplos de poliácidos son sales alcalinas de ácido poliacrílico o polímeros de peine poliácidos. Ejemplos de polibases son polivinilaminas o polietilenaminas.
- 20
- Adyuvantes adecuados son compuestos, que tienen una despreciable o incluso ninguna actividad pesticida, y que mejoran el rendimiento biológico del compuesto I en el objetivo. Ejemplos son surfactantes, aceites minerales o vegetales y otros agentes auxiliares. Ejemplos adicionales se listan por Knowles, Adjuvants y additives, Agrow Reports DS256, T&F Informa UK, 2006, chapter 5.
- 25
- Los 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.
- 30
- Agentes anticongelantes adecuados son etilenglicol, propilenglicol, urea y glicerina.
- Los 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 de alizarina, azo y ftalocianina).
- 35
- Los agentes de pegajosidad o aglutinantes adecuados son polivinilpirrolidonas, poli(acetato de vinilo), poli(alcoholes de vinilo), poli(acrilatos), ceras biológicas o sintéticas y éteres de celulosa.
- Ejemplos de tipos de composición y su preparación son:
- i) Concentrados solubles en agua (SL, LS)
- 40
- 10-60% en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención y 5-15% en peso de agente humectante (por ejemplo, alcoxilatos de alcohol) se disuelven en agua y/o en un disolvente soluble en agua (por ejemplo, alcoholes) hasta el 100% en peso. La sustancia activa se disuelve en dilución con agua.
- ii) Concentrados dispersables (DC)
- 45
- Se disuelve 5-25% en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención y 1-10% en peso de dispersante (por ejemplo, polivinilpirrolidona) en un disolvente orgánico (por ejemplo, ciclohexanona) al 100% en peso. La dilución con agua da una dispersión.
- iii) Concentrados emulsionables (EC)
- 50
- 15-70% en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención y 5-10% en peso de emulsionantes (por ejemplo, dodecibencenosulfonato de calcio y etoxilato de aceite de ricino) se disuelven en disolvente orgánico insoluble en agua (por ejemplo, hidrocarburo aromático) y 100% en peso. La dilución con agua da una emulsión.
- iv) Emulsiones (EW, EO, ES)

Se disuelven 5-40% en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención y 1-10% en peso de emulsionantes (por ejemplo, dodecilmencenosulfonato de calcio y etoxilato de aceite de ricino) en 20-40% en peso de disolvente orgánico insoluble en agua (por ejemplo, hidrocarburo aromático). Esta mezcla se introduce en agua al 100% en peso mediante una máquina emulsionante y se convierte en una emulsión homogénea. La dilución con agua da una emulsión.

5 v) Suspensiones (SC, OD, FS)

En un molino de bolas con agitación, 20-60% en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención se trituran con la adición de 2-10% en peso de agentes dispersantes y humectantes (por ejemplo, lignosulfonato de sodio y alcohol etoxilato), 0,1-2% en peso de espesante. (por ejemplo goma xantana) y agua al 100% en peso para dar una suspensión fina de principio activo. La dilución con agua proporciona una suspensión estable de la sustancia activa. Para la composición de tipo FS se agrega hasta un 40% en peso de aglutinante (por ejemplo, alcohol polivinílico).

10

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

El 50-80% en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención se tritura finamente con la adición de dispersantes y agentes humectantes (por ejemplo, lignosulfonato de sodio y etoxilato de alcohol) al 100% en peso y se prepara como gránulos dispersables en agua o solubles en agua por medio de aplicaciones técnicas (por ejemplo, extrusión, torre de aspersión, lecho fluidizado). La dilución con agua proporciona una dispersión o solución estable de la sustancia activa.

15

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

El 50-80% en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención se muele en un molino de rotor-estator con la adición de 1-5% en peso de dispersantes (por ejemplo, lignosulfonato de sodio), 1-3% en peso de agentes humectantes (por ejemplo, etoxilato de alcohol) y portador sólido (por ejemplo, sílica gel) al 100% en peso. La dilución con agua proporciona una dispersión o solución estable de la sustancia activa.

20

viii) Gel (GW, GF)

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

25

iv) Microemulsión (ME)

5-20% en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención se agregan a 5-30% en peso de mezcla de solvente orgánico (por ejemplo, ácido graso dimetilamida y ciclohexanona), 10-25% en peso de mezcla de surfactante (por ejemplo, etoxilato de alcohol y aroxifenol etoxilato), y agua al 100%. Esta mezcla se agita durante 1 h para producir espontáneamente una microemulsión termodinámicamente estable.

30

iv) Microcápsulas (CS)

Una fase oleosa que comprende 5-50% en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención, 0-40% en peso de disolvente orgánico insoluble en agua (por ejemplo, hidrocarburo aromático), 2-15% en peso de monómeros acrílicos (por ejemplo, metacrilato de metilo, ácido metacrílico y un di o triacrilato) se dispersan en una solución acuosa de un coloide protector (por ejemplo, alcohol polivinílico). La polimerización radical iniciada por un iniciador de radicales da como resultado la formación de microcápsulas de poli(met) acrilato. Alternativamente, una fase oleosa que comprende 5-50% en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención, 0-40% en peso de disolvente orgánico insoluble en agua (por ejemplo, hidrocarburo aromático) y un monómero de isocianato (por ejemplo, difenilmetileno-4,4'-diisocianatos) se dispersan en una solución acuosa de un coloide protector (por ejemplo, alcohol polivinílico). La adición de una poliamina (por ejemplo, hexametilendiamina) da como resultado la formación de microcápsulas de poliurea. Los monómeros ascienden a 1-10% en peso. El % en peso se relaciona con la composición total de CS.

40

ix) Polvos pulverizables (DP, DS)

ix) Los polvos pulverizables (DP, DS)

45

1-10% en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención se muelen finamente y se mezclan íntimamente con un portador sólido (por ejemplo, caolín finamente dividido) y 100% en peso).

x) Gránulos (GR, FG)

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

50

xi) Líquidos de volumen ultra bajo (UL)

ES 2 710 217 T3

1-50% en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención se disuelven en un disolvente orgánico (por ejemplo, hidrocarburo aromático) al 100% en peso.

5 Los tipos de composiciones i) a xi) pueden comprender opcionalmente agentes auxiliares adicionales, tales como 0,1-1% en peso de bactericidas, 5-15% en peso de agentes anticongelantes, 0,1-1% en peso de agentes antiespumantes y 0, 1-1% en peso de colorantes.

Las composiciones agroquímicas comprenden generalmente entre 0,01 y 95%, preferiblemente entre 0,1 y 90%, y en particular 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).

10 Soluciones para tratamiento de semillas (LS), Suspoemulsiones (SE), concentrados fluidos (FS), polvos para el tratamiento en seco (DS), polvos dispersables en agua para el tratamiento de lodos (WS), polvos solubles en agua (SS), emulsiones (ES) concentrados emulsionables (EC) y geles (GF) se emplean generalmente para el tratamiento de materiales de propagación de plantas, particularmente semillas. Las composiciones en cuestión proporcionan, después de una dilución de dos a diez veces, concentraciones de sustancia activa de 0,01 a 60% en peso, preferiblemente de 0,1 a 40% en peso, en las preparaciones listas para usar. La aplicación puede realizarse antes o durante la siembra. Los métodos para aplicar el compuesto I y sus composiciones, respectivamente, sobre el material de propagación de plantas, especialmente las semillas incluyen los métodos de cubrimiento, recubrimiento, granulación, espolvoreo, remojo y aplicación en el surco del material de propagación. Preferiblemente, el compuesto I o las composiciones del mismo, respectivamente, se aplican sobre el material de propagación de la planta por un método tal que no se induce la germinación, por ejemplo mediante cubrimiento de semillas, granulación, recubrimiento y espolvoreado.

20 Cuando se emplean en la protección de plantas, las cantidades de sustancias activas aplicadas son, dependiendo del tipo de efecto deseado, de 0.001 a 2 kg por ha, preferiblemente de 0.005 a 2 kg por ha, más preferiblemente de 0.05 a 0.9 kg por ha, y en particular de 0,1 a 0,75 kg por ha.

25 En el tratamiento de materiales de propagación de plantas tales como semillas, por ejemplo pulverizando, recubriendo o empapando semillas, son generalmente requeridas cantidades de sustancia activa de 0,1 a 1000 g, preferiblemente de 1 a 1000 g, más preferiblemente de 1 a 100 g y lo más preferiblemente de 5 a 100 g, por 100 kilogramos de material de propagación de plantas (preferiblemente semillas).

30 Cuando se utiliza en la protección de materiales o productos almacenados, la cantidad de sustancia activa aplicada depende del tipo de área de aplicación y del efecto deseado. Las cantidades que se aplican habitualmente en la protección de materiales son de 0,001 ga 2 kg, preferiblemente de 0,005 ga 1 kg de sustancia activa por metro cúbico de material tratado.

35 Pueden agregarse diversos tipos de aceites, humectantes, adyuvantes, fertilizantes o micronutrientes, y pesticidas adicionales (por ejemplo, herbicidas, insecticidas, fungicidas, reguladores del crecimiento, protectores) a las sustancias activas o las composiciones que los contienen como premezcla o, si es apropiado, 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.

40 El usuario aplica la composición de acuerdo con la invención generalmente desde un dispositivo de predosificación, un rociador de mochila, un tanque de rociado, un plano de rociado o un sistema de irrigación. Normalmente, la composición agroquímica se compone de agua, regulador y/o agentes auxiliares adicionales para la concentración de aplicación deseada y se obtiene así el licor de pulverización listo para usar o la composición agroquímica de acuerdo con la invención. Por lo general, se aplican de 20 a 2000 litros, preferiblemente de 50 a 400 litros, del licor de pulverización listo para usar por hectárea de área útil para la agricultura.

45 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 mezcladas por el propio usuario en un tanque de aspersión y se pueden agregar otros agentes auxiliares, si es apropiado.

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 compuestos I y/o sustancias activas de los grupos M) o F) (véase a continuación) en un tanque de aspersión y, si corresponde, se pueden agregar otros agentes auxiliares y aditivos.

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 I y/o sustancias activas de los grupos M.1 a M.UN.X o F.I a F.XIII, pueden aplicarse conjuntamente (por ejemplo, después de la mezcla en tanque) o consecutivamente.

55 La siguiente lista M de pesticidas, agrupada de acuerdo con la Mode of Action Classification of the Insecticide Resistance Action Committee (IRAC), junto con la cual se pueden usar los compuestos de acuerdo con la invención y con la cual se podrían producir efectos sinérgicos potenciales, se pretende ilustrar las posibles combinaciones, pero no para imponer ninguna limitación:

M.1 Inhibidores de la acetilcolina esterasa (AChE) de la clase de

M.1A carbamatos, por ejemplo aldicarb, alanicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbarilo, carbofaryl, etiofencarb, fenobucarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metiocarb, metomil, metolcarb, oxamil, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, trimethacarb, XMC, xililcarb y triazamato; o de la clase de

- 5 M.1B, organofosfatos por ejemplo, acefato, azametifos, azinfos-etilo, azinfosmetilo, cadusafos, cloretoxifos, clorfenvinfos, clormefos, clorpirifos, clorpirifos-metilo, coumafos, cianophos, demeton-S-metilo, diazinon, diclorvos/DDVP, dicrotofos, dimetoato, dimetilvinfos, disulfoton, EPN, etion, etoprofos, famfur, fenamifos, fenitrotrion, fention, fostiazato, heptenofos, imiciafos, isofenfos, isopropil O-(methoxiaminotio-fosforil)salicilato, isoxation, malation, mecarbam, metamidofos, metidation, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, óxidometon-metilo, paration, paration-metilo, fentoato, forato, fosalona, fosmet, fosfamidon, foxim, pirimifos- metilo, profenofos, propetamfos, protiofos, piraclafos, piridafention, quinalfos, sulfotep, tebupirimfos, temefos, terbufos, tetraclorvinfos, tiometon, triazofos, triclofon y vamidotion;
- 10

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

M.2A Compuestos organoclorados de ciclodieno, como por ejemplo endosulfán o clordano; o

- 15 M.2B Fiproles (fenilpirazols), como por ejemplo etiprole, fipronil, flufiprole, pirafluprole y piriprole;

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

- M.3A piretroides, por ejemplo acrinatrina, aletrina, d-cis-trans aletrina, d-trans aletrina, bifentrina, bioaletrina bioaletrin S-ciclopentenilo, bioresmetrina, ciclotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, citiotrina, y una cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, alfa-cipermetrina, teta-cipermetrina, cefermetrina, cefermetrina, cefaletrina, fenotropina, fenoprotina, fenopirazina, fenpropatrín, fenpetrina, flucytrina momfluorotrina, permetrina, fenotrina, praletrin, proflutrina, piretrina (pyrethrum), resmetrina, silafluofen, teflutrina, tetrametilflutrina, tetrametrina, tralometrina y transflutrina; o
- 20

- M.3A piretroides, por ejemplo acrinatrina, aletrin, d-cis-trans aletrin, d-trans aletrin, bifentrina, bioaletrin, bioaletrin S-ciclopentenilo, bioresmetrina, ciclotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, gamma-cihalotrina, cypermetrina, alpha-cypermetrina, beta-cypermetrina, theta-cypermetrina, zeta-cypermetrina, cyphenotrina, deltametrina, empentrina, esfenvalerate, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerate, flucytrinaato, flumetrina, tau-fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, meperflutrina, metoflutrina, momfluorotrina, permetrina, fenotrina, praletrin, proflutrina, piretrina (pyrethrum), resmetrina, silafluofen, teflutrina, tetrametilflutrina, tetrametrina, tralometrina y transflutrina; o
- 25

- 30 M.3B Moduladores del canal de sodio, tales como DDT o metoxicloro;

M.4 Agonistas del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR) de la clase de

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

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

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

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

o M.4B nicotina.

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

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

M.7 Imitadores de hormonas juveniles, tales como

M.7A Análogos de la hormona juvenil como hidropreno, cinopreno y metopreno; u otros como M.7B fenoxicarb o M.7C piriproxifen;

- 45 M.8 varios inhibidores no específicos (multisitio), por ejemplo

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

M.8B cloropiricina, o M.8C fluoruro de sulfurilo, o M.8D bórax, o M.8E emético tártaro;

M.9 Bloqueadores selectivos de alimentación de homópteros, por ejemplo.

- M.9B pimetrozina, o M.9C flonicamid;
- M.10 Inhibidores del crecimiento de ácaros, por ejemplo
- M.10A clofentezina, hexitiazox y diflovidazina, o M.10B etoxazol;
- 5 M.11 Interruptores microbianos de las membranas del intestino medio del insecto, por ejemplo, el *bacillus thuringiensis* o *bacillus sphaericus*, y las proteínas insecticidas que las producen, tal como *bacillus thuringiensis subsp. israelensis*, *bacillus sphaericus*, *bacillus thuringiensis subsp. aizawai*, *bacillus thuringiensis subsp. kurstaki* y *bacillus thuringiensis subsp. tenebrionis*, o las proteínas de cultivo Bt: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry2Ab, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb y Cry34/35Ab1;
- M.12 Inhibidores de la ATP mitocondrial sintasa, por ejemplo
- 10 M.12A diafentiuron, o
- M.12B miticidas de organoestaño tales como azociclotina, cihexatina u óxido de fenbutatina, o M.12C propargita, o M.12D tetradifón;
- M.13 Desacopladores de la fosforilación oxidativa mediante la interrupción del gradiente de protones, por ejemplo, clorfenapir, DNOC o sulfluramida;
- 15 M.14 Bloqueadores del receptor de acetilcolina nicotínico (nAChR), por ejemplo, análogos de la nereistoxina como bensultap, clorhidrato de cartap, tiociclam o tiosultap sódico;
- M.15 Inhibidores de la biosíntesis de quitina tipo 0, tales como benzoilureas como por ejemplo bistrifluron, clorfluazuron, diflubenzuron, flucicloخورon, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenururon, noviflumuron, teflubenzuron o triflumuron;
- 20 M.16 Inhibidores de la biosíntesis de quitina tipo 1, como por ejemplo buprofezina;
- M.17 Interruptores de muda, Dipteran, como por ejemplo la ciromazina;
- M.18 agonistas del receptor de Ecdyson, tales como diacilhidracinas, por ejemplo, metoxifenozida, tebufenozida, halofenozida, fufenozida o cromafenozida;
- M.19 Agonistas del receptor de octopamina, como por ejemplo amitraz;
- 25 M.20 Inhibidores del transporte de electrones del complejo mitocondrial III, por ejemplo
- M.20A hidrametilnon, o M.20B acequinocil, o M.20C fluaciripirim;
- M.21 Inhibidores del transporte de electrones del complejo mitocondrial I, por ejemplo
- M.21A acaricidas e insecticidas METI tal como fenazaquin, fenpiroximato, porimidifen, piridaben, tebufenpirad o tolfenpirad, o M.21B rotenona;
- 30 M.22 Bloqueadores de canales de sodio dependientes de voltaje, por ejemplo
- M.22A indoxacarb, o M.22B metaflumizona, o M.22C 1-[(E)-[2-(4-cianofenil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etilidene]amino]-3-[4-(difluorometoxi)fenil]urea;
- M.23 Inhibidores de la acetil CoA carboxilasa, tal como los derivados del ácido tetrónico y tetramico, por ejemplo, espirodiclofeno, espiromasifeno o espirotetramato;
- 35 M.24 Inhibidores del transporte de electrones del complejo mitocondrial IV, por ejemplo
- M.24A fosfina tal como fosfuro de aluminio, fosfuro de calcio, fosfina o fosfuro de zinc o M.24B cianuro.
- M.25 Inhibidores del transporte de electrones del complejo mitocondrial II, tales como derivados de beta-cetonitrilo, por ejemplo, cenopirofeno o ciflumetofeno;
- 40 M.28 Moduladores del receptor de rianodina de la clase de las diamidas, como por ejemplo flubendiamida, clorantraniliprol (rynaxypyr®), ciantraniliprole (cyazypyr®), o los compuestos de ftalamida
- M.28.1: (R)-3-Clor-N1-{2-metil-4-[1,2,2,2-tetrafluor-1-(trifluorometil)etil]fenilo}-N2-(1-metil-2-metilsulfoniloetil)ftalamida y
- M.28.2: (S)-3-Clor-N1-{2-metil-4-[1,2,2,2-tetrafluor-1-(trifluorometil)etil]fenilo}-N2-(1-metil-2-metilsulfoniloetil)ftalamida, o el compuesto
- 45 M.28.3: 3-bromo-N-{2-bromo-4-cloro-6-[(1-ciclopropiloetil)carbamoil]fenilo}-1-(3-clorpiridin-2-il)-1H-pirazol-5-carboxamida (nombre ISO propuesto: cyclaniliprole), o el compuesto

- M.28.4: metil-2-[3,5-dibromo-2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonilo}amino)benzoil]-1,2-dimetilhidrazinacarboxilato; o un compuesto seleccionado de M.28.5a) a M.28.5l):
- M.28.5a) N-[4,6-dicloro-2-[(dietil-lambda-4-sulfaniliden)carbamoil]-fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil)pirazol-3-carboxamida;
- 5 M.28.5b) N-[4-cloro-2-[(dietil-lambda-4-sulfaniliden)carbamoil]-6-metil-fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil)pirazol-3-carboxamida;
- M.28.5c) N-[4-cloro-2-[(di-2-propilo-lambda-4-sulfaniliden)carbamoil]-6-metilfenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil)pirazol-3-carboxamida;
- 10 M.28.5d) N-[4,6-dicloro-2-[(di-2-propilo-lambda-4-sulfaniliden)carbamoil]-fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil)pirazol-3-carboxamida;
- M.28.5e) N-[4,6-dicloro-2-[(dietil-lambda-4-sulfaniliden)carbamoil]-fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(difluorometil)pirazol-3-carboxamida;
- M.28.5f) N-[4,6-dibromo-2-[(di-2-propilo-lambda-4-sulfaniliden)carbamoil]-fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil)pirazol-3-carboxamida;
- 15 M.28.5g) N-[4-cloro-2-[(di-2-propilo-lambda-4-sulfaniliden)carbamoil]-6-cianofenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil)pirazol-3-carboxamida;
- M.28.5h) N-[4,6-dibromo-2-[(dietil-lambda-4-sulfaniliden)carbamoil]-fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil)pirazol-3-carboxamida;
- M.28.5i) N-[2-(5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-il)-4-cloro-6-metil-fenil]-5-bromo-2-(3-cloro-2-piridil)pirazol-3-carboxamida;
- 20 M.28.5j) 5-cloro-2-(3-cloro-2-piridil)-N-[2,4-dicloro-6-[(1-ciano-1-metiletil)carbamoil]fenil]pirazol-3-carboxamida;
- M.28.5k) 5-bromo-N-[2,4-dicloro-6-(metilcarbamoil)fenil]-2-(3,5-dicloro-2-piridil)pirazol-3-carboxamida;
- M.28.5l) N-[2-(tert-butilocarbamoil)-4-cloro-6-metil-fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(fluorometoxi)pirazol-3-carboxamida; o un compuesto seleccionado de
- M.28.6 N2-(1-ciano-1-metil-etil)-N1-(2,4-dimetilfenil)-3-yodo-ftalamida; o
- 25 M.28.7 3-cloro-N2-(1-ciano-1-metil-etil)-N1-(2,4-dimetilfenil)ftalamida;
- M.UN.X Compuestos activos insecticidas de modo de acción desconocido o incierto, como por ejemplo afidopiropen, azadiractina, amidoflumet, benzoximate, bifenazato, bromopropiloato, chinometionat, criolite, dicofol, flufenerim, flometoquin, fluensulfone, flupiradifurona, piperonil butóxido, piridalilo, pirifluquinazon, sulfoxaflor, piflubumida o los compuestos
- 30 M.UN.X.1: 4-[5-(3,5-Dicloro-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-isoxazol-3-il]-2-metil-N-[(2,2,2-trifluoro-etilcarbamoil)-metil]-benzamida, o el compuesto
- M.UN.X.2: 4-[5-[3-cloro-5-(trifluorometil)fenil]-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il]-N-[2-oxo-2-(2,2,2-trifluoroetilamino)etil]naftalen-1-carboxamida, o el compuesto
- M.UN.X.3: 11-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-12-hidroxi-1,4-dioxa-9-azadiespiro[4.2.4.2]-tetradec-11-en-10-ona, o el compuesto
- 35 M.UN.X.4: 3-(4'-fluoro-2,4-dimetilbifenilo-3-il)-4-hidroxi-8-oxa-1-azaespiro[4.5]dec-3-en-2-ona, o el compuesto
- M.UN.X.5: 1-[2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfonil]fenil]-3-(trifluorometil)-1H-1,2,4-triazol-5-amina, o activos sobre la base de *Bacillus firmus* (Votivo, I-1582); o
- M.UN.X.6; un compuesto seleccionado del grupo de
- 40 M.UN.X.6a) (E/Z)-N-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiloiden]-2,2,2-trifluoroacetamida;
- M.UN.X.6b) (E/Z)-N-[1-[(6-cloro-5-fluoro-3-piridil)metil]-2-piridiloiden]-2,2,2-trifluoroacetamida;
- M.UN.X.6c) (E/Z)-2,2,2-trifluoro-N-[1-[(6-fluoro-3-piridil)metil]-2-piridiloiden]acetamida;
- M.UN.X.6d) (E/Z)-N-[1-[(6-bromo-3-piridil)metil]-2-piridiloiden]-2,2,2-trifluoroacetamida;
- M.UN.X.6e) (E/Z)-N-[1-[(6-cloro-3-piridil)etil]-2-piridiloiden]-2,2,2-trifluoroacetamida;
- 45 M.UN.X.6f) (E/Z)-N-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiloiden]-2,2-difluoroacetamida;

M.UN.X.6g) (E/Z)-2-cloro-N-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiloiden]-2,2-difluoro-acetamida;

M.UN.X.6h) (E/Z)-N-[1-[(2-cloropirimidin-5-il)metil]-2-piridiloiden]-2,2,2-trifluoroacetamida y

M.UN.X.6i) (E/Z)-N-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiloiden]-2,2,3,3,3-pentafluoro-propanamida.); o de los compuestos

M.UN.X.7: 3-[3-cloro-5-(trifluorometil)fenil]-4-oxo-1-(pirimidin-5-ilometil)pirido[1,2-a]pirimidin-1-io-2-olato; o

5 M.UN.X.8: 1-[(2-clorotiazol-5-il)metil]-3-(3,5-diclorofenil)-9-metil-4-oxo-pirido[1,2-a]pirimidin-1-io-2-olato; o

M.UN.X.9: 8-cloro-N-[2-cloro-5-metoxifenil]sulfonil]-6-trifluorometil]-imidazo[1,2-a]piridin-2-carboxamida; o

M.UN.X.10: 4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il]-2-metil-N-(1-oxotietan-3-il)benzamida; o

M.UN.X.11: 5-[3-[2,6-dicloro-4-(3,3-dicloroaliloxi)fenoxi]propoxi]-1H-pirazol.

10 Los compuestos disponibles comercialmente del grupo M listados anteriormente se pueden encontrar en The Pesticide Manual, 15th Edition, C. D. S. Tomlin, British Crop Protection Council (2011) entre otras publicaciones.

15 El derivado de quinolina flometoquin se muestra en el documento WO2006/013896. Los compuestos de aminofuranona flupiradifurona se conocen del documento WO 2007/115644. El compuesto de sulfoximina sulfoxaflor se conoce a partir del documento WO2007/149134. El piretroide momfluorotrina se conoce del documento US6908945. El acaricida pirazol piflubumida se conoce a partir del documento WO2007/020986. Los compuestos de isoxazolina se han descrito igualmente M.UN.X.1 en el documento WO2005/085216, M.UN.X.2. en el documento WO2009/002809 y en el documento WO2011/149749 y la isoxazolina M.UN.X.10 en el documento WO2013/050317. El afidopiropen derivado de piripropileno se ha descrito en el documento WO 2006/129714. El derivado de cetoenol cíclico sustituido con espirocetal M.UN.X.3 se conoce a partir del documento WO2006/089633 y el derivado de cetoenol espirocíclico sustituido con bifenilo M.UN.X.4 del documento WO2008/067911. Finalmente, el triazoilfenilsulfuro como M.UN.X.5 se ha descrito en el documento WO2006/043635 y los agentes de control biológico sobre la base de bacillus firmus en el documento WO2009/124707. Los neonicotinoides 4A.1 se conocen a partir del documento WO2012/069266 y el documento WO2011/06946, el M.4.A.2 del documento WO2013/003977, el M4.A.3 de WO2010/069266.

25 El análogo de la metaflumizona M.22C se describe en CN 10171577. Las ftalamidas M.28.1 y M.28.2 se conocen del documento WO 2007/101540. La antranilamida M.28.3 se ha descrito en el documento WO2005/077934. El compuesto de hidrazida M.28.4 se ha descrito en el documento WO 2007/043677. Las antranilamidas M.28.5a) a M.28.5h) se pueden preparar como se describe en los documentos WO 2007/006670, WO2013/024009 y WO2013/024010, la antranilamida M.28.5i) se describe en el documento WO2011/085575, la M.28.5 j) en WO2008/134969, M.28.5k) en US2011/046186 y M.28.5l) en WO2012/034403. Los compuestos de diamida M.28.6 y M.28.7 se pueden encontrar en CN102613183.

30 Los compuestos M.UN.X.6a) a M.UN.X.6i) listados en M.UN.X.6 se han descrito en el documento WO2012/029672. El compuesto antagonista mesoiónico M.UN.X.7 se describió en el documento WO2012/092115, el compuesto antagonista mesoiónico M.UN.X.8 se describió en el documento WO 2013/192035, el nematocida M.UN.X.9 en el documento WO2013/055584 y el análogo de tipo piridililo M.UN.X.11 en el documento WO2010/060379.

35 Los ingredientes activos como pesticidas adicionales preferidos son aquellos seleccionados del grupo 1 de IRAC, los inhibidores de la acetilcolinesterasa (AChE), en este documento del grupo 1A (Carbamatos) tiodicarb, metomilo y carbarilo, y del grupo 1B (Organofosfatos), especialmente Acefato, Clorpirifos y Dimetoato, del grupo 2B, los fiproles, aquí especialmente ethiprole y fipronil, del grupo 3, los piretroides, aquí especialmente lambda-cihalotrina, alfa-cipermetrina o deltametrina, y del grupo 4A, los neonicotinoides, aquí especialmente acetamiprid, clotianidin, dinotefuran, imidacloprid, nitenpiram, tiacloprid o tiometoxam.

40 Especialmente las combinaciones de compuestos de la invención con fiproles, neonicotinoides o piretroides pueden exhibir un control sinérgico de las chinches apestosas (de acuerdo con la fórmula de Colby), en particular Euschistus, por ejemplo. Euschistus heros.

