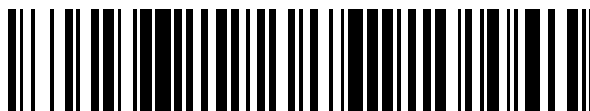


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 731 078**

51 Int. Cl.:

C07D 471/04 (2006.01)

C07D 519/00 (2006.01)

A01N 43/90 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **07.03.2016 PCT/EP2016/054757**

87 Fecha y número de publicación internacional: **15.09.2016 WO16142326**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **07.03.2016 E 16710116 (1)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **06.02.2019 EP 3268365**

54 Título: **Derivados tetracíclicos activos como plaguicidas con sustituyentes que contienen azufre**

30 Prioridad:

12.03.2015 EP 15158762

31.07.2015 EP 15179249

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

13.11.2019

73 Titular/es:

**SYNGENTA PARTICIPATIONS AG (100.0%)
Rosentalstrasse 67
4058 Basel, CH**

72 Inventor/es:

**JUNG, PIERRE JOSEPH MARCEL;
HUETER, OTTMAR FRANZ;
EDMUNDS, ANDREW;
MUEHLEBACH, MICHEL;
HALL, ROGER GRAHAM y
CASSAYRE, JÉRÔME YVES**

74 Agente/Representante:

LEHMANN NOVO, María Isabel

ES 2 731 078 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

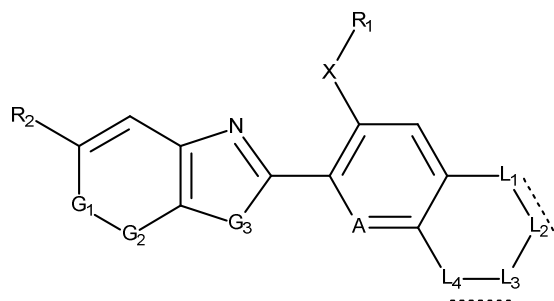
Derivados tetracíclicos activos como plaguicidas con sustituyentes que contienen azufre

5 La presente invención se refiere a derivados tetracíclicos activos como plaguicidas, en particular a derivados tetracíclicos activos como plaguicidas que contienen sustituyentes de azufre, a composiciones que comprenden esos compuestos y a su uso para controlar plagas de animales (incluyendo artrópodos y, en particular, insectos o representantes del orden *Acarina*).

10 Compuestos heterocíclicos con acción plaguicida son conocidos y se describen, por ejemplo, en los documentos WO 2012/086848 y WO 2013/018928.

15 Se han encontrado ahora nuevos derivados tetracíclicos activos como plaguicidas con un resto bicíclico que contiene azufre.

La presente invención se refiere, por consiguiente, a compuestos de fórmula I,



(I),

20 en donde

A es CH o N;

25 X es S, SO o SO₂

R₁ es alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄; o es cicloalquilo C₃-C₆ mono- o poli-sustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano, haloalquilo C₁-C₄ y alquilo C₁-C₄; o es cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ mono- o poli-sustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano, haloalquilo C₁-C₄ y alquilo C₁-C₄;

R₂ es hidrógeno, halógeno, haloalquil C₁-C₄sulfanilo, haloalquil C₁-C₄sulfinilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo,

35 O(haloalquilo C₁-C₄),-SF₅, -C(O)haloalquilo C₁-C₄, ciano, haloalquilo C₁-C₆ o es haloalquilo C₁-C₆ sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en hidroxilo, metoxi y ciano; o es cicloalquilo C₃-C₆, que puede estar mono- o poli-sustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano, haloalquilo C₁-C₄ y alquilo C₁-C₄;

40 G₁ es NR₄ y G₂ es C(Y); o

G₁ es C(Y) y G₂ es NR₅;

Y es O o S;

45 G₃ es NR₆;

R₆ es alquilo C₁-C₄, que puede estar mono- o poli-sustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno y alquil C₁-C₂sulfinilo;

50 R₄ es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, o son cicloalquilo C₃-C₆, que puede estar mono- o poli-sustituido con R₇; o son cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, que puede estar mono- o poli-sustituido con R₇; o

R₄ es alquilo C₁-C₄ sustituido con ciano, alquil C₁-C₄sulfanilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfinilo,

- alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ o con fenilo que, por sí mismo, puede estar mono- o poli-sustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y alcoxi C₁-C₄; o
- 5 R₄ es alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₆sulfanilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₆sulfonilo, haloalquil C₁-C₆sulfanilo, haloalquil C₁-C₆sulfonilo, amina o hidroxilo; o
- 10 R₄ es alqueno C₂-C₆ sustituido con R₁₁ o alquino C₂-C₆ sustituido con R₁₁; o
- R₄ es un sistema de anillo de cinco a seis miembros, aromático, parcialmente saturado o totalmente saturado, dicho sistema de anillo puede estar mono- o poli-sustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄sulfanilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfonilo y -C(O)alquilo C₁-C₄, haloalquil C₁-C₄sulfanilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo y
- 15 -C(O)haloalquilo C₁-C₄; y dicho sistema de anillo puede contener 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre, en que dicho sistema de anillo puede no contener más de un átomo de oxígeno y no más de un átomo de azufre;
- 20 R₅ es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, o son cicloalquilo C₃-C₆, que puede estar mono- o poli-sustituido con R₇; o son cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, que puede estar mono- o poli-sustituido con R₇; o
- 25 R₅ es alquilo C₁-C₄ sustituido con ciano, alquil C₁-C₄sulfanilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfonilo,
- alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ o con fenilo que, por sí mismo, puede estar mono- o poli-sustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y alcoxi C₁-C₄; o
- 30 R₅ es alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₆sulfanilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₆sulfonilo, haloalquil C₁-C₆sulfanilo, haloalquil C₁-C₆sulfonilo, amina o hidroxilo; o
- 35 R₅ es alqueno C₂-C₆ sustituido con R₁₁ o alquino C₂-C₆ sustituido con R₁₁; o
- R₅ es un sistema de anillo de cinco a seis miembros, aromático, parcialmente saturado o totalmente saturado, dicho sistema de anillo puede estar mono- o poli-sustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄sulfanilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfonilo y -C(O)alquilo C₁-C₄, haloalquil C₁-C₄sulfanilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo y -C(O)haloalquilo C₁-C₄; y dicho sistema de anillo puede contener 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre, en que dicho sistema de anillo puede no contener más de un átomo de oxígeno y no más de un átomo de azufre;
- 40 R₇ es ciano, halógeno, alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₄;
- 45 L₁, L₂, L₃ y L₄ forman, junto con el átomo de carbono al que L₁ y L₄ están unidos, un sistema de anillo aromático parcialmente saturado o totalmente saturado; en donde
- 50 L₁ es nitrógeno, S(O)_n, oxígeno, N-R_{10a} o C(R_{10a})_m;
- L₂ es nitrógeno, S(O)_n, oxígeno, N-R_{10b} o C(R_{10b})_m;
- 55 L₃ es nitrógeno, S(O)_n, oxígeno, N-R_{10c} o C(R_{10c})_m;
- L₄ es nitrógeno, S(O)_n, oxígeno, un enlace directo, N-R_{10d} o C(R_{10d})_m; con las condiciones de que no más de 2 sustituyentes seleccionados de L₁, L₂, L₃ y L₄ pueden ser oxígeno o azufre; y si dos grupos L son oxígeno, no son adyacentes entre sí y no más de tres grupos L pueden ser nitrógeno;
- 60 n es 0, 1 o 2;
- m es 1 o 2;
- 65 R_{10a}, R_{10b}, R_{10c} y R_{10d}, independientemente uno de otro, son hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, hidroxilo, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalqueno C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆,

- halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆tio, alquil C₁-C₆sulfinilo, alquil C₁-C₆sulfonilo, haloalquil C₁-C₆tio, haloalquil C₁-C₆sulfinilo, haloalquil C₁-C₆sulfonilo, alquil C₂-C₆carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, haloalquil C₂-C₆ carbonilo, haloalcoxi C₂-C₆carbonilo, (alquil C₁-C₆)NH, (alquil C₁-C₆)₂N, (cicloalquil C₁-C₆)NH, (cicloalquil C₁-C₆)₂N,
- 5 alquil C₁-C₆carbonilamino, cicloalquil C₁-C₆carbonilamino o -SF₅; adicionalmente uno de R_{10a}, R_{10b}, R_{10c} y R_{10d} pueden ser oxo; o
- 10 R_{10a}, R_{10b}, R_{10c}, y R_{10d}, independientemente uno de otro, son cicloalquilo C₃-C₆mono- a poli-sustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, haloalquilo C₁-C₄, alquilo C₁-C₄ y ciano; o
- R_{10a}, R_{10b}, R_{10c}, y R_{10d}, independientemente uno de otro, son fenilo que puede estar mono- a poli-sustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, haloalquilo C₁-C₄, alquilo C₁-C₄ y ciano; y
- 15 R₁₁ es nitro, fenilo, ciano, alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄sulfanilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfinilo, haloalquil C₁-C₄sulfanilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo o haloalquil C₁-C₄sulfinilo;
- y sales, estereoisómeros, enantiómeros, tautómeros y N-óxidos agroquímicamente aceptables de esos compuestos.
- 20 Compuestos de fórmula I que tienen al menos un centro básico pueden formar, por ejemplo, sales por adición de ácidos, por ejemplo con ácidos inorgánicos fuertes tales como ácidos minerales, por ejemplo ácido perclórico, ácido sulfúrico, ácido nítrico, un ácido fosforoso o un ácido hidrohálico, con ácidos carboxílicos orgánicos fuertes, tales como ácidos alcano C₁-C₄carboxílicos que están no sustituidos o están sustituidos, por ejemplo, con halógeno, por ejemplo ácido acético, tales como ácidos dicarboxílicos saturados o insaturados, por ejemplo ácido oxálico, ácido malónico, ácido succínico, ácido maleico, ácido fumárico o ácido ftálico, tales como ácidos hidroxicarboxílicos, por ejemplo, ácido ascórbico, ácido láctico, ácido málico, ácido tartárico o ácido cítrico, o tales como ácido benzoico, o con ácidos sulfónicos orgánicos, tales como ácidos alcano C₁-C₄-o aril-sulfónicos que están no sustituidos o están sustituidos, por ejemplo, con halógeno, por ejemplo ácido metano- o p-tolueno-sulfónico. Compuestos de fórmula I que tienen al menos un grupo ácido pueden formar, por ejemplo, sales con bases, por ejemplo, sales minerales tales como sales con un metal alcalino o un metal alcalinotérreo, por ejemplo, sales de sodio, potasio o magnesio o sales con amoniaco o una amina orgánica, tal como morfolina, piperidina, pirrolidina, una mono-, di- o tri-alquilamina inferior, por ejemplo, etil-, dietil-, trietil- o dimetil-propilamina, o una mono-, di- o tri-hidroalquilamina inferior, por ejemplo, mono-, di- o tri-etanolamina.
- 30 m es 1 o 2 dependiendo de la hibridación del átomo de carbono.
- 35 Si m es 2 en la definición C(R_{10a})_m, los R_{10a} pueden ser los mismos o diferentes, por ejemplo, un R_{10a} puede ser hidrógeno y el otro metilo- Esto es también válido para las definiciones de C(R_{10b})_m, C(R_{10c})_m y C(R_{10d})_m.
- 40 Los grupos alquilo que aparecen en las definiciones de los sustituyentes pueden ser de cadena lineal o ramificada y son, por ejemplo, pero no están limitados a metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec.-butilo, iso-butilo, terc.-butilo, pentilo, hexilo, nonilo, decilo y sus isómeros ramificados. Los radicales alquilsulfanilo, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alcoxi, alquenilo y alquinilo se derivan de los radicales alquilo mencionados. Los grupos alquenilo y alquinilo pueden ser mono- o poli-insaturados.
- 45 Halógeno es, en general, flúor, cloro, bromo o yodo. Esto también se aplica, correspondientemente, a halógeno en combinación con otros significados, tales como haloalquilo o halofenilo.
- 50 Los grupos haloalquilo tienen preferiblemente una longitud de cadena de 1 a 6 átomos de carbono. Haloalquilo es, por ejemplo, pero no se limita a fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorometilo, diclorometilo, triclorometilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2-cloroetilo, pentafluoroetilo, 1-1-difluoro-2,2,2-tricloroetilo, 2,2,3,3-tetrafluoroetilo y 2,2,2-tricloroetilo.
- 55 Alcoxi es, por ejemplo, pero no se limita a metoxi, etoxi, propoxi, i-propoxi, n-butoxi, isobutoxi, sec.-butoxi y terc.-butoxi y también los radicales isoméricos pentiloxi y hexiloxi.
- Los grupos alcoxialquilo tienen preferiblemente una longitud de cadena de 1 a 6 átomos de carbono.
- 60 Alcoxialquilo es, por ejemplo, pero no se limita a metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, n-propoximetilo, n-propoxietilo, isopropoximetilo o isopropoxietilo.
- Alcoxicarbonilo es, por ejemplo, pero no se limita a metoxicarbonilo (que es alcoxi C₁carbonilo), etoxicarbonilo, propoxicarbonilo, isopropoxicarbonilo, n-butoxicarbonilo, terc.-butoxicarbonilo, n-pentoxicarbonilo o hexoxicarbonilo.
- 65 Los grupos cicloalquilo tienen preferiblemente de 3 a 6 átomos de carbono en el anillo, por ejemplo, pero no se limitan a ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo.

Tal como se utiliza en esta memoria, el término "alquinilo C₂-C₆" se refiere a un grupo radical de cadena de hidrocarburo lineal o ramificada que consiste únicamente en átomos de carbono e hidrógeno, que contiene al menos un triple enlace, que tiene de dos a seis átomos de carbono, y que está unido al resto de la molécula por un único enlace. Los términos alquinilo "C₂C₄" y "alquinilo C₂C₃" se pueden formar en consecuencia. Ejemplos de alquinilo C₂-C₆ incluyen, pero no se limitan a etinilo, prop-1-inilo, but-1-inilo, but-2-inilo.

Tal como se utiliza en esta memoria, el término "alquenilo C₂-C₆" se refiere a un grupo radical de cadena de hidrocarburo lineal o ramificada que consiste únicamente en átomos de carbono e hidrógeno, que contiene al menos un doble enlace, que tiene de dos a seis átomos de carbono, y que está unido al resto de la molécula por un único enlace. Los términos

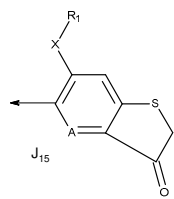
"alquenilo C₂C₄" y "alquinilo C₂C₃" se pueden formar en consecuencia. Ejemplos de alquenilo C₂-C₆ incluyen, pero no se limitan a prop-1-enilo, but-1-enilo, but-2-enilo.

En el contexto de esta invención, "L₁, L₂, L₃ y L₄" forman, junto con los dos átomos de carbono a los que están unidos L₁ y L₄ o a los que están unidos L₁ y L₃, cuando L₄ es un enlace, un sistema de anillo aromático, parcialmente saturado o totalmente saturado", el sistema de anillo es preferiblemente un grupo que tiene de 5 a 6 átomos de carbono del anillo que están saturados, insaturados o parcialmente saturados, por ejemplo, pero no se limitan a fenilo, ciclopentilo y ciclohexenilo o, si el sistema de anillo es un sistema de anillo heterocíclico, este sistema de anillo es preferiblemente un grupo que comprende de 5 a 6 átomos de carbono en el anillo, que están saturados, insaturados o parcialmente saturados, por ejemplo, pero no se limitan a pirrolilo; pirazolilo; isoxazolilo; furanilo; tienilo; imidazolilo; oxazolilo;

tiazolilo; isotiazolilo; triazolilo; oxadiazolilo; tiadiazolilo; tetrazolilo; furilo, piridilo; pirimidilo; pirazinilo; piridazinilo; triazinilo, piranilo; pirrolidinilo, piperidinilo; pirrolidinil-2-ona; piperidinil-2-ona.

En el contexto de esta invención, "mono- a poli-sustituido" en la definición de los sustituyentes, significa típicamente, dependiendo de la estructura química de los sustituyentes, monosustituido a siete veces sustituido, preferiblemente monosustituido a cinco veces sustituido, más preferiblemente mono-, di- o tri-sustituido.

Un ejemplo de un sistema de anillo carbocíclico o heterocíclico, parcialmente saturado o totalmente saturado, en el que uno de R_{10a}, R_{10b}, R_{10c} o R_{10d} puede representar oxo, es el grupo J₁₅:



, en donde X, R₁ y A son como se definen bajo la fórmula I anterior.

Los compuestos de fórmula I de acuerdo con la invención también incluyen hidratos que pueden formarse durante la formación de sales.

En compuestos preferidos de fórmula I,

R₂ es hidrógeno, halógeno, haloalquil C₁-C₄sulfanilo, haloalquil C₁-C₄sulfinilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, O(haloalquilo C₁-C₄), -SF₅, -C(O)haloalquilo C₁-C₄, ciano, haloalquilo C₁-C₆ o es haloalquilo C₁-C₆ sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en hidroxilo, metoxi y ciano; o es cicloalquilo C₃-C₆, que puede estar mono- o poli-sustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano y alquilo C₁-C₄;

R₄ y R₅ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, o son cicloalquilo C₃-C₆, que puede estar mono- o poli-sustituido con R₇; o son cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, que puede estar mono- o poli-sustituido con R₇; o

R₄ y R₅ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₄ sustituido con ciano o con fenilo que, por sí mismo, puede estar mono- o poli-sustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y alcoxi C₁-C₄;

R₄ y R₅ son, independientemente uno de otro, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆sulfanilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₆sulfinilo, haloalquil C₁-C₆sulfanilo, haloalquil C₁-C₆sulfonilo, haloalquil C₁-C₆sulfinilo, amina o hidroxilo;

R₇ es ciano, halógeno o haloalquilo C₁-C₂;

L₁, L₂, L₃ y L₄ forman, junto con los dos átomos de carbono al que L₁ y L₄ están unidos, un sistema de anillo aromático parcialmente saturado o totalmente saturado; en donde

5 L₁ es nitrógeno, azufre, oxígeno, N-R_{10a} o CR_{10a};

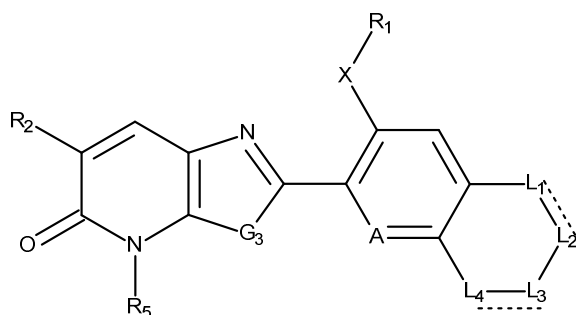
L₂ es nitrógeno, azufre, oxígeno, N-R_{10b} o CR_{10b};

10 L₃ es nitrógeno, azufre, oxígeno, N-R_{10c} o CR_{10c};

L₄ es nitrógeno, azufre, oxígeno, un enlace directo, C-R_{10d}; con las condiciones de que no más de 2 sustituyentes seleccionados de L₁, L₂, L₃ y L₄ pueden ser oxígeno o azufre; y si dos grupos L son oxígeno, no son adyacentes entre sí; y

15 R_{10a}, R_{10b}, R_{10c} y R_{10d}, independientemente uno de otro, son hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, hidroxilo, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, haloalquil C₁-C₄tio, haloalquil C₁-C₄sulfinilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo o -SF₅; adicionalmente uno de R_{10a}, R_{10b}, R_{10c} y R_{10d} pueden ser oxo.

Un grupo preferido de compuestos de fórmula I está representado por los compuestos de fórmula I-1



(I-1),

25 en donde los sustituyentes X, A, R₁, R₂, R₅, G₃, L₁, L₂, L₃ y L₄ son como se definen bajo la fórmula I anterior e Y es O.

Realización (A1):

30 Se prefieren compuestos de fórmula I-1, en donde

A es C-H o N;

35 R₁ es alquilo C₁-C₄, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆;

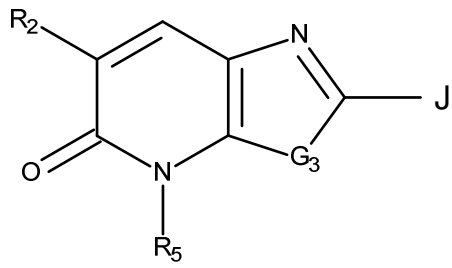
R₂ es halógeno, haloalquil C₁-C₄sulfanilo, haloalquil C₁-C₄sulfinilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, haloalcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, ciano o es cicloalquilo C₃-C₆, que puede estar mono- o poli-sustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano y alquilo C₁-C₄;

40 R₅, X, G₃, L₁, L₂, L₃ y L₄ son como se definen bajo la fórmula I anterior; y

45 R_{10a}, R_{10b}, R_{10c} y R_{10d}, independientemente uno de otro, son hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, hidroxilo, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-cicloalquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, ciclohaloalquil C₃-C₆-cicloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, haloalquil C₁-C₄tio, haloalquil C₁-C₄sulfinilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, -SF₅; adicionalmente uno de R_{10a}, R_{10b}, R_{10c} y R_{10d} pueden ser oxo.

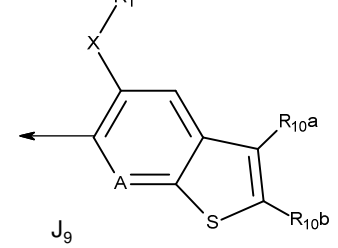
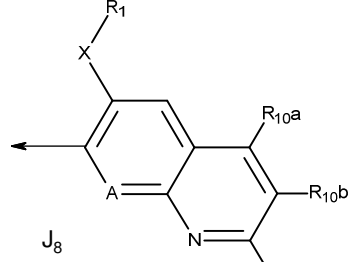
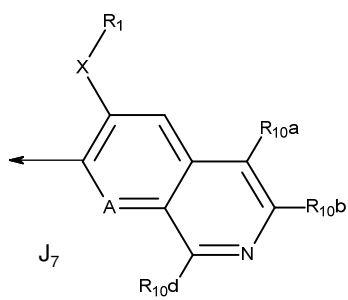
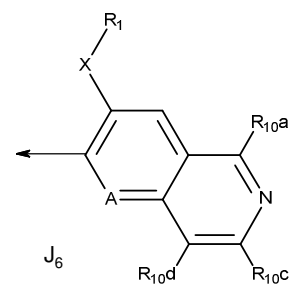
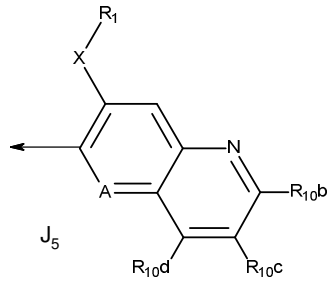
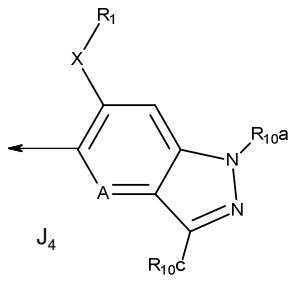
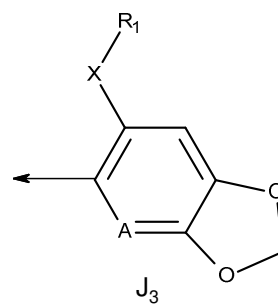
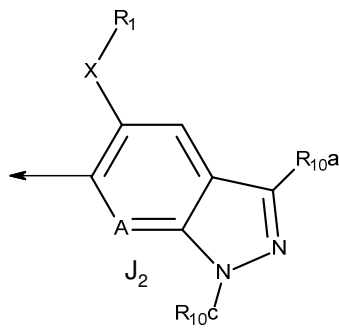
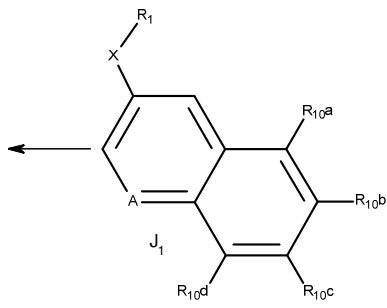
50 Realización (A2):

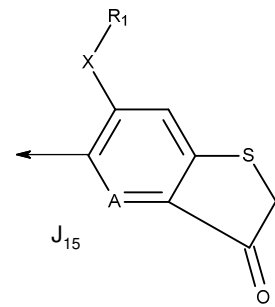
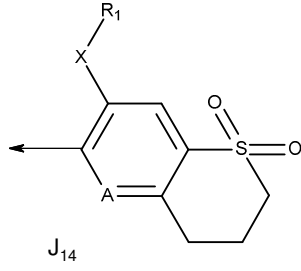
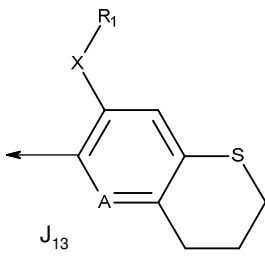
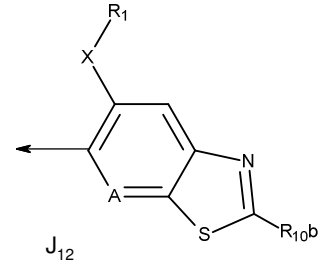
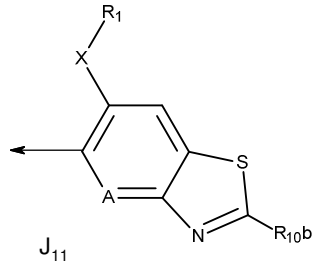
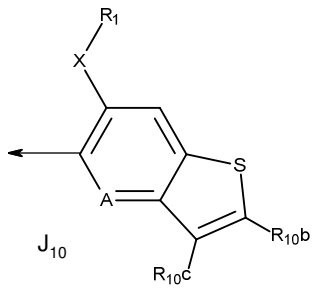
Se prefieren, además, compuestos de fórmula I-1a,