45 La siguiente lista F de sustancias activas, junto con la que se pueden usar los compuestos de acuerdo con la invención, pretende ilustrar las posibles combinaciones, pero no las limita:

F.I) Inhibidores de la respiración

50 F.I 1) Inhibidores de complejo III en el sitio Q_o (por ejemplo estrobilurinas): azoxiestrobina, coumetoxiestrobina, coumoxiestrobina, dimoxiestrobina, enestroburin, fenaminstrobina, fenoxistrobina/flufenoxiestrobina, fluoxastrobina, kresoxim-metilo, mandestrobina, metominostrobina, orisastrobina, picoxiestrobina, piracllostrobina, pirametostrobina, piraoxiestrobina, trifloxistrobina y 2-(2-(3-(2,6-diclorofenil)-1-metil-alilidenoaminooximetil)-fenil)-2-metoxiimino-N-metil-acetamida, piribencarb, triclopircarb/clorodincarb, famoxadona, fenamidona;

F.I 2) Inhibidores de complejo III en el sitio Q_i: ciazofamid, amisulbrom, [(3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[(3-acetoxi-4-metoxi-piridin-2-carbonilo)amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-il] 2-metilpropanoato, [(3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[[3-

- (acetoximetoxi)-4-metoxi-piridin-2-carbonilo]amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-il] 2-metilpropanoato, [(3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[(3-isobutoxicarbonilooxi-4-metoxi-piridin-2-carbonilo)amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-il] 2-metilpropanoato, [(3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[[3-(1,3-benzodioxol-5-ilometoxi)-4-metoxi-piridin-2-carbonilo]amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-il] 2-metilpropanoato; (3S,6S,7R,8R)-3-[[[(3-hidroxi-4-metoxi-2-piridinil)carbonilo]amino]-6-metil-4,9-dioxo-8-(fenilometil)-1,5-dioxonan-7-ilo 2-metilpropanoato;
- 5
- F.I 3) Inhibidores de complejo II (por ejemplo carboxamidas): benodanil, benzovindiflupir, bixafen, boscalid, carboxin, fenfuram, fluopiram, flutolanil, fluxaproxad, furametpir, isofetamid, isopirazam, mepronil, oxicarboxin, penflufen, pentiopirad, sedaxano, tecloftalam, tfluzamida, N-(4'-trifluorometiltiobifenilo-2-il)-3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, N-(2-(1,3,3-trimetil-butyl)-fenil)-1,3-dimetil-5-fluoro-1H-pirazol-4-carboxamida, 3-(difluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida, 3-(trifluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetil-indan-4-il)pirazol-4-carboxamida, 1,3-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida, 3-(trifluorometil)-1,5-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida, 1,3,5-trimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida, N-(7-fluoro-1,1,3-trimetil-indan-4-il)-1,3-dimetil-pirazol-4-carboxamida, N-[2-(2,4-diclorofenil)-2-metoxi-1-metil-etil]-3-(difluorometil)-1-metil-pirazol-4-carboxamida, N-[2-(2,4-difluorofenil)fenil]-3-(trifluorometil)pirazine-2-carboxamida;
- 10
- FI 4) otros inhibidores de la respiración (por ejemplo, complejo I, desacopladores): diflumetorim, (5,8-difluoroquinazolin-4-il)-{2-[2-fluoro-4-(4-trifluorometilpiridin-2-iloxi)-fenilo]-etil}-amina; derivados de nitrofenilo: binapacril, dinobuton, dinocap, fluazinam; ferimzón; compuestos organometálicos: sales de fentina, tales como acetato de fentina, cloruro de fentina o hidróxido de fentina; ametoctradina; y siltiofam;
- 15
- F.II) Inhibidores de la biosíntesis de esteroides (fungicidas SBI)
- F.II 1) C14 inhibidores de desmetilasa (fungicidas DMI): triazoles: azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, myclobutanil, oxpoconazol, paclobutrazol, penconazol, propiconazol, protioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, triticonazol, uniconazol, 1-[*rel*-(2S;3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)-oxiranylmethyl]-5-tio-cianato-1H-[1,2,4]triazol, 2-[*rel*-(2S;3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)-oxiranylmethyl]-2H-[1,2,4]triazol-3-tiol, 2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-1-(1,2,4-triazol-1-il)pentan-2-ol, 1-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-ciclopropilo-2-(1,2,4-triazol-1-il)etanol, 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, 2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-1-(1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-3-metil-1-(1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, 2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-3-metil-1-(1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol; imidazoles: imazalil, pefurazoato, procloraz, triflumizol; pirimidinas, piridinas y piperazinas: fenarimol, nuarimol, pirifenox, triforina, [3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)]isoxazol-4-il)-(3-piridil)metanol;
- 20
- 25
- 30
- F.II 2) Inhibidores delta 14-reductasa: aldimorf, dodemorf, dodemorfo-acetato, fenpropimorf, tridemorf, fenpropidina, piperalina, espiroxamina;
- 35
- F.II 3) Inhibidores de la 3-ceto reductasa: fenhexamid;
- F.III) Inhibidores de la síntesis de ácidos nucleicos
- F.III 1) fenilamidas o fungicidas de acil aminoácido: benalaxil, benalaxil-M, kiralaxil, metalaxil, metalaxil-M (mefenoxam), ofurace, oxadixil;
- 40
- F.III 2) otros: himexazol, octilina, ácido oxolínico, bupirimato, 5-fluorocitosina, 5-fluoro-2-(p-toluilmetoxi) pirimidin-4-amina, 5-fluoro-2-(4-fluorofenilmetoxi) pirimidin 4-amina;
- F.IV) Inhibidores de la división celular y citoesqueleto.
- F.IV 1) inhibidores de tubulina, tales como bencimidazoles, tiofanatos: benomil, carbendazim, fuberidazol, tiabendazol, tiofanato-metilo; triazolopirimidinas: 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina;
- 45
- F.IV 2) otros inhibidores de la división celular: dietofencarb, ethaboxam, pencicurón, fluopicolida, zoxamida, metrafenona, pirofenona;
- F.V) Inhibidores de la síntesis de aminoácidos y proteínas.
- F.V 1) inhibidores de la síntesis de metionina (anilino-pirimidinas): ciprodinilo, mepanipirim, pirimetanilo;
- 50
- F.V 2) inhibidores de la síntesis de proteínas: blasticidina-S, kasugamicina, hidrocloreto de kasugamicina-hidrato, mildiomicina, estreptomycin, oxitetraciclina, polioxina, validamicina A;
- F.VI) Inhibidores de la transducción de señales.
- F.VI 1) Inhibidores de MAP/histidina quinasa: fluoroimid, iprodiona, procimidona, vinclozolin, fenciclonil, fludioxonil;

- F.VI2) Inhibidores de la proteína G: quinoxifeno;
- F.VII) Inhibidores de la síntesis de lípidos y membranas.
- F.VII 1) Inhibidores de la biosíntesis de fosfolípidos: edifenfos, iprobenfos, pirazofos, isoprotilano;
- F.VII 2) peroxidación lipídica: diclorano, quintozeno, tecnazeno, tolclufos-metilo, bifenilo, cloroneb, etridiazol;
- 5 F.VII 3) biosíntesis de fosfolípidos y deposición de la pared celular: dimetomorf, flumorph, mandipropamid, pirimorph, bentiavalicarb, iprovalicarb, valifenalate y ácido-(4-fluorofenil) éster N-(1-(1-(1-(4-ciano-fenil)etanosulfonil)-but-2-il) carbámico;
- F.VII 4) Compuestos que afectan la permeabilidad de la membrana celular y los ácidos grasos: propamocarb, propamocarb-hidrocloruro;
- 10 F.VII 5) inhibidores de hidrolasa de amidas de ácidos grasos: oxatiapirolina;
- F.VIII) Inhibidores con acción multisitio
- F.VIII 1) sustancias activas inorgánicas: mezcla de Bordeaux, acetato de cobre, hidróxido de cobre, oxiclóruo de cobre, sulfato de cobre básico, azufre;
- F.VIII 2) tio y ditiocarbamatos: ferbam, mancozeb, maneb, metam, metiram, propineb, tiram, zineb, ziram;
- 15 F.VIII 3) Compuestos organoclorados (por ejemplo, ftalimidas, sulfamidas, cloronitrilos): anilazina, clorotalonil, captafol, captan, folpet, diclofluanida, diclorofeno, hexaclorobenceno, pentaclorfenol y sus sales, ftalida, toluilfluanida, N-(4-cloropenol)nitro-fenil)-N-etil-4-metil-bencenosulfonamida;
- F.VIII 4) guanidinas y otros: guanidina, dodina, base libre de dodina, guazatina, guazatina-acetato, iminoctadina, iminoctadina triacetato, iminoctadina-tris (albesilato), ditiánón, 2,6-dimetil-1H, 5H-[1], 4] ditiino [2,3-c: 5,6-c'] dipirrol-1,3,5,7 (2H, 6H)-tetraona;
- 20 F.IX) Inhibidores de la síntesis de la pared celular.
- F.IX 1) Inhibidores de la síntesis de glucano: validamicina, polioxina B;
- F.IX 2) Inhibidores de la síntesis de melanina: piroquilón, triciclazol, carpropamid, diciclomet, fenoxanil;
- F.X) Inductores de defensa vegetal.
- 25 F.X 1) acibenzolar-S-metilo, probenazol, isotianilo, tiadinilo, prohexadiona-calcio;
- F.X2) fosfonatos: fosetilo, fosetil-aluminio, ácido fosforoso y sus sales, 4-ciclopropil-N-(2,4-dimetoxifenil) tiadiazol-5-carboxamida;
- F.XI) Modo de acción desconocido.
- 30 bronopol, chinometionat, ciflufenamid, cymoxanil, dazomet, debacarb, diclomezine, difenzoquat, difenzoquat-metilsulfato, difeniloamin, fempirazamina, flumetover, flusulfamida, flutianil, metasulfocarb, nitrapirin, nitrothal-isopropilo, oxatiapirolin, picarbutrazox, tolprocarb, 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-(prop-2-in-1-ilooxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-ilo]-1,3-tiazol-2-il)]piperidin-1-il]etanona, 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-fluoro-6-(prop-2-in-1-ilooxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-ilo]-1,3-tiazol-2-il)]piperidin-1-il]etanona, 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-cloro-6-(prop-2-in-1-ilo-oxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-ilo]-1,3-tiazol-2-il)]piperidin-1-il]etanona, oxin-copper, proquinazid, tebufloquin, tecloftalam, triazóxido, 2-butoxi-6-yodo-3-propillocromen-4-ona, N-(ciclopropilmetoxiimino-(6-difluoro-metoxi-2,3-difluoro-fenil)-metil)-2-fenilo acetamida, N'-(4-(4-cloro-3-trifluorometil-fenoxi)-2,5-dimetil-fenil)-N-etil-N-metilo formamidina, N'-(4-(4-fluoro-3-trifluorometil-fenoxi)-2,5-dimetil-fenil)-N-etil-N-metilo formamidina, N'-(2-metil-5-trifluorometil-4-(3-trimetil-silanil-propoxi)-fenil)-N-etil-N-metilo formamidina, N'-(5-difluorometil-2-metil-4-(3-trimetilsilanil-propoxi)-fenil)-N-etil-N-metilo formamidina, 6-tert-butilo-8-fluoro-2,3-dimetil-quinolin-4-il éster de ácido metoxi-acético, 3-[5-(4-metilfenil)-2,3-dimetil-isoxazolidin-3-il]-piridina, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetil-isoxazolidin-3-il]-piridina (pirisoxazol), amida de ácido N-(6-metoxi-piridin-3-il) ciclopropanecarboxílico, 5-cloro-1-(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)-2-metil-1H-benzoimidazol, 2-(4-cloro-fenil)-N-[4-(3,4-dimetoxi-fenil)-isoxazol-5-il]-2-prop-2-inilo-acetamida, etilo (Z)-3-amino-2-ciano-3-fenilo-prop-2-enoato, pentilo N-[6-[[[(Z)-[(1-metiltetrazol-5-il)-fenilo-metilene]amino]oximetil]-2-piridilo]carbamatato, 2-[2-[(7,8-difluoro-2-metil-3-quinolil)oxi]-6-fluoro-fenil]propan-2-ol, 2-[2-fluoro-6-[(8-fluoro-2-metil-3-quinolil)oxi]fenil]propan-2-ol, 3-(5-fluoro-3,3,4,4-tetrametil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina, 3-(4,4-difluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina, 3-(4,4,5-trifluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina;
- 45 F.XII) Bioplaguicidas
- F.XII 1) Pesticidas microbianos con actividad activadora fungicida, bactericida, viricida y/o de defensa de plantas:
- 50 *Ampelomyces quisqualis*, *Aspergillus flavus*, *Aureobasidium pullulans*, *Bacillus amyloliquefaciens*, *B. mojavensis*, *B.*

5 pumilus, B. simplex, B. solisalsi, B. subtilis, B. subtilis var. amyloliquefaciens, Candida oleophila, C. saitoana, Clavibacter michiganensis (bacteriophages), Coniothyrium minitans, Cryphonectria parasitica, Cryptococcus albidus, Dilophosphora alopecuri, Fusarium oxisporum, Clonostachys rosea f. catenulate (also named Gliocladium catenulatum), Gliocladium roseum, Lysobacter antibioticus, L. enzymogenes, Metschnikowia fructicola, Microdochium
 10 dimerum, Microsphaeropsis ochracea, Muscodor albus, Paenibacillus polymyxa, Pantoea vagans, Phlebiopsis gigantea, Pseudomonas sp., Pseudomonas chloraphis, Pseudozyma flocculosa, Pichia anomala, Pythium oligandrum, Sphaerodes mycoparasitica, Streptomyces griseoviridis, S. lydicus, S. violaceusniger, Talaromyces flavus, Trichoderma asperellum, T. atroviride, T. fertile, T. gamsii, T. harmatum, T. harzianum; mixture of T. harzianum y T. viride; mixture of T. polysporum y T. harzianum; T. stromaticum, T. virens (also named Gliocladium virens), T. viride, Typhula phacorrhiza, Ulocladium oudemansii, Verticillium dahlia, virus del mosaico amarillo del calabacín (cepa avirulenta);

15 F.XII 2) Pesticidas bioquímicos con actividad activadora de defensa fungicida, bactericida, viricida y/o vegetal: quitosán (hidrolizado), proteína harpin, laminarina, aceite de pescado Menhaden, natamicina, proteína de la capa del virus de la viruela del ciruelo, bicarbonato de potasio o sodio, extracto de Reynoutria sachlinensis, ácido salicílico, aceite de árbol de té;

Los compuestos activos fungicidas mencionados anteriormente de los grupos FI a F.XI, su preparación y su acción contra hongos dañinos son generalmente conocidos (véase, por ejemplo, <http://www.hclrss.demon.co.uk/index.html>).

20 Los fungicidas de naturaleza química descritos por los nombres comunes, su preparación y su actividad contra las plagas son conocidos (cf. <http://www.alanwood.net/pesticides/>); estos pesticidas a menudo están disponibles comercialmente.

También se conocen los fungicidas descritos por la nomenclatura IUPAC, su preparación y su actividad pesticida (cf. Can. J. Plant Sci. 48(6), 587-94, 1968; EP-A 141 317; EP-A 152 031; EP-A 226 917; EP-A 243 970; EP-A 256 503; EP-A 428 941; EP-A 532 022; EP-A 1 028 125; EP-A 1 035 122; EP-A 1 201 648; EP-A 1 122 244, JP 2002316902; DE 19650197; DE 10021412; DE 102005009458; US 3,296,272; US 3,325,503; WO 98/46608; WO 99/14187; WO 99/24413; WO 99/27783; WO 00/29404; WO 00/46148; WO 00/65913; WO 01/54501; WO 01/56358; WO 02/22583; WO 02/40431; WO 03/10149; WO 03/11853; WO 03/14103; WO 03/16286; WO 03/53145; WO 03/61388; WO 03/66609; WO 03/74491; WO 04/49804; WO 04/83193; WO 05/120234; WO 05/123689; WO 05/123690; WO 05/63721; WO 05/87772; WO 05/87773; WO 06/15866; WO 06/87325; WO 06/87343; WO 07/82098; WO 07/90624, WO 11/028657, WO2012/168188, WO 2007/006670, WO 11/77514; WO13/047749, WO 10/069882, WO 13/047441, WO 03/16303, WO 09/90181, WO 13/007767, WO 13/010862, WO 13/024009 y WO 13/024010).

35 Los bioplaguicidas del grupo F.XII) de fungicidas, su preparación y su actividad pesticida, por ejemplo se conocen los hongos o insectos dañinos (e-Pesticide Manual V 5.2 (ISBN 978 1 901396 85 0) (2008-2011); <http://www.epa.gov/opp00001/biopesticides/>, vea las listas en el mismo; <http://www.omri.org/omri-lists>, vea las listas en el mismo; Bio-Pesticides Database BPDB <http://sitem.herts.ac.uk/aeru/bpdb/>, vea el enlace de la A a la Z en el mismo).

40 Los bioplaguicidas del grupo F.XII. También puede tener actividad insecticida, acaricida, molusquida, feromona, nematocida, reductor del estrés de las plantas, regulador del crecimiento de las plantas, promotora del crecimiento de las plantas y/o actividad que aumenta el rendimiento. Los bioplaguicidas del grupo L3) y/o L4 también pueden tener actividad fungicida, bactericida, viricida, activador de defensa de la planta, reductor de estrés de la planta, regulador del crecimiento de la planta, actividad que promueve el crecimiento de la planta y/o que mejora el rendimiento. Los bioplaguicidas del grupo F.XII también pueden tener actividad fungicida, bactericida, viricida, activadora de defensa de plantas, insecticida, acaricida, molusquida, feromona y/o nematocida.

Muchos de estos bioplaguicidas están registrados y/o están disponibles comercialmente: silicato de aluminio (Screen™ Duo de Certis LLC, EE. UU.), Agrobacterium radio-bacter K1026 (por ejemplo, NoGall® de Becker Underwood Pty Ltd., Australia), A. radiobacter K84 (Nature 280, 697-699, 1979; por ejemplo, GallTroll® de AG Biochem, Inc., C, EE. UU.), Ampelomyces quisqualis M-10 (por ejemplo, AQ 10® de Intrachem Bio GmbH & Co. KG, Alemania), Ascophyllum nodosum (algas marinas noruegas, algas marrones) extracto o filtrado (por ejemplo ORKA GOLD de Becker Underwood, Sudáfrica; o Goemar® de Laboratoires Goemar, Francia), Aspergillus flavus NRRL 21882 aislado de un maní en Georgia en 1991 por el USDA, National Peanut Research Laboratory (por ejemplo, en Afla-Guard® de Syngenta, CH), mezclas de Aureobasidium pullulans DSM14940 y DSM 14941 (por ejemplo, blastosporas en BlossomProtect® de bio-ferm GmbH, Alemania), Azospirillum brasilense XOH (por ejemplo, AZOS de Xtreme Gardening, EE. UU. o RTI Reforestation Technologies Internacional; Estados Unidos), Bacillus amyloliquefaciens FZB42 (por ejemplo, en RhizoVital® 42 de AbiTEP GmbH, Berlín, Alemania), B. amyloliquefaciens IN937a (J. Microbiol. Biotechnol. 17 (2), 280-286, 2007; por ejemplo, en BioYield® de Gustafson LLC, TX, EE. UU.), B. amyloliquefaciens IT-45 (CNCM I-3800) (por ejemplo, Rhizocell C de ITHec, Francia), B. amyloliquefaciens subsp. plantarum MBI600 (NRRL B-50595, depositado en el Departamento de Agricultura de los Estados Unidos) (por ejemplo, Integral®, Subtiled® NG de Becker Underwood, EE. UU.), B. cereus CNCM 1-1562 (EE. UU. 6,406,690), B. firmus CNCM 1-1582 (WO 2009/126473, WO 2009/124707, US 6,406,690; Votivo® de Bayer Crop Science LP, EE. UU.), B. pumilus GB34 (ATCC 700814; por ejemplo, en YieldShield® de Gustafson LLC, TX, USA), y Bacillus pumilus KFP9F (NRRL B-50754) (por ejemplo, en BAC-UP o FUSION-P de Becker Underwood South Africa), B. pumilus QST

2808 (NRRL B-30087) (por ejemplo, Sonata® y Ballad® Plus de AgraQuest Inc., EE. UU.), *B. subtilis* GB03 (por ejemplo, Kodiak® o BioYield® de Gustafson, Inc., EE. UU. O Companion® de Growth Products, Ltd., White Plains, NY 10603, EE. UU.), *B. subtilis* GB07 (Epic® de Gustafson, Inc., EE. UU.), *B. subtilis* QST-713 (NRRL B-21661 en Rhapsody®, Serenade® MAX y Serenade® ASO de AgraQuest Inc., EE. UU.), *B. subtilis* var. *amylolique-faciens* FZB24 (por ejemplo, Taegro® de Novozyme Biologicals, Inc., EE. UU.), *B. subtilis* var. *amyloliquefaciens* D747 (por ejemplo, Double Nickel 55 de Certis LLC, EE. UU.), *B. thuringiensis* ssp. *aizawai* ABTS-1857 (por ejemplo, en XenTari® de BioFa AG, Münsingen, Alemania), *B. t. ssp. aizawai* SAN 401 I, ABG-6305 y ABG-6346, *Bacillus t. ssp. israelensis* AM65-52 (por ejemplo, en VectoBac® de Valent BioSciences, IL, EE. UU.), *Bacillus thuringiensis* ssp. *kurstaki* SB4 (NRRL B-50753; por ejemplo, Beta Pro® de Becker Underwood, Sudáfrica), *B. t. ssp. kurstaki* ABTS-351 idéntico a HD-1 (ATCC SD-1275; por ejemplo, en Dipel® DF de Valent BioSciences, IL, EE. UU.), *B. t. ssp. kurstaki* EG 2348 (por ejemplo, en Lepinox® o Rapax® de CBC (Europa) S.r.l., Italia), *B. t. ssp. tenebrionis* DSM 2803 (EP 0 585 215 B1; idéntico a NRRL B-15939; Mycogen Corp.), *B. t. ssp. tenebrionis* NB-125 (DSM 5526; EP 0 585 215 B1; también conocido como SAN 418 I o ABG-6479; antigua cepa de producción de Novo-Nordisk), *B. t. ssp. tenebrionis* NB-176 (o NB-176-1) un mutante de alto rendimiento inducido por gamma-irradiado de la cepa NB-125 (DSM 5480; EP 585 215 B1; Novodor® de Valent BioSciences, Suiza), *Beauveria bassiana* ATCC 74040 (por ejemplo, en Naturalis® de CBC (Europe) Srl, Italia), *B. bassiana* DSM 12256 (US 200020031495; por ejemplo, BioExpert® SC de Live Sytems Technology SA, Colombia), *B. bassiana* GHA (BotaniGard® 22WGP de Laverlam Int. Corp., EE. UU.), *B. bassiana* PPRI 5339 (número ARSEF 5339 en la colección USDA ARS de cultivos de hongos entomopatógenos; NRRL 50757) (por ejemplo, BroadBand® de Becker Underwood, Sudáfrica), *B. brongniartii* (por ejemplo, en Melocont® de Agrifutur, Agrianello, Italia, para el control del abejorro; J. Appl. Microbiol. 100 (5), 1063-72, 2006), *Bradyrhizobium* sp. (por ejemplo, Vault® de Becker Underwood, EE. UU.), *B. japonicum* (por ejemplo, VAULT® de Becker Underwood, EE. UU.), *Candida oleophila* 1-182 (NRRL Y-18846; por ejemplo, Aspire® de Ecogen Inc., EE. UU., *Phytoparasitica* 23 (3), 231-234, 1995), *C. oleophila* cepa O (NRRL Y-2317; *Biological Control* 51, 403-408, 2009), *Candida saitoana* (por ejemplo, Biocure® (en mezcla con lisozima) y BioCoat® de Micro Flo Company, EE. UU. (BASF SE) y Arysta), *Chitosan* (por ejemplo, Armor-Zen® de BotriZen Ltd., NZ), *Clonostachys rosea* f. *catenulata*, también llamada *Gliocladium catenulatum* (por ejemplo, aislamiento J 1446: Prestop® de Verdera Oy, Finlandia), *Chromobacterium subsugae* PRAA4-1 aislada del suelo bajo una cicuta oriental (*Tsuga canadensis*) en la región de Catocin Mountain en Maryland central (por ejemplo, en GRANDEVO desde Marrone Bio Innovations, EE. UU.), *Coniothyrium minitans* CON/M/91-08 (por ejemplo Contans® WG de Prophyta, Alemania), *Cryphonectria parasitica* (por ejemplo, *Endothia parasitica* de CNICM, Francia), *Cryptococcus albidus* (por ejemplo, YIELD PLUS® de Anchor Bio- Technologies, Sudáfrica), *Cryptophlebia leucotreta granulovirus* (CrleGV) (por ejemplo, en CRYPTEX de Adermatt Biocontrol, Suiza), *Cydia pomonella granulovirus* (CpGV) V03 (DSM GV-0006; por ejemplo, en MADEX Max de Adermatt Biocontrol, Suiza), *CpGV* V22 DSM GV-0014; por ejemplo, en MADEX Twin de Adermatt Biocontrol, Suiza), *Delftia acidovorans* RAY209 (ATCC PTA-4249; WO 2003/57861; por ejemplo, en BIOBOOST de Brett Young, Winnipeg, Canadá), *Dilophosphora alopecuri* (Twist Fungus de Becker Underwood, Australia), extracto de *Ecklonia maxima* (alga marina) (por ejemplo, KELPAK SL de Kelp) Products Ltd, Sudáfrica), formononetina (por ejemplo, en MYCONATE de Plant Health Care plc, Reino Unido), *Fusarium oxysporum* (por ejemplo, BIOFOX® de SIAPA, Italia, FUSACLEAN® de Natural Plant Protection, Francia), *Glomus intraradices* (por ejemplo, MYC 4000 de ITHÉC, Francia), *Glomus intraradices* RTI-801 (por ejemplo, MYKOS de Xtreme Gardening, EE. UU. O RTI Reforestation Technologies International; EE. UU.), Semillas de pomelo y extracto de pulpa (por ejemplo, BC-1000 de Chemie SA, Chile), proteína harpin (alfa-beta) (por ejemplo, MESSENGER o HARP-N-Tek de Plant Health Care plc, Reino Unido; *Science* 257, 1- 132, 1992), *Heterorhabditis bacteriophaga* (por ejemplo, Nemasys® G de Becker Underwood Ltd., Reino Unido), *Isaria fumosorosea* Apopka-97 (ATCC 20874) (PFR-97™ de Certis LLC, EE. UU.), *Cis-jasmona* (US 8.221.73). 6), laminarina (por ejemplo, en VACCIPLANT de Laboratoires Goemar, St. Malo, Francia o Stähler SA, Suiza), *Lecanicillium longisporum* KV42 y KV71 (por ejemplo, VERTALEC® de Koppert BV, Países Bajos), *L. muscarium* KV01 (anteriormente *Verticillium lecanii*) (por ejemplo, MYCOTAL de Koppert BV, Netherlands), *Lysobacter antibioticus* 13-1 (*Biological Control* 45, 288-296, 2008), *L. antibioticus* HS124 (*Curr. Microbiol.* 59 (6), 608-615, 2009), *L. enzymogenes* 3.1T8 (*Microbiol. Res.* 158, 107-115; *Biological Control* 31 (2), 145-154, 2004), *Metarhizium anisopliae* var. *acidum* IMI 330189 (aislado de *Ornithacris cavroisi* en Níger; también NRRL 50758) (por ejemplo, GREEN MUSCLE® de Becker Underwood, Sudáfrica), *M. a. var. acidum* FI-985 (por ejemplo, GREEN GUARD® SC de Becker Underwood Pty Ltd, Australia), *M. anisopliae* FI-1045 (por ejemplo, BIOCANE® de Becker Underwood Pty Ltd, Australia), *M. anisopliae* F52 (DSM 3884, ATCC 90448; MET52® Novozymes Biologicals BioAg Group, Canadá), *M. anisopliae* ICIPE 69 (por ejemplo, METATHRIPOL de ICIPE, Nairobi, Kenia), *Metschnikowia fructicola* (NRRL Y-30752; por ejemplo, SHEMER® de Agrogreen, Israel, ahora distribuido por Bayer CropSciences, Alemania; US 6,994,849), *Microdochium dimerum* (por ejemplo, ANTIBOT® de Agrauxine, Francia), *Microphocherie Pops* (PAC) 74444 de un huerto abandonado, St-Joseph-du-Lac, Quebec, Canadá en 1993; *Mycologia* 94 (2), 297-301, 2002), *Muscudor albus* QST 20799 originalmente aislado de la corteza de un árbol de canela en Honduras (por ejemplo, en productos de desarrollo Muscudor™ o QRD300 de AgraQuest, EE. UU.), aceite de Neem (por ejemplo, TRILOGY®, TRIACT® 70 EC de Certis LLC, EE. UU.), cepas de *Nomuraea rileyi* SA86101, GU87401, SR86151, CG128 y VA9101, *Paecilomyces fumosoroseus* FE 9901 FLY™ de Natural Industries, Inc., EE. UU.), *P. lilacinus* 251 (por ejemplo, en BioAct®/MeloCon® de Prophyta, Alemania; *Crop Protection* 27, 352-361, 2008; originalmente aislado de huevos de nematodos infectados en Filipinas), *P. lilacinus* DSM 15169 (por ejemplo, NEMATA® SC de Live Systems Technology S.A., Colombia), *P. lilacinus* BCP2 (NRRL 50756; p.ej. PL GOLD de Becker Underwood BioAg SA Ltd, Sudáfrica), mezcla de *Paenibacillus alvei* NAS6G6 (NRRL B-50755), *Pantoea vagans* (anteriormente *aglomerantes*) C9-1 (originalmente aislado en 1994 de tejido de manzana; BlightBan C9-1® de NuFrams America Inc., EE. UU., Para el control del tizón del fuego en manzanas; *J. Bacteriol.* 192 (24) 6486-6487, 2010), *Pasteuria* spp. ATCC PTA-9643 (WO

- 2010/085795), *Pasteuria* spp. ATCC SD-5832 (WO 2012/064527), *P. nishizawae* (WO 2010/80169), *P. penetrans* (US 5,248,500), *P. ramosae* (WO 2010/80619), *P. thornea* (WO 2010/80169), *P. usgae* (WO 2010/80169), *Penicillium bilaiae* (por ejemplo, Jump Start® de Novozymes Biologicals BioAg Group, Canadá, originalmente aislado del suelo en el sur de Alberta; Fertilizer Res. 39, 97-103, 1994), *Phlebiopsis gigantea* (por ejemplo, RotStop® de Verdera Oy, Finlandia),
- 5 *Pichia anomala* WRL-076 (NRRL Y-30842; US 8,206,972), bicarbonato de potasio (por ejemplo, Amicarb® de Stähler SA, Suiza), silicato de potasio (por ejemplo, Sil-MATRIX™ de Certis LLC, EE. UU.), *Pseudozyma flocculosa* PF-A22 UL (por ejemplo, Sporodex® de Plant Products Co. Ltd., Canadá), *Pseudomonas* sp. DSM 13134 (WO 2001/40441, por ejemplo, en PRORADIX de Sourcon Padena GmbH & Co. KG, Heching Str. 262, 72072 Tübingen, Alemania),
- 10 *P. chloraphis* MA 342 (por ejemplo, en CERALL o CEDEMON de BioAgri AB, Uppsala, Suecia), *P. fluorescens* CL 145A (por ejemplo, en ZEQUANOX de Marrone BioInnovations, Davis, CA, EUA; J. Invertebr. Pathol. 113 (1): 104-14, 2013), *Pythium oligandrum* DV 74 (ATCC 38472; por ejemplo, POLYVERSUM® de Remeslo SSRO, Biopreparaty, Rep. Checa y GOWAN, EE. UU.; EE. UU. 2013/0035230), extracto de *Reynoutria sachlinensis* (por ejemplo, REGALIA® SC de Marrone BioInnovations, Davis, CA, EE. UU.), *Rhizobium leguminosarum* bv. *phaseolii* (por ejemplo, RHIZO-STICK de Becker Underwood, EE. UU.), *R. l. trifolii* RP113-7 (por ejemplo, DORMAL de Becker Underwood,
- 15 EE. UU.; Appl. Environ. Microbiol. 44 (5), 1096-1101), *R. l. bv. viciae* P1NP3Cst (también conocido como 1435; New Phytol 179 (1), 224-235, 2008; por ejemplo, en NODULATOR PL Peat Granule de Becker Underwood, EE. UU., o en NODULATOR XL PL de Becker Underwood, Canadá), *R. l. bv. viciae* SU303 (por ejemplo, NODULAID Grupo E de Becker Underwood, Australia), *R. l. bv. viciae* WSM1455 (por ejemplo NODULAID Grupo F de Becker Underwood, Australia), *R. tropici* SEMIA 4080 (idéntico a PRF 81; Soil Biology & Biochemistry 39, 867- 876, 2007), *Sinorhizobium meliloti* MSDJ0848 (INRA, Francia) también se refirió a cepa 2011 o RCR2011 (Mol Gen Genomics (2004) 272: 1-17; por ejemplo DORMAL ALFALFA de Becker Underwood, EE. UU.; NITRAGIN® Gold de Novozymes Biologicals BioAg Group, Canadá), *Sphaerodes mycoparasitica* IDAC 301008-01 (WO 2011/022809) , *Steinernema carpocapsae* (por ejemplo, MILLENIUM® de Becker Underwood Ltd., Reino Unido), *S. feltiae* (NEMASHIELD® de BioWorks, Inc., EE. UU.; NEMASYS® de Becker Underwood Ltd., Reino Unido), *S. kraussei* L137 (NEMASYS® L de Becker Underwood Ltd., Reino Unido), *Streptomyces griseoviridis* K61 (por ejemplo, MYCOSTOP® de Verdera Oy, Espoo, Finlandia; Crop Protection 25, 468-475, 2006), *S. lydicus* WYEC 108 (por ejemplo, Actinovate® de Natural Industries, Inc., EE. UU., EE. UU., EE. UU., 5.403.584), *S. violaceusniger* YCED-9 (por ejemplo, DT-9® de Natural Industries, Inc., EE. UU., EE. UU., EE. UU., EE. UU., EE. UU., 5.968.503), *Talaromyces flavus* V117b (por ejemplo, PROTUS® de Prophyta, Alemania), *Trichoderma asperellum* SKT-1 (por ejemplo, ECO-HOPE® de Kumiai Chemical) Industry Co., Ltd., Japón), *T. asperellum* ICC 012 (por ejemplo, en TENET WP, REMDIER WP, BIOTEN WP de Isagro NC, EE. UU., BIO-TAM de AgraQuest, EE. UU.), *T. atroviride* LC52 (por ejemplo, SENTINEL® de Agrimm Technologies Ltd, NZ), *T. atroviride* CNCM 1-1237 (por ejemplo, En Esquive WG de Agrauxine SA, Francia, por ejemplo, contra enfermedades por heridas por la poda en patógenos de vides y raíces de plantas), *T. fertile* JM41R (NRRL 50759; por ejemplo RICHPLUS™ de Becker Underwood Bio Ag SA Ltd, Sudáfrica), *T. gamsii* ICC 080 (por ejemplo En TENET WP, REMDIER WP, BIOTEN WP de Isagro NC, EE. UU., BIO-TAM de AgraQuest, EE. UU.), *T. h. arzianum* T-22 (por ejemplo, PLANTSHIELD® der Firma BioWorks Inc., EE. UU.), *T. harzianum* TH 35 (por ejemplo, ROOT PRO® de Mycontrol Ltd., Israel), *T. harzianum* T-39 (por ejemplo, TRICHODEX® y TRICHODERMA 2000® de Mycontrol Ltd., Israel y Makhteshim Ltd., Israel), *T. harzianum* y *T. viride* (por ejemplo, TRICHOPEL de Agrimm Technologies Ltd, NZ), *T. harzianum* ICC012 y *T. viride* ICC080 (por ejemplo, REMEDIER® WP de Isagro Ricerca, Italia), *T. polysporum* y *T. harzianum* (por ejemplo, BINAB® de BINAB Bio-Innovation AB, Suecia), *T. stromaticum* (por ejemplo, TRICOVAB® de CEPLAC, Brasil), *T. virens* GL-21 (también llamado *Gliocladium virens*) (por ejemplo, SOILGARD® de Certis LLC, EE. UU.), *T. viride* (por ejemplo, TRIECO® de Ecosense Labs. (India) Pvt. Ltd., Indien, BIO-CURE® F de T. Stanes & Co. Ltd., Indien), *T. viride* TV1 (por ejemplo, *T. viride* TV1 de Agribiotec srl, Italia) y *Ulocladium oudemansii* HRU3 (por ejemplo, en BOTRY-ZEN® de Botry-Zen Ltd, NZ).
- 45 Las cepas pueden obtenerse de recursos genéticos y centros de deposición: American Type Culture Collection, 10801 University Blvd., Manassas, VA 20110-2209, EE. UU. (Cepas con prefijo ATCC); CABI Europe-International Mycological Institute, Bakeham Lane, Egham, Surrey, TW20 9TYNRRL, Reino Unido (cepas con prefijo CABI e IMI); Centraalbureau voor Schimmelcultures, Fungal Biodiversity Center, Uppsalaan 8, PO Box 85167, 3508 AD Utrecht, Países Bajos (cepas con prefijo CBS); División de Industria Vegetal, CSIRO, Canberra, Australia (cepas con el prefijo CC); Colección Nacional de Cultivos de Microorganismos, Instituto Pasteur, 25 rue du Docteur Roux, F-75724 PARIS Cedex 15 (cepas con el prefijo CNCM); Leibniz-Institut DSMZ-Deutsche Sammlung von Mikroorganismen und Zellkulturen GmbH, Inhoffenstraße 7 B, 38124 Braunschweig, Alemania (cepas con el prefijo DSM); Colección de la Autoridad Internacional de Depositarios de Canadá, Canadá (cepas con el prefijo IDAC); Colección internacional de microorganismos de Plants, Landcare Research, Private Bag 92170, Auckland Mail Center, Auckland 1142, Nueva Zelanda (strans con el prefijo ICMP); IITA, PMB 5320, Ibadan, Nigeria (versión con el prefijo IITA); The National Collections of Industrial and Marine Bacteria Ltd., Torry Research Station, P.O. Box 31, 135 Abbey Road, Aberdeen, AB9 8DG, Escocia (cepas con prefijo NCIMB); ARS Culture Collection of the National Center for Agricultural Utilization Research, Agricultural Research Service, U.S. Department of Agriculture, 1815 North University Street, Peoria, Illinois 61604, USA (cepas con prefijo NRRL); Department of Scientific y Industrial Research Culture Collection, Applied Biochemistry Division, Palmerston North, New Zealand (cepas con prefijo NZP); FEPAGRO-Fundação Estadual de Pesquisa Agropecuária, Rua Gonçalves Dias, 570, Bairro Menino Deus, Porto Alegre/RS, Brasil (cepas con prefijo SEMIA); SARDI, Adelaida, Sur de Australia (cepas con prefijo SRDI); U.S. Department of Agriculture, Agricultural Research Service, Soybean y Alfalfa Research Laboratory, BARC-West, 10300 Baltimore Boulevard, Building 011, Room 19-9, Beltsville, MD 20705, USA (cepas con prefijo USDA: Beltsville Rhizobium Culture Collection Catalog March 1987 USDA-ARS ARS-30: http://pdf.usaid.gov/pdf_docs/PNAAW891.pdf); y Murdoch University, Perth, Western
- 65

Australia (strains with prefix WSM). Otras cepas se pueden encontrar en la Global catalogue of Microorganisms: <http://gcm.wfcc.info/> y <http://www.landcareresearch.co.nz/resources/collections/icmp> y otras referencias a las colecciones de cepas y sus prefijos en <http://refs.wdcm.org/collections.htm>.