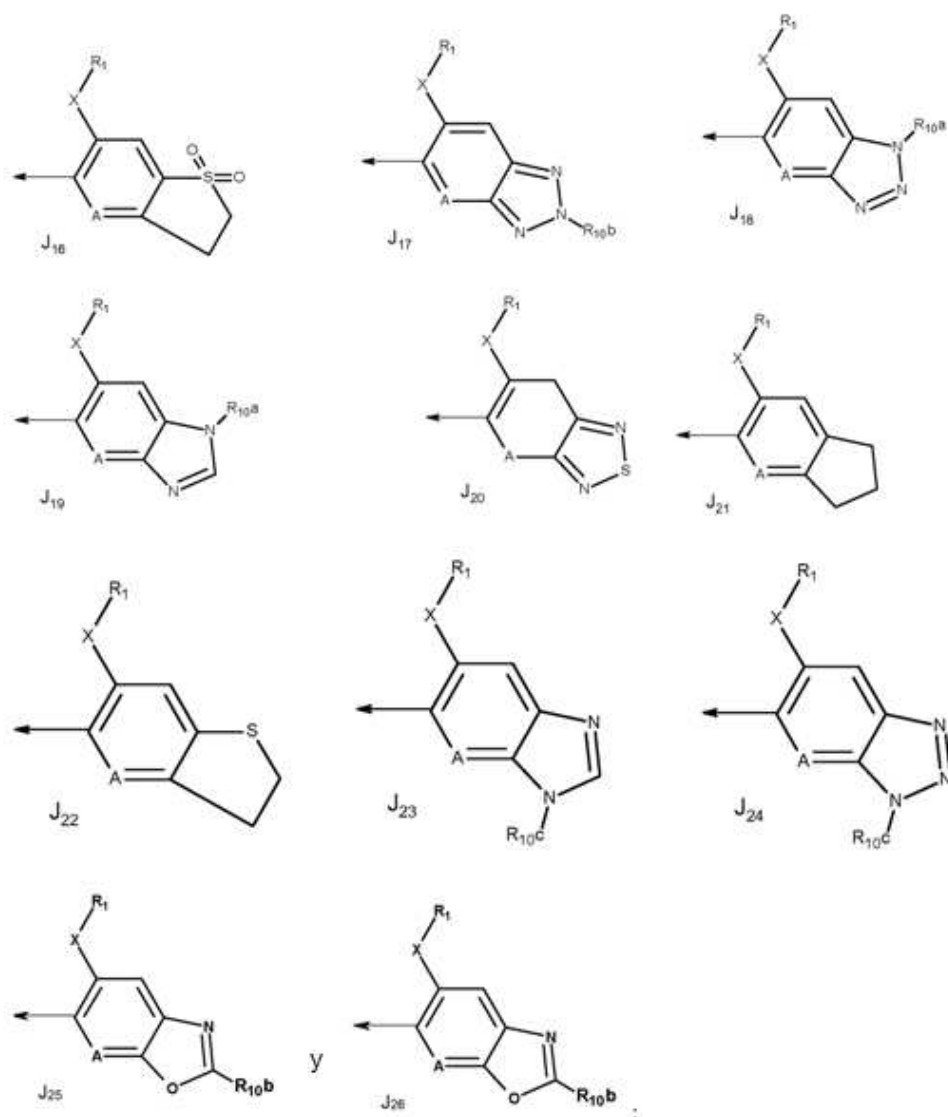


(I-1a),

en donde J se selecciona del grupo que consiste en



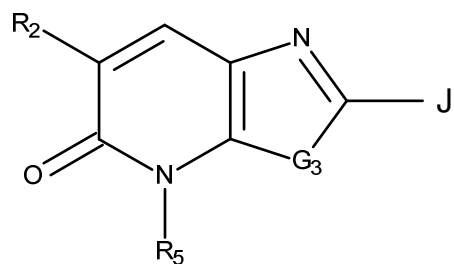




y A, G₃, R₁, R₂, R₅, X, R_{10a}, R_{10b}, R_{10c}, R_{10d}, son como se definen bajo la Realización (A1).

5 Realización (A3):

Se prefieren, además, compuestos de fórmula I-1a,



(I-1a),

10

en donde J es como se definen bajo la Realización (A2) anterior y .

A es C-H o N;

R₁ es alquilo C₁-C₄, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆;

R₂ es halógeno, haloalquil C₁-C₄sulfanilo, haloalquil C₁-C₄sulfinilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, haloalcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, ciano o cicloalquilo C₃-C₆;

5

X y G₃ son como se definen bajo la fórmula I anterior; y

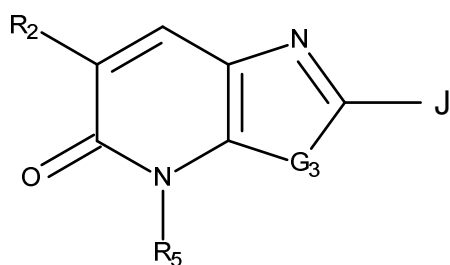
R_{10a}, R_{10b}, R_{10c} y R_{10d}, independientemente uno de otro, son hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, hidroxilo, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-cicloalquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, ciclohaloalquil C₃-C₆-cicloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, haloalquil C₁-C₄tio, haloalquil C₁-C₄sulfinilo o haloalquil C₁-C₄sulfonilo.

10

Realización (A4):

15

Se prefieren, además, compuestos de fórmula I-1a,



(I-1a),

20 en donde J es como se definen bajo la Realización (A2) anterior y .

A es C-H o N;

R₁ es alquilo C₁-C₄;

25

R₂ es haloalquil C₁-C₄sulfanilo, haloalquil C₁-C₄sulfinilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, haloalcoxi C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄;

X es como se define bajo la fórmula I anterior; y

30

G₃ es N-R₆, en donde R₆ es como se define bajo la fórmula I anterior; y

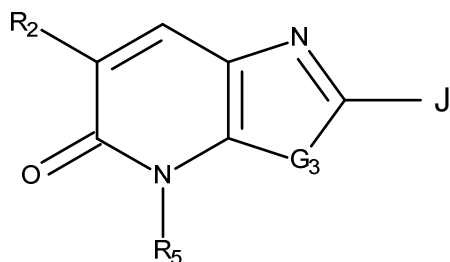
R_{10a}, R_{10b}, R_{10c} y R_{10d}, independientemente uno de otro, son hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, hidroxilo, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-cicloalquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, ciclohaloalquil C₃-C₆-cicloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, haloalquil C₁-C₄tio, haloalquil C₁-C₄sulfinilo o haloalquil C₁-C₄sulfonilo.

35

Realización (A5):

40

Se prefieren, además, compuestos de fórmula I-1a,



(I-1a),

45 en donde J es como se definen bajo la Realización (A2) anterior y .

A es C-H o N;

R₁ es alquilo C₁-C₄;

5

R₂ es -OCF₃, -SCF₃, -S(O)CF₃, -S(O)₂CF₃ o CF₃

X es como se define bajo la fórmula I anterior; y

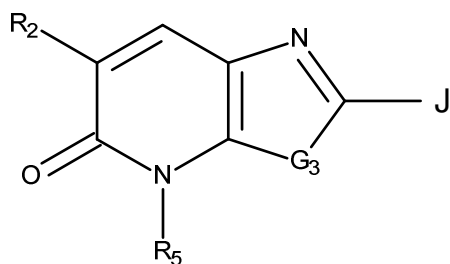
10 G₃ es N-R₆, en donde R₆ es como se define bajo la fórmula I anterior; y

R_{10a}, R_{10b}, R_{10c} y R_{10d}, independientemente uno de otro, son hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, haloalquil C₁-C₄tio, haloalquil C₁-C₄sulfinilo o haloalquil C₁-C₄sulfonilo.

15

Realización (A6):

Se prefieren, además, compuestos de fórmula I-1a,



20

(I-1a),

en donde J es como se definen bajo la Realización (A2) anterior y .

A es C-H o N;

25

R₁ es etilo;

R₂ es -SCF₃, -S(O)CF₃, -S(O)₂CF₃ o CF₃;

30 X es como se define bajo la fórmula I anterior; y

G₃ es N-R₆, en donde R₆ es como se define bajo la fórmula I anterior; y

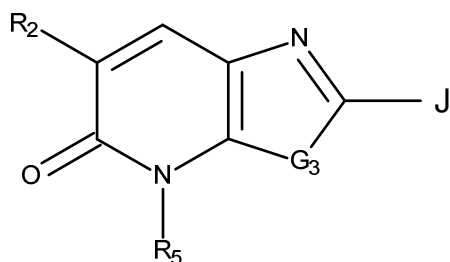
R_{10a}, R_{10b}, R_{10c} y R_{10d}, independientemente uno de otro, son hidrógeno, bromo, cloro, yodo, fluoro, ciano, metilo, etilo, isopropilo, propilo, trifluorometilo, CF₃CH₂-, CH₃O-, -SCF₃, -S(O)CF₃ o -S(O)₂CF₃.

35

Realización (A7):

Se prefieren, además, compuestos de fórmula I-1a,

40



(I-1a),

en donde J es como se definen bajo la Realización (A2) anterior y .

45 A es C-H o N;

R₁ es etilo;

R₂ es -SCF₃, -S(O)CF₃, -S(O)₂CF₃ o CF₃;

5

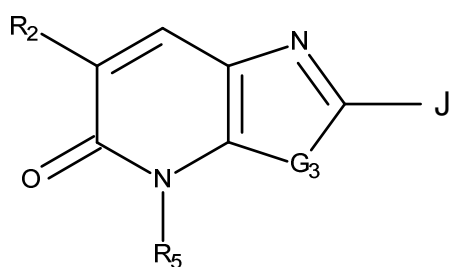
X es como se define bajo la fórmula I anterior;

G₃ es N-R₆, en donde R₆ es como se define bajo la fórmula I anterior; y

10 R_{10a}, R_{10b}, R_{10c} y R_{10d}, independientemente uno de otro, son hidrógeno, bromo, cloro, yodo, fluoro, ciano, metilo o trifluorometilo.

Realización (A8):

15 Se prefieren, además, compuestos de fórmula I-1a,



(I-1a),

en donde J es como se define bajo la Realización (A2) y .

20

A es C-H o N;

R₁ es etilo;

25

R₂ es CF₃;

X es como se define bajo la fórmula I anterior;

G₃ es N-R₆, R₆ es como se define bajo la fórmula I anterior;

30

R_{10a}, R_{10b}, R_{10c} y R_{10d}, independientemente uno de otro, son hidrógeno en todos los grupos J excepto J₂; y

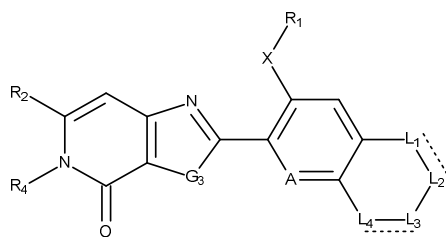
R_{10a}, R_{10b}, R_{10c} y R_{10d}, independientemente uno de otro, son hidrógeno en J₂ y R_{10c} es metilo en J₂.

35 En todas las realizaciones preferidas de fórmulas I, I-1 e I-1a anteriores, X es preferiblemente S o SO₂ y R₆ es metilo.

En todas las realizaciones preferidas de fórmulas I, I-1 e I-1a anteriores, R₅ es preferiblemente metilo o etilo, en particular etilo.

40

Otro grupo preferido de compuestos de fórmula I está representado por los compuestos de fórmula I-2



(I-2),

45 en donde los sustituyentes X, A, R₁, R₂, R₄, G₃, L₁, L₂, L₃ y L₄ son como se definen bajo la fórmula I anterior e Y es O.

Realización (B1):

Se prefieren compuestos de fórmula I-2, en donde

5 A es C-H o N;

R₁ es alquilo C₁-C₄, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆;

10 R₂ es halógeno, haloalquil C₁-C₄sulfanilo, haloalquil C₁-C₄sulfinilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, haloalcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, ciano o es cicloalquilo C₃-C₆, que puede estar mono- o poli-sustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano y alquilo C₁-C₄;

X y G₃ son como se definen bajo la fórmula I anterior;

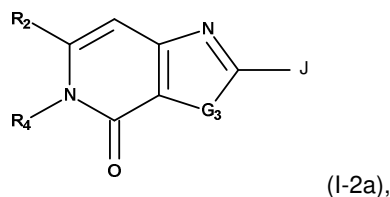
15 L₁, L₂, L₃ y L₄ son como se definen bajo la fórmula I anterior; y

20 R_{10a}, R_{10b}, R_{10c} y R_{10d}, independientemente uno de otro, son hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, hidroxilo, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-cicloalquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₆, haloalqueno C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, ciclohaloalquil C₃-C₆-cicloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, haloalquil C₁-C₄tio, haloalquil C₁-C₄sulfinilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, -SF₅; adicionalmente uno de R_{10a}, R_{10b}, R_{10c} y R_{10d} pueden ser oxo.

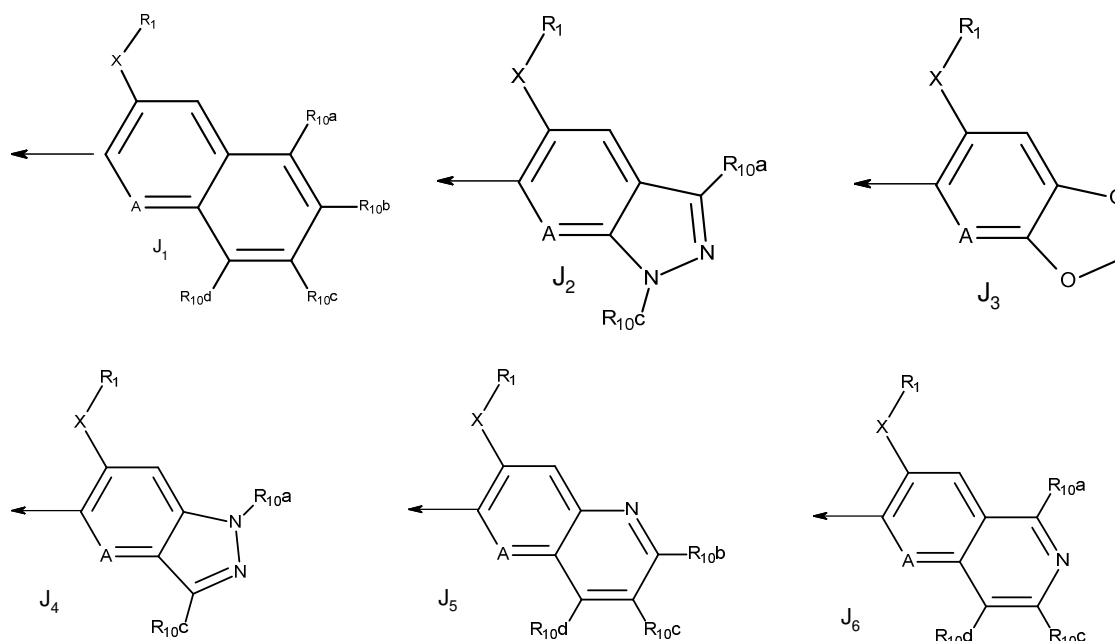
Realización (B2):

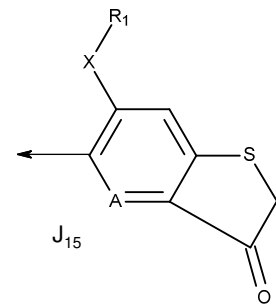
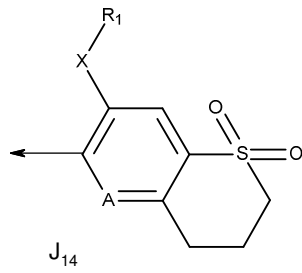
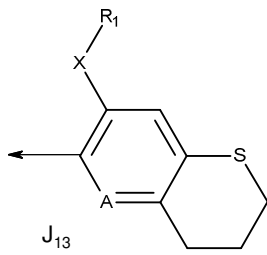
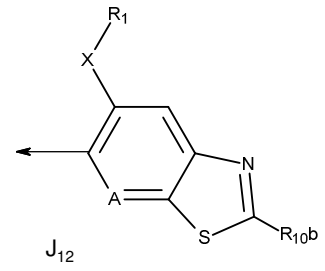
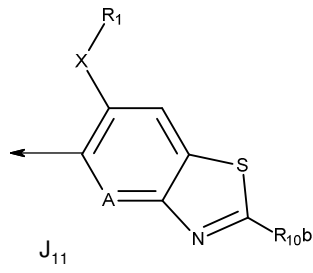
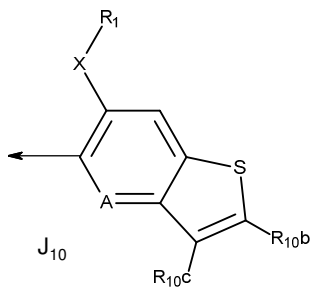
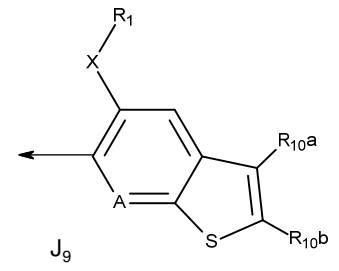
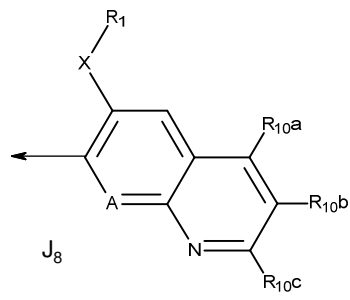
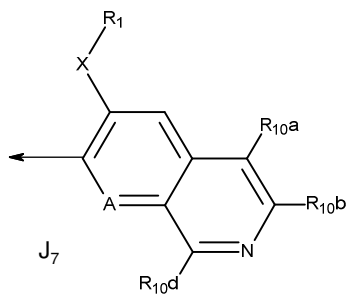
25