5 Bacillus amyloliquefaciens subsp. plantarum MBI600 (NRRL B-50595) se deposita con el número de acceso NRRL B-50595 con la designación de cepa Bacillus subtilis 1430 (e idéntica a NCIMB 1237). Recientemente, MBI 600 ha sido reclasificado como Bacillus amyloliquefaciens subsp. plantarum con base en pruebas polifásicas que combinan métodos microbiológicos clásicos basados en una mezcla de herramientas tradicionales (tal como los métodos basados en cultivos) y herramientas moleculares (tal como el análisis de genotipos y ácidos grasos). Por lo tanto, Bacillus subtilis MBI600 (o MBI 600 o MBI-600) es idéntico a Bacillus amyloliquefaciens subsp. plantarum MBI600, anteriormente Bacillus subtilis MBI600. Bacillus amyloliquefaciens MBI600 se conoce como tratamiento de semilla de arroz que promueve el crecimiento de plantas de Int. J. Microbiol. Res. 3 (2) (2011), 120-130 y se describen con más detalle, por ejemplo en US 2012/0149571 A1. Esta cepa MBI600 está, por ejemplo, disponible comercialmente como producto de formulación líquida INTEGRAL® (Becker-Underwood Inc., EE. UU.).

15 La cepa FB17 de Bacillus subtilis se aisló originalmente de las raíces de remolacha roja en América del Norte (System Appl. Microbiol 27 (2004) 372-379). Esta cepa de B. subtilis promueve la salud de las plantas (US 2010/0260735 A1; WO 2011/109395 A2). B. subtilis FB17 también se ha depositado en ATCC con el número PTA-11857 el 26 de abril de 2011. La cepa de Bacillus subtilis FB17 puede denominarse en otro lugar como UD1022 o UD10-22.

20 Bacillus amyloliquefaciens AP-136 (NRRL B-50614), B. amyloliquefaciens AP-188 (NRRL B-50615), B. amyloliquefaciens AP-218 (NRRL B-50618), B. amyloliquefaciens AP-219 (NRRL B-50619), B. amyloliquefaciens AP-295 (NRRL B-50620), B. japonicum SEMIA 5079 (por ejemplo Gelfix 5 o Adhere 60 de Nitral Urbana Laboratories, Brasil, a BASF Company), B. japonicum SEMIA 5080 (por ejemplo GELFIX 5 o ADHERE 60 de Nitral Urbana Laboratories, Brasil, a BASF Company), B. mojavensis AP-209 (NRRL B-50616), B. solisalsi AP-217 (NRRL B-50617), B. pumilus cepa INR-7 (referido de otra manera como BU-F22 (NRRL B-50153) y BU-F33 (NRRL B-50185)), B. simplex ABU 288 (NRRL B-50340) y B. amyloliquefaciens subsp. plantarum MBI600 (NRRL B-50595) se han mencionado i.a. en la solicitud de patente US 20120149571, US 8,445,255, WO 2012/079073. Bradyrhizobium japonicum USDA 3 Se conoce de la patente de US 7,262,151.

30 Ácido jasmónico o sales (jasmonatos) o derivados incluyen sin limitación jasmonato de potasio, jasmonato de sodio, jasmonato de litio, jasmonato de amonio, jasmonato de dimetilamonio, jasmonato de isopropilamonio, jasmonato de diolamonio, jasmonato de dietrietanolamonio, éster metílico del ácido jasmónico, amida del ácido jasmónico, metilamida del ácido jasmónico, conjugados de ácido jasmónico-L-aminoácido conjugado (por ejemplo conjugados con L-isoleucina, L-valina, L-leucina, o L-fenilalanina), ácido 12-oxo-fitodienoico, coronatina, coronafacoil-L-serina, coronafacoil-L-treonina, ésteres metílicos de 1-oxo-indanoil-isoleucina, ésteres metílicos de 1-oxo-indanoil-leucina, metil éster del ácido coronalon (2-[(6-etil-1-oxo-indano-4-carbonil)-amino]-3-metil-pentanoico), ácido linoleico o sus derivados y cis-jasmona, o combinaciones de cualquiera de lo anterior.

35 Los humatos son ácidos húmicos y fúlvicos extraídos de una forma de carbón de lignito, y arcilla, conocidos como leonardita. Los ácidos húmicos son ácidos orgánicos que se producen en el humus y otros materiales derivados orgánicamente, como la turba y cierto carbón blando. Se ha demostrado que aumentan la eficiencia de los fertilizantes en la absorción de fosfatos y micronutrientes por parte de las plantas, así como en el desarrollo de sistemas de raíces de plantas.

40 Los compuestos de la invención se pueden mezclar con el suelo, la turba u otros medios de enraizamiento para la protección de las plantas contra enfermedades fúngicas transmitidas por las semillas, por el suelo o por las hojas.

Los ejemplos de sinergistas adecuados para uso en las composiciones incluyen butóxido de piperonilo, sesamex, safroxan y dodecil imidazol.

45 Los herbicidas y los reguladores del crecimiento de plantas adecuados para la inclusión en las composiciones dependerán del objetivo deseado y del efecto requerido.

Un ejemplo de un herbicida selectivo de arroz que puede incluirse es el propanilo. Un ejemplo de un regulador de crecimiento de plantas para uso en algodón es PIX™.

Algunas mezclas pueden comprender ingredientes activos que tienen propiedades físicas, químicas o biológicas significativamente diferentes, de tal manera que no se prestan fácilmente a las mismas.

50 La plaga de invertebrados (también conocida como "plaga animal"), es decir, insectos, arácnidos y nematodos, la planta, el suelo o el agua en que la planta crece o puede crecer puede ponerse en contacto con los compuestos de la presente invención o composiciones que las comprenden por cualquier método de aplicación conocido en la técnica. Como tal, "poner en contacto" incluye tanto el contacto directo (aplicando los compuestos/composiciones directamente sobre la plaga o la planta de invertebrados-típicamente al follaje, el tallo o las raíces de la planta) como el contacto indirecto (aplicando los compuestos/composiciones al locus de las plagas de invertebrados o la planta).

55 Los compuestos de la presente invención o las composiciones pesticidas que los comprenden pueden usarse para proteger a las plantas y cultivos en crecimiento del ataque o la infestación por plagas de animales, especialmente

insectos, ácaros o arácnidos al poner en contacto la planta/cultivo con una cantidad efectiva como pesticida de compuestos de la presente invención. El término "cultivo" se refiere tanto a cultivos en crecimiento como a cosechados.

5 Los compuestos de la presente invención y las composiciones que los comprenden son particularmente importantes en el control de una multitud de insectos en diversas plantas cultivadas, tales como cereales, cultivos de raíces, cultivos oleaginosos, vegetales, especias, plantas ornamentales, por ejemplo, semillas de trigo durum y otros trigo, cebada, avena, centeno, maíz (maíz forrajero y maíz de azúcar/maíz dulce y de campo), soja, cultivos oleaginosos, crucíferas, algodón, girasoles, bananas, arroz, colza, colza, remolacha, remolacha forrajera, patatas, pasto, césped, turba, pasto de forraje, tomates, puerros, calabacines/calabazas, col, lechuga iceberg, pimiento, pepinos, melones, especies de Brassica, melones, frijoles, guisantes, ajo, cebollas, zanahorias, plantas tuberosas tal como las patatas, caña de 10 azúcar, tabaco, uvas, petunias, geranio/pelargonios, pensamientos e impatiens.

15 Los compuestos de la presente invención se emplean como tales o en forma de composiciones para el tratamiento de insectos o plantas, materiales de propagación de plantas, tales como semillas, suelo, superficies, materiales o cuartos a proteger del ataque insecticida con una cantidad efectiva como insecticida de los compuestos activos. La aplicación puede llevarse a cabo tanto antes como después de la infección de las plantas, materiales de propagación de plantas, tal como semillas, suelo, superficies, materiales o cuartos por los insectos.

Además, las plagas de invertebrados se pueden controlar al poner en contacto la plaga objetivo, su suministro de alimentos, hábitat, sus terrenos de crianza o su locus con una cantidad de compuestos de la presente invención efectiva como pesticida. Como tal, la aplicación puede llevarse a cabo antes o después de la infección del locus, los cultivos en crecimiento o los cultivos cosechados por la plaga.

20 Los compuestos de la presente invención también pueden aplicarse de manera preventiva a lugares en los que se espera la aparición de plagas.

25 Los compuestos de la presente invención también se pueden usar para proteger las plantas en crecimiento del ataque o la infestación por plagas poniendo en contacto la planta con una cantidad efectiva como pesticida de compuestos de la presente invención. Como tal, el "poner en contacto" incluye tanto el contacto directo (aplicando los compuestos/composiciones directamente sobre la plaga y/o la planta-típicamente al follaje, el tallo o las raíces de la planta) como el contacto indirecto (aplicando los compuestos/composiciones al locus de la plaga y/o planta).

"Locus" significa un hábitat, terrenos de crianza, planta, semilla, suelo, área, material o entorno en el que una plaga o un parásito crece o puede crecer.

30 En general, "cantidad efectiva como pesticida" 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 pesticida puede variar para los diversos compuestos/composiciones usados en la invención. Una cantidad efectiva como pesticida de las composiciones también variará de acuerdo con las condiciones prevalecientes, tales como el efecto pesticida y duración deseados, el clima, las especies objetivo, el locus, el modo de aplicación y 35 similares.

En el caso del tratamiento del suelo o de la 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 m², preferiblemente de 0,001 a 20 g por 100 m².

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

40 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.

45 Para uso en el tratamiento de plantas de cultivo, la tasa de aplicación de los ingredientes activos de esta invención puede estar en el rango de 0,1 ga 4000 g por hectárea, deseablemente de 5 ga 500 g por hectárea, más deseablemente de 5 ga 200 g por hectárea.

Los compuestos de la presente invención son efectivos a través tanto del contacto (a través de suelo, vidrio, pared, red de cama, alfombra, partes de plantas o partes de animales) como de ingestión (cebo o parte de plantas).

50 Los compuestos de la presente invención también pueden aplicarse contra plagas de insectos que no afectan cultivos, tales como hormigas, termitas, avispas, moscas, mosquitos, grillos o cucarachas. Para el uso contra dichas plagas que no afectan cultivos, los compuestos de la presente invención se usan preferiblemente en una composición de cebo.

55 El cebo puede ser un líquido, un sólido o una preparación semisólida (por ejemplo, un gel). Los cebos sólidos se pueden formar en diversas formas y formas adecuadas para la aplicación respectiva, por ejemplo gránulos, bloques, barras, discos. Los cebos líquidos se pueden rellenar en diversos dispositivos para asegurar una aplicación adecuada, por ejemplo, contenedores abiertos, dispositivos de pulverización, fuentes de gotas o fuentes de evaporación. Los

geles se pueden basar en matrices acuosas o aceitosas y se pueden formular para necesidades particulares en términos de pegajosidad, retención de humedad o características de envejecimiento. El cebo empleado en la composición es un producto que es lo suficientemente atractivo como para incitar a los insectos como hormigas, termitas, avispa, 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 los mismos 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 y son conocidas por los expertos en la técnica.

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 ingrediente activo.

Las formulaciones de los compuestos de la presente invención como aerosoles (por ejemplo, en botes de pulverización), pulverizaciones de aceite o pulverizaciones 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 se componen preferiblemente del compuesto activo, disolventes tales como alcoholes inferiores (por ejemplo, metanol, etanol, propanol, butanol), cetonas (por ejemplo, acetona, metil etil cetona), hidrocarburos de parafina (por ejemplo, querosenos) que tienen rangos de ebullición de aproximadamente 50 a 250°C. °C, dimetilformamida, N-metilpirrolidona, dimetilsulfóxido, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, xileno, agua, además agentes auxiliares tales como emulsionantes tales como monooleato de sorbitol, etoxilato de oleilo con 3-7 moles de óxido de etileno, etoxilato de alcohol graso, aceites de perfume tales como aceites étereos, ésteres de ácidos grasos medios con alcoholes inferiores, compuestos carbonílicos aromáticos, si es apropiado estabilizadores tales como benzoato de sodio, surfactantes anfotéricos, epóxidos inferiores, ortoformiato de trietilo y, si es necesario, propelentes tales como propano, butano, nitrógeno, aire comprimido, éter dimetílico, dióxido de carbono, óxido nitroso o mezclas de estos gases.

Las formulaciones de aspersión de aceite difieren de las recetas de aerosol en que no se usan propelentes.

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 respectivas composiciones también pueden usarse en mosquiteros y bobinas de fumigación, cartuchos de humo, placas vaporizadoras o vaporizadores a largo plazo y también en papeles de polillas, almohadillas de polillas u otros sistemas de 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 de aire e impregnación de cortinas, tiendas de campaña, prendas de vestir, mosquiteros, trampas de mosca tsetse o similares. Las composiciones insecticidas para aplicación a fibras, telas, tejidos, telas no tejidas, material en red o láminas y lonas impermeables comprenden preferiblemente una mezcla que incluye el insecticida, opcionalmente un repelente y al menos un aglutinante. Repelentes adecuados, por ejemplo, son N,N-dietil-meta-toluanida (DEET), N,N-dietilfenilacetamida (DEPA), 1-(3-ciclohexan-1-il-carbonil)-2-metilpiperina, (2-hidroxi metilciclohexilo) ácido acético lactona, 2-etil-1,3-hexandiol, indalona, metilneodecanamida (MNDA), un piretroide no utilizado para el control de insectos tal como {(+/-)-3-allyl-2-metil-4-oxociclopent-2-(+)-enil-(+)-trans-crisantemato (Esbiotrina), un repelente derivado o idéntico a extractos de plantas como limoneno, eugenol, (+)-Eucamalol (1), (-)-1-epi-eucamalol o extractos de plantas crudas de plantas como Eucalyptus maculata, Vitex rotundifolia, Cymbopogon martinii, Cymbopogon citratus (hierba de limón), Cymbopogon nardus (citronella). Los aglutinantes adecuados se seleccionan, por ejemplo, de polímeros y copolímeros de ésteres vinílicos de ácidos alifáticos (tales como acetato de vinilo y versatato de vinilo), ésteres acrílicos y metacrílicos de alcoholes, tales como acrilato de butilo, acrilato de 2-etilhexilo y acrilato de metilo, mono- e hidrocarburos dietilénicamente insaturados, tal como el estireno, y residuos alifáticos, tal como el butadieno.

La impregnación de cortinas y mosquiteros se realiza en general sumergiendo el material textil en emulsiones o dispersiones del insecticida o asperjándolas sobre las redes.

Los compuestos de la presente invención y sus composiciones pueden usarse para proteger materiales de madera tales como árboles, cercas de tablas, durmientes, etc. y edificios tales como casas, dependencias, fábricas, pero también materiales de construcción, muebles, pieles, fibras, artículos de vinilo, alambres eléctricos y cables, 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). Los compuestos de la presente invención se aplican no solo a la superficie del suelo circundante o al suelo debajo del piso para proteger los materiales de madera, sino que también se pueden aplicar a artículos con entramado tales como las superficies del concreto debajo del piso, postes de alcoba, vigas, tableros contrachapados, muebles, etc., artículos de madera tales como tableros de partículas, medias tablas, etc., y artículos de vinilo tales como alambres eléctricos recubiertos, láminas de vinilo,

material aislante térmico tal como espumas de estireno, etc. En caso de aplicación contra hormigas que hacen daño a los cultivos o seres humanos, el controlador de hormigas de la presente invención se aplica a los cultivos o al suelo circundante, o se aplica directamente al nido de hormigas o similares.

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

10 Los compuestos de la presente invención son particularmente útiles para la protección de las semillas contra las plagas del suelo y las raíces y brotes de la planta resultantes contra las plagas del suelo y los insectos foliares. Se prefiere la protección de las raíces y brotes de la planta resultante. Más preferida es la protección de los brotes de la planta resultantes de los insectos perforadores y chupadores, en donde la protección contra los áfidos es la más preferida.

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

20 El término semilla abarca semillas y propágulos de plantas de todo tipo que incluyen, entre otros, semillas verdaderas, piezas de semillas, retoños, cormos, bulbos, frutos, tubérculos, granos, esquejes, brotes cortados y similares, y en una realización preferida, semillas verdaderas.

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 empapado de semillas y la granulación de semillas.

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

25 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.

30 Las semillas adecuadas son semillas de cereales, cultivos de raíces, cultivos oleaginosos, hortalizas, especias, plantas ornamentales, por ejemplo, semillas de trigo durum y otros de trigos, cebada, avena, centeno, maíz (maíz forrajero y maíz de azúcar/dulce y maíz de campo), soja, cultivos oleaginosos, crucíferas, algodón, girasoles, plátanos, arroz, colza oleaginosa, colza nabina, remolacha, remolacha forrajera, berenjenas, patatas, pasto, césped, turba, pasto de forraje, tomate, puerro, calabacines/calabazas, col, lechuga, pimienta, pepinos, melones, especies de Brassica, melones, frijoles, guisantes, ajos, cebollas, zanahorias, plantas tuberosas tal como patatas, caña de azúcar, tabaco, uvas, petunias, geranio/pelargonio, pensamientos e impatiens. Además, el compuesto activo también puede usarse para el tratamiento de semillas de plantas, que toleran la acción de herbicidas o fungicidas o insecticidas debido al cruzamiento, incluidos los métodos de ingeniería genética.

40 Por ejemplo, el compuesto activo se puede emplear en el tratamiento de semillas de plantas, que son resistentes a los herbicidas del grupo que consiste en las sulfonilureas, imidazolinonas, glufosinato de amonio o glifosato de isopropilamonio y sustancias activas análogas (véase, por ejemplo, EP-A 242 236, EP-A 242 246) (WO 92/00377) (EP-A 257 993, US 5,013,659) o en plantas de cultivos transgénicos, por ejemplo algodón, con la capacidad de producir toxinas de *Bacillus thuringiensis* (toxinas Bt) que producen plantas resistentes a ciertas plagas (EP-A 142 924, EP-A 193 259). Adicionalmente, el compuesto activo puede usarse también para el tratamiento de semillas de plantas, que tienen características modificadas en comparación con las plantas existentes, que pueden ser: generados, por ejemplo, por métodos de reproducción tradicionales y/o la generación de mutantes, o por procedimientos recombinantes). Por ejemplo, se han descrito varios casos de modificaciones recombinantes de plantas de cultivo con el fin de modificar el almidón sintetizado en las plantas (por ejemplo, los documentos WO 92/11376, WO 92/14827, WO 91/19806) o de plantas de cultivos transgénicos que tienen una composición de ácidos grasos modificada (documento WO 91/13972).

50 La aplicación del compuesto activo para el tratamiento de semillas se lleva a cabo rociando o espolvoreando las semillas antes de sembrar las plantas y antes de la aparición de las plantas.

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

A Concentrados solubles (SL, LS)

Emulsiones D (EW, EO, ES)

55 Suspensiones E (SC, OD, FS)

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

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

H-Formulaciones en gel (GF)

I Polvos regulables (DP, DS)

5 I Polvos pulverizables (DP, DS)

10 Las formulaciones convencionales para el tratamiento de semillas incluyen, por ejemplo, concentrados fluidos FS, soluciones LS, polvos para el tratamiento en seco DS, polvos dispersables en agua para el tratamiento con lodos WS, polvos solubles en agua SS y emulsión ES y EC y formulación de 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.

En una realización preferida, se usa una formulación de FS para el tratamiento de semillas. Típicamente, 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.

15 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 agente más húmedo 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 (espesante/agente de adhesión), opcionalmente hasta 5% en peso, por ejemplo 0,1 a 5% en peso de un aglutinante, 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.

Las formulaciones para el tratamiento de semillas también pueden comprender aglutinantes y opcionalmente colorantes.

25 Se pueden agregar aglutinantes para mejorar la adhesión de los materiales activos en las semillas después del tratamiento. Los aglutinantes adecuados son homo- y copolímeros de óxidos de alquileo como óxido de etileno u óxido de propileno, acetato de polivinilo, alcoholes de polivinilo, polivinilpirrolidonas y copolímeros de los mismos, copolímeros de etileno-acetato de vinilo, poliesténeros de las instalaciones de las instalaciones de las instalaciones de las instalaciones de la naturaleza, poliesténeros de las condiciones de la naturaleza, polietileno, polietilenaminas, polietilenaminas y polietilenaminas, polietilenaminas y polietilenamidos y almidón, homopolímeros y copolímeros de poliolefina, como copolímeros de olefina/anhídrido maleico, poliuretanos, poliésteres, homo y copolímeros de poliestireno.

30 Opcionalmente, también se pueden incluir colorantes en la formulación. Los colorantes o colorantes adecuados para las formulaciones para el tratamiento de semillas son Rhodamin B, C.I. Pigment Red 112, C.I. Solvent Red 1, pigment blue 15:4, pigment blue 15:3, pigment blue 15:2, pigment blue 15:1, pigment blue 80, pigment yellow 1, pigment yellow 13, pigment red 112, pigment red 48:2, pigment red 48:1, pigment red 57:1, pigment red 53:1, pigment orange 43, pigment orange 34, pigment orange 5, pigment green 36, pigment green 7, pigment white 6, pigment brown 25, basic violet 10, basic violet 49, acid red 51, acid red 52, acid red 14, acid blue 9, acid yellow 23, basic red 10, basic red 108.

Ejemplos de un agente gelificante es carragenano (Satiagel®)

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

45 Por lo tanto, la invención también se refiere a una semilla que comprende un compuesto de la presente invención, que incluye una sal del mismo útil en agricultura, como se define en el presente documento. La cantidad del compuesto de la presente invención, que incluye una sal agrícola útil del mismo, variará en general de 0,01 g a 10 kg por 100 kg de semilla, preferiblemente de 0,05 g a 5 kg por 100 kg de semilla, en particular de 0,1 g hasta 1000 g por 100 kg de semilla. Para cultivos específicos como la lechuga, la tasa puede ser mayor.

50 Los métodos que se pueden emplear para tratar la semilla son, en principio, todos los tratamientos de semilla adecuados y especialmente las técnicas de preparación de semillas conocidas en la técnica, tales como el recubrimiento de semillas (por ejemplo, la granulación de semillas), el espolvoreo de semillas y la imbibición de semillas (por ejemplo, remojo de semillas). Aquí, "tratamiento de semillas" se refiere a todos los métodos que ponen en contacto las semillas y los compuestos de la presente invención, y "cubrimiento de semillas" a métodos de tratamiento de semillas que proporcionan a las semillas una cantidad de los compuestos de la presente invención, es decir, que generan una semilla que comprende un compuesto de la presente invención. En principio, el tratamiento se puede aplicar a la semilla en cualquier momento desde la cosecha de la semilla hasta la siembra de la semilla. La

55

semilla se puede tratar inmediatamente antes o durante la siembra de la semilla, por ejemplo, utilizando el método de "caja de jardinería". Sin embargo, el tratamiento también puede llevarse a cabo varias semanas o meses, por ejemplo hasta 12 meses, antes de plantar la semilla, por ejemplo en forma de un tratamiento de preparación de semillas, sin que se observe una eficacia sustancialmente reducida.

- 5 Convenientemente, el tratamiento se aplica a las semillas no cultivadas. Tal como se usa en el presente documento, el término "semilla no cultivada" pretende incluir la semilla en cualquier período desde la cosecha de la semilla hasta la siembra de la semilla en el suelo con el propósito de la germinación y el crecimiento de la planta.

10 Específicamente, se sigue un procedimiento en el tratamiento en el que se mezcla la semilla, en un dispositivo adecuado, por ejemplo, un dispositivo de mezcla para parejas de mezcla sólido o sólido/líquido, con la cantidad deseada de formulaciones para el tratamiento de semillas, ya sea como tal o después de Dilución con agua, hasta que la composición se distribuya uniformemente sobre la semilla. Si es apropiado, esto es seguido por una etapa de secado.

Los compuestos de la presente invención, incluidos sus estereoisómeros, sales veterinariamente aceptables o N-óxidos, en particular también son adecuados para ser usados para combatir parásitos en y sobre animales.

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

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

25 La presente invención también proporciona un método para tratar, controlar, prevenir y proteger a los animales contra la infestación e infección por parásitos, que comprende administrar o aplicar por vía oral, tópica o parenteral a los animales una cantidad parasiticida de un compuesto de la presente invención, incluyendo sus estereoisómeros, sales o N-óxidos aceptables para uso veterinario, o una composición que lo contenga.

La invención también proporciona el uso de un compuesto de la presente invención, incluidos sus estereoisómeros, sales veterinariamente aceptables o N-óxidos, para tratar o proteger a un animal de la infestación o infección por plagas de invertebrados.

30 La invención también proporciona un proceso para la preparación de una composición para tratar, controlar, prevenir o proteger a los animales contra la infestación o infección por parásitos que comprende una cantidad parasiticida eficaz de un compuesto de la presente invención, incluyendo sus estereoisómeros, sales veterinariamente aceptables o N-Oxidos, o una composición que lo contenga.

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

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

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

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

Las infestaciones en animales y peces de sangre caliente incluyen, entre otros, piojos, piojos masticadores, garrapatas, lombrices nasales, keds, moscas picadoras, moscas muscoides, moscas, larvas de moscas miasóticas, niguas, jejenes, mosquitos y pulgas.

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

5 Los compuestos de la presente invención son especialmente útiles para combatir parásitos de los siguientes órdenes y especies, respectivamente:

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*,

10 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 columbiana*, *Psorophora discolor*, *Prosimulium mixtum*, *Sarcophaga haemorrhoidalis*, *Sarcophaga* sp., *Simulium vittatum*, *Stomoxys calcitrans*, *Tabanus bovinus*, *Tabanus atratus*, *Tabanus lineola*, y *Tabanus similis*,

20 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*.

25 garrapatas y ácaros parasíticos (Parasitiformes): garrapatas (Ixodida), por ejemplo *Ixodes scapularis*, *Ixodes holocyclus*, *Ixodes pacificus*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor variabilis*, *Amblyomma americanum*, *Amblyomma maculatum*, *Ornithodoros hermsi*, *Ornithodoros turicata* y ácaros parasíticos (Mesostigmata), por ejemplo *Ornithonyssus bacoti* y *Dermanyssus gallinae*,

30 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*,

35 Anoplurida, por ejemplo *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Pthirus* spp., y *Solenopotes* spp, Mallophagida (subórdenes *Amblycerina* e *Ischnocerina*), por ejemplo *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Trichodectes* spp., y *Felicola* spp,

Gusanos Nematoda:

40 Gusanos frotadores y Trichinosis (*Trichosyringida*), por ejemplo *Trichinellidae* (*Trichinella* spp.), (*Trichuridae*) *Trichuris* spp., *Capillaria* spp,

Rhabditida, por ejemplo *Rhabditis* spp, *Strongyloides* spp., *Helicephalobus* spp,

45 *Strongylida*, por ejemplo *Strongylus* spp., *Ancylostoma* spp., *Necator americanus*, *Bunostomum* spp. (Hookworm), *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 *Diocotophyma renale*,

50 gusanos intestinales (*Ascaridida*), por ejemplo *Ascaris lumbricoides*, *Ascaris suum*, *Ascaridia galli*, *Parascaris equorum*, *Enterobius vermicularis* (Threadworm), *Toxocara canis*, *Toxascaris leonine*, *Skrjabinema* spp., y *Oxiuris equi*,

Camallanida, por ejemplo *Dracunculus medinensis* (guinea worm)

Spirurida, por ejemplo *Thelazia* spp. *Wuchereria* spp., *Brugia* spp., *Onchocerca* spp., *Dirofilaria* spp.a, *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,

Planarios (Plathelminthes):

5 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 (Tapeworms), por ejemplo Diphylobothrium spp., Tenia spp., Echinococcus spp., Dipylidium caninum, Multiceps spp., Hymenolepis spp., Mesocostoides spp., Vampirolepis spp., Moniezia spp., Anoplocephala spp., Sirometra spp., Anoplocephala spp., y Hymenolepis spp.

10 La presente invención se refiere al uso no terapéutico de compuestos de la presente invención y composiciones que los comprenden para controlar y/o combatir parásitos en y/o sobre animales, y a los compuestos de la presente invención y composiciones que los comprenden para uso para controlar y/o combatir parásitos en y/o en animales. Los compuestos de la presente invención y las composiciones que los comprenden pueden usarse para proteger a los animales del ataque o la infestación por parásitos poniéndolos en contacto con una cantidad parasiticida de los compuestos de la presente invención y composiciones que los contienen.

15 Los compuestos de la presente invención y las composiciones que los comprenden pueden ser efectivos tanto a través de contacto (a través del suelo, vidrio, pared, mosquitero, alfombras, mantas o partes de animales) como de la ingestión (por ejemplo, los cebos). Como tal, "poner en contacto" incluye tanto contacto directo (aplicación de las mezclas de pesticidas/composiciones que contienen los compuestos de la presente invención directamente sobre el parásito, que puede incluir un contacto indirecto en su locus-P, y opcionalmente también la administración de las mezclas de pesticida/composición directamente sobre el animal que se va a proteger) y contacto indirecto (aplicación de los compuestos/composiciones al locus del parásito). El contacto del parásito mediante la aplicación a su locus es un ejemplo de un uso no terapéutico de los compuestos de la presente invención. "Locus-P" tal como es utilizado anteriormente significa el hábitat, suministro de alimentos, terrenos de crianza, área, material o ambiente en el cual un parásito está creciendo o puede crecer fuera del animal.

20 En general, "cantidad efectiva como parasiticida" significa la cantidad de ingrediente activo necesaria para lograr un efecto observable sobre el crecimiento, incluyendo los efectos de necrosis, muerte, retardo, prevención, y remoción, destrucción, o de otra manera disminución de la ocurrencia y actividad del organismo objetivo. La cantidad efectiva como parasiticida puede variar para los diversos compuestos /composiciones de la presente invención. Una cantidad efectiva como parasiticida de las composiciones variará también de acuerdo con las condiciones prevalecientes tales como el efecto parasiticida deseado y la duración, la especie objetivo, modo de aplicación, y similares.

30 Los compuestos de la presente invención también se pueden aplicar preventivamente a lugares en los que se espera la ocurrencia de las plagas o parásitos.

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

40 Los compuestos de la invención son mejor biodegradables que los de la técnica anterior y, además, conservan un alto nivel de control de plagas. Esto los hace superiores en términos de seguridad ambiental. A la luz de las similitudes estructurales de los compuestos de fórmula I, esta diferencia significativa en la biodegradabilidad a favor de los compuestos de la invención es inesperada y no puede derivarse de lo que se conoce de la técnica anterior.

Ejemplos

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

I. Ejemplos de preparación

45 Los compuestos se pueden caracterizar, por ejemplo por cromatografía líquida de alto rendimiento/espectrometría de masas (HPLC/MS), por ¹H-RMN y/o por sus puntos de fusión.

Columna de HPLC analítica:

50 Método A: Columna analítica UPLC: Phenomenex Kinetex 1,7 μm XB-C18 100A; 50 x 2.1 mm de Phenomenex, Alemania. Elución: acetonitrilo + 0.1% de ácido trifluoroacético (TFA)/agua + 0.1% de ácido trifluoroacético (TFA) en una proporción de 5:95 a 100: 0 en 1.5 min a 60 °C. Flujo: 0,8 ml/min a 1 ml/min en 1,5 min. Método MS: ESI positivo.

¹H-RMN: las señales se caracterizan por el desplazamiento químico (ppm, δ [delta]) vs. tetrametilsilano, respectivamente, CDCl₃ para ¹³C-RMN, por su multiplicidad y por su integral (número relativo de átomos de hidrógeno

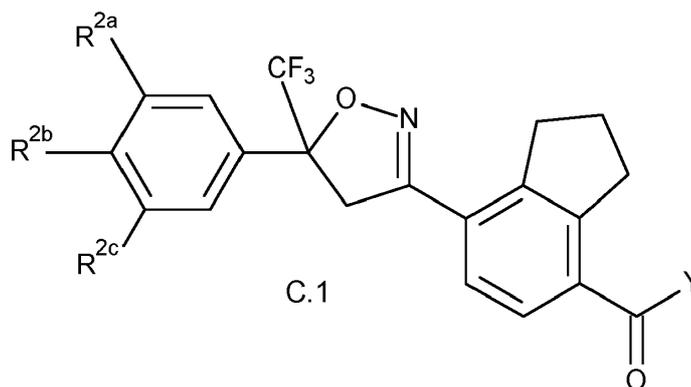
dado). Las siguientes abreviaturas se utilizan para caracterizar la multiplicidad de las señales: m = multiplete, q = cuarteto, t = triplete, d = doblete y s = singlete.

Las abreviaturas utilizadas son: d para día(s), h para hora(s), mín. para minuto(s), r.t./temperatura ambiente para 20-25 °C, THF para tetrahidrofurano, DCE para dicloroetano, PyBroP para hexafluorofosfato de bromotripirrolidinofosfonio.

5

C.1 Ejemplos de compuestos 1

Los ejemplos de compuestos 1-1 a 1-138 corresponden a compuestos de fórmula C.1:



en donde R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y Y de cada compuesto sintetizado se definen en una fila de la tabla C.1 a continuación.

10 Los compuestos se sintetizaron en analogía con el Ejemplo de síntesis S.1.

Tabla C.1

Ej.	R ^{2a} , R ^{2b} , R ^{2c}	-Y	HPLC-MS:		
			Método, R _t (min) & [M+H] ⁺		
			o		
			¹ H-RMN		
1-1	Cl, F, Cl	-OCH ₃	A	1.559	477.5
1-2	Cl, F, Cl	-OH	A	1.446	461.4
1-3	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -ciclopropilo	¹ H RMN (400 MHz, CDCl ₃): δ 7.6 (m, 2H), 7.5 (m, 1H), 7.2 (m, 1H), 6.0 (s, 1H), 4.2 (d, 1H), 3.8 (d, 1H), 3.4-3.3 (m, 2H), 3.3-3.1 (m, 4H), 2.2-2.1 (m, 2H), 1.1-1.0 (m, 1H), 0.6-0.5 (m, 2H), 0.3-0.2 (m, 2H).		
1-4	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ C(=O)NHCH ₂ CF ₃	A	1.355	599.8
1-5	Cl, F, Cl	-NH-(1,1-dioxo-tietan-3-il)	A	1.402	564.3
1-6	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(2-piridil)	A	1.248	551.4
1-7	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(2-pirimidinil)	A	1.432	552.4
1-8	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(tietan-3-il)	A	1.464	546.8
1-9	Cl, F, Cl	-NH-(tietan-3-il)	A	1.460	532.8

ES 2 710 217 T3

Ej.	R ^{2a} , R ^{2b} , R ^{2c}	-Y	HPLC-MS:		
			Método, R _t (min) & [M+H] ⁺		
			o		
			¹ H-RMN		
1-10	Cl, F, Cl	-NH-(1-oxo-tietan-3-il)	A	1.305	548.8
1-11	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ CH=CH ₂	A	1.440	500.8
1-12	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ CF ₃	A	1.467	542.8
1-13	Cl, F, Cl	-NH-(1-ciano-ciclopropil)	A	1.410	525.9
1-14	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ C≡CH	A	1.409	498.8
1-15	Cl, F, Cl	-NH ₂	A	1.460	460.4
1-16	Cl, F, Cl	-NHNH-(2-pirimidinil)	A	1.446	553.4
1-17	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ CN	A	1.515	499.4
1-18	Cl, F, Cl	-NH-CH ₂ -(1,1-dioxo-tietan-3-il)	A	1.342	578.9
1-19	Cl, F, Cl	-NH-(2,2-dimetil-1,1-dioxo-tietan-3-il)	A	1.430	592.9
1-20	Cl, F, Cl	-NH-(2,2-dimetiltietan-3-il)	A	1.538	561.3
1-21	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(1,1-dioxotietan-2-il)	A	1.372	579.3
1-22	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -CH=CH-CH ₃ (trans)	A	1.479	514.9
1-23	Cl, F, Cl	-NHCH=NOCH ₃	A	1.513	518.0
1-24	Cl, H, Cl	-NH ₂	A	1.319	442.9
1-25	Cl, H, Cl	-NHNH-(2-pirimidinil)	A	1.317	535.9
1-26	Cl, H, Cl	-NHCH=NOCH ₃	A	1.488	500.0
1-27	Cl, H, Cl	-NHCH ₂ -(2-piridil)	A	1.259	534.0
1-28	Cl, H, Cl	-NHCH ₂ C(=O)NHCH ₂ CF ₃	A	1.369	582.0
1-29	Cl, H, Cl	-NHCH ₂ CF ₃	A	1.463	524.9
1-30	Cl, H, Cl	-NHCH ₂ -(2-pirimidinil)	A	1.357	535.0
1-31	Cl, H, Cl	-NH-ciclopropilo	A	1.404	483.0
1-32	Cl, H, Cl	-NHCH ₂ -(tiazol-4-il)	A	1.380	539.9

ES 2 710 217 T3

Ej.	R ^{2a} , R ^{2b} , R ^{2c}	-Y	HPLC-MS:		
			Método, R _t (min) & [M+H] ⁺		
			o		
			¹ H-RMN		
1-33	Cl, H, Cl	-NH-(1,1-dioxo-tietan-3-il)	A	1.347	547.0
1-34	Cl, H, Cl	-NH-(tietan-3-il)	A	1.450	514.9
1-35	Cl, H, Cl	-NHCH ₂ -ciclopropilo	A	1.456	496.9
1-36	Cl, H, Cl	-NHCH ₂ -(1,1-dioxo-tietan-3-il)	A	1.353	561.0
1-37	Cl, H, Cl	-NH-CH(CH ₃)- C(=O)NHCH ₂ CF ₃	A	1.403	596.0
1-38	Cl, H, Cl	-NH-[(4R)-2-etil-3-oxo- isoxazolidin-4-il]	A	1.377	556.0
1-39	Cl, H, Cl	-NH-[(4R)-3-oxo-2-(2,2,2- trifluoroetil)isoxazolidin-4-il]	A	1.425	609.9
1-40	Cl, H, Cl	-N(CH ₃)-CH ₂ -(2-piridil)	A	1.284	548.5
1-41	Cl, H, Cl	-N(CH ₂ CH ₃)-CH ₂ -(2-piridil)	A	1.313	562.1
1-42	Cl, H, Cl	-NH-(1-oxo-tietan-3-il)	A	1.304	531.0
1-43	Cl, H, Cl	-NH-[(4S)-2-etil-3-oxo- isoxazolidin-4-il]	A	1.396	556.0
1-44	Cl, F, Cl	-NH-CH ₂ CH ₃	A	1.428	489.0
1-45	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ C(=O)NHCH ₂ CH ₃	A	1.350	548.0
1-46	Cl, F, Cl	-NH-ciclopropilo	A	1.430	503.0
1-47	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ C(=O)NH-ciclopropilo	A	1.358	558.0
1-48	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ C(=O)NHCH ₂ CH ₂ F	A	1.334	564.0
1-49	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ C(=O)NHCH ₂ CHF ₂	A	1.359	582.0
1-50	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(2,2- difluorociclopropil)	A	1.466	551.0
1-51	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ C(=O)NHCH ₂ C≡CH	A	1.347	556.0
1-52	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ C(=O)-NHCH ₂ CH=CH ₂	A	1.368	558.0
1-53	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ C(=O)-NHCH ₃	A	1.315	532.0

ES 2 710 217 T3

Ej.	R ^{2a} , R ^{2b} , R ^{2c}	-Y	HPLC-MS:		
			Método, R _t (min) & [M+H] ⁺		
			o		
			¹ H-RMN		
1-54	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(4-tiazolil)	A	1.402	558.0
1-55	Cl, F, Cl	-NH-(3-tetrahidrofuranil)	A	1.395	531.0
1-56	Cl, H, Cl	-OH	¹ H RMN (400 MHz, CDCl ₃): δ 7.96 (d, 1H), 7.51 (s, 2H), 7.43 (s, 1H), 7.26 (d, 1H), 4.15 (d, 1H), 3.76 (d, 1H), 3.40-3.33 (m, 2H), 3.24-3.20 (m, 2H), 2.20-2.10 (m, 2H)		
1-57	Cl, H, Cl	-NHCH ₂ -(tietan-3-il)	A	1.446	529.0
1-58	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -ciclobutilo	A	1.524	529.1
1-59	Cl, F, Cl	-NH-(3,3-difluorociclobutil)	A	1.471	551.0
1-60	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(3,3-difluorociclobutil)	A	1.477	565.0
1-61	Cl, F, Cl	-NH-[(4 <i>R</i>)-3-oxo-2-(2,2,2-trifluoroetil)isoxazolidin-4-il]	A	1.426	627.9
1-62	Cl, F, Cl	-NH-[(4 <i>S</i>)-2-etil-3-oxo-isoxazolidin-4-il]	A	1.385	574.0
1-63	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(3-piridazinil)	A	1.303	552.9
1-64	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(5-bromopirimidin-2-il)	A	1.454	632.8
1-65	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -[(1-difluorometil)ciclopropil]	A	1.464	564.9
1-66	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ C(=O)-NHCH ₂ -ciclopropilo	A	1.394	572.0
1-67	Cl, F, Cl	-NH-ciclobutilo	A	1.466	514.9
1-68	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -[4,6-bis(trifluorometil)pirimidin-2-il]	A	1.546	689.0
1-69	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(2,2-diclorociclopropil)	A	1.526	584.9
1-70	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ CCl=CCl ₂	A	1.560	604.9
1-71	Cl, F, Cl	-N HCH ₂ -[4-(trifluorometil)pirimidin-2-il]	A	1.480	621.0
1-72	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(5-cloropirimidin-2-il)	A	1.463	588.9
1-73	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(4-metil-pirimidin-2-il)	A	1.396	566.9

ES 2 710 217 T3

Ej.	R ^{2a} , R ^{2b} , R ^{2c}	-Y	HPLC-MS:		
			Método, R _t (min) & [M+H] ⁺		
			o		
			¹ H-RMN		
1-74	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(4,6-dimetil-pirimidin-2-il)	A	1.411	581.0
1-75	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -[4-metil-6-(trifluorometil)pirimidin-2-ilo	A	1.496	635.0
1-76	Cl, F, H	-NHCH ₂ -(2-pirimidinil)	A	1.290	519.0
1-77	Cl, F, H	-NHCH ₂ -(2-piridil)	A	1.148	518.1
1-78	Cl, F, H	-NHCH ₂ C(=O)NHCH ₂ CF ₃	A	1.300	566.0
1-79	Cl, F, H	-NH-(1,1-dioxo-tietan-3-il)	A	1.281	531.0
1-80	Cl, F, Cl	-H	A	1.525	445.9
1-81	Cl, F, H	-OH	A	1.346	428.0
1-82	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(2-metil-tetrazol-5-il)	A	1.373	557.0
1-83	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(5-fluoro-pirimidin-2-il)	A	1.418	571.0
1-84	Cl, F, Cl	-NH-(3-piridil)	A	1.241	538.0
1-85	Cl, F, Cl	-NHNHC(=O)NHCH ₂ CF ₃	A	1.338	600.9
1-86	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(1,2,4-oxadiazol-3-il)	A	1.375	542.9
1-87	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(1,3,4-tiadiazol-2-il)	A	1.363	558.9
1-88	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(4-cloro-pirimidin-2-il)	A	1.440	588.8
1-89	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(5-metil-pirimidin-2-il)	A	1.404	567.0
1-90	Cl, F, Cl	-NH-[(4 <i>R</i>)-2-etil-3-oxo-isoxazolidin-4-il]	A	1.393	574.1
1-91	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	A	1.336	567.0
1-92	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(1-metil-1,2,3-triazol-4-il)	A	1.332	556.0
1-93	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(1-metil-1,2,4-triazol-3-il)	A	1.307	556.0
1-94	Cl, F, Cl	3-etil-4-oxo-imidazolidin-1-ilo	A	1.375	558.0

ES 2 710 217 T3

Ej.	R ^{2a} , R ^{2b} , R ^{2c}	-Y	HPLC-MS:		
			Método, R _t (min) & [M+H] ⁺		
			o		
			¹ H-RMN		
1-95	Cl, F, Cl	4-oxo-3-(2,2,2-trifluoroetil)imidazolidin-1-ilo	A	1.426	612.0
1-96	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(1-metil-tetrazol-5-il)	A	1.351	557.0
1-97	Cl, F, Cl	-NHNHC(=O)NHCH ₂ CF ₂ H	¹ H RMN (400 MHz, d ₆ -DMSO): δ 10.0 (s, 1H), 8.2 (s, 1H), 7.8 (m, 2H), 7.6 (d, 1H), 7.5 (d, 1H), 6.8 (s, 1H), 6.2-5.8 (m, 1H), 4.5-4.3 (m, 2H), 3.6-3.4 (m, 2H), 3.2-3.0 (m, 4H), 2.1-1.9 (m, 2H)		
1-98	Cl, F, Cl	-NHNHC(=O)NHCH ₂ CH ₃	A	1.309	547.0
1-99	Cl, F, Cl	-NH-(5-pirimidinil)	A	1.404	539.0
1-100	Cl, F, Cl	-NHNHC(=O)NHCH ₃	A	1.275	533.0
1-101	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(oxazol-2-il)	A	1.387	554.1
1-102	Cl, F, Cl	-NHN(CH ₃)-(2-pirimidinil)	A	1.407	568.1
1-103	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ CH ₂ SCH ₃	A	1.466	535.0
1-104	Cl, F, Cl	-NH-[2-oxo-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirrolidin-3-il]	A	1.413	626.1
1-105	Cl, F, Cl	-NH-(2-pirazinil)	A	1.467	539.0
1-106	Cl, F, Cl	-NH-(1-metil-pirazol-3-il)	A	1.422	541.1
1-107	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(1-(trifluorometil)ciclopropil)	A	1.525	583.1
1-108	Cl, F, Cl	-NH-(3-metil-isotiazol-5-il)	A	1.460	558.0
1-109	Cl, F, Cl	-NHNH-(2-piridil)	A	1.164	553.0
1-110	Cl, F, Cl	-NH-(3-piridazinil)	A	1.419	539.0
1-111	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(1,3-dioxolan-2-il)	A	1.399	547.1
1-112	Cl, F, Cl	-NH-(1-metil-2-oxopirrolidin-3-il)	A	1.336	558.0
1-113	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(4-pirimidinil)	A	1.355	553.1
1-114	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(1-metil-pirazol-3-il)	A	1.376	555.1
1-115	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ CH ₂ CF ₂ H	A	1.444	539.1

ES 2 710 217 T3

Ej.	R ^{2a} , R ^{2b} , R ^{2c}	-Y	HPLC-MS:		
			Método, R _t (min) & [M+H] ⁺		
			o		
			¹ H-RMN		
1-116	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ CH ₂ -(1,3-dioxolan-2-il)	A	1.421	561.1
1-117	Cl, F, Cl	-NH-(1-etil-2-oxo-pirrolidin-3-il)	A	1.369	572.1
1-118	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(4-oxazolil)	A	1.374	542.0
1-119	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(4-metil-1,2,4-triazol-3-il)	A	1.207	556.1
1-120	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(3-isoxazolil)	A	1.403	542.1
1-121	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(2-metil-pirazol-3-il)	A	1.369	555.1
1-122	Cl, F, Cl	-NH-(1-metil-5-oxo-1,2,4-triazol-4-il)	A	1.324	558.1
1-123	F, H, OCF ₃	-NHCH ₂ -(2-pirimidinil)	A	1.342	569.1
1-124	F, H, OCF ₃	-NHCH ₂ -(2-piridil)	A	1.177	568.1
1-125	Cl, F, Cl	-NH-[(4 <i>R</i>)-2-metil-3-oxo-isoxazolidin-4-il]	A	1.358	560.1
1-126	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -ciclopentilo	A	1.558	543.0
1-127	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(2-tetrahidrofuranil)	A	1.439	545.1
1-128	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ CF ₂ H	A	1.438	524.9
1-129	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ CFH ₂	A	1.406	507.1
1-130	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(1-ciano-ciclopropil)	A	1.412	540.1
1-131	Cl, F, Cl	-NH-(2,2-difluorociclopropil)	A	1.450	537.0
1-132	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(1-oxo-tietan-3-il)	A	1.302	563.1
1-133	Cl, F, Cl	-NH-(4-piridazinil)	A	1.277	539.0
1-134	F, H, OCF ₃	-NH-(1,1-dioxo-tietan-3-il)	A	1.330	581.0
1-135	F, H, OCF ₃	-NHCH ₂ C(=O)NHCH ₂ CF ₃	A	1.356	616.1
1-136	Cl, F, Cl	-N=S(CH ₂ CH ₃) ₂	A	1.349	549.0
1-137	Cl, F, Cl	-NH-(1-ciano-ciclobutilol)	A	1.454	540.1

Ej.	R ^{2a} , R ^{2b} , R ^{2c}	-Y	HPLC-MS:		
			Método, R _t (min) & [M+H] ⁺		
			o		
			¹ H-RMN		
1-138	F, H, OCF ₃	-NH-[(4 <i>R</i>)-2-etil-3-oxo-isoxazolidin-4-il]	A	1.363	590.1

Ejemplo de síntesis S.1

N-(Ciclopropilometil)-7-[5-(3,5-dicloro-4-fluoro-fenil)-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il]indano-4-carboxamida

5 (Ejemplo de compuesto 1-3; compuesto de fórmula C.1, en donde R^{2a} y R^{2c} son Cl, R^{2b} es F, y -Y es -NHCH₂-ciclopropil)

(7-Acetilindano-4-il) trifluorometanosulfonato (CAS 1312609-69-0) fue sintetizado como se describe en US 2011/0152246 (p. 118, compuesto I-III f).

Etapa 1: 7-acetilindano-4-carboxilato de metilo

10 A una solución de (7-acetilindano-4-il) trifluorometanosulfonato (40 g) en metanol (357 ml) se le añadió Na₂CO₃ (27.5 g) y [1,1'-bis (difenilfosfino)ferroceno]dicloro-paladio (II) (Pd (dppf)Cl₂, 9,5 g). La solución se presurizó con monóxido de carbono (50 psi) y se calentó a 50°C durante 5 h. Luego, la mezcla se filtró y el filtrado se concentró. El residuo se disolvió en CH₂Cl₂ y se lavó con salmuera, se secó (Na₂SO₄), se filtró y se concentró para dar un residuo, que se purificó por cromatografía instantánea sobre sílica gel (éter de petróleo/acetato de etilo) para proporcionar el producto (18,3 g, 64%).

15 ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 7.9 (d, 1H), 7.7 (d, 1H), 4.0 (s, 3H), 3.3-3.2 (m, 4H), 2.6 (s, 3H), 2.1 (m, 2H).

Etapa 2: 7-[(3-(3,5-dicloro-4-fluoro-fenil)-4,4,4-trifluoro-but-2-enil]indano-4-carboxilato de metilo

20 A una solución del producto de la etapa 1 (12 g) y 1-(3,5-dicloro-4-fluoro-fenil)-2,2,2-trifluoro-etanona (28,7 g, CAS 1190865-44-1) en DCE (100 ml) se añadió K₂CO₃ (7,6 g) y trietilamina (7,6 ml). La reacción se agitó a reflujo durante la noche. Luego, la mezcla se enfrió hasta temperatura ambiente, se filtró y se concentró para dar un residuo, que se purificó por cromatografía instantánea sobre sílica gel (éter de petróleo/acetato de etilo) para proporcionar el producto (18,75 g, 74%).

¹H RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 7.8 (m, 1H), 7.5 (m, 1H), 7.3 (m, 1H), 7.2 (m, 2H), 3.9 (s, 3H), 3.2 (m, 2H), 3.1 (m, 2H), 2.0 (m, 2H).

25 Etapa 3: 7-[5-(3,5-dicloro-4-fluoro-fenil)-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il]indano-4-carboxilato de metilo (ejemplo de compuesto 1-1)

30 A una solución del producto de la etapa 2 (10 g) en THF (167 ml) se añadió clorhidrato de hidroxilamina (3 g), seguido de una adición gota a gota de una solución de NaOH (3,5 g) en agua (83 ml). La reacción se agitó a temperatura ambiente durante la noche, y se concentró. El residuo se recogió en acetato de etilo y la capa orgánica se lavó con agua (3x), se secó (Na₂SO₄), se filtró y se concentró para dar un residuo, que se purificó por cromatografía instantánea sobre sílica gel (éter de petróleo/acetato de etilo), para proporcionar el producto (6 g, 58%).

¹H RMN (400 MHz, MeOH-d₄): δ 7.9 (d, 1H), 7.8 (m, 2H), 7.4 (d, 1H), 4.3 (d, 1H), 4.1 (d, 1H), 3.9 (s, 3H), 3.3 (m, 2H), 3.2 (m, 2H), 2.1 (m, 2H).

Etapa 5: ácido 7-[5-(3,5-Dicloro-4-fluoro-fenil)-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il]indano-4-carboxílico (ejemplo de compuesto 1-2)

35 A 0 °C, el producto de la etapa 4 (4,5 g) en THF (45 ml) se trató con una solución de LiOH (0,45 g) en agua (5 ml) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 5 h. Luego, se añadió más LiOH (0,2 g) y la reacción se agitó a temperatura ambiente durante la noche. Posteriormente, se añadió HCl acuoso al 10% para ajustar el pH de la reacción a pH 3-4. La capa orgánica se diluyó con CH₂Cl₂, se lavó con agua (2x), se secó (Na₂SO₄), se filtró y se concentró. El residuo obtenido se purificó por trituración (hexanos) para proporcionar el producto (3,35 g, 77%).

40 ¹H RMN (400 MHz, d₆-DMSO): δ 13.0 (s, 1H), 7.9-7.8 (m, 3H), 7.6-7.5 (m, 1H), 4.4-4.3 (m, 2H), 3.3-3.2 (m, 2H), 3.2-3.0 (m, 2H), 2.1-1.9 (m, 2H).

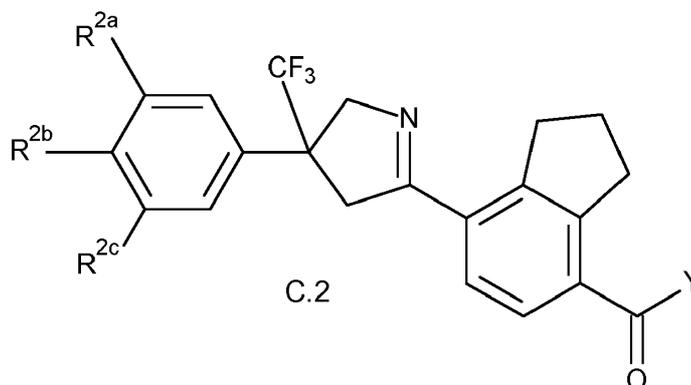
Etapa 6: N-(Ciclopropilometil)-7-[5-(3,5-dicloro-4-fluoro-fenil)-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il]indano-4-carboxamida (ejemplo de compuesto 1-3)

5 A una solución del producto de la etapa 5 (0,23 g), ciclopropilmetilamina (0,04 g) y PyBroP (0,28 g) en CH₂Cl₂ (15 ml) a temperatura ambiente. Se añadió N,N-diisopropiletilamina (0,26 g). La reacción se agitó a temperatura ambiente durante la noche. Luego, la reacción se diluyó con CH₂Cl₂, se lavó con agua (2x), se secó (Na₂SO₄), se filtró y se concentró para dar un residuo, que se purificó mediante cromatografía instantánea sobre sílica gel para proporcionar el producto (0,21 g, 82%).

¹H RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 7.6 (m, 2H), 7.5 (m, 1H), 7.2 (m, 1H), 6.0 (s, 1H), 4.2 (d, 1H), 3.8 (d, 1H), 3.4-3.3 (m, 2H), 3.3-3.1 (m, 4H), 2.2-2.1 (m, 2H), 1.1-1.0 (m, 1H), 0.6-0.5 (m, 2H), 0.3-0.2 (m, 2H).

10 C.2 Ejemplos de compuesto 2

Los Ejemplos de compuesto 2-1 a 2-24 corresponden a compuestos de fórmula C.2:



en donde R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y Y de cada compuesto sintetizado se define en una fila de la tabla C.2 a continuación.

Los compuestos fueron sintetizados en analogía al Ejemplo de síntesis S.2.

15

Tabla C.2

Ej.	R ^{2a} , R ^{2b} , R ^{2c}	-Y	HPLC-MS: Método, R _t (min) & [M+H] ⁺ o ¹ H-RMN		
2-1	Cl, F, Cl	-OH	A	1.500	459.4
2-2	Cl, F, Cl	-OCH ₃	A	1.661	473.4
2-3	Cl, F, Cl	-NH-(1,1-dioxo-tietan-3-il)	¹ H RMN (400 MHz, CDCl ₃): δ 7.5 (m, 2H), 7.35 (m, 2H), 7.2 (m, 1H), 6.7 (d, 1H), 5.0-4.85 (m, 2H), 4.7-4.6 (m, 2H), 4.45 (d, 1H), 4.1-4.0 (m, 2H), 3.8 (d, 1H), 3.4 (d, 1H), 3.3-3.1 (m, 4H), 2.2-2.1 (m, 2H).		
2-4	Cl, F, Cl	-NH-(tietan-3-il)	A	1.526	532.2
2-5	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(tietan-3-il)	A	1.527	544.8
2-6	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -ciclopropilo	A	1.393	514.6
2-7	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ C(=O)NHCH ₂ CF ₃	A	1.311	599.6
2-8	Cl, F, Cl	-NH-(1-oxo-tietan-3-il)	A	1.395	546.7
2-9	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(2-piridil)	A	1.125	549.9
2-10	Cl, F, Cl	-NHCH ₂ -(2-pirimidinil)	A	1.284	550.9

Ej.	R ^{2a} , R ^{2b} , R ^{2c}	-Y	HPLC-MS: Método, R _t (min) & [M+H] ⁺ o ¹ H-RMN		
2-11	Cl, F, Cl	-NH-CH ₂ -(1,1-dioxo-tietan-3-il)	A	1.265	576.9
2-12	Cl, H, Cl	-NHNH-(2-pirimidinil)	A	1.241	534.0
2-13	Cl, H, Cl	-NHCH ₂ -(2-piridil)	A	1.158	532.0
2-14	Cl, H, Cl	-NHCH ₂ C(=O)NHCH ₂ CF ₃	A	1.302	580.0
2-15	Cl, H, Cl	-OH	A	1.351	441.9
2-16	Cl, H, Cl	-OCH ₃	A	1.529	455.9
2-17	Cl, H, Cl	-NHCH ₂ -(2-pirimidinil)	A	1.291	533.0
2-18	Cl, H, Cl	-NH-ciclopropilo	A	1.347	481.0
2-19	Cl, H, Cl	-NH-(1,1-dioxo-tietan-3-il)	A	1.289	545.0
2-20	Cl, H, Cl	-NHCH ₂ -(4-tiazol)	A	1.319	538.0
2-21	Cl, H, Cl	-NH-[(4 <i>R</i>)-2-etil-3-oxo-isoxazolidin-4-il]	A	1.325	554.0
2-22	Cl, H, Cl	-NHCH(CH ₃)-C(=O)NHCH ₂ CF ₃	A	1.357	594.0
2-23	Cl, H, Cl	-NH-(tietan-3-il)	A	1.404	513.0
2-24	Cl, H, Cl	-NH-(1-oxo-tietan-3-il)	A	1.232	529.0

Ejemplo de síntesis S.2

7-[3-(3,5-Dicloro-4-fluoro-fenil)-3-(trifluorometil)-2,4-dihidropirrol-5-il]-N-(1,1-dioxotietan-3-il)indano-4-carboxamida

5 (Ejemplo de compuesto 2-3; compuesto de fórmula C.2, en donde R^{2a}y R^{2c} son Cl, R^{2b} es F y -Y es -NH-(1,1,-dioxo-tietan-3-il))

Etapa 1: 7-[3-(3,5-dicloro-4-fluoro-fenil)-4,4,4-trifluoro-3-(nitrometil)butanoil]indano-4-carboxilato de metilo

10 A una solución de 7-[(3-(3,5-dicloro-4-fluoro-fenil)-4,4,4-trifluoro-but-2-enil] indano-4-carboxilato de metilo (es decir, el producto del Ejemplo de síntesis S.1, etapa 2, 10 g) en CH₃CN (400 mL) se añadió 1,8-diazabicyclo [5.4.0] undec-7-eno ("DBU", 16.6 g) y CH₃NO₂ (6 g) a temperatura ambiente. La mezcla se agitó durante 20 minutos y luego se ajustó a pH 6 con una solución acuosa de HCl 1 M. La fase acuosa se extrajo con acetato de etilo (3 x 150 ml). Las capas orgánicas se combinaron, se concentraron y el residuo obtenido se purificó por cromatografía instantánea sobre sílica gel (éter de petróleo/acetato de etilo) para proporcionar el producto (6 g, 52%).

¹H RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 7.89 (d, 1H), 7.66 (d, 1H), 7.21-7.19 (m, 2H), 5.52 (d, 1H), 5.39 (d, 1H), 4.04 (d, 1H), 3.91-3.87 (m, 4H), 3.25-3.15 (m, 2H), 3.06-2.99 (m, 2H), 2.1-1.9 (m, 2H).

15 Etapa 2: 7-[3-(3,5-dicloro-4-fluoro-fenil)-3-(trifluorometil)-2,4-dihidropirrol-5-il]indano-4-carboxilato de metilo (compuesto 2-2)

20 A una solución del producto de la etapa 2 (6 g) en CH₃OH (100 ml) se le añadió ácido acético (100 ml) y polvo de hierro (1,9 g). La mezcla se agitó a 70°C durante la noche y luego se concentró. Se añadió agua (20 ml) y la capa acuosa se extrajo con acetato de etilo (3 x 100 ml). Las capas orgánicas combinadas se concentraron y el residuo obtenido se purificó por cromatografía instantánea sobre sílica gel (éter de petróleo/acetato de etilo) para proporcionar el producto (3,1 g, 56%).

¹H RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 7.90 (d, 1H), 7.47 (d, 1H), 7.35-7.30 (m, 2H), 4.94 (d, 1H), 4.47 (d, 1H), 3.93 (s, 3H), 3.81 (d, 1H), 3.49 (d, 1H), 3.35-3.25 (m, 2H), 3.25-3.20 (m, 2H), 2.15-1.06 (m, 2H).

Etapa 3: ácido 7-[3-(3,5-Dicloro-4-fluoro-fenil)-3-(trifluorometil)-2,4-dihidropirrol-5-il]indano-4-carboxílico (compuesto 2-1)

5 A 0°C, el producto de la etapa 2 (1.66 g) en THF (25 ml) se trató con una solución de LiOH (0.17 g) en agua (10 ml) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante la noche. Luego, se añadió más LiOH (0,1 g) y la reacción se agitó a 30°C durante 4 h. Se añadió HCl acuoso al 10% para ajustar el pH de la reacción a pH 3-4. Se añadió más agua y la capa acuosa se extrajo con CH₂Cl₂ (3x). Las capas orgánicas combinadas se secaron (Na₂SO₄), se filtraron y se concentraron. El residuo obtenido se purificó por trituración (hexanos) para proporcionar el producto (1,0 g, 62%).