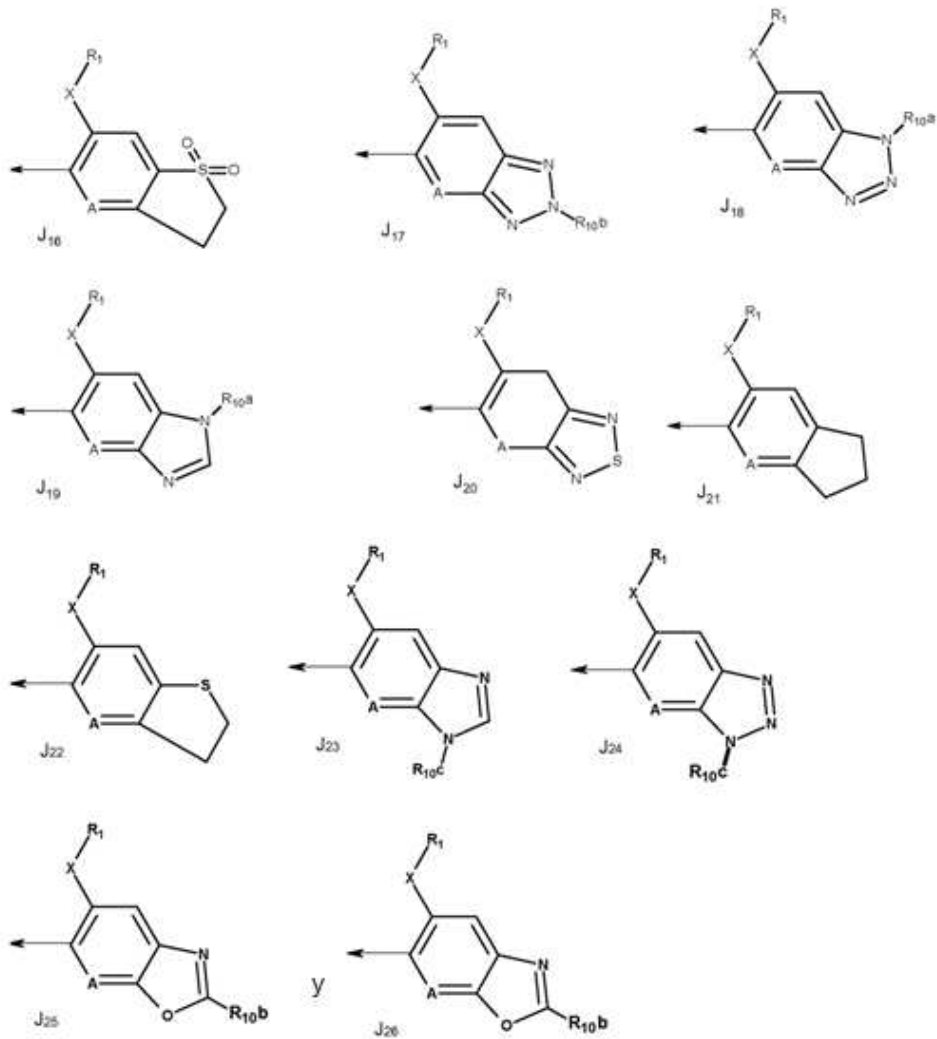
Se prefieren, además, compuestos de fórmula I-2a,



30 en donde J se selecciona del grupo que consiste en



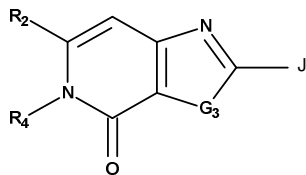




y A, G₃, R₁, R₂, X, R_{10a}, R_{10b}, R_{10c}, R_{10d} son como se definen bajo la Realización (B1).

5 Realización (B3):

Se prefieren, además, compuestos de fórmula I-2a,



(I-2a),

10

en donde J es como se define bajo la Realización (B2) y .

A es C-H o N;

15

R₁ es alquilo C₁-C₄, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆;

R₂ es halógeno, haloalquil C₁-C₄sulfanilo, haloalquil C₁-C₄sulfino, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, haloalcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, ciano o cicloalquilo C₃-C₆;

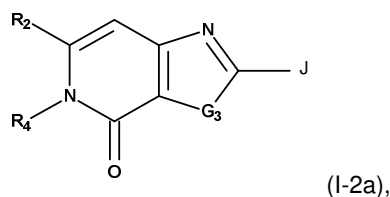
X y G₃ son como se definen bajo la fórmula I anterior; y

R_{10a}, R_{10b}, R_{10c} y R_{10d}, independientemente uno de otro, son hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, hidroxilo, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-cicloalquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, ciclohaloalquil C₃-C₆-cicloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, haloalquil C₁-C₄tio, haloalquil C₁-C₄sulfinilo o haloalquil C₁-C₄sulfonilo.

Realización (B4):

10

Se prefieren, además, compuestos de fórmula I-2a,



15 en donde J es como se define bajo la Realización (B2) y .

A es C-H o N;

R₁ es alquilo C₁-C₄;

20

R₂ es haloalquil C₁-C₄sulfanilo, haloalquil C₁-C₄sulfinilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, haloalcoxi C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄;

X es como se define bajo la fórmula I anterior; y

25

G₃ es N-R₆, en donde R₆ es como se define bajo la fórmula I anterior; y

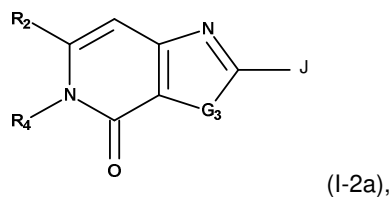
R_{10a}, R_{10b}, R_{10c} y R_{10d}, independientemente uno de otro, son hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, hidroxilo, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-cicloalquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, ciclohaloalquil C₃-C₆-cicloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, haloalquil C₁-C₄tio, haloalquil C₁-C₄sulfinilo o haloalquil C₁-C₄sulfonilo.

30

Realización (B5):

35

Se prefieren, además, compuestos de fórmula I-2a,



40 en donde J es como se define bajo la Realización (B2) y .

A es C-H o N;

R₁ es alquilo C₁-C₄;

45

R₂ es -OCF₃, -SCF₃, -S(O)CF₃, -S(O)₂CF₃ o CF₃

X es como se define bajo la fórmula I anterior; y

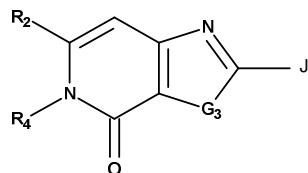
50 G₃ es N-R₆, en donde R₆ es como se define bajo la fórmula I anterior; y

R_{10a}, R_{10b}, R_{10c} y R_{10d}, independientemente uno de otro, son hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, haloalquil C₁-C₄tio, haloalquil C₁-C₄sulfinilo o haloalquil C₁-C₄sulfonilo.

C₄sulfonilo, haloalquil C₁-C₄tio, haloalquil C₁-C₄sulfinito o haloalquil C₁-C₄sulfonilo.

Realización (B6):

5 Se prefieren, además, compuestos de fórmula I-2a,



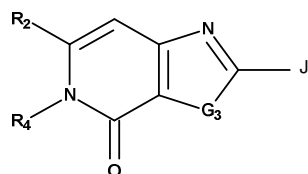
(I-2a),

En donde J es como se define bajo la Realización (B2) y.

- 10 A es C-H o N;
 R₁ es etilo;
 15 R₂ es -SCF₃, -S(O)CF₃, -S(O)₂CF₃ o CF₃;
 X es como se define bajo la fórmula I anterior; y
 20 G₃ es N-R₆, en donde R₆ es como se define bajo la fórmula I anterior; y
 R_{10a}, R_{10b}, R_{10c} y R_{10d}, independientemente uno de otro, son hidrógeno, bromo, cloro, yodo, fluoro, ciano, metilo, etilo, isopropilo, propilo, trifluorometilo, CF₃CH₂-, CH₃O-, -SCF₃, -S(O)CF₃ o -S(O)₂CF₃

Realización (B7):

25 Se prefieren, además, compuestos de fórmula I-2a,

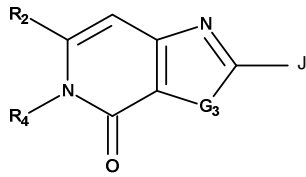


(I-2a),

- 30 en donde J es como se define bajo la Realización (B2) y .
 A es C-H o N;
 R₁ es etilo;
 35 R₂ es -SCF₃, -S(O)CF₃, -S(O)₂CF₃ o CF₃;
 X es como se define bajo la fórmula I anterior;
 40 G₃ es N-R₆, en donde R₆ es como se define bajo la fórmula I anterior; y
 R_{10a}, R_{10b}, R_{10c} y R_{10d} independientemente uno de otro, son hidrógeno, Br, Cl, I, F, ciano, metilo o trifluorometilo.

Realización (B8):

45 Se prefieren, además, compuestos de fórmula I-2a,



(I-2a),

En donde J es como se define bajo la Realización (B2) y.

5 A es C-H o N;

R₁ es etilo;

R₂ es CF₃;

10

X es como se define bajo la fórmula I anterior;

G₃ es N-R₆, R₆ es como se define bajo la fórmula I anterior;

15

R_{10a}, R_{10b}, R_{10c} y R_{10d}, independientemente uno de otro, son hidrógeno en todos los grupos J excepto J₂; y

R_{10a}, R_{10b}, y R_{10d}, independientemente uno de otro, son hidrógeno en J₂ y R_{10c} es metilo en J₂.

20

En todas las realizaciones preferidas de fórmulas I, I-2 y I-2a anteriores, X es preferiblemente S o SO₂ y R₆ es metilo.

En todas las realizaciones preferidas de fórmulas I, I-2 y I-2a anteriores, R₄ es preferiblemente metilo o etilo, en particular etilo.

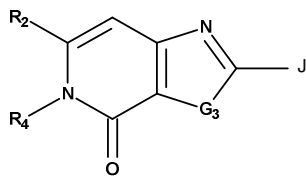
25

En todas las realizaciones preferidas A2-A8 y B2-B8, J se selecciona preferiblemente de J₁, J₂, J₃, J₄, J₅, J₆, J₁₂, J₁₇, J₁₈, J₂₄, J₁₉, J₂₀ y J₂₃, en particular en todas las realizaciones preferidas A2-A8 y B2-B8, J es J₁.

Realización (B9):

30

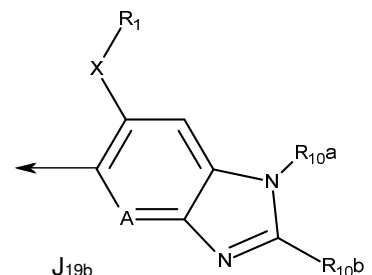
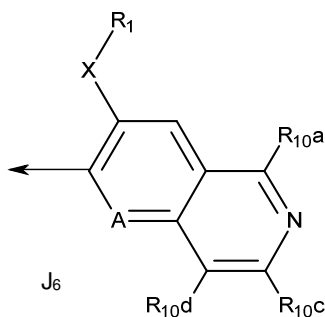
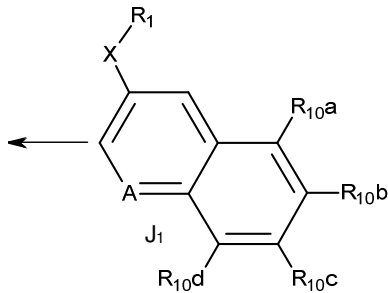
Más preferidos son los compuestos de fórmula I-2a,



(I-2a),

35

en donde J se selecciona del grupo que consiste en



en donde

40

A es CH o N;

R₂ es haloalquilo C₁-C₂;

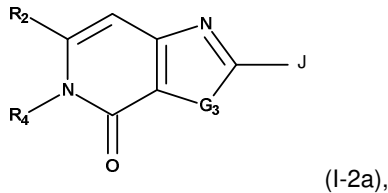
R₄ es alquilo C₁-C₄; y

5 R_{10a}, R_{10b}, R_{10c} y R_{10d}, independientemente uno de otro, son hidrógeno, haloalquilo C₁-C₂ o alquilo C₁-C₂.

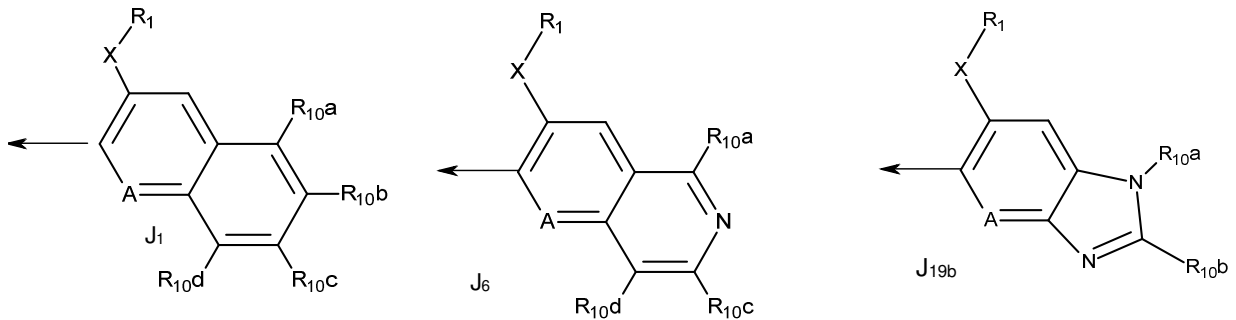
Realización (B10):

Incluso más preferidos son los compuestos de fórmula I-2a,

10



en donde J se selecciona del grupo que consiste en



15

en donde

A es CH o N;

20

R₂ es trifluorometilo;

R₄ es metilo o etilo; y

25

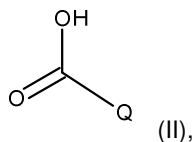
R_{10a}, R_{10b}, R_{10c} y R_{10d} independientemente uno de otro, son hidrógeno, trifluorometilo o metilo.

El procedimiento de acuerdo con la invención para preparar compuestos de fórmula (I) se lleva a cabo mediante métodos conocidos por los expertos en la técnica, o descritos, por ejemplo, en los documentos WO 2009/131237,

30

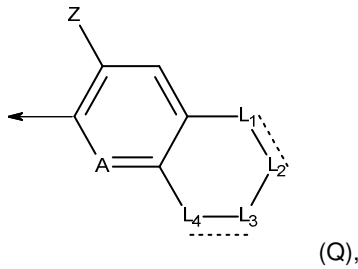
WO 2011/043404, WO 2011/040629, WO 2010/125985, WO 2012/086848, WO 2013/018928,

WO 2013/191113, WO 2013/180193 y WO 2013/180194, y comprende la reacción de un compuesto de fórmula II,



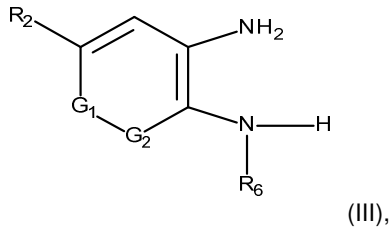
35

en donde Q es el grupo



5 en donde Z es X-R₁ o un grupo lábil, por ejemplo un halógeno, y en donde X, R₁, L₁, L₂, L₃, L₄ y A son como se describen en la fórmula I anterior, y en donde la flecha en el radical Q muestra el punto de unión al átomo de carbono del grupo carboxilo en el compuesto de fórmula II,

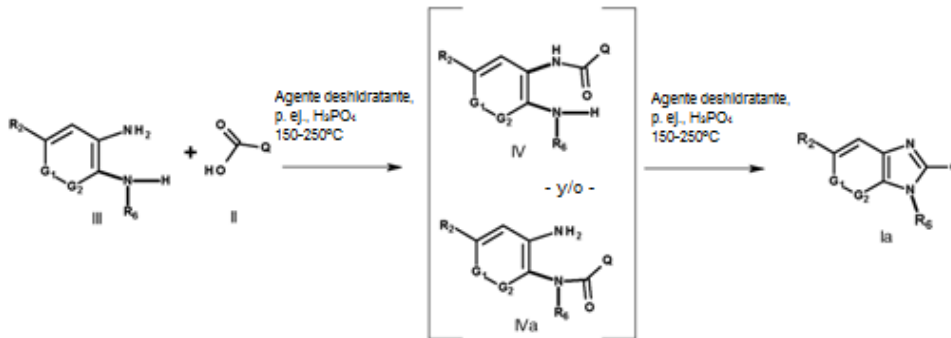
con un compuesto de fórmula III,



10 en donde R₆, R₂, G₁ y G₂ son como se describen bajo la fórmula I anterior, en presencia de un agente deshidratante, tal como por ejemplo ácido polifosfórico, a una temperatura entre 150°C y 250°C, para proporcionar compuestos de fórmula Ia, en donde los sustituyentes son como se describen arriba y bajo la fórmula I.