10 ¹H RMN (400 MHz, d₆-DMSO): δ 13.0 (s, 1H), 7.9-7.75 (m, 3H), 7.75-7.6 (m, 1H), 4.9 (d, 1H), 4.45 (d, 1H), 3.9-3.7 (m, 2H), 3.3-3.1 (m, 2H), 2.1-1.9 (m, 2H).

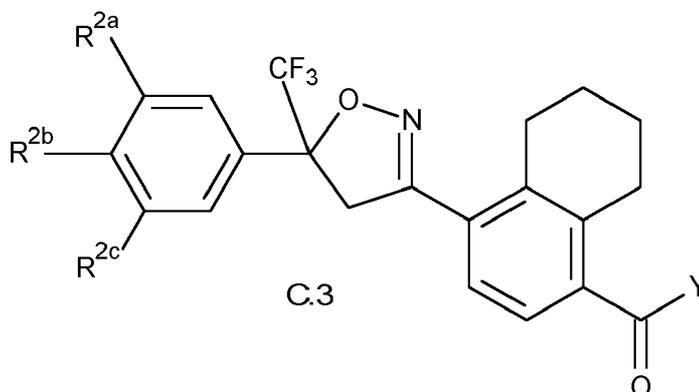
Etapa 4: 7-[3-(3,5-Dicloro-4-fluoro-fenil)-3-(trifluorometil)-2,4-dihidropirrol-5-il]-N-(1,1-dioxotietan-3-il)indano-4-carboxamida (compuesto 2-3)

15 A una solución del producto de la etapa 3 (0,2 g), clorhidrato de 1,1-dioxotietan-3-amina (0,08 g) y PyBroP (0,24 g) en CH₂Cl₂ (20 ml) a temperatura ambiente se añadió N,N-diisopropiletilamina (0,22 g). La reacción se agitó a temperatura ambiente durante la noche. Luego, la reacción se diluyó con CH₂Cl₂, se lavó con agua (2x), se secó (Na₂SO₄), se filtró y se concentró para dar un residuo, que se purificó por cromatografía instantánea sobre sílica gel para proporcionar el producto (0,15 g, 55%).

20 ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 7.5 (m, 2H), 7.35 (m, 2H), 7.2 (m, 1H), 6.7 (d, 1H), 5.0-4.85 (m, 2H), 4.7-4.6 (m, 2H), 4.45 (d, 1H), 4.1-4.0 (m, 2H), 3.8 (d, 1H), 3.4 (d, 1H), 3.3-3.1 (m, 4H), 2.2-2.1 (m, 2H).

C.3 Ejemplos de compuesto 3

Los Ejemplos de compuesto 3-1 a 3-13 corresponden a compuestos de fórmula C.3:



en donde R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y Y de cada compuesto sintetizado se define en una fila de la tabla C.3 a continuación.

25 Los compuestos fueron sintetizados en analogía al Ejemplo de síntesis S.3.

Tabla C.3

Ej.	R ^{2a} , R ^{2b} , R ^{2c}	-Y	HPLC-MS: Método, R _t (min) & [M+H] ⁺ o ¹ H-RMN (400 MHz, CDCl ₃)		
3-1	Cl, H, Cl	-OCH ₃	δ 7.64 (d, 1H), 7.51 (s, 2H), 7.45 (s, 1H), 7.18 (d, 1H), 4.09 (d, 2H), 3.90 (s, 3H), 3.73 (d, 1H), 3.08 (m, 2H), 2.94 (m, 2H), 1.86-1.72 (m, 4H)		
3-2	Cl, H, Cl	-OH	¹ H RMN (400 MHz, CDCl ₃): δ 7.87 (d, 1H), 7.65 (s, 2H), 7.50 (s, 1H), 7.23 (d, 1H), 4.11 (d, 1H), 3.74 (d, 1H), 3.19 (m, 2H), 2.97 (m, 2H), 1.82-1.81 (m, 4H).		
3-3	Cl, H, Cl	-NH-(1,1-dioxo-tietan-3-il)	A	1.361	561.0
3-4	Cl, H, Cl	-NHCH ₂ C(=O)NHCH ₂ CF ₃	A	1.391	596.0

Ej.	R ^{2a} , R ^{2b} , R ^{2c}	-Y	HPLC-MS: Método, R _t (min) & [M+H] ⁺ o ¹ H-RMN (400 MHz, CDCl ₃)		
3-5	Cl, H, Cl	-NHCH ₂ CF ₃	A	1.466	539.0
3-6	Cl, H, Cl	-NH-ciclopropilo	A	1.424	497.0
3-7	Cl, H, Cl	-NH-(tietan-3-il)	A	1.446	529.0
3-8	Cl, H, Cl	-NHCH(CH ₃)- C(=O)NHCH ₂ CF ₃	A	1.400	610.0
3-9	Cl, H, Cl	-NH-[(4 <i>R</i>)-2-etil-3-oxo- isoxazolidin-4-il]	A	1.379	570.0
3-10	Cl, H, Cl	-NHCH ₂ -(tiazol-4-il)	A	1.389	554.0
3-11	Cl, H, Cl	-NHCH ₂ -(2-pirimidinil)	A	1.371	549.0
3-12	Cl, H, Cl	-NHCH ₂ -(2-piridil)	A	1.243	548.0
3-13	Cl, H, Cl	-NH-(1-oxo-tietan-3-il)	A	1.293	545.0

Ejemplo de síntesis S.3

8-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il]-N-(2,2,2-trifluoroetil)tetralin-5-carboxamida

(Ejemplo de compuesto 3-5; compuesto de fórmula C.3, en donde R^{2a} y R^{2c} son Cl, R^{2b} es H, y -Y es NHCH₂CF₃)

5 Etapa 1: 5-Metoxitetralina

A una mezcla de tetralin-5-ol (32 g) y K₂CO₃ (64 g) en acetona (600 ml) se añadió (CH₃)₂SO₄ (60 g) y la mezcla se agitó a reflujo durante 15 h. Luego, la mezcla se filtró y se concentró. El producto crudo se purificó por cromatografía instantánea sobre sílica gel (éter de petróleo/acetato de etilo) para proporcionar el producto (34 g, 88%).

10 ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 7.12 (m, 1H), 6.81-6.70 (m, 2H), 3.86 (s, 3H), 2.81 (m, 2H), 2.71 (m, 2H), 1.91-1.77 (m, 4H).

15 Etapa 2: 1-(8-Metoxitetralin-5-il)etanona

A 0°C, se añadió gota a gota cloruro de acetilo ("AcCl", 16 g) a una mezcla del producto de la etapa 1 (25 g) y AlCl₃ (28 g) en DCE (300 ml). La reacción se agitó a 25°C durante 10 h, y luego se vertió en agua con hielo (200 ml). La capa acuosa se extrajo con CH₂Cl₂ (3 x 300 ml) y las capas orgánicas combinadas se secaron (Na₂SO₄), se filtraron y se concentraron para dar el producto crudo (27 g) que se usó en la siguiente etapa sin purificación adicional.

15 ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 7.64 (d, 1H), 6.71 (d, 1H), 3.89 (s, 3H), 3.10-3.00 (m, 2H), 2.68 (m, 2H), 2.56 (s, 3H), 1.83-1.68 (m, 4H).

20 Etapa 3: 1-(8-Hidroxitetralin-5-il)etanona

El producto crudo de la etapa 2 (30 g) en DCE (1,5 l) se trató con AlCl₃ (30 g) y la mezcla se agitó a 100°C durante la noche. Luego, la solución se vertió en agua con hielo (500 ml) y se extrajo con CH₂Cl₂. Las capas orgánicas combinadas se secaron (Na₂SO₄), se filtraron y se concentraron para dar un residuo, que se purificó por cromatografía instantánea sobre sílica gel (éter de petróleo/acetato de etilo) para proporcionar el producto (15 g, 50%).

20 ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 7.56 (d, 1H), 6.69 (d, 1H), 3.06 (m, 2H), 2.68 (m, 2H), 2.56 (s, 3H), 1.87-1.80 (m, 2H), 1.80-1.72 (m, 2H).

25 Etapa 4: (8-Aciltetralin-5-il) trifluorometanosulfonato

Al producto de la etapa 3 (15 g) y Et₃N (20 g) en CH₂Cl₂ (500 ml) a 0 °C se le añadió anhídrido triflico ("Tf₂O", 33 g). La mezcla se agitó a 0°C durante 30 min. Luego, la solución se vertió en agua con hielo (500 ml) y se extrajo con CH₂Cl₂. Las capas orgánicas combinadas se secaron (Na₂SO₄), se filtraron y se concentraron para dar un residuo,

que se purificó por cromatografía instantánea sobre sílica gel (éter de petróleo/acetato de etilo) para proporcionar el producto (25 g, 95%).

^1H RMN (400 MHz, CDCl_3): δ 7.55-7.46 (m, 1H), 7.18 (m, 1H), 3.03-2.95 (m, 2H), 2.84 (m, 2H), 2.58 (s, 3H), 1.91-1.79 (m, 4H).

5 Etapa 5: 8-acetiltetralin-5-carboxilato de metilo

10 A una solución del producto de la etapa 4 (25 g) en metanol (500 ml) se le añadió Na_2CO_3 (30 g) y [1,1'-bis(difenilfosfino) ferroceno]dicloropaldio (II) ($\text{Pd}(\text{dppf})\text{Cl}_2$, 3 g). La solución se presurizó con monóxido de carbono (50 psi) y se calentó a 50°C durante la noche. Luego, la mezcla se filtró y el filtrado se concentró. El residuo se disolvió en CH_2Cl_2 y se lavó con agua, se secó (Na_2SO_4), se filtró y se concentró para dar un residuo, que se purificó por cromatografía instantánea sobre sílica gel (éter de petróleo/acetato de etilo) para proporcionar el producto (15 g, 65%).

^1H RMN (400 MHz, CDCl_3): δ 7.63 (d, 1H), 7.34 (d, 1H), 3.89 (s, 3H), 3.04 (m, 2H), 2.92 (m, 2H), 2.57 (s, 3H), 1.77 (m, 4H).

Etapa 6: 8-[3-(3,5-diclorofenil)-4,4,4-trifluoro-but-2-enoil]tetralin-5-carboxilato de metilo

15 A una solución del producto de la etapa 5 (10 g) y 1-(3,5-diclorofenil)-2,2,2-trifluoroetanol (15.7 g, CAS 130336-16-2) en DCE (100 ml) se agregó K_2CO_3 (5.9 g) y Et_3N (10 ml). La reacción se agitó durante 16 h a 100°C . Luego, la mezcla se filtró y se concentró para dar un residuo, que se purificó por cromatografía instantánea sobre sílica gel (éter de petróleo/acetato de etilo) para proporcionar el producto (17 g, 86%).

^1H RMN (400 MHz, CDCl_3): δ 7.66 (d, 1H), 7.38 (s, 2H), 7.34 (d, 1H), 7.11 (m, 2H), 4.01 (s, 3H), 3.11-3.03 (m, 2H), 2.88 (m, 2H), 1.87-1.77 (m, 4H).

20 Etapa 7: 8-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il]tetralin-5-carboxilato de metilo (ejemplo de compuestos 3-1)

25 A una solución del producto de la etapa 2 (17 g) en DCE (500 ml) se le añadió clorhidrato de hidroxilamina (5.3 g) y bromuro de tetrabutilamonio ("TBAB", 6.2 g), seguido de la adición gota a gota de una solución de NaOH (6.1 g) en agua (70 ml). La reacción se agitó durante 12 h a 25°C . La capa orgánica se lavó con agua (3 x 100 ml), se secó (Na_2SO_4), se filtró y se concentró para dar un residuo, que se purificó por cromatografía instantánea sobre sílica gel (éter de petróleo/acetato de etilo) para proporcionar el producto (12 g, 67%).

^1H RMN (400 MHz, CDCl_3): δ 7.64 (d, 1H), 7.51 (s, 2H), 7.45 (s, 1H), 7.18 (d, 1H), 4.09 (d, 2H), 3.90 (s, 3H), 3.73 (d, 1H), 3.08 (m, 2H), 2.94 (m, 2H), 1.86-1.72 (m, 4H).

30 Etapa 8: ácido 8-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il]tetralin-5-carboxílico (ejemplo de compuestos 3-2)

35 El producto de la etapa 7 (12 g) en THF (100 ml) se trató con una solución de LiOH (3 g) en agua (30 ml) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 12 h y a 80°C durante 5 h. Luego, el pH de la reacción se ajustó a pH 3 utilizando una solución acuosa de HCl 1M. La capa acuosa se extrajo con metil-terc-butiléter ("MTBE", 3x 100 ml). Las capas orgánicas se combinaron, se secaron (Na_2SO_4), se filtraron y se concentraron para proporcionar el producto (10 g, 88%).

^1H RMN (400 MHz, CDCl_3): δ 7.87 (d, 1H), 7.65 (s, 2H), 7.50 (s, 1H), 7.23 (d, 1H), 4.11 (d, 1H), 3.74 (d, 1H), 3.19 (m, 2H), 2.97 (m, 2H), 1.82-1.81 (m, 4H).

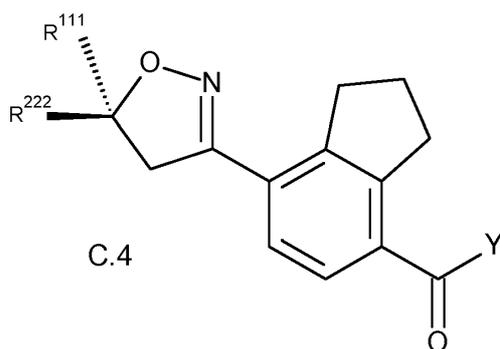
Etapa 9: 8-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il]-N-(2,2,2-trifluoroetil)tetralin-5-carboxamida

40 A una solución del producto de la etapa 8 (0.3 g), 2,2,2-trifluoroetilamina (0.08 g) y PyBroP (0.37 g) en CH_2Cl_2 (10 ml) a temperatura ambiente se añadió N,N-diisopropiletilamina (0.27 g). La reacción se agitó a temperatura ambiente durante la noche. Luego, la reacción se concentró para dar un residuo, que se purificó por cromatografía instantánea sobre sílica gel para proporcionar el producto (0.19 g, 52%).

^1H RMN (400 MHz, CDCl_3): δ 7.55 (s, 2H), 7.45 (s, 1H), 7.2 (d, 1H), 7.1 (d, 1H), 6.0 (m, 1H), 4.2-4.0 (m, 3H), 3.7 (d, 1H), 2.9 (m, 2H), 2.85 (m, 2H), 1.8-1.7 (m, 4H).

45 **C.4 Ejemplos de compuesto 4**

Los Ejemplos de compuesto 4-1 a 4-2 corresponden a compuestos de fórmula C.4:



en donde R¹¹¹, R²²² y Y de cada compuesto se define en una fila de la tabla C.4 a continuación.

- 5 Los compuestos 4-1 y 4-2 se obtuvieron a partir del ejemplo de compuesto racémico 1-7 correspondiente mediante separación usando una HPLC quiral preparativa (método B). La asignación de la configuración absoluta se realizó mediante cristalografía de rayos X.

Método B (HPLC quiral preparativa). Instrumento: Thar SFC Pre-80. Columna: Chiralpak AS-H 5 mm, 3,0 cm id x 25 cm L Fase móvil: A para SFC CO₂ y B para MeOH (0,1% NH₄OH). Gradiente: A: B = 65: 35. Tasa de flujo: 70 ml/min. Longitud de onda de detección: 220 nm. Presión trasera del sistema: 100 bar.

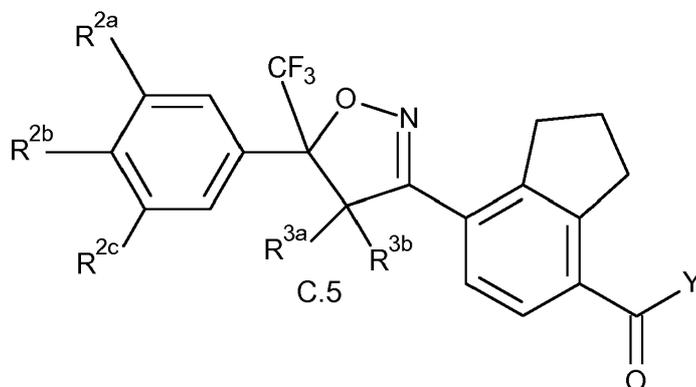
- 10 Método C (HPLC quiral analítica). Instrumento: Thar analítico SFC. Columna: Chiralpak AS-H 5 mm, 0,46 cm id x 15 cm L Fase móvil: A para SFC CO₂ y B para metanol (isopropilamina al 0,05%). Gradiente: B en A de 10% a 40% en 5 minutos. Tasa de flujo: 4,0 ml/min. Longitud de onda de detección: 220 nm. Presión trasera del sistema: 100 bar.

Tabla C.4

Ej.	R ¹¹¹	R ²²²	-Y	Método de HPLC analítica quiral, tiempo de retención	
4-1	3,5-Dicloro-4-fluoro-fenilo	CF ₃	-NHCH ₂ -(2-pirimidinil)	C	2.78 min
4-2	CF ₃	3,5-Dicloro-4-fluoro-fenilo	-NHCH ₂ -(2-pirimidinil)	C	3.44 min

C.5 Ejemplos de compuesto 5

- 15 Los Ejemplos de compuesto 5-1 a 5-2 corresponden a compuestos de fórmula C.5:



en donde R^{2a}, R^{2b}, R^{2c}, R^{3a}, R^{3b} y Y de cada compuesto sintetizado se define en una fila de la tabla C.5 a continuación.

Los compuestos fueron sintetizados en analogía al Ejemplo de síntesis S.4.

Tabla C.5

Ej.	R ^{2a} , R ^{2b} , R ^{2c}	R ^{3a} , R ^{3b}	-Y	HPLC-MS: Método, R _t (min) & [M+H] ⁺ or ¹ H-RMN		
5-1	Cl, F, Cl	F, H	-OCH ₃	¹ H RMN (400 MHz, CDCl ₃): δ 7.9 (d, 1H), 7.6 (m, 2H), 7.45 (d, 1H), 6.5 (d, 1H), 3.9 (s, 3H), 3.35 (m, 2H), 3.2 (m, 2H), 2.15 (m, 2H)		
5-2	Cl, F, Cl	F, H	-NHCH ₂ -(2-piridil)	A	1.248	570.0

Ejemplo de síntesis S.4

7-[5-(3,5-Dicloro-4-fluoro-fenil)-4-fluoro-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il]-N-(2-piridilometil)indano-4-carboxamida

- 5 (Ejemplo de compuesto 5-2; compuesto de fórmula C.5, en donde R^{2a} y R^{2c} son Cl, R^{2b} es F, R^{3a} es F y R^{3b} es H, y -Y es -NHCH₂-(2-piridil))

Etapa 1: 7-[5-(3,5-dicloro-4-fluoro-fenil)-4-fluoro-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il]indano-4-carboxilato de metilo (ejemplo de compuesto 5-1)

- 10 A una solución de 7-[5-(3,5-dicloro-4-fluoro-fenil)-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il] indano-4-carboxilato (ejemplo de compuesto 1-1, 2) g) en THF (30 ml) bajo nitrógeno a -78 °C se añadió, hexametildisilazida de litio ("LiHMDS", 4,6 ml, solución 1 M en THF) y la mezcla se agitó durante 1,5 horas a -78 °C. Luego, se añadió N-fluorobencenosulfonimida ("NFSI", 1.7 g) a -78 °C en una porción y la mezcla se agitó a -78 °C durante otras 3 h. Luego, la reacción se detuvo con una solución acuosa saturada de NH₄Cl. Se añadió acetato de etilo (300 ml) y la capa orgánica se lavó con agua (3x), se secó (Na₂SO₄), se filtró y se concentró para proporcionar un residuo que se purificó por cromatografía instantánea sobre sílica gel (acetato de etilo/ciclohexano) para proporcionar el producto (0,4 g, 19%).

¹H RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 7.9 (d, 1H), 7.6 (m, 2H), 7.45 (d, 1H), 6.5 (d, 1H), 3.9 (s, 3H), 3.35 (m, 2H), 3.2 (m, 2H), 2.15 (m, 2H).

Etapa 2: ácido 7-[5-(3,5-Dicloro-4-fluoro-fenil)-4-fluoro-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il]indano-4-carboxílico

- 20 El producto de la etapa 1 (0,4 g) en THF (7,5 ml) se trató con una solución de LiOH (0,08 g) en agua (2,5 ml) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante la noche. Luego, se añadió éter dietílico (300 ml) y el pH de la solución se ajustó a pH 3-4 utilizando una solución acuosa al 10% de HCl. La capa orgánica se separó, se lavó con agua (2x), se secó (Na₂SO₄), se filtró y se concentró para proporcionar el producto (0,37 g, 95%), que se usó en la siguiente etapa sin purificación adicional.

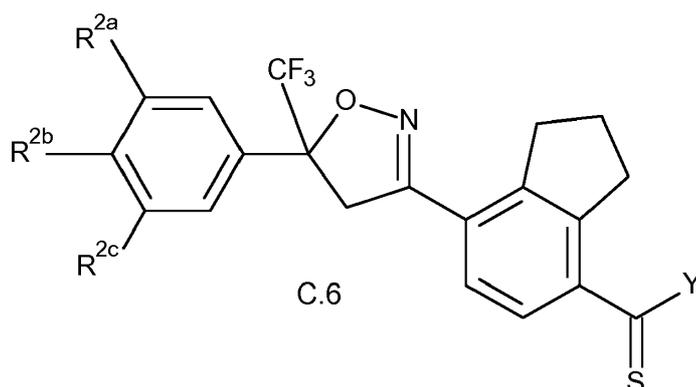
- 25 Etapa 3: 7-[5-(3,5-Dicloro-4-fluoro-fenil)-4-fluoro-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il]-N-(2-piridilometil)indano-4-carboxamida (ejemplo de compuesto 5-2)

- 30 A una solución del producto de la etapa 2 (0,36 g), 2-picolilamina (0,1 g, CAS 3731-51-9) y PyBroP (0,42 g) en CH₂Cl₂ (40 ml) a temperatura ambiente se añadió N,N-diisopropiletilamina (0,31 g). La reacción se agitó a temperatura ambiente durante la noche. Entonces, la reacción se detuvo con agua. La capa orgánica se separó, se secó (Na₂SO₄), se filtró y se concentró para dar un residuo, que se purificó por cromatografía instantánea sobre sílica gel para proporcionar el producto (0,29 g, 68%).

HPLC-MS (método A): 1.248 min, M = 570.0.

C.6 Ejemplos de compuesto 6

El ejemplo del compuesto 6-1 corresponde a un compuesto de fórmula C.6:



en donde R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y Y de cada compuesto sintetizado se define en una fila de la tabla C.6 a continuación.

El compuesto se sintetizó en analogía al Ejemplo de síntesis S.5.

Tabla C.6

Ej.	R ^{2a} , R ^{2b} , R ^{2c}	-Y	HPLC-MS: Método, R _t (min) & [M+H] ⁺ o ¹ H-RMN		
6-1	Cl, H, Cl	-NHCH ₂ -(2-piridil)	A	1.248	570.0

5

Ejemplo de síntesis S.5

7-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il]-N-(2-piridilometil)indano-4-carbotioamida

(Ejemplo de compuesto 6-1; compuesto de fórmula C.5, en donde R^{2a} y R^{2c} son Cl, R^{2b} es H, y -Y es -NHCH₂-(2-piridil))

10 Una solución de 7-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il]-N-(2-piridilometil) indano-4-carboxamida (ejemplo de compuesto 1-27, 190 mg) y el reactivo de Lawesson (90 mg, CAS 19172-47-5) en tolueno (15 ml) se sometió a reflujo durante 5 h y luego se agitó a temperatura ambiente durante la noche. Se añadió acetato de etilo (200 ml) y la capa orgánica se lavó con agua (3x), se secó (Na₂SO₄), se filtró y se concentró para dar un residuo, que se purificó por cromatografía instantánea sobre sílica gel para proporcionar el producto (70 mg, 60%).

HPLC-MS (método A): 1.335 min, M = 550.0.

15 II. Evaluación de la actividad plaguicida:

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

B.1 Polilla dorso de diamante (*Plutella xylostella*)

20 El compuesto activo se disolvió a la concentración deseada en una mezcla de 1:1 (vol: vol) de agua destilada: acetona. Se añadió surfactante (Kinetic HV) a una tasa de 0.01% (vol/vol). La solución de prueba se preparó el día de uso.

Las hojas de repollo se sumergieron en solución de prueba y se secaron al aire. Las hojas tratadas se colocaron en placas de Petri revestidas con papel de filtro húmedo y se inocularon con diez larvas de tercer estadio. La mortalidad se registró 72 horas después del tratamiento.

25 En esta prueba, los compuestos 1-1, 1-2, 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-37, 1-38, 1-39, 1-40, 1-41, 1-42, 1-43, 1-44, 1-45, 1-46, 1-47, 1-48, 1-49, 1-50, 1-51, 1-52, 1-53, 1-54, 1-55, 1-57, 1-58, 1-59, 1-60, 1-61, 1-62, 1-63, 1-64, 1-65, 1-66, 1-67, 1-69, 1-70, 1-71, 1-72, 2-1, 2-3, 2-4, 2-5, 2-6, 2-7, 2-8, 2-9, 2-10, 2-11, 2-12, 2-13, 2-14, 2-17, 2-18, 2-19, 2-20, 2-21, 2-22, 2-23, 2-24, 3-3, 3-4, 3-5, 3-6, 4-1, 4-2 a 300 ppm, respectivamente, mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

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

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

Los compuestos se formularon utilizando una solución que contiene 75% v/v de agua y 25% v/v de DMSO. Se pipetearon diferentes concentraciones de compuestos formulados en la dieta del áfido, utilizando un pipeteador construido a medida, en dos repeticiones.

- 5 Después de la aplicación, se colocaron de 5 a 8 pulgones adultos en la membrana artificial dentro de los pocillos de la placa de microtitulación. Luego se dejó que los áfidos chuparan la dieta de áfidos tratados y se incubaron a aproximadamente 23 + 1 °C y aproximadamente 50 + 5% de humedad relativa durante 3 días. Luego se evaluó visualmente la mortalidad y fecundidad de áfidos.

- 10 En esta prueba, los compuestos 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-37, 1-38, 1-39, 1-40, 1-41, 1-42, 1-43, 1-44, 1-45, 1-46, 1-47, 1-48, 1-49, 1-50, 1-51, 1-52, 1-53, 1-54, 1-55, 1-57, 1-58, 1-59, 1-60, 1-61, 1-62, 1-63, 1-64, 1-65, 1-66, 1-67, 1-69, 1-70, 1-71, 1-72, 1-73, 1-74, 1-75, 1-76, 1-77, 1-78, 1-79, 1-80, 1-82, 2-1, 2-2, 2-3, 2-4, 2-5, 2-6, 2-7, 2-8, 2-9, 2-10, 2-11, 2-12, 2-13, 2-14, 2-17, 2-18, 2-19, 2-20, 2-21, 2-22, 2-23, 2-24, 3-3, 3-4, 3-5, 3-6, 3-7, 3-8, 3-9, 3-10, 3-11, 3-12, 3-13, 4-1, 4-2 a 2500 ppm, respectivamente, mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

15 B.3 Áfido del algarrobo (*Megoura viciae*)

Para evaluar el control del áfido del algarrobo (*Megoura viciae*) a través de contacto o medios sistémicos, la unidad de prueba consistió en placas de microtitulación de 24 pocillos que contenían discos de hoja ancha de frijol.

- 20 Los compuestos se formularon utilizando una solución que contiene 75% v/v de agua y 25% v/v de DMSO. Se rociaron diferentes concentraciones de compuestos formulados sobre los discos de hojas a 2,5 µl, utilizando un microatomizador hecho a medida, en dos repeticiones.

Después de la aplicación, los discos de las hojas se secaron al aire y se colocaron de 5 a 8 áfido adultos en los discos de las hojas dentro de los pocillos de la placa de microtitulación. Luego se dejó que los áfido chuparan los discos de las hojas tratadas y se incubaron a aproximadamente 23 + 1 °C y aproximadamente 50 + 5% de humedad relativa durante 5 días. Luego se evaluó visualmente la mortalidad y fecundidad de áfidos.

- 25 En esta prueba, los compuestos 1-1, 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-37, 1-38, 1-39, 1-40, 1-41, 1-42, 1-43, 1-44, 1-45, 1-46, 1-47, 1-48, 1-49, 1-50, 1-51, 1-52, 1-53, 1-54, 1-55, 1-57, 1-58, 1-59, 1-60, 1-61, 1-62, 1-63, 1-64, 1-65, 1-66, 1-67, 1-69, 1-70, 1-71, 1-72, 1-73, 1-74, 1-75, 1-76, 1-77, 1-78, 1-79, 1-80, 1-82, 2-2, 2-3, 2-4, 2-5, 2-6, 2-7, 2-8, 2-9, 2-10, 2-11, 2-12, 2-13, 2-14, 2-17, 2-18, 2-19, 2-20, 2-21, 2-22, 2-23, 2-24, 3-3, 3-4, 3-5, 3-6, 3-7, 3-8, 3-9, 3-10, 3-11, 3-12, 3-13, 4-1, 4-2 a 2500 ppm, respectivamente, mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

30 B.4 Gusano del brote del tabaco (*Heliothis virescens*)

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

- 35 Los compuestos se formularon utilizando una solución que contiene 75% v/v de agua y 25% v/v de DMSO. Se pulverizaron diferentes concentraciones de compuestos formulados sobre la dieta de insectos a 10 µl, utilizando un microatomizador hecho a medida, en dos repeticiones.

Después de la aplicación, las placas de microtitulación se incubaron a aproximadamente 28 + 1 °C y aproximadamente 80 + 5% de humedad relativa durante 5 días. Luego se evaluó visualmente la mortalidad de huevos y larvas.

- 40 En esta prueba, los compuestos 1-1, 1-2, 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-37, 1-38, 1-39, 1-40, 1-41, 1-42, 1-43, 1-44, 1-45, 1-46, 1-47, 1-48, 1-49, 1-50, 1-51, 1-52, 1-53, 1-54, 1-55, 1-57, 1-58, 1-59, 1-60, 1-61, 1-62, 1-63, 1-64, 1-65, 1-66, 1-67, 1-68, 1-69, 1-70, 1-71, 1-72, 1-73, 1-74, 1-75, 1-76, 1-77, 1-78, 1-79, 1-80, 1-82, 2-1, 2-2, 2-3, 2-4, 2-5, 2-6, 2-7, 2-8, 2-9, 2-10, 2-11, 2-12, 2-13, 2-14, 2-17, 2-18, 2-19, 2-20, 2-21, 2-22, 2-23, 2-24, 3-3, 3-4, 3-5, 3-6, 3-7, 3-8, 3-9, 3-10, 3-11, 3-12, 3-13, 4-1, 4-2 a 2500 ppm, respectivamente, mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

45 B.5 Gorgojo de baya (*Anthonomus grandis*)

Para evaluar el control del gorgojo de baya (*Anthonomus grandis*), la unidad de prueba consistió en placas de microtitulación de 96 pocillos que contenían una dieta para insectos y 5-10 huevos de *A. grandis*.

- 50 Los compuestos se formularon utilizando una solución que contiene 75% v/v de agua y 25% v/v de DMSO. Se pulverizaron diferentes concentraciones de compuestos formulados sobre la dieta de insectos a 5 µl, utilizando un microatomizador hecho a la medida, en dos repeticiones.

Después de la aplicación, las placas de microtitulación se incubaron a aproximadamente 25 + 1 °C y aproximadamente 75 + 5% de humedad relativa durante 5 días. Luego se evaluó visualmente la mortalidad de huevos y larvas.

5 En esta prueba, los compuestos 1-1, 1-2, 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-37, 1-38, 1-39, 1-40, 1-41, 1-42, 1-43, 1-44, 1-45, 1-46, 1-47, 1-48, 1-49, 1-50, 1-51, 1-52, 1-53, 1-54, 1-55, 1-57, 1-58, 1-59, 1-60, 1-61, 1-62, 1-63, 1-64, 1-65, 1-66, 1-67, 1-69, 1-70, 1-71, 1-72, 1-73, 1-74, 1-75, 1-76, 1-77, 1-78, 1-79, 1-80, 1-81, 1-82, 2-1, 2-2, 2-3, 2-4, 2-5, 2-6, 2-7, 2-8, 2-9, 2-10, 2-11, 2-12, 2-13, 2-14, 2-16, 2-17, 2-18, 2-19, 2-20, 2-21, 2-22, 2-23, 2-24, 3-2, 3-3, 3-4, 3-5, 3-6, 3-7, 3-8, 3-9, 3-10, 3-11, 3-12, 3-13, 4-1, 4-2 a 2500 ppm, respectivamente, mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

10 B.6 Mosca de la fruta del Mediterráneo (*Ceratitis capitata*)

Para evaluar el control de la mosca de la fruta del Mediterráneo (*Ceratitis capitata*), la unidad de prueba consistió en placas de microtitulación que contenían una dieta para insectos y 50-80 huevos de *C. capitata*. Los compuestos se formularon utilizando una solución que contiene 75% v/v de agua y 25% v/v de DMSO. Se pulverizaron diferentes concentraciones de compuestos formulados sobre la dieta de insectos a 5 µl, utilizando un microatomizador hecho a la medida, en dos repeticiones.

15 Después de la aplicación, las placas de microtitulación se incubaron a aproximadamente 28 + 1 °C y aproximadamente 80 + 5% de humedad relativa durante 5 días. Luego se evaluó visualmente la mortalidad de huevos y larvas.

20 En esta prueba, los compuestos 1-1, 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-37, 1-38, 1-39, 1-40, 1-41, 1-42, 1-43, 1-44, 1-45, 1-46, 1-47, 1-48, 1-49, 1-50, 1-51, 1-52, 1-53, 1-54, 1-55, 1-57, 1-58, 1-59, 1-60, 1-61, 1-62, 1-63, 1-64, 1-65, 1-66, 1-67, 1-69, 1-70, 1-71, 1-72, 1-73, 1-74, 1-75, 1-76, 1-77, 1-78, 1-79, 1-80, 1-82, 2-3, 2-4, 2-5, 2-6, 2-7, 2-8, 2-9, 2-10, 2-11, 2-12, 2-13, 2-14, 2-16, 2-17, 2-18, 2-19, 2-20, 2-21, 2-22, 2-23, 2-24, 3-3, 3-4, 3-5, 3-6, 3-7, 3-8, 3-9, 3-10, 3-11, 3-12, 3-13, 4-1, 4-2 a 2500 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

25 B.7 Trips de orquídeas (*dichromothrips corbetti*)

Dichromothrips corbetti adultos utilizados para bioensayo se obtuvieron de una colonia mantenida continuamente bajo condiciones de laboratorio. Para propósitos de prueba, el compuesto de prueba se diluye en una mezcla 1:1 de acetona: agua (vol:vol), más Kinetic HV a una tasa de 0.01% v/v.

30 La potencia de los trips de cada compuesto se evaluó utilizando una técnica de inmersión floral. Todos los pétalos de flores de orquídeas individuales e intactas se sumergieron en la solución de tratamiento y se dejaron secar en placas de Petri. Los pétalos tratados se colocaron en un plástico resellable individual junto con unos 20 trips adultos. Todos los estadios de prueba se mantuvieron bajo luz continua y una temperatura de aproximadamente 28 °C durante la duración del ensayo. Después de 3 días, se contó el número de trips vivos en cada pétalo. El porcentaje de mortalidad se registró 72 horas después del tratamiento.

35 En esta prueba, los compuestos 1-1, 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-37, 1-38, 1-39, 1-40, 1-41, 1-42, 1-43, 1-44, 1-45, 1-46, 1-47, 1-48, 1-49, 1-50, 1-51, 1-52, 1-53, 1-54, 1-55, 1-57, 1-58, 1-59, 1-60, 1-61, 1-62, 1-63, 1-64, 1-65, 1-66, 1-67, 1-68, 1-69, 1-70, 1-71, 1-72, 2-2, 2-3, 2-4, 2-5, 2-6, 2-7, 2-8, 2-9, 2-10, 2-11, 2-12, 2-13, 2-14, 2-17, 2-18, 2-19, 2-20, 2-21, 2-22, 2-23, 2-24, 3-3, 3-4, 3-5, 3-6, 4-1, 4-2 a 300 ppm, respectivamente, mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

40 B.8 Saltamontes verde de arroz (*Nephotettix virescens*)

Las plántulas de arroz se limpiaron y lavaron 24 horas antes de pulverizar. Los compuestos activos se formularon en acetona: agua 1: 1 (vol: vol) y se agregó 0.01% vol/vol de surfactante (Kinetic HV). Las plántulas de arroz en macetas se rociaron con 5-6 ml de solución de prueba, se secaron al aire, se cubrieron con jaulas Mylar y se inocularon con 10 adultos. Las plantas de arroz tratadas se mantuvieron a aproximadamente 28-29 °C y una humedad relativa de aproximadamente 50-60%. El porcentaje de mortalidad se registró después de 72 horas.

50 En esta prueba, los compuestos 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-38, 1-39, 1-40, 1-41, 1-42, 1-43, 1-44, 1-45, 1-46, 1-47, 1-48, 1-49, 1-50, 1-51, 1-52, 1-53, 1-54, 1-55, 1-57, 1-58, 1-59, 1-60, 1-61, 1-62, 1-63, 1-64, 1-65, 1-66, 1-67, 1-69, 1-70, 1-71, 1-72, 2-3, 2-4, 2-5, 2-6, 2-7, 2-8, 2-9, 2-10, 2-11, 2-12, 2-13, 2-14, 2-17, 2-18, 2-19, 2-20, 2-21, 2-23, 2-24, 3-3, 3-4, 3-5, 3-6, 4-2 a 300 ppm, respectivamente, mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

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

El compuesto activo se disolvió a la concentración deseada en una mezcla de 1:1 (vol: vol) de agua destilada: acetona. Se añadió surfactante de adición (Kinetic HV) a una tasa de 0.01% (vol/vol). La solución de prueba se preparó el día de uso.

5 Los frijoles de caupí en maceta de 4-5 días de edad se limpiaron con agua corriente y se rociaron con 1-2 ml de la solución de prueba utilizando un atomizador manual accionado por aire. Las plantas tratadas se dejaron secar al aire y luego se inocularon con 30 o más ácaros recortando una sección de hoja de yuca de la población de crianza. Las plantas tratadas se colocaron dentro de una sala de almacenamiento a aproximadamente 25-27 °C y aproximadamente 50-60% de humedad relativa. El porcentaje de mortalidad se evaluó 72 horas después del tratamiento.

10 En esta prueba, los compuestos 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-18, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-38, 1-39, 1-40, 1-41, 1-42, 1-43, 1-44, 1-45, 1-46, 1-47, 1-48, 1-49, 1-50, 1-51, 1-52, 1-53, 1-54, 1-55, 1-57, 1-58, 1-59, 1-60, 1-61, 1-62, 1-63, 1-64, 1-65, 1-66, 1-67, 1-69, 1-70, 1-71, 1-72, 2-3, 2-4, 2-5, 2-6, 2-7, 2-8, 2-9, 2-10, 2-11, 2-12, 2-13, 2-14, 2-17, 2-18, 2-19, 2-20, 2-21, 2-22, 2-23, 2-24, 3-3, 3-4, 3-5, 3-6, 4-2 a 300 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los
15 controles no tratados.

B.10 Gusano cogollero del sur (*Spodoptera eridania*)

Los compuestos activos se formularon en ciclohexanona como una solución de 10,000 ppm suministrada en tubos. Los tubos se insertaron en un pulverizador electrostático automático equipado con una boquilla atomizadora y sirvieron como soluciones de reserva para las cuales se hicieron diluciones más bajas en acetona al 50% (v/v).
20 Se incluyó un surfactante no iónico (Kinetic®) en la solución a un volumen de 0.01% (v/v).

Las plantas de frijol de Lima (variedad Sieva) se cultivaron 2 plantas en una maceta y se seleccionaron para el tratamiento en la 1ª etapa de hoja verdadera. Las soluciones de prueba se rociaron sobre el follaje con un rociador automático de plantas electrostáticas equipado con una boquilla atomizadora. Las plantas se secaron en la campana extractora y luego se retiraron del pulverizador. Cada maceta se colocó en bolsas de plástico perforadas con un cierre de cremallera. Se colocaron alrededor de 10 a 11 larvas de gusano cogollero en la bolsa y las bolsas se cerraron con cremallera. Las plantas de prueba se mantuvieron en una sala de crecimiento a aproximadamente 25 °C y aproximadamente 20-40% de humedad relativa durante 4 días, evitando la exposición directa a la luz fluorescente (fotoperíodo de 24 horas) para evitar la captura de calor dentro de las bolsas. La mortalidad y la alimentación reducida se evaluaron 4 días después del tratamiento, en comparación con las plantas de control sin tratar.
25

30 En esta prueba, los compuestos 1-5, 1-6, 1-7, 1-10, 1-12, 1-14, 1-16, 1-17, 1-21, 1-23, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-38, 1-42, 1-49, 1-51, 2-3, 2-4, 2-5, 2-6, 2-7, 2-8, 2-9, 2-10, 2-11, 2-12, 2-13, 2-14, 4-2 a 1 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

B.11 Chinche verde apestosa (*Nezara viridula*)

35 El compuesto activo se disolvió a la concentración deseada en una mezcla de 1:1 (vol: vol) de agua destilada: acetona. Se añadió surfactante (Kinetic HV) a una tasa de 0.01% (vol/vol). La solución de prueba se preparó el día de uso.

Las vainas de soja se colocaron en placas de Petri de vidrio forradas con papel de filtro húmedo y se inocularon con diez *N. viridula* de tercera etapa tardía. Usando un atomizador manual, se rocían aproximadamente 2 ml de solución en cada placa de Petri. Las arenas de ensayo se mantuvieron a aproximadamente 25°C. El porcentaje de mortalidad se registró después de 5 días.

40 En esta prueba, los compuestos 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-18, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-3, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-38, 1-39, 1-40, 1-41, 1-42, 1-44, 1-45, 1-46, 1-47, 1-48, 1-49, 1-50, 1-51, 1-53, 1-54, 1-55, 1-57, 1-58, 1-59, 1-60, 1-61, 1-62, 1-63, 1-64, 1-65, 1-66, 1-67, 1-72, 2-3, 2-4, 2-5, 2-6, 2-7, 2-8, 2-9, 2-10, 2-11, 2-12, 2-13, 2-14, 2-17, 2-18, 2-19, 2-20, 2-21, 2-22, 2-23, 2-24, 3-3, 3-4, 4-2 a 300 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles
45 no tratados.

B.12 Chinche apestosa marrón Neotropical (*Euschistus heros*)

El compuesto activo se disolvió a la concentración deseada en una mezcla de 1:1 (vol: vol) de agua destilada: acetona. Se añadió surfactante (Kinetic HV) a una tasa de 0.01% (vol/vol). La solución de prueba se preparó el día de uso.

50 Las vainas de soja se colocaron en vasos de plástico para microondas y se inocularon con diez hembras de *E. heros* adultos. Usando un atomizador manual, se rocía aproximadamente 1 ml de solución en cada taza, los insectos y los alimentos presentes. Se proporcionó una fuente de agua (mecha de algodón con agua). Cada tratamiento se repitió 2 veces. Las arenas de ensayo se mantuvieron a aproximadamente 25°C. El porcentaje de mortalidad se registró después de 5 días.

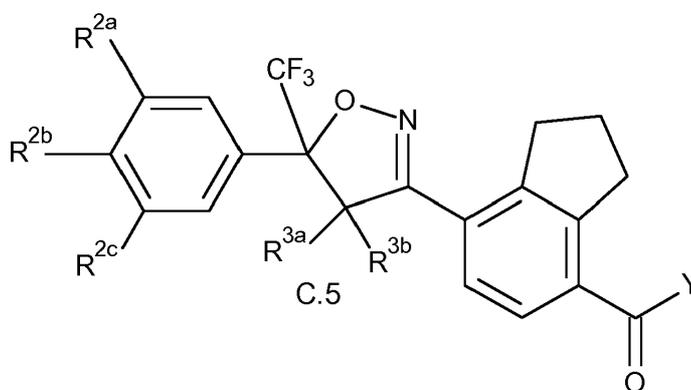
En esta prueba, los compuestos 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-17, 1-18, 1-20, 1-21, 1-23, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 2-3, 2-4, 2-6, 2-7, 2-8, 2-9, 2-10, 2-11 a 100 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

B.13 Chinche apestosa marmorado marrón (*halyomorpha halys*)

- 5 El compuesto activo se disolvió a la concentración deseada en una mezcla de 1:1 (vol: vol) de agua destilada: acetona. Se añadió surfactante (Kinetic HV) a una tasa de 0.01% (vol/vol). La solución de prueba se preparó el día de uso.

Se colocaron semillas de soja y cacahuets en hileras en vasos de plástico para microondas y se inocularon con cinco *H. halis* en estadio adulto. Usando un atomizador manual, se rocía aproximadamente 1 ml de solución en cada taza, los insectos y los alimentos presentes. Se proporcionó una fuente de agua (mecha de algodón con agua). Cada tratamiento se repite 4 veces. Las arenas de ensayo se mantienen a unos 25 °C. El porcentaje de mortalidad se registró después de 5 días.

En esta prueba, los compuestos 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-9, 1-11, 1-12, 1-14, 1-16, 1-20, 1-21, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 2-3, 2-4, 2-5, 2-6, 2-7, 2-8, 2-9, 2-10 a 100 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.



- 15 en donde R^{2a}, R^{2b}, R^{2c}, R^{3a}, R^{3b} y Y de cada compuesto sintetizado se define en una fila de la tabla C.5 a continuación.

Los compuestos fueron sintetizados en analogía al Ejemplo de síntesis S.4.

Tabla C.5

Ej.	R ^{2a} , R ^{2b} , R ^{2c}	R ^{3a} , R ^{3b}	-Y	HPLC-MS: Método, R _t (min) & [M+H] ⁺ or ¹ H-RMN		
5-1	Cl, F, Cl	F, H	-OCH ₃	¹ H RMN (400 MHz, CDCl ₃): δ 7.9 (d, 1H), 7.6 (m, 2H), 7.45 (d, 1H), 6.5 (d, 1H), 3.9 (s, 3H), 3.35 (m, 2H), 3.2 (m, 2H), 2.15 (m, 2H)		
5-2	Cl, F, Cl	F, H	-NHCH ₂ -(2-piridil)	A	1.248	570.0

20 **Ejemplo de síntesis S.4**

7-[5-(3,5-Dicloro-4-fluoro-fenil)-4-fluoro-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il]-N-(2-piridilometil)indano-4-carboxamida

(Ejemplo de compuesto 5-2; compuesto de fórmula C.5, en donde R^{2a} y R^{2c} son Cl, R^{2b} es F, R^{3a} es F y R^{3b} es H, y -Y es -NHCH₂-(2-piridil))

- 25 Etapa 1: 7-[5-(3,5-dicloro-4-fluoro-fenil)-4-fluoro-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il]indano-4-carboxilato de metilo (ejemplo de compuesto 5-1)

30 A una solución de 7-[5-(3,5-dicloro-4-fluoro-fenil)-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il] indano-4-carboxilato (ejemplo del compuesto 1-1, 2) g) en THF (30 ml) bajo nitrógeno a -78 °C se añadió, hexametildisilazida de litio ("LiHMDS", 4,6 ml, solución 1 M en THF) y la mezcla se agitó durante 1,5 horas a -78 °C. Luego, se añadió N-fluorobencenosulfonimida ("NFSI", 1,7 g) a -78 °C en una porción y la mezcla se agitó a -78 °C durante otras 3 h. Luego, la reacción se detuvo con una solución acuosa saturada de NH₄Cl. Se añadió acetato de etilo (300 ml) y la capa orgánica se lavó con agua (3x), se secó (Na₂SO₄), se filtró y se concentró para proporcionar un residuo que se purificó por cromatografía instantánea sobre sílica gel (acetato de etilo/ciclohexano) para proporcionar el producto (0,4 g, 19%).

¹H RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 7.9 (d, 1H), 7.6 (m, 2H), 7.45 (d, 1H), 6.5 (d, 1H), 3.9 (s, 3H), 3.35 (m, 2H), 3.2 (m, 2H), 2.15 (m, 2H).

Etapla 2: ácido 7-[5-(3,5-Dicloro-4-fluoro-fenil)-4-fluoro-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il]indano-4-carboxílico

5 El producto de la etapa 1 (0,4 g) en THF (7,5 ml) se trató con una solución de LiOH (0,08 g) en agua (2,5 ml) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante la noche. Luego, se añadió éter dietílico (300 ml) y el pH de la solución se ajustó a pH 3-4 utilizando una solución acuosa al 10% de HCl. La capa orgánica se separó, se lavó con agua (2x), se secó (Na₂SO₄), se filtró y se concentró para proporcionar el producto (0,37 g, 95%), que se usó en la siguiente etapa sin purificación adicional.

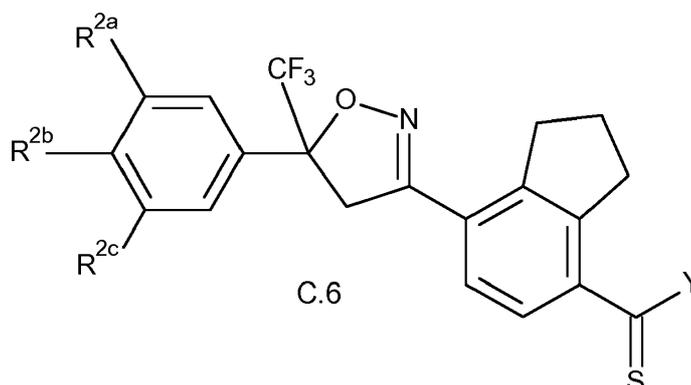
10 Etapa 3: 7-[5-(3,5-Dicloro-4-fluoro-fenil)-4-fluoro-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il]-N-(2-piridilometil)indano-4-carboxamida (ejemplo de compuesto 5-2)

15 A una solución del producto de la etapa 2 (0,36 g), 2-picolilamina (0,1 g, CAS 3731-51-9) y PyBroP (0,42 g) en CH₂Cl₂ (40 ml) a temperatura ambiente. Se añadió N,N-diisopropiletilamina (0,31 g). La reacción se agitó a temperatura ambiente durante la noche. Entonces, la reacción se detuvo con agua. La capa orgánica se separó, se secó (Na₂SO₄), se filtró y se concentró para dar un residuo, que se purificó por cromatografía instantánea sobre sílica gel para proporcionar el producto (0,29 g, 68%).

HPLC-MS (método A): 1.248 min, M = 570.0.

C.6 Ejemplos de compuesto 6

Ejemplo del compuesto 6-1 corresponde a un compuesto de fórmula C.6:



20 en donde R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y Y de cada compuesto sintetizado se define en una fila de la tabla C.6 a continuación.

El compuesto se sintetizó en analogía al Ejemplo de síntesis S.5.

Tabla C.6

Ej.	R ^{2a} , R ^{2b} , R ^{2c}	-Y	HPLC-MS: Método, R _t (min) & [M+H] ⁺ o ¹ H-RMN		
6-1	Cl, H, Cl	-NHCH ₂ -(2-piridil)	A	1.248	570.0

Ejemplo de síntesis S.5

25 7-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il]-N-(2-piridilometil)indano-4-carboxioamida

(Ejemplo de compuesto 6-1; compuesto de fórmula C.5, en donde R^{2a} y R^{2c} son Cl, R^{2b} es H, y -Y es -NHCH₂-(2-piridil))

30 Una solución de 7-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il]-N-(2-piridilometil) indano-4-carboxamida (ejemplo de compuesto 1-27, 190 mg) y el reactivo de Lawesson (90 mg, CAS 19172-47-5) en tolueno (15 ml) se sometió a reflujo durante 5 h y luego se agitó a temperatura ambiente durante la noche. Se añadió acetato de etilo (200 ml) y la capa orgánica se lavó con agua (3x), se secó (Na₂SO₄), se filtró y se concentró para dar un residuo, que se purificó por cromatografía instantánea sobre sílica gel para proporcionar el producto (70 mg, 60%).

HPLC-MS (método A): 1.335 min, M = 550.0.

II. Evaluación de la actividad plaguicida:

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

B.1 Polilla dorso de diamante (*Plutella xylostella*)

5 El compuesto activo se disolvió a la concentración deseada en una mezcla de 1:1 (vol: vol) de agua destilada: acetona. Se añadió surfactante (Kinetic HV) a una tasa de 0.01% (vol/vol). La solución de prueba se preparó el día de uso.

Las hojas de repollo se sumergieron en solución de prueba y se secaron al aire. Las hojas tratadas se colocaron en placas de Petri revestidas con papel de filtro húmedo y se inocularon con diez larvas de tercer estadio. La mortalidad se registró 72 horas después del tratamiento.

10 En esta prueba, los compuestos 1-1, 1-2, 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-37, 1-38, 1-39, 1-40, 1-41, 1-42, 1-43, 1-44, 1-45, 1-46, 1-47, 1-48, 1-49, 1-50, 1-51, 1-52, 1-53, 1-54, 1-55, 1-57, 1-58, 1-59, 1-60, 1-61, 1-62, 1-63, 1-64, 1-65, 1-66, 1-67, 1-69, 1-70, 1-71, 1-72, 2-1, 2-3, 2-4, 2-5, 2-6, 2-7, 2-8, 2-9, 2-10, 2-11, 2-12, 2-13, 2-14, 2-17, 2-18, 2-19, 2-20, 2-21, 2-22, 2-23, 2-24, 3-3, 3-4, 3-5, 3-6, 4-1, 4-2 a 300 ppm, respectivamente, mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

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

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

20 Los compuestos se formularon utilizando una solución que contiene 75% v/v de agua y 25% v/v de DMSO. Se pipetearon diferentes concentraciones de compuestos formulados en la dieta del áfido, utilizando un pipeteador construido a medida, en dos repeticiones.

25 Después de la aplicación, se colocaron de 5 a 8 pulgones adultos en la membrana artificial dentro de los pocillos de la placa de microtitulación. Luego se dejó que los áfidos chuparan la dieta de áfidos tratados y se incubaron a aproximadamente 23 + 1 °C y aproximadamente 50 + 5% de humedad relativa durante 3 días. Luego se evaluó visualmente la mortalidad y fecundidad de áfidos.

30 En esta prueba, los compuestos 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-37, 1-38, 1-39, 1-40, 1-41, 1-42, 1-43, 1-44, 1-45, 1-46, 1-47, 1-48, 1-49, 1-50, 1-51, 1-52, 1-53, 1-54, 1-55, 1-57, 1-58, 1-59, 1-60, 1-61, 1-62, 1-63, 1-64, 1-65, 1-66, 1-67, 1-69, 1-70, 1-71, 1-72, 1-73, 1-74, 1-75, 1-76, 1-77, 1-78, 1-79, 1-80, 1-82, 2-1, 2-2, 2-3, 2-4, 2-5, 2-6, 2-7, 2-8, 2-9, 2-10, 2-11, 2-12, 2-13, 2-14, 2-17, 2-18, 2-19, 2-20, 2-21, 2-22, 2-23, 2-24, 3-3, 3-4, 3-5, 3-6, 3-7, 3-8, 3-9, 3-10, 3-11, 3-12, 3-13, 4-1, 4-2 a 2500 ppm, respectivamente, mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

B.3 Áfido del algarrobo (*Megoura viciae*)

35 Para evaluar el control del áfido del algarrobo (*Megoura viciae*) a través de contacto o medios sistémicos, la unidad de prueba consistió en placas de microtitulación de 24 pocillos que contenían discos de hoja ancha de frijol.

Los compuestos se formularon utilizando una solución que contiene 75% v/v de agua y 25% v/v de DMSO. Se rociaron diferentes concentraciones de compuestos formulados sobre los discos de hojas a 2,5 µl, utilizando un microatomizador hecho a medida, en dos repeticiones.

40 Después de la aplicación, los discos de las hojas se secaron al aire y se colocaron de 5 a 8 áfidos adultos en los discos de las hojas dentro de los pocillos de la placa de microtitulación. Luego se dejó que los áfidos chuparan los discos de las hojas tratadas y se incubaron a aproximadamente 23 + 1 °C y aproximadamente 50 + 5% de humedad relativa durante 5 días. Luego se evaluó visualmente la mortalidad y fecundidad de áfidos.

45 En esta prueba, los compuestos 1-1, 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-37, 1-38, 1-39, 1-40, 1-41, 1-42, 1-43, 1-44, 1-45, 1-46, 1-47, 1-48, 1-49, 1-50, 1-51, 1-52, 1-53, 1-54, 1-55, 1-57, 1-58, 1-59, 1-60, 1-61, 1-62, 1-63, 1-64, 1-65, 1-66, 1-67, 1-69, 1-70, 1-71, 1-72, 1-73, 1-74, 1-75, 1-76, 1-77, 1-78, 1-79, 1-80, 1-82, 2-2, 2-3, 2-4, 2-5, 2-6, 2-7, 2-8, 2-9, 2-10, 2-11, 2-12, 2-13, 2-14, 2-17, 2-18, 2-19, 2-20, 2-21, 2-22, 2-23, 2-24, 3-3, 3-4, 3-5, 3-6, 3-7, 3-8, 3-9, 3-10, 3-11, 3-12, 3-13, 4-1, 4-2 a 2500 ppm, respectivamente, mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

50 B.4 Gusano del brote del tabaco (*Heliothis virescens*)

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

ES 2 710 217 T3

Los compuestos se formularon utilizando una solución que contiene 75% v/v de agua y 25% v/v de DMSO. Se pulverizaron diferentes concentraciones de compuestos formulados sobre la dieta de insectos a 10 µl, utilizando un microatomizador hecho a medida, en dos repeticiones.

5 Después de la aplicación, las placas de microtitulación se incubaron a aproximadamente 28 + 1 °C y aproximadamente 80 + 5% de humedad relativa durante 5 días. Luego se evaluó visualmente la mortalidad de huevos y larvas.

10 En esta prueba, los compuestos 1-1, 1-2, 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-37, 1-38, 1-39, 1-40, 1-41, 1-42, 1-43, 1-44, 1-45, 1-46, 1-47, 1-48, 1-49, 1-50, 1-51, 1-52, 1-53, 1-54, 1-55, 1-57, 1-58, 1-59, 1-60, 1-61, 1-62, 1-63, 1-64, 1-65, 1-66, 1-67, 1-68, 1-69, 1-70, 1-71, 1-72, 1-73, 1-74, 1-75, 1-76, 1-77, 1-78, 1-79, 1-80, 1-82, 2-1, 2-2, 2-3, 2-4, 2-5, 2-6, 2-7, 2-8, 2-9, 2-10, 2-11, 2-12, 2-13, 2-14, 2-17, 2-18, 2-19, 2-20, 2-21, 2-22, 2-23, 2-24, 3-3, 3-4, 3-5, 3-6, 3-7, 3-8, 3-9, 3-10, 3-11, 3-12, 3-13, 4-1, 4-2 a 2500 ppm, respectivamente, mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

B.5 Gorgojo de baya (*Anthonomus grandis*)

15 Para evaluar el control del gorgojo de baya (*Anthonomus grandis*), la unidad de prueba consistió en placas de microtitulación de 96 pocillos que contenían una dieta para insectos y 5-10 huevos de *A. grandis*.

Los compuestos se formularon utilizando una solución que contiene 75% v/v de agua y 25% v/v de DMSO. Se pulverizaron diferentes concentraciones de compuestos formulados sobre la dieta de insectos a 5 µl, utilizando un microatomizador hecho a la medida, en dos repeticiones.

20 Después de la aplicación, las placas de microtitulación se incubaron a aproximadamente 25 + 1 °C y aproximadamente 75 + 5% de humedad relativa durante 5 días. Luego se evaluó visualmente la mortalidad de huevos y larvas.

25 En esta prueba, los compuestos 1-1, 1-2, 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-37, 1-38, 1-39, 1-40, 1-41, 1-42, 1-43, 1-44, 1-45, 1-46, 1-47, 1-48, 1-49, 1-50, 1-51, 1-52, 1-53, 1-54, 1-55, 1-57, 1-58, 1-59, 1-60, 1-61, 1-62, 1-63, 1-64, 1-65, 1-66, 1-67, 1-69, 1-70, 1-71, 1-72, 1-73, 1-74, 1-75, 1-76, 1-77, 1-78, 1-79, 1-80, 1-81, 1-82, 2-1, 2-2, 2-3, 2-4, 2-5, 2-6, 2-7, 2-8, 2-9, 2-10, 2-11, 2-12, 2-13, 2-14, 2-16, 2-17, 2-18, 2-19, 2-20, 2-21, 2-22, 2-23, 2-24, 3-2, 3-3, 3-4, 3-5, 3-6, 3-7, 3-8, 3-9, 3-10, 3-11, 3-12, 3-13, 4-1, 4-2 a 2500 ppm, respectivamente, mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

B.6 Mosca de la fruta del Mediterráneo (*Ceratitis capitata*)

30 Para evaluar el control de la mosca de la fruta del Mediterráneo (*Ceratitis capitata*), la unidad de prueba consistió en placas de microtitulación que contenían una dieta para insectos y 50-80 huevos de *C. capitata*. Los compuestos se formularon utilizando una solución que contiene 75% v/v de agua y 25% v/v de DMSO. Se pulverizaron diferentes concentraciones de compuestos formulados sobre la dieta de insectos a 5 µl, utilizando un microatomizador hecho a la medida, en dos repeticiones.

35 Después de la aplicación, las placas de microtitulación se incubaron a aproximadamente 28 + 1 °C y aproximadamente 80 + 5% de humedad relativa durante 5 días. Luego se evaluó visualmente la mortalidad de huevos y larvas.

40 En esta prueba, los compuestos 1-1, 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-37, 1-38, 1-39, 1-40, 1-41, 1-42, 1-43, 1-44, 1-45, 1-46, 1-47, 1-48, 1-49, 1-50, 1-51, 1-52, 1-53, 1-54, 1-55, 1-57, 1-58, 1-59, 1-60, 1-61, 1-62, 1-63, 1-64, 1-65, 1-66, 1-67, 1-69, 1-70, 1-71, 1-72, 1-73, 1-74, 1-75, 1-76, 1-77, 1-78, 1-79, 1-80, 1-82, 2-3, 2-4, 2-5, 2-6, 2-7, 2-8, 2-9, 2-10, 2-11, 2-12, 2-13, 2-14, 2-16, 2-17, 2-18, 2-19, 2-20, 2-21, 2-22, 2-23, 2-24, 3-3, 3-4, 3-5, 3-6, 3-7, 3-8, 3-9, 3-10, 3-11, 3-12, 3-13, 4-1, 4-2 a 2500 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

B.7 Thrips de orquídeas (*dichromothrips corbetti*)

45 *Dichromothrips corbetti* adultos utilizados para bioensayo se obtuvieron de una colonia mantenida continuamente en condiciones de laboratorio. Para propósitos de prueba, el compuesto de prueba se diluye en una mezcla 1: 1 de acetona: agua (vol: vol), más Kinetic HV a una tasa de 0.01% v/v.

50 La potencia de los trips de cada compuesto se evaluó utilizando una técnica de inmersión floral. Todos los pétalos de flores de orquídeas individuales e intactas se sumergieron en la solución de tratamiento y se dejaron secar en placas de Petri. Los pétalos tratados se colocaron en un plástico resellable individual junto con unos 20 trips adultos. Todos los estadios de prueba se mantuvieron bajo luz continua y una temperatura de aproximadamente 28 °C durante la duración del ensayo. Después de 3 días, se contó el número de trips vivos en cada pétalo. El porcentaje de mortalidad se registró 72 horas después del tratamiento.

En esta prueba, los compuestos 1-1, 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-37, 1-

38, 1-39, 1-40, 1-41, 1-42, 1-43, 1-44, 1-45, 1-46, 1-47, 1-48, 1-49, 1-50, 1-51, 1-52, 1-53, 1-54, 1-55, 1-57, 1-58, 1-59, 1-60, 1-61, 1-62, 1-63, 1-64, 1-65, 1-66, 1-67, 1-68, 1-69, 1-70, 1-71, 1-72, 2-2, 2-3, 2-4, 2-5, 2-6, 2-7, 2-8, 2-9, 2-10, 2-11, 2-12, 2-13, 2-14, 2-17, 2-18, 2-19, 2-20, 2-21, 2-22, 2-23, 2-24, 3-3, 3-4, 3-5, 3-6, 4-1, 4-2 a 300 ppm, respectivamente, mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

5 B.8 Saltamontes verde de arroz (*Nephotettix virescens*)

Las plántulas de arroz se limpiaron y lavaron 24 horas antes de pulverizar. Los compuestos activos se formularon en acetona: agua 1: 1 (vol: vol) y se agregó 0.01% vol/vol de surfactante (Kinetic HV). Las plántulas de arroz en macetas se rociaron con 5-6 ml de solución de prueba, se secaron al aire, se cubrieron con jaulas Mylar y se inocularon con 10 adultos. Las plantas de arroz tratadas se mantuvieron a aproximadamente 28-29 °C y una humedad relativa de aproximadamente 50-60%. El porcentaje de mortalidad se registró después de 72 horas.

10 En esta prueba, los compuestos 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-38, 1-39, 1-40, 1-41, 1-42, 1-43, 1-44, 1-45, 1-46, 1-47, 1-48, 1-49, 1-50, 1-51, 1-52, 1-53, 1-54, 1-55, 1-57, 1-58, 1-59, 1-60, 1-61, 1-62, 1-63, 1-64, 1-65, 1-66, 1-67, 1-69, 1-70, 1-71, 1-72, 2-3, 2-4, 2-5, 2-6, 2-7, 2-8, 2-9, 2-10, 2-11, 2-12, 2-13, 2-14, 2-17, 2-18, 2-19, 2-20, 2-21, 2-23, 2-24, 3-3, 3-4, 3-5, 3-6, 4-2 a 300 ppm, respectivamente, mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

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

El compuesto activo se disolvió a la concentración deseada en una mezcla de 1: 1 (vol: vol) de agua destilada: acetona. Se añadió surfactante de adición (Kinetic HV) a una tasa de 0.01% (vol/vol). La solución de prueba se preparó el día de uso.

20 Los frijoles de caupí en maceta de 4-5 días de edad se limpiaron con agua corriente y se rociaron con 1-2 ml de la solución de prueba utilizando un atomizador manual accionado por aire. Las plantas tratadas se dejaron secar al aire y luego se inocularon con 30 o más ácaros recortando una sección de hoja de yuca de la población de crianza. Las plantas tratadas se colocaron dentro de una sala de almacenamiento a aproximadamente 25-27 °C y aproximadamente 50-60% de humedad relativa. El porcentaje de mortalidad se evaluó 72 horas después del tratamiento.

30 En esta prueba, los compuestos 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-18, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-38, 1-39, 1-40, 1-41, 1-42, 1-43, 1-44, 1-45, 1-46, 1-47, 1-48, 1-49, 1-50, 1-51, 1-52, 1-53, 1-54, 1-55, 1-57, 1-58, 1-59, 1-60, 1-61, 1-62, 1-63, 1-64, 1-65, 1-66, 1-67, 1-69, 1-70, 1-71, 1-72, 2-3, 2-4, 2-5, 2-6, 2-7, 2-8, 2-9, 2-10, 2-11, 2-12, 2-13, 2-14, 2-17, 2-18, 2-19, 2-20, 2-21, 2-22, 2-23, 2-24, 3-3, 3-4, 3-5, 3-6, 4-2 a 300 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

B.10 gusano cogollero del sur (*Spodoptera eridania*)

35 Los compuestos activos se formularon en ciclohexanona como una solución de 10,000 ppm suministrada en tubos. Los tubos se insertaron en un pulverizador electrostático automático equipado con una boquilla atomizadora y sirvieron como soluciones de reserva para las cuales se hicieron diluciones más bajas en acetona al 50%: agua al 50% (v/v). Se incluyó un surfactante no iónico (Kinetic®) en la solución a un volumen de 0.01% (v/v).

40 Las plantas de frijol de Lima (variedad Sieva) se cultivaron 2 plantas en una maceta y se seleccionaron para el tratamiento en la 1ª etapa de hoja verdadera. Las soluciones de prueba se rociaron sobre el follaje con un rociador automático de plantas electrostáticas equipado con una boquilla atomizadora. Las plantas se secaron en la campana extractora y luego se retiraron del pulverizador. Cada maceta se colocó en bolsas de plástico perforadas con un cierre de cremallera. Se colocaron alrededor de 10 a 11 larvas de gusano cogollero en la bolsa y las bolsas se cerraron con cremallera. Las plantas de prueba se mantuvieron en una sala de crecimiento a aproximadamente 25 °C y aproximadamente 20-40% de humedad relativa durante 4 días, evitando la exposición directa a la luz fluorescente (fotoperíodo de 24 horas) para evitar la captura de calor dentro de las bolsas. La mortalidad y la alimentación reducida se evaluaron 4 días después del tratamiento, en comparación con las plantas de control sin tratar.

45 En esta prueba, los compuestos 1-5, 1-6, 1-7, 1-10, 1-12, 1-14, 1-16, 1-17, 1-21, 1-23, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-38, 1-42, 1-49, 1-51, 2-3, 2-4, 2-5, 2-6, 2-7, 2-8, 2-9, 2-10, 2-11, 2-12, 2-13, 2-14, 4-2 a 1 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

50 B.11 Chinche verde apestosa (*Nezara viridula*)

El compuesto activo se disolvió a la concentración deseada en una mezcla de 1: 1 (vol: vol) de agua destilada: acetona. Se añadió surfactante (Kinetic HV) a una tasa de 0.01% (vol/vol). La solución de prueba se preparó el día de uso.

Las vainas de soja se colocaron en placas de Petri de vidrio forradas con papel de filtro húmedo y se inocularon con diez *N. viridula* en tercer estadio tardío. Usando un atomizador manual, se rocían aproximadamente 2 ml de solución

en cada placa de Petri. Las arenas de ensayo se mantuvieron a aproximadamente 25°C. El porcentaje de mortalidad se registró después de 5 días.

5 En esta prueba, los compuestos 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-18, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-3, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-38, 1-39, 1-40, 1-41, 1-42, 1-44, 1-45, 1-46, 1-47, 1-48, 1-49, 1-50, 1-51, 1-53, 1-54, 1-55, 1-57, 1-58, 1-59, 1-60, 1-61, 1-62, 1-63, 1-64, 1-65, 1-66, 1-67, 1-72, 2-3, 2-4, 2-5, 2-6, 2-7, 2-8, 2-9, 2-10, 2-11, 2-12, 2-13, 2-14, 2-17, 2-18, 2-19, 2-20, 2-21, 2-22, 2-23, 2-24, 3-3, 3-4, 4-2 a 300 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

B.12 Chincheapestoso marrón (*Euschistus heros*)

10 El compuesto activo se disolvió a la concentración deseada en una mezcla de 1:1 (vol: vol) de agua destilada: acetona. Se añadió surfactante (Kinetic HV) a una tasa de 0.01% (vol/vol). La solución de prueba se preparó el día de uso.

15 Las vainas de soja se colocaron en vasos de plástico para microondas y se inocularon con diez hembras de *E. heros* adultos. Usando un atomizador manual, se rocía aproximadamente 1 ml de solución en cada taza, los insectos y los alimentos presentes. Se proporcionó una fuente de agua (mecha de algodón con agua). Cada tratamiento se repitió 2 veces. Las arenas de ensayo se mantuvieron a aproximadamente 25°C. El porcentaje de mortalidad se registró después de 5 días.

En esta prueba, los compuestos 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-17, 1-18, 1-20, 1-21, 1-23, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 2-3, 2-4, 2-6, 2-7, 2-8, 2-9, 2-10, 2-11 a 100 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

20 B.13 Chincheapestoso marmorado marrón (*halyomorpha halys*)

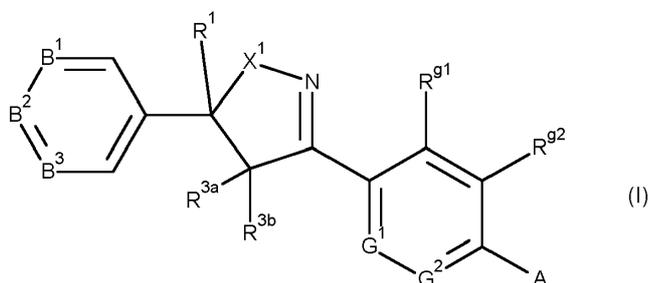
El compuesto activo se disolvió a la concentración deseada en una mezcla de 1:1 (vol: vol) de agua destilada: acetona. Se añadió surfactante (Kinetic HV) a una tasa de 0.01% (vol/vol). La solución de prueba se preparó el día de uso.

25 Se colocaron semillas de soja y cacahuets en hileras en tasas de plástico para microondas y se inocularon con cinco *H. halis* en estadio adulto. Usando un atomizador manual, se rocía aproximadamente 1 ml de solución en cada taza, los insectos y los alimentos presentes. Se proporcionó una fuente de agua (mecha de algodón con agua). Cada tratamiento se repite 4 veces. Las arenas de ensayo se mantienen a unos 25 °C. El porcentaje de mortalidad se registró después de 5 días.

30 En esta prueba, los compuestos 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-9, 1-11, 1-12, 1-14, 1-16, 1-20, 1-21, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 2-3, 2-4, 2-5, 2-6, 2-7, 2-8, 2-9, 2-10 a 100 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

REIVINDICACIONES

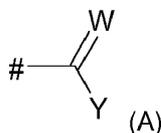
1. Compuestos de azolina de la fórmula I



en donde

5 X¹ es O o CH₂;

A es un grupo de la siguiente fórmula:



en donde

denota el enlace al anillo aromático de fórmula (I);

10 W se selecciona de O y S;

Y se selecciona de hidrógeno, -N(R⁵)R⁶ y -OR⁹;

B¹, B² y B³ son cada uno independientemente CR²;

G¹ y G² son cada uno independientemente CR⁴;

R⁹¹ y R⁹² formar juntos un grupo puente seleccionado de -CH₂CH₂CH₂CH₂- y -CH₂CH₂CH₂-;

15 R¹ es CF₃;

cada R² se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, C₁-C₂-haloalcoxi y C₁-C₂-haloalquilo;

20 R^{3a}, R^{3b} son cada uno independientemente seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, hidroxilo, -CO₂R^{3d}, C₁-C₃-alquilo, C₁-C₃-haloalquilo, C₂-C₃-alqueno, C₂-C₃-alquinilo, C₁-C₃-alcoxi, C₁-C₃-haloalcoxi, C₁-C₃-alquiltio, C₁-C₃-haloalquiltio, C₁-C₃-alquilsulfonilo y C₁-C₃-haloalquilsulfonilo; o R^{3a} y R^{3b} juntos forman un grupo =O, =C(R^{3c})₂, =NOH o =NOCH₃;

cada R^{3c} se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, CH₃ y CF₃;

R^{3d} se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, C₁-C₆-alquilo y C₁-C₃-alquilo-C₁-C₃-alquil-;

cada R⁴ se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno y ciano;

25 R⁵ se selecciona de hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₃-alquinilo y CH₂-CN;

R⁶ se selecciona de hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₄-alquilo que porta un radical R⁸, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-haloalqueno, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo que pueden estar sustituidos con 1 o 2 sustituyentes seleccionados de F, CN y piridilo;

-N(R^{101a})R^{101b},

30 en donde

R^{101a} se selecciona de hidrógeno y C₁-C₆-alquilo; y

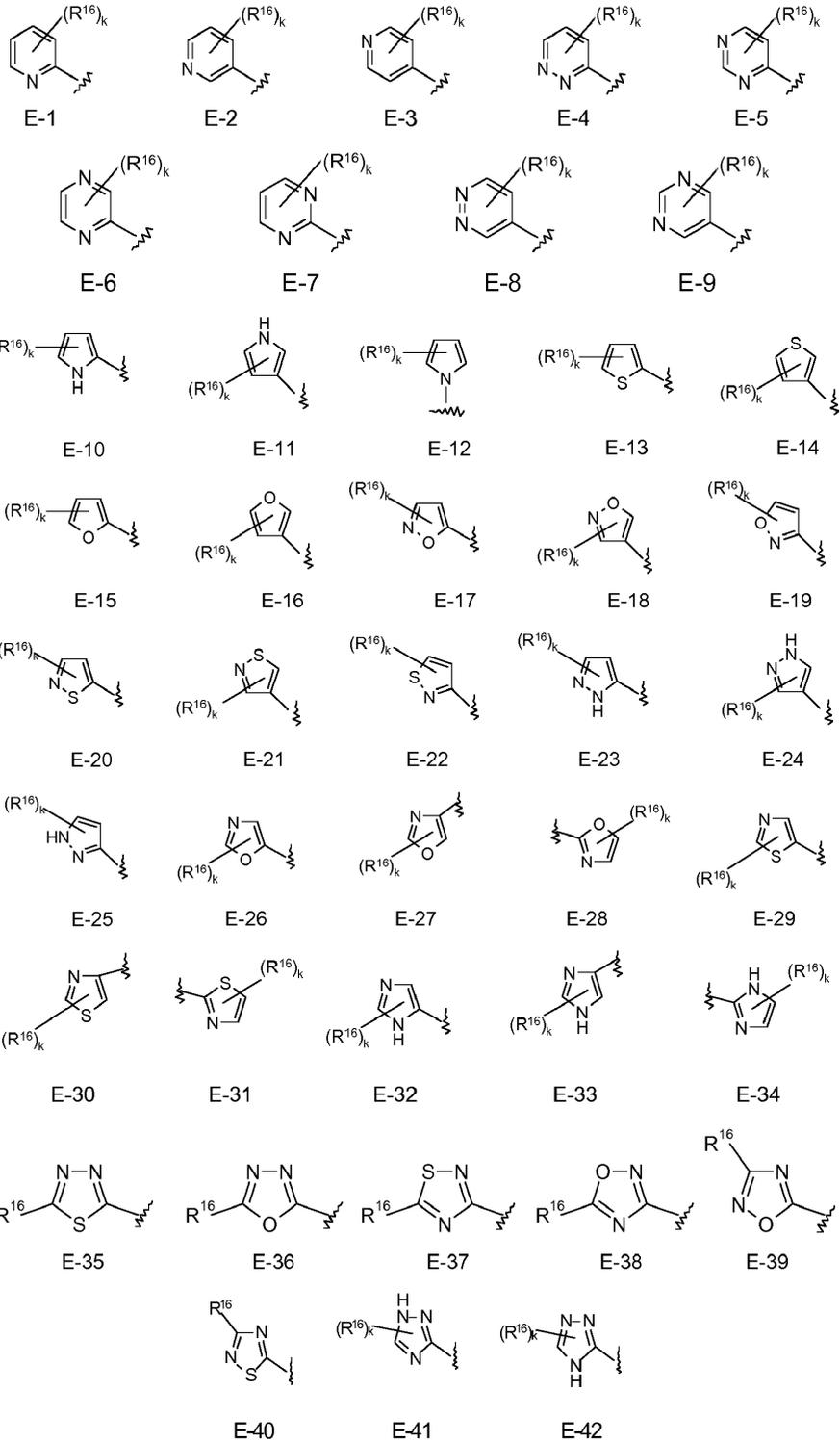
R^{101b} se selecciona de hidrógeno, -C(=O)N(R^{14a})R^{14b}, en donde

R^{14a} se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno y C₁-C₆-alquilo; y

R^{14b} se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₄-alquinilo, CH₂-CN, C₁-C₆-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;

fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R¹⁶, y un anillo heterocíclico seleccionado de anillos de fórmulas E-1 a E-42

5



10

15

en donde estos anillos E-1 a E-42 como un significado para R^{101b} la

línea en zigzag denota el punto de unión al resto de la molécula;

k es 0, 1, 2 o 3, y

5 cada R¹⁶ se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinilo, C₁-C₄-haloalquilsulfinilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alquenilo, C₂-C₄-haloalquenilo, C₂-C₄-alquinilo, C₂-C₄-haloalquinilo, C₁-C₄-alquilcarbonilo, C₁-C₄-haloalquilcarbonilo, aminocarbonilo, C₁-C₄-alquilaminocarbonilo y di-(C₁-C₄-alquil)amino-carbonilo;

-CH=NOR^{9a}, en donde R^{9a} se selecciona de hidrógeno, C₁-C₆-alquilo y C₁-C₆-haloalquilo;

10 fenilo que puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R¹¹, y un anillo heteromonocíclico saturado, parcialmente insaturado o insaturado al máximo de 3, 4, 5 o 6 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados independientemente de N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heteromonocíclico puede estar sustituido con uno o más sustituyentes R¹¹;

en donde

15 cada R¹¹ se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alquenilo, C₂-C₄-haloalquenilo, C₂-C₄-alquinilo y C₂-C₄-haloalquinilo; o

dos R¹¹ presentes en el mismo átomo de carbono de un anillo heterocíclico saturado pueden formar juntos =O o =S;

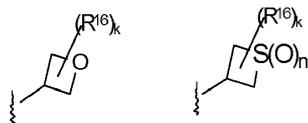
dos R¹¹ presentes en el mismo miembro de anillo S o SO de un anillo heterocíclico pueden formar juntos un grupo =N(C₁-C₆-alquil), =NO(C₁-C₆-alquil), =NN(H)(C₁-C₆-alquil) o =NN(C₁-C₆-alquil)₂;

20 cada R⁸ se selecciona independientemente de OH, CN, C₃-C₈-cicloalquilo que porta opcionalmente un sustituyente CN o un C₁-C₂-haloalquilo; C₃-C₈-halocicloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-haloalquiltio, C₁-C₆-alquilsulfonilo, C₁-C₆-haloalquilsulfonilo, -C(=O)N(R^{102a})R^{102b}, fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R¹⁶, y un anillo heteromonocíclico saturado, parcialmente insaturado o insaturado al máximo de 3, 4, 5 o 6 miembros que contienen 1, 2, 3 o 4 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados independientemente de N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heteromonocíclico puede estar sustituido con uno o más sustituyentes R¹⁶;

en donde

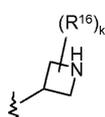
R^{102a} se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₃-alquinilo y CH₂-CN;

30 R^{102b} se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₄-alquenilo, C₂-C₄-alquinilo, CH₂-CN, C₁-C₆-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilmetilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, fenilo que está opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₂-C₄-alquenilo, C₂-C₄-haloalquenilo, C₂-C₄-alquinilo, C₂-C₄-haloalquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio y C₁-C₄-haloalquiltio; y un anillo heterocíclico seleccionado de anillos de fórmulas E-1 a E-42 como se define más arriba y E-43 a E-57:

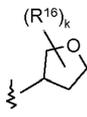


E-43

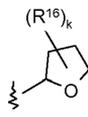
E-44



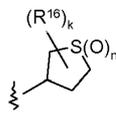
E-45



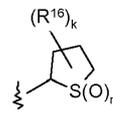
E-46



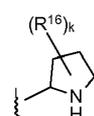
E-47



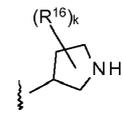
E-48



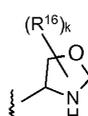
E-49



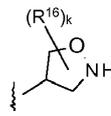
E-50



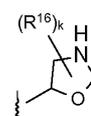
E-51



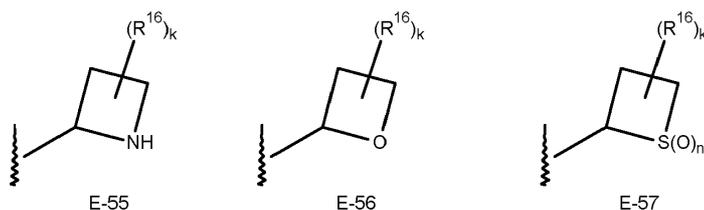
E-52



E-53



E-54



donde en estos anillos E-43 a E-57

la línea en zigzag denota el punto de unión al resto de la molécula;

k es 0, 1, 2 o 3,

5 n es 0, 1 o 2; y

cada R^{16} se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -haloalquilo, C_1 - C_4 -alcoxi, C_1 - C_4 -haloalcoxi, C_1 - C_4 -alquiltio, C_1 - C_4 -haloalquiltio, C_1 - C_4 -alquilsulfinilo, C_1 - C_4 -haloalquilsulfinilo, C_1 - C_4 -alquilsulfonilo, C_1 - C_4 -haloalquilsulfonilo, C_3 - C_6 -cicloalquilo, C_3 - C_6 -halocicloalquilo, C_2 - C_4 -alquenilo, C_2 - C_4 -haloalquenilo, C_2 - C_4 -alquinilo, C_2 - C_4 -haloalquinilo, C_1 - C_4 -alquilcarbonilo, C_1 - C_4 -haloalquilcarbonilo, aminocarbonilo, C_1 - C_4 -alquilaminocarbonilo y di- $(C_1$ - C_4 -alquil)amino-carbonilo; o

10

dos R^{16} presentes en el mismo átomo de carbono de un anillo saturado pueden formar juntos =O o =S; y

cada R^{16} como sustituyente en fenilo (como un significado de R^8) o los anillos heterocíclicos (como un significado de R^8) se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -haloalquilo, C_1 - C_4 -alcoxi, C_1 - C_4 -haloalcoxi, C_1 - C_4 -alquiltio, C_1 - C_4 -haloalquiltio, C_3 - C_6 -cicloalquilo, C_3 - C_6 -halocicloalquilo, C_2 - C_4 -alquenilo, C_2 - C_4 -haloalquenilo, C_2 - C_4 -alquinilo y C_2 - C_4 -haloalquinilo; o

15

dos R^{16} presentes en el mismo átomo de carbono de un anillo heterocíclico saturado pueden formar juntos =O o =S; o

dos R^{16} presentes en el mismo miembro de anillo S o SO de un anillo heterocíclico pueden formar juntos un grupo =N(C_1 - C_6 -alquil), =NO(C_1 - C_6 -alquil), =NN(H)(C_1 - C_6 -alquil) o =NN(C_1 - C_6 -alquil)₂;

20 o

R^5 y R^6 , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un anillo heterocíclico saturado de 5 o 6 miembros, donde el anillo puede contener además 1 o 2 heteroátomos o grupos que contienen heteroátomos seleccionados de O, S, SO, SO₂, NH y C=O como miembros de anillo, en donde el anillo heterocíclico puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -haloalquilo, C_1 - C_6 -alcoxi y C_1 - C_6 -haloalcoxi;

25

o

R^5 y R^6 juntos forman un grupo =S(R^{9b})₂, donde R^{9b} se selecciona de C_1 - C_6 -alquilo y C_1 - C_6 -haloalquilo;

R^9 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -haloalquilo y C_1 - C_6 -alquilo sustituido por un radical R^{13} ; donde R^{13} se selecciona de CN, C_1 - C_6 -alcoxi, C_1 - C_6 -haloalcoxi, C_1 - C_6 -alquiltio, C_1 - C_6 -haloalquiltio, C_1 - C_6 -alquilsulfinilo, C_1 - C_6 -haloalquilsulfinilo, C_1 - C_6 -alquilsulfonilo, C_1 - C_6 -haloalquilsulfonilo y un anillo heterocíclico seleccionado de anillos de fórmulas E-1 a E-57 como se define más arriba;

30

donde en estos anillos E-1 a E-57 como un significado de R^{13}

la línea en zigzag denota el punto de unión al resto de la molécula;

k es 0, 1, 2 o 3,

35 n es 0, 1 o 2; y

cada R^{16} se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -haloalquilo, C_1 - C_4 -alcoxi, C_1 - C_4 -haloalcoxi, C_1 - C_4 -alquiltio, C_1 - C_4 -haloalquiltio, C_1 - C_4 -alquilsulfinilo, C_1 - C_4 -haloalquilsulfinilo, C_1 - C_4 -alquilsulfonilo, C_1 - C_4 -haloalquilsulfonilo, C_3 - C_6 -cicloalquilo, C_3 - C_6 -halocicloalquilo, C_2 - C_4 -alquenilo, C_2 - C_4 -haloalquenilo, C_2 - C_4 -alquinilo, C_2 - C_4 -haloalquinilo, C_1 - C_4 -alquilcarbonilo, C_1 - C_4 -haloalquilcarbonilo, aminocarbonilo, C_1 - C_4 -alquilaminocarbonilo y di- $(C_1$ - C_4 -alquil)aminocarbonilo; o

40

dos R^{16} presentes en el mismo átomo de carbono de un anillo saturado pueden formar juntos =O o =S; y

cada R^{16} en todos los otros casos se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, -OH, -SH, C_1 - C_6 -alcoxi, C_1 - C_6 -haloalcoxi, C_1 - C_6 -alquiltio, C_1 - C_6 -haloalquiltio, C_1 - C_6 -alquilsulfinilo, C_1 - C_6 -

haloalquilsulfinilo, C₁-C₆-alquilsulfonilo, C₁-C₆-haloalquilsulfonilo, C₁-C₄-alquilcarbonilo, C₁-C₄-haloalquilcarbonilo, C₁-C₄-alcoxycarbonilo, C₁-C₄-haloalcoxycarbonilo, aminocarbonilo, C₁-C₄-alquilaminocarbonilo, di-(C₁-C₄-alquil)-aminocarbonilo, trimetilsililo, trietilsililo, *tert*-butildimetilsililo;

5 C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenoilo, C₂-C₆-alquinilo, en donde los tres radicales alifáticos mencionados en último lugar pueden estar sin sustituir, parcialmente o totalmente halogenados y/o pueden llevar 1 o 2 radicales seleccionados de ciano, C₃-C₄-cicloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi y oxo;

C₃-C₈-cicloalquilo que puede estar sin sustituir, parcial o totalmente halogenado y/o puede llevar 1 o 2 radicales seleccionados de ciano, C₁-C₄-alquilo, C₃-C₄-cicloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi y oxo;

10 fenilo, bencilo, piridilo y fenoxi, en donde los cuatro últimos radicales mencionados pueden estar sin sustituir, parcial o totalmente halogenados y/o portan 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados de C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi y (C₁-C₆-alcoxi)carbonilo;

o

dos R¹⁶ presentes juntos en el mismo átomo de un anillo insaturado o parcialmente insaturado pueden ser =O, =S, =N(C₁-C₆-alquil), =NO(C₁-C₆-alquil), =CH(C₁-C₄-alquil) o =C(C₁-C₄-alquil)C₁-C₄-alquilo;o

15 o dos R¹⁶ presentes en el mismo miembro de anillo S o SO de un anillo heterocíclico pueden formar juntos un grupo =N(C₁-C₆-alquil), =NO(C₁-C₆-alquil), =NN(H)(C₁-C₆-alquil) o =NN(C₁-C₆-alquil)₂;

o

20 dos R¹⁶ en dos átomos de carbono adyacentes se forman junto con los átomos de carbono que están unidos a un anillo saturado, parcialmente insaturado o insaturado al máximo de 4, 5, 6, 7 u 8 miembros, en donde el anillo puede contener 1 o 2 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados de N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros de anillo, y en donde el anillo lleva opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;

y los N-óxidos, estereoisómeros y sales agrícola o veterinariamente aceptables de los mismos.

25 2. Los compuestos como se reivindican en la reivindicación 1, donde cada R⁸ se selecciona independientemente de OH, CN, C₃-C₈-cicloalquilo que porta opcionalmente un sustituyente CN o CF₃, C₃-C₈-halocicloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-haloalquiltio, C₁-C₆-alquilsulfonilo, C₁-C₆-haloalquilsulfonilo, -C(=O)N(R^{102a})R^{102b}, fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R¹⁶, y un anillo heteromonocíclico saturado, parcialmente insaturado o insaturado al máximo de 3, 4, 5 o 6 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados independientemente de N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heteromonocíclico puede estar sustituido con uno o más sustituyentes R¹⁶; donde R^{102a}, R^{102b} y R¹⁶ son como se define en la reivindicación 1.

30

3. Los compuestos como se reivindican en cualquiera de las reivindicaciones 1 o 2, donde X¹ es O.

4. Los compuestos como se reivindican en cualquiera de las reivindicaciones 1 o 2, donde X¹ es CH₂.

35 5. Los compuestos como se reivindican en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, donde en A W es O y Y es -N(R⁵)R⁶; en donde

R⁵ es hidrógeno o C₁-C₃-alquilo;

R⁶ se selecciona de hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₄-alquilo que porta un radical R⁸, en donde R⁸ es como se define más abajo; C₂-C₆-alquenoilo, C₂-C₆-haloalquenoilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo que pueden estar sustituidos con 1 o 2 sustituyentes seleccionados de F, CN y piridilo;

40 -N(R^{101a})R^{101b}, en donde

R^{101a} se selecciona de hidrógeno y C₁-C₆-alquilo; y

R^{101b} se selecciona de hidrógeno, -C(=O)N(R^{14a})R^{14b}, en donde

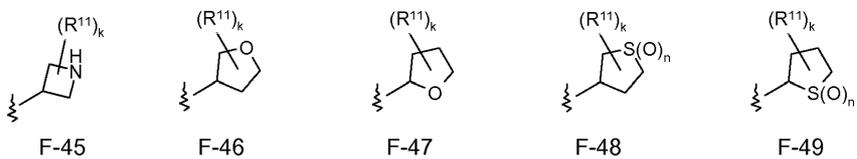
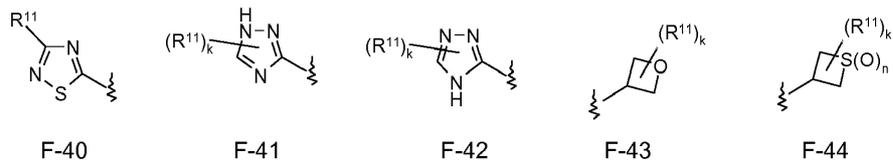
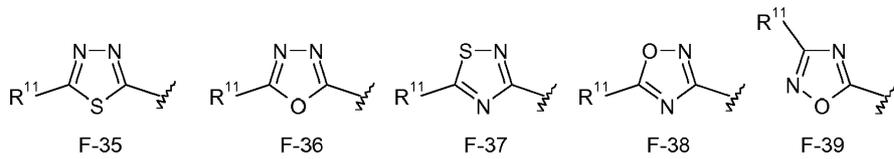
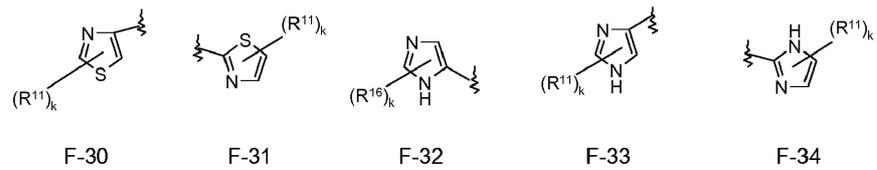
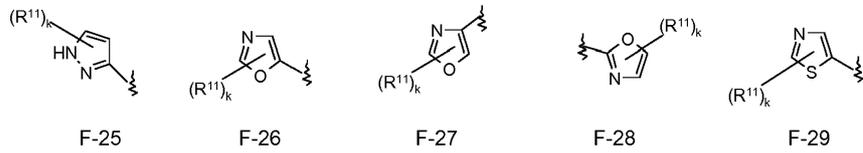
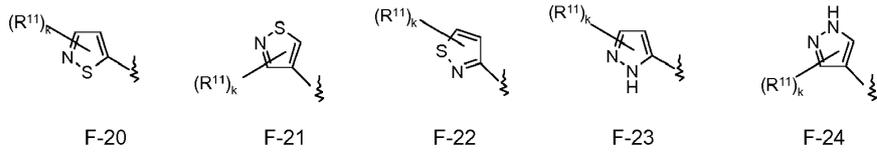
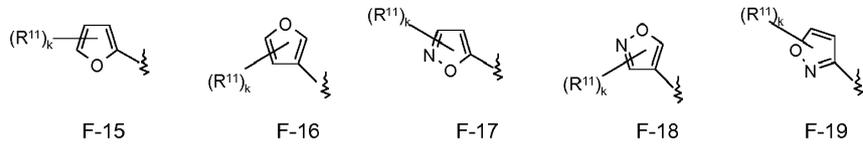
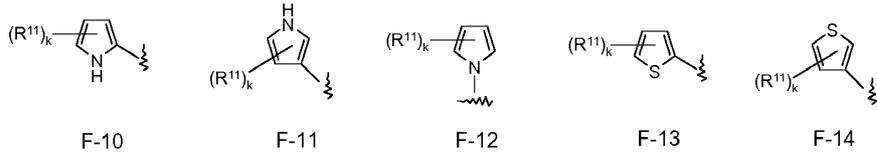
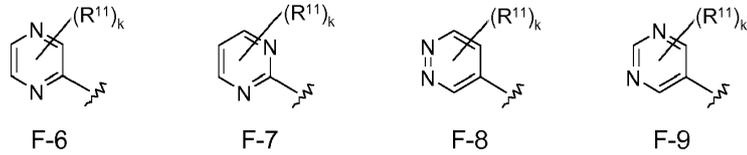
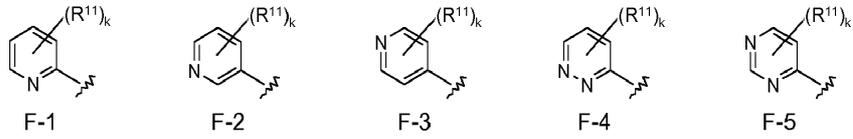
R^{14a} se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno y C₁-C₆-alquilo; y

45 R^{14b} se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₄-alquinilo, CH₂-CN, C₁-C₆-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;

fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R¹⁶, en donde R¹⁶ es como se define más abajo; y un anillo heteroaromático seleccionado de los anillos de fórmulas E-1 a E-42 como se define en la reivindicación 1;

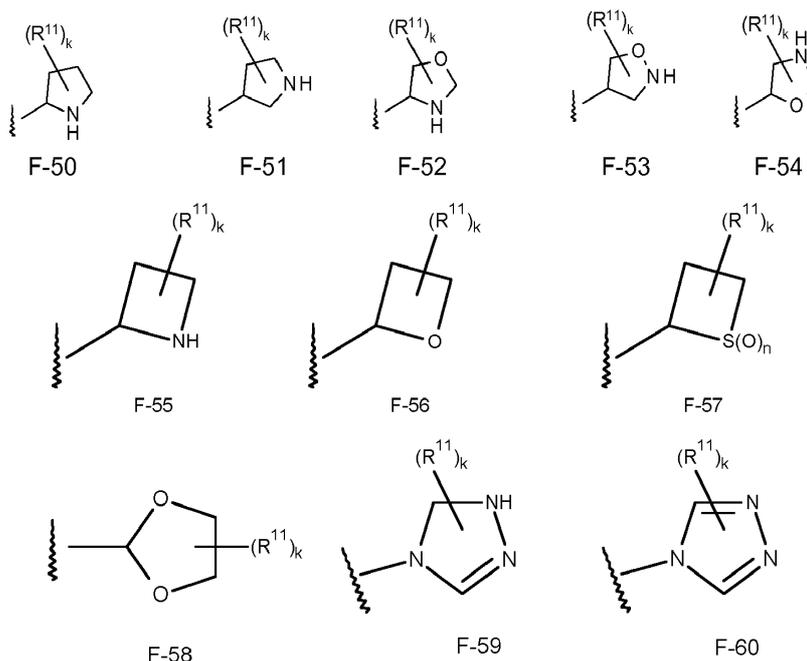
-CH=NOR^{9a}, en donde R^{9a} se selecciona de hidrógeno, C₁-C₆-alquilo y C₁-C₆-haloalquilo;

fenilo que puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R¹¹, en donde R¹¹ es como se define más abajo; y un anillo heteromonocíclico seleccionado de anillos de fórmulas F-1 a F-60



5

10



en donde

5 la línea en zigzag denota el punto de unión al resto de la molécula;

k es 0, 1, 2 o 3,

n es 0, 1 o 2, y

10 cada R¹¹ se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinilo, C₁-C₄-haloalquilsulfinilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alquenilo, C₂-C₄-haloalquenilo, C₂-C₄-alquinilo, C₂-C₄-haloalquinilo, C₁-C₄-alquilcarbonilo, C₁-C₄-haloalquilcarbonilo, aminocarbonilo, C₁-C₄-alquilaminocarbonilo y di-(C₁-C₄-alquil)-aminocarbonilo; o

dos R¹¹ presentes en el mismo átomo de carbono de un anillo heterocíclico saturado o parcialmente insaturado pueden formar juntos =O o =S; o

15 dos R¹¹ presentes en el mismo miembro de anillo S o SO de un anillo heterocíclico pueden formar juntos un grupo =N(C₁-C₆-alquil), =NO(C₁-C₆-alquil), =NN(H)(C₁-C₆-alquil) o =NN(C₁-C₆-alquil)₂;

20 R⁸ se selecciona de OH, CN, C₃-C₈-cicloalquilo que porta opcionalmente un sustituyente CN, CHF₂ o CF₃, C₃-C₈-halocicloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-haloalquiltio, C₁-C₆-alquilsulfinilo, C₁-C₆-haloalquilsulfinilo, C₁-C₆-alquilsulfonilo, C₁-C₆-haloalquilsulfonilo, -C(=O)N(R^{102a})R^{102b}, fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R¹⁶, y un anillo heterocíclico seleccionado de anillos de fórmulas E-1 a E-57 como se define en la reivindicación 1 y adicionalmente de 1,3-dioxolan-2-ilo que puede llevar 1, 2 o 3 sustituyentes R¹⁶ como se define en la reivindicación 1;

en donde

R^{102a} se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno y C₁-C₆-alquilo;

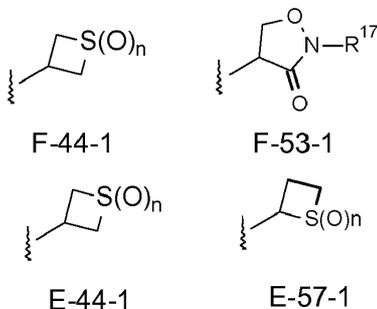
25 R^{102b} se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₂-C₄-alquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, CH₂-CN, C₁-C₆-alcoxi y C₁-C₆-haloalcoxi; y

30 cada R¹⁶ como sustituyente en fenilo o anillos heterocíclicos de fórmulas E-1 a E-57 se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinilo, C₁-C₄-haloalquilsulfinilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alquenilo, C₂-C₄-haloalquenilo, C₂-C₄-alquinilo, C₂-C₄-haloalquinilo, C₁-C₄-alquilcarbonilo, C₁-C₄-haloalquilcarbonilo, aminocarbonilo, C₁-C₄-alquilaminocarbonilo y di-(C₁-C₄-alquil)-aminocarbonilo; o

dos R¹⁶ presentes en el mismo átomo de carbono de un anillo heterocíclico saturado pueden formar juntos =O o =S; o

dos R¹⁶ presentes en el mismo miembro de anillo S o SO de un anillo heterocíclico pueden formar juntos un grupo =N(C₁-C₆-alquil), =NO(C₁-C₆-alquil), =NN(H)(C₁-C₆-alquil) o =NN(C₁-C₆-alquil)₂.

6. Los compuestos como se reivindican en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, donde el anillo heteromonocíclico saturado R⁶ se selecciona de los anillos de fórmulas F-44-1 y F-53-1, y el anillo heterocíclico R⁸ se selecciona de los anillos de fórmulas E-44-1 y E-57-1



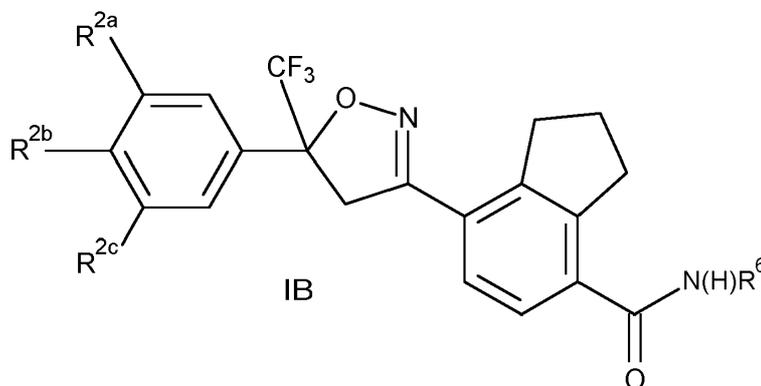
en donde

n es 0, 1 o 2; y

- 10 R¹⁷ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alquenilo, C₂-C₄-haloalquenilo, C₂-C₄-alquinilo, C₂-C₄-haloalquinilo y CH₂-(C₃-C₆-cicloalquil).

7. Los compuestos como se reivindica en cualquiera de las reivindicaciones precedentes, donde B¹ es CR₂, donde R₂ no es hidrógeno, y B² y B³ son CR₂, donde R₂ se selecciona de hidrógeno, F, Cl, Br, OCF³ y CF³; R₄ es hidrógeno; y R_{3a} y R^{3b} son hidrógeno o flúor, en particular hidrógeno.

- 15 8. Los compuestos como se reivindican en cualquiera de las reivindicaciones 1, 2, 3, 5 y 7, de fórmula IB



en donde R^{2a} es Cl, R^{2b} es F, R^{2c} es Cl, y

R⁶ es CH₂-C(O)-N(H)-R^{102b}, en donde

- 20 R^{102b} se selecciona del grupo que consiste en C₁-C₄-alquilo, C₂-C₄-alquilo sustituido con 1 o 2 átomos de flúor, C₂-C₄-alquenilo, C₂-C₄-alquinilo, CH₂-CN, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo y C₃-C₆-cicloalquilmetilo;

y los estereoisómeros y sus sales agrícola o veterinariamente aceptables.

9. Los compuestos como se reivindican en cualquiera de las reivindicaciones 1, 2, 3, 5 y 7, de fórmula IB como se define en la reivindicación 8, en donde R^{2a} es Cl, R^{2b} es F, R^{2c} es Cl, y R⁶ es -CH₂-R⁸, en donde

- 25 R⁸ se selecciona de los anillos E-5, E-6, E-7, E-19, E-25, E-27, E-44-1 y E-57-1 como se define en la reivindicación 1 o 6, donde los anillos E-5, E-6, E-7, E-19 y E-27 están sin sustituir (k es 0) o portan 1 o 2 sustituyentes R¹⁶ (k es 1 o 2), en donde cada R¹⁶ se selecciona independientemente de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₂-alquilo,

C₁-C₂-haloalquilo, C₁-C₂-alcoxi, C₁-C₂-haloalcoxi, C₁-C₂-alquiltio, C₁-C₂-haloalquiltio, C₁-C₂-alquilsulfinilo, C₁-C₂-haloalquilsulfinilo, C₁-C₂-alquilsulfonilo, C₁-C₂-haloalquilsulfonilo, C₃-C₄-cicloalquilo, C₃-C₄-halocicloalquilo, C₂-C₃-alquenilo, C₂-C₃-alquinilo; y

- 30 donde el anillo E-25 lleva un sustituyente R¹⁶ en el átomo de nitrógeno en la posición 1 y opcionalmente porta 1 o 2 sustituyentes R¹⁶ adicionales, donde R¹⁶ es como se define más arriba; donde sin embargo R¹⁶ unido en la posición 1

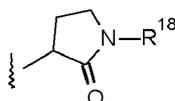
no es halógeno, ciano, nitro, C₁-C₂-alcoxi, C₁-C₂-haloalcoxi, C₁-C₂-alquiltio, C₁-C₂-haloalquiltio, C₁-C₂-alquilsulfinilo, C₁-C₂-haloalquilsulfinilo, C₁-C₂-alquilsulfonilo o C₁-C₂-haloalquilsulfonilo;

y los estereoisómeros y sus sales agrícola o veterinariamente aceptables.

- 5 10. Los compuestos como se reivindican en cualquiera de las reivindicaciones 1, 2, 3, 5 y 7, de fórmula IB como se define en la reivindicación 8, en donde R^{2a} es Cl, R^{2b} es F, R^{2c} es Cl, y R⁶ se selecciona de los anillos F-2, F-4, F-6, F-8, F-9, F-44-1, F-46, F-51 y F-53-1 como se define en la reivindicación 5 o 6, donde los anillos F-2, F-4, F-6, F-8, F-9 y F-46 están sin sustituir (k es 0) o portan 1 o 2 sustituyentes R¹¹ (k es 1 o 2), en donde

- 10 cada R¹¹ se selecciona independientemente de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₂-alquilo, C₁-C₂-haloalquilo, C₁-C₂-alcoxi, C₁-C₂-haloalcoxi, C₁-C₂-alquiltio, C₁-C₂-haloalquiltio, C₁-C₂-alquilsulfinilo, C₁-C₂-haloalquilsulfinilo, C₁-C₂-alquilsulfonilo, C₁-C₂-haloalquilsulfonilo, C₃-C₄-cicloalquilo, C₃-C₄-halocicloalquilo, C₂-C₃-alqueno y C₂-C₃-alquino; y

donde el anillo F-51 es un anillo de fórmula F-51-1



F-51-1

en donde

- 15 R¹⁸ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, C₁-C₂-alquilo, C₁-C₂-haloalquilo, C₃-C₄-cicloalquilo, C₃-C₄-halocicloalquilo, C₂-C₃-alqueno y C₂-C₃-alquino;

y los estereoisómeros y sus sales agrícola o veterinariamente aceptables.

- 20 11. Los compuestos como se reivindican en cualquiera de las reivindicaciones 1, 2, 3, 5 y 7, de fórmula IB como se define en la reivindicación 8, en donde R^{2a} es Cl, R^{2b} es F, R^{2c} es Cl, y R⁶ se selecciona de C₂-C₄-alquilo que puede estar sustituido con 1 o 2 átomos de flúor, ciclopropilo, C₃-C₅-halocicloalquilo, CH₂-(C₃-C₅-halocicloalquil), CH₂-(1-ciano-(C₃-C₅-cicloalquil)), C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-alquino, CH₂-CN y -CH=NOR^{9a}, en donde R^{9a} se selecciona de C₁-C₃-alquilo y C₁-C₃-haloalquilo;

y los estereoisómeros y sus sales agrícola o veterinariamente aceptables.

12. Los compuestos como se reivindican en cualquiera de las reivindicaciones 1, 2, 3, 5 y 7, de fórmula IB como se define en la reivindicación 8, en donde R^{2a} es Cl, R^{2b} es F, R^{2c} es Cl, y R⁶ es N(H)R^{101b}, en donde

- 25 R^{101b} se selecciona de -C(O)-N(H)R^{14b} y los anillos E-1 y E-7 como se define en la reivindicación 1,

donde

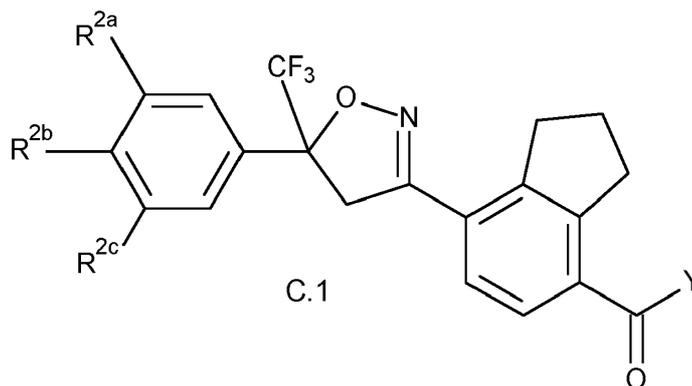
R^{14b} se selecciona de C₁-C₃-alquilo, C₁-C₃-haloalquilo y ciclopropilo; y donde en los anillos E-1 y E-7

k es 0, 1 o 2; y

- 30 cada R¹⁶ se selecciona independientemente de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₂-alquilo, C₁-C₂-haloalquilo, C₁-C₂-alcoxi, C₁-C₂-haloalcoxi, C₁-C₂-alquiltio, C₁-C₂-haloalquiltio, C₁-C₂-alquilsulfinilo, C₁-C₂-haloalquilsulfinilo, C₁-C₂-alquilsulfonilo, C₁-C₂-haloalquilsulfonilo, C₃-C₄-cicloalquilo, C₃-C₄-halocicloalquilo, C₂-C₃-alqueno, C₂-C₃-alquino;

y los estereoisómeros y sus sales agrícola o veterinariamente aceptables.

13. Los compuestos como se reivindican en la reivindicación 1, de fórmula C.1



ES 2 710 217 T3

en donde R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y Y de cada compuesto se define en una fila de la siguiente tabla:

No.	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	-Y
1-1	Cl	F	Cl	-OCH ₃
1-2	Cl	F	Cl	-OH
1-3	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -ciclopropilo
1-4	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ C(=O)NHCH ₂ CF ₃
1-5	Cl	F	Cl	-NH-(1,1-dioxo-tietan-3-il)
1-6	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(2-piridil)
1-7	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(2-pirimidinil)
1-8	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(tietan-3-il)
1-9	Cl	F	Cl	-NH-(tietan-3-il)
1-10	Cl	F	Cl	-NH-(1-oxo-tietan-3-il)
1-11	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ CH=CH ₂
1-12	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ CF ₃
1-13	Cl	F	Cl	-NH-(1-ciano-ciclopropil)
1-14	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ C≡CH
1-15	Cl	F	Cl	-NH ₂
1-16	Cl	F	Cl	-NHNH-(2-pirimidinil)
1-17	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ CN
1-18	Cl	F	Cl	-NH-CH ₂ -(1,1-dioxo-tietan-3-il)
1-19	Cl	F	Cl	-NH-(2,2-dimetil-1,1-dioxo-tietan-3-il)
1-20	Cl	F	Cl	-NH-(2,2-dimetiltietan-3-il)
1-21	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(1,1-dioxotietan-2-il)
1-22	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -CH=CH-CH ₃ (trans)
1-23	Cl	F	Cl	-NHCH=NOCH ₃
1-24	Cl	H	Cl	-NH ₂
1-25	Cl	H	Cl	-NHNH-(2-pirimidinil)
1-26	Cl	H	Cl	-NHCH=NOCH ₃

ES 2 710 217 T3

No.	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	-Y
1-27	Cl	H	Cl	-NHCH ₂ -(2-piridil)
1-28	Cl	H	Cl	-NHCH ₂ C(=O)NHCH ₂ CF ₃
1-29	Cl	H	Cl	-NHCH ₂ CF ₃
1-30	Cl	H	Cl	-NHCH ₂ -(2-pirimidinil)
1-31	Cl	H	Cl	-NH-ciclopropilo
1-32	Cl	H	Cl	-NHCH ₂ -(tiazol-4-il)
1-33	Cl	H	Cl	-NH-(1,1-dioxo-tietan-3-il)
1-34	Cl	H	Cl	-NH-(tietan-3-il)
1-35	Cl	H	Cl	-NHCH ₂ -ciclopropilo
1-36	Cl	H	Cl	-NHCH ₂ -(1,1-dioxo-tietan-3-il)
1-37	Cl	H	Cl	-NH-CH(CH ₃)-C(=O)NHCH ₂ CF ₃
1-38	Cl	H	Cl	-NH-[(4R)-2-etil-3-oxo-isoxazolidin-4-il]
1-39	Cl	H	Cl	-NH-[(4R)-3-oxo-2-(2,2,2-trifluoroetil)isoxazolidin-4-il]
1-40	Cl	H	Cl	-N(CH ₃)-CH ₂ -(2-piridil)
1-41	Cl	H	Cl	-N(CH ₂ CH ₃)-CH ₂ -(2-piridil)
1-42	Cl	H	Cl	-NH-(1-oxo-tietan-3-il)
1-43	Cl	H	Cl	-N H-[(4S)-2-etil-3-oxo-isoxazolid en-4-il]
1-44	Cl	F	Cl	-NH-CH ₂ CH ₃
1-45	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ C(=O)NHCH ₂ CH ₃
1-46	Cl	F	Cl	-NH-ciclopropilo
1-47	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ C(=O)NH-ciclopropilo
1-48	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ C(=O)NHCH ₂ CH ₂ F
1-49	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ C(=O)NHCH ₂ CHF ₂
1-50	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(2,2-difluorociclopropil)
1-51	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ C(=O)NHCH ₂ C≡CH
1-52	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ C(=O)-NHCH ₂ CH=CH ₂
1-53	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ C(=O)-NHCH ₃

ES 2 710 217 T3

No.	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	-Y
1-54	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(4-tiazolil)
1-55	Cl	F	Cl	-N H-(3-tetrahidrofuranil)
1-56	Cl	H	Cl	-OH
1-57	Cl	H	Cl	-NHCH ₂ -(tietan-3-il)
1-58	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -ciclobutilo
1-59	Cl	F	Cl	-NH-(3,3-difluorociclobutil)
1-60	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(3,3-difluorociclobutil)
1-61	Cl	F	Cl	-NH-[(4 <i>R</i>)-3-oxo-2-(2,2,2-trifluoroetil)isoxazolidin-4-il]
1-62	Cl	F	Cl	-NH-[(4 <i>S</i>)-2-etil-3-oxo-isoxazolidin-4-il]
1-63	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(3-piridazinil)
1-64	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(5-bromopirimidin-2-il)
1-65	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -[(1-difluorometil)ciclopropil]
1-66	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ C(=O)-NHCH ₂ -ciclopropilo
1-67	Cl	F	Cl	-NH-ciclobutilo
1-68	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -[4,6-bis(trifluorometil)pirimidin-2-il]
1-69	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(2,2-diclorociclopropil)
1-70	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ CCl=CCl ₂
1-71	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -[4-(trifluorometil)pirimidin-2-il]
1-72	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(5-cloropirimidin-2-il)
1-73	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(4-metil-pirimidin-2-il)
1-74	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(4,6-dimetil-pirimidin-2-il)
1-75	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -[4-metil-6-(trifluorometil)pirimidin-2-ilo]
1-76	Cl	F	H	-NHCH ₂ -(2-pirimidinil)
1-77	Cl	F	H	-NHCH ₂ -(2-piridil)
1-78	Cl	F	H	-NHCH ₂ C(=O)NHCH ₂ CF ₃
1-79	Cl	F	H	-NH-(1,1-dioxo-tietan-3-il)
1-80	Cl	F	Cl	-H

ES 2 710 217 T3

No.	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	-Y
1-81	Cl	F	H	-OH
1-82	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(2-metil-tetrazol-5-il)
1-83	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(5-fluoro-pirimidin-2-il)
1-84	Cl	F	Cl	-NH-(3-piridil)
1-85	Cl	F	Cl	-NHNHC(=O)NHCH ₂ CF ₃
1-86	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(1,2,4-oxadiazol-3-il)
1-87	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(1,3,4-tiadiazol-2-il)
1-88	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(4-cloro-pirimidin-2-il)
1-89	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(5-metil-pirimidin-2-il)
1-90	Cl	F	Cl	-NH-[(4 <i>R</i>)-2-etil-3-oxo-isoxazolidin-4-il]
1-91	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃
1-92	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(1-metil-1,2,3-triazol-4-il)
1-93	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(1-metil-1,2,4-triazol-3-il)
1-94	Cl	F	Cl	3-etil-4-oxo-imidazolidin-1-ilo
1-95	Cl	F	Cl	4-oxo-3-(2,2,2-trifluoroetil)imidazolidin-1-ilo
1-96	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(1-metil-tetrazol-5-il)
1-97	Cl	F	Cl	-NHNHC(=O)NHCH ₂ CF ₂ H
1-98	Cl	F	Cl	-NHNHC(=O)NHCH ₂ CH ₃
1-99	Cl	F	Cl	-NH-(5-pirimidinil)
1-100	Cl	F	Cl	-NHNHC(=O)NHCH ₃
1-101	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(oxazol-2-il)
1-102	Cl	F	Cl	-NHN(CH ₃)-(2-pirimidinil)
1-103	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ CH ₂ SCH ₃
1-104	Cl	F	Cl	-NH-[2-oxo-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirrolidin-3-il]
1-105	Cl	F	Cl	-NH-(2-pirazinil)
1-106	Cl	F	Cl	-NH-(1-metil-pirazol-3-il)
1-107	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(1-(trifluorometil)ciclopropil)

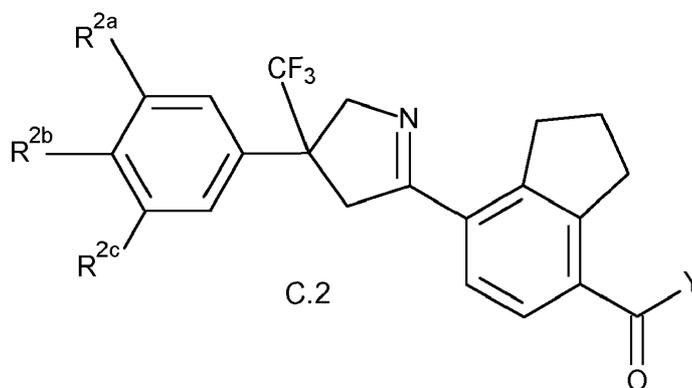
ES 2 710 217 T3

No.	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	-Y
1-108	Cl	F	Cl	-N H-(3-metil-isotiazol-5-il)
1-109	Cl	F	Cl	-NHNH-(2-piridil)
1-110	Cl	F	Cl	-NH-(3-piridazinil)
1-111	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(1,3-dioxolan-2-il)
1-112	Cl	F	Cl	-NH-(1-metil-2-oxo-pirrolidin-3-il)
1-113	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(4-pirimidinil)
1-114	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(1-metil-pirazol-3-il)
1-115	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ CH ₂ CF ₂ H
1-116	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ CH ₂ -(1,3-dioxolan-2-il)
1-117	Cl	F	Cl	-NH-(1-etil-2-oxo-pirrolidin-3-il)
1-118	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(4-oxazolil)
1-119	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(4-metil-1,2,4-triazol-3-il)
1-120	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(3-isoxazolil)
1-121	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(2-metil-pirazol-3-il)
1-122	Cl	F	Cl	-NH-(1-metil-5-oxo-1,2,4-triazol-4-il)
1-123	F	H	OCF ₃	-NHCH ₂ -(2-pirimidinil)
1-124	F	H	OCF ₃	-NHCH ₂ -(2-piridil)
1-125	Cl	F	Cl	-NH-[(4 <i>R</i>)-2-metil-3-oxo-isoxazolidin-4-il]
1-126	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -ciclopentilo
1-127	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(2-tetrahidrofuranil)
1-128	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ CF ₂ H
1-129	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ CFH ₂
1-130	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(1-ciano-ciclopropil)
1-131	Cl	F	Cl	-NH-(2,2-difluorociclopropil)
1-132	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(1-oxo-tietan-3-il)
1-133	Cl	F	Cl	-NH-(4-piridazinil)
1-134	F	H	OCF ₃	-NH-(1,1-dioxo-tietan-3-il)

ES 2 710 217 T3

No.	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	-Y
1-135	F	H	OCF ₃	-NHCH ₂ C(=O)NHCH ₂ CF ₃
1-136	Cl	F	Cl	-N=S(CH ₂ CH ₃) ₂
1-137	Cl	F	Cl	-NH-(1-ciano-ciclobutilol)
1-138	F	H	OCF ₃	-NH-[(4 <i>R</i>)-2-etil-3-oxo-isoxazolidin-4-il]

o de fórmula C.2

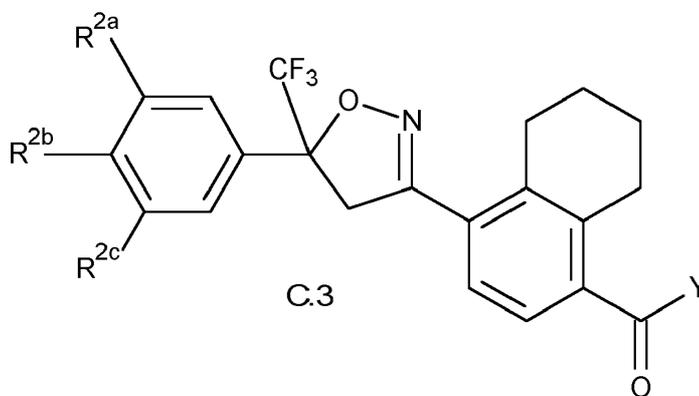


en donde R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y Y de cada compuesto se define en una fila de la siguiente tabla:

No.	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	-Y
2-1	Cl	F	Cl	-OH
2-2	Cl	F	Cl	-OCH ₃
2-3	Cl	F	Cl	-NH-(1,1-dioxo-tietan-3-il)
2-4	Cl	F	Cl	-NH-(tietan-3-il)
2-5	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(tietan-3-il)
2-6	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -ciclopropilo
2-7	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ C(=O)NHCH ₂ CF ₃
2-8	Cl	F	Cl	-NH-(1-oxo-tietan-3-il)
2-9	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(2-piridil)
2-10	Cl	F	Cl	-NHCH ₂ -(2-pirimidinil)
2-11	Cl	F	Cl	-NH-CH ₂ -(1,1-dioxo-tietan-3-il)
2-12	Cl	H	Cl	-NHNH-(2-pirimidinil)
2-13	Cl	H	Cl	-NHCH ₂ -(2-piridil)

No.	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	-Y
2-14	Cl	H	Cl	-NHCH ₂ C(=O)NHCH ₂ CF ₃
2-15	Cl	H	Cl	-OH
2-16	Cl	H	Cl	-OCH ₃
2-17	Cl	H	Cl	-NHCH ₂ -(2-pirimidinil)
2-18	Cl	H	Cl	-NH-ciclopropilo
2-19	Cl	H	Cl	-NH-(1,1-dioxo-tietan-3-il)
2-20	Cl	H	Cl	-NHCH ₂ -(4-tiazol)
2-21	Cl	H	Cl	-NH-[(4 <i>R</i>)-2-etil-3-oxo-isoxazolidin-4-il]
2-22	Cl	H	Cl	-NHCH(CH ₃)-C(=O)NHCH ₂ CF ₃
2-23	Cl	H	Cl	-NH-(tietan-3-il)
2-24	Cl	H	Cl	-NH-(1-oxo-tietan-3-il)

o de fórmula C.3

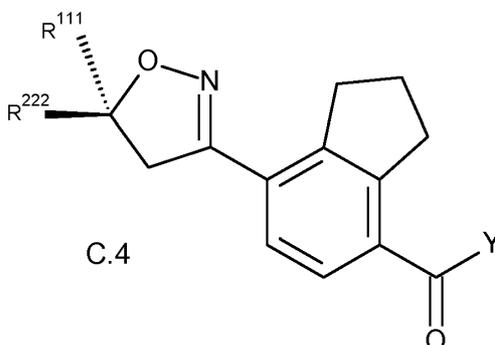


en donde R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y Y de cada compuesto se define en una fila de la siguiente tabla:

No.	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	-Y
3-1	Cl	H	Cl	-OCH ₃
3-2	Cl	H	Cl	-OH
3-3	Cl	H	Cl	-NH-(1,1-dioxo-tietan-3-il)
3-4	Cl	H	Cl	-NHCH ₂ C(=O)NHCH ₂ CF ₃
3-5	Cl	H	Cl	-NHCH ₂ CF ₃
3-6	Cl	H	Cl	-NH-ciclopropilo

No.	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	-Y
3-7	Cl	H	Cl	-NH-(tietan-3-il)
3-8	Cl	H	Cl	-NHCH(CH ₃)-C(=O)NHCH ₂ CF ₃
3-9	Cl	H	Cl	-NH-[(4 <i>R</i>)-2-etil-3-oxo-isoxazolidin-4-il]
3-10	Cl	H	Cl	-NHCH ₂ -(tiazol-4-il)
3-11	Cl	H	Cl	-NHCH ₂ -(2-pirimidinil)
3-12	Cl	H	Cl	-NHCH ₂ -(2-piridil)
3-13	Cl	H	Cl	-NH-(1-oxo-tietan-3-il)

o de fórmula C.4

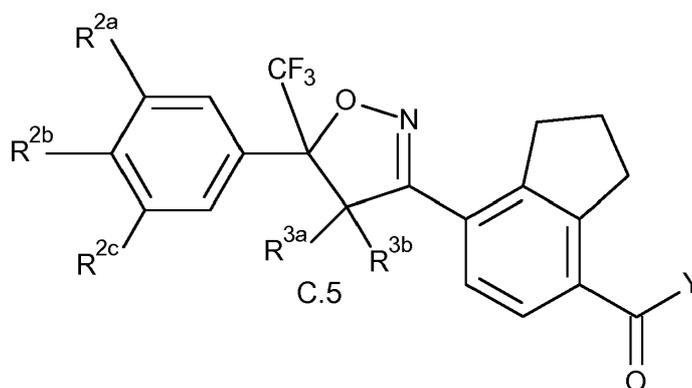


en donde R¹¹¹, R²²² y Y de cada compuesto se define en una fila de la siguiente tabla:

No.	R ¹¹¹	R ²²²	-Y
4-1	3,5-Dicloro-4-fluorofenilo	CF ₃	-NHCH ₂ -(2-pirimidinil)
4-2	CF ₃	3,5-Dicloro-4-fluorofenilo	-NHCH ₂ -(2-pirimidinil)

5

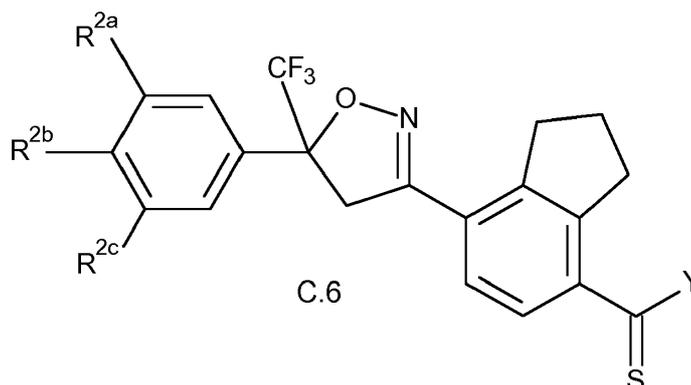
o de fórmula C.5



en donde R^{2a}, R^{2b}, R^{2c}, R^{3a}, R^{3b} y Y de cada compuesto se define en una fila de la siguiente tabla:

No.	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{3a}	R ^{3b}	-Y
5-1	Cl	F	Cl	F	H	-OCH ₃
5-2	Cl	F	Cl	F	H	-NHCH ₂ -(2-piridil)

o de fórmula C.6:



en donde R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y Y de cada compuesto se define en una fila de la siguiente tabla:

No.	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	-Y
6-1	Cl	H	Cl	-NHCH ₂ -(2-piridil)

5

14. Una composición agrícola o veterinaria que comprende al menos un compuesto de la fórmula I, como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13, un estereoisómero del mismo y/o al menos una sal del mismo agrícola o veterinariamente aceptable, y al menos un líquido inerte y/o portador sólido agrícola o veterinariamente aceptable.

10 15. El uso no terapéutico de un compuesto como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13, de un estereoisómero y/o de una sal del mismo agrícola o veterinariamente aceptable para combatir plagas de invertebrados.

16. El compuesto como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13, un estereoisómero y/o una sal veterinariamente aceptable del mismo, para uso en el tratamiento o protección de un animal contra la infestación o infección por plagas de invertebrados.

15 17. Un método para proteger el material de propagación de las plantas y/o las plantas que crecen a partir del mismo de un ataque o infestación por plagas de invertebrados, método que comprende tratar el material de propagación de las plantas con una cantidad efectiva como pesticida de al menos un compuesto de la fórmula I como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13, un estereoisómero del mismo y/o al menos una sal agrícolamente aceptable del mismo.