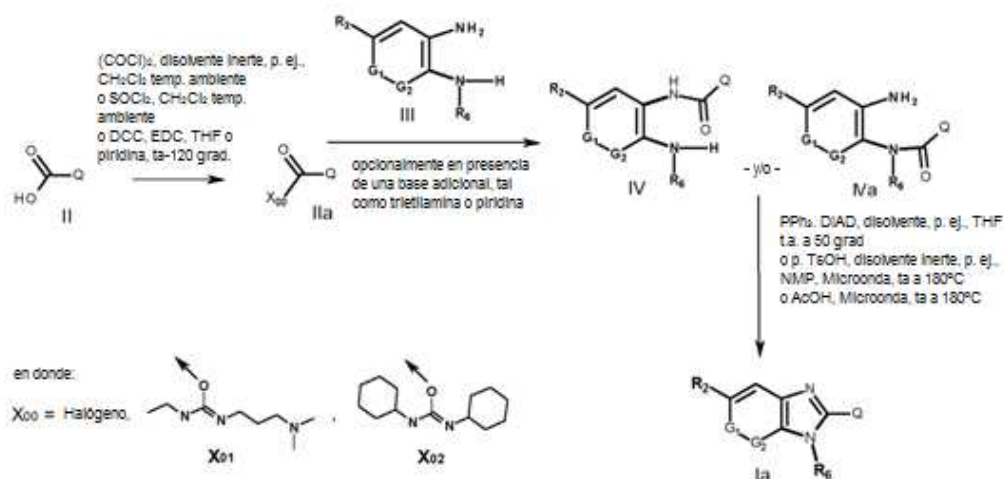
15 Procedimientos de este tipo son bien conocidos y se han descrito, por ejemplo, en el documento WO 2008/128968 o el documento WO 2006/003440. El procedimiento se resume en el esquema 1 para compuestos de fórmula Ia:

20 Esquema 1



25 Como puede verse en el esquema 1, la formación de compuestos de fórmula Ia ocurre a través de la intermediación de un compuesto de fórmula IV (y/o su isómero de posición IVa). El compuesto intermedio IV o el compuesto intermedio IVa pueden formarse como una entidad pura, o los compuestos intermedios IV y IVa pueden surgir como una mezcla de productos de acilación regioisoméricos. En muchos casos es ventajoso preparar así compuestos de fórmula (I) a través de tales compuestos intermedios IV/IVa, que pueden aislarse y opcionalmente purificarse. Esto se ilustra para los compuestos de fórmula Ia en el esquema 2:

30 Esquema 2



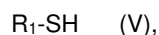
Compuestos de la fórmula IV y/o IVa (o una mezcla de los mismos), o una sal de los mismos, en donde Q es como se define arriba, y en donde R₆, R₂, G₁ y G₂ son como se describen bajo la fórmula I anterior, pueden prepararse por

i) la activación del compuesto de fórmula II, en donde Q es como se define arriba, por métodos conocidos por los expertos en la técnica y descritos en, por ejemplo, Tetrahedron, 2005, 61 (46), 10827-10852, para formar especies activadas Ila, en donde Q es como se define arriba y en donde X₀₀ es halógeno, preferiblemente cloro. Por ejemplo, compuestos Ila, en los que X₀₀ es halógeno, preferiblemente cloro, se forman mediante el tratamiento de II con, por ejemplo, cloruro de oxalilo (COCl)₂ o cloruro de tionilo SOCl₂ en presencia de cantidades catalíticas de N,N-dimetilformamida DMF en disolventes inertes, tales como cloruro de metileno CH₂Cl₂ o tetrahydrofurano THF, a temperaturas entre 20 y 100°C, preferiblemente 25°C. Alternativamente, el tratamiento de compuestos de fórmula II con, por ejemplo, 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil) carbodiimida EDC o dicitohexilcarbodiimida DCC generará una especie activada Ila, en donde X₀₀ es X₀₁ o X₀₂, respectivamente, en un disolvente inerte, tal como piridina o tetrahydrofurano THF, opcionalmente en presencia de una base, tal como trietilamina, a temperaturas entre 25-180°C; seguido por

ii) tratamiento de las especies activadas Ila con un compuesto de fórmula III (o una sal del mismo), en donde R₆, R₂, G₁ y G₂ son como se describen bajo la fórmula I anterior, opcionalmente en presencia de una base, tal como trietilamina o piridina, en disolventes inertes, tales como diclorometano, tetrahydrofurano, dioxano o tolueno, a temperaturas entre 0 y 80°C, para formar los compuestos de fórmula IV y/o IVa (o una mezcla de los mismos).

Compuestos de fórmula IV y/o IVa (o una mezcla de los mismos) pueden convertirse adicionalmente en compuestos de fórmula Ia, en donde Q es como se define arriba, y en donde R₆, R₂, G₁ y G₂ son como se describen bajo la fórmula I anterior, por deshidratación, p. ej., calentando los compuestos IV y/o IVa (o una mezcla de los mismos) en presencia de un catalizador ácido, tal como, por ejemplo, ácido metanosulfónico o ácido *para*-toluenosulfónico TsOH, en un disolvente inerte, tal como N-metilpirrolidina NMP o en ácido puro, tal como ácido acético con o sin disolvente, a temperaturas entre 25-180°C, preferiblemente 100-170°C, opcionalmente en condiciones de microondas. Procedimientos de este tipo se han descrito previamente, por ejemplo, en el documento WO 2010/125985.

Compuestos de fórmula Ia, en donde Q es como se define arriba, y en donde Z es un grupo lábil, por ejemplo halógeno, preferiblemente flúor o cloro, y en donde R₆, R₂, G₁ y G₂ son como se describen bajo la fórmula I anterior, pueden reaccionar con compuestos de fórmula V

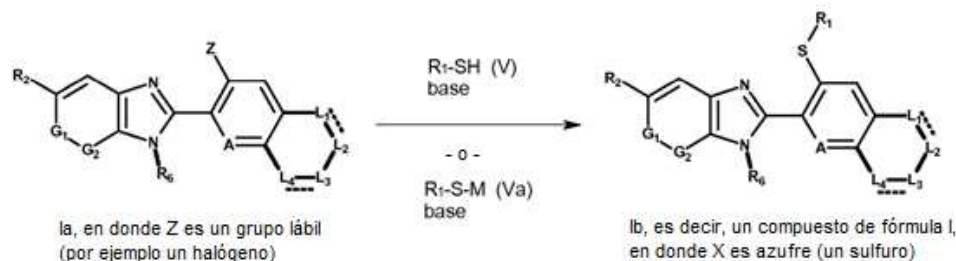


o una de sus sales, en donde R₁ es como se define en la fórmula I, opcionalmente en presencia de una base adecuada, tal como carbonatos de metales alcalinos, por ejemplo carbonato de sodio y carbonato de potasio, o hidruros de metales alcalinos, tales como hidruro de sodio, o hidróxidos de metales alcalinos, tales como hidróxido de sodio e hidróxido de potasio, en un disolvente inerte a temperaturas preferiblemente entre 25-120°C, para generar compuestos de fórmula Ib, en donde R₁ es como se describe bajo la fórmula I anterior, y en que R₆, A, R₂, L₁, L₂, L₃, L₄, G₁ y G₂ son como se describen bajo la fórmula I anterior. Ejemplos de disolventes a utilizar incluyen éteres, tales como THF, etilenglicol dimetiléter, terc.-butilmetiléter y 1,4-dioxano, hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno y xileno, nitrilos, tales como acetonitrilo o disolventes apróticos polares, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metil-2-pirrolidona o dimetilsulfóxido. Una química similar se ha descrito previamente, tal como, por ejemplo, en el documento WO2013/018928.. Ejemplos de sales del compuesto de fórmula V incluyen compuestos de fórmula Va

R_1-S-M (Va),

5 en donde R_1 es como se define anteriormente y en donde M es, por ejemplo, sodio o potasio. Esto se ilustra para compuestos de fórmula Ib en el esquema 3:

Esquema 3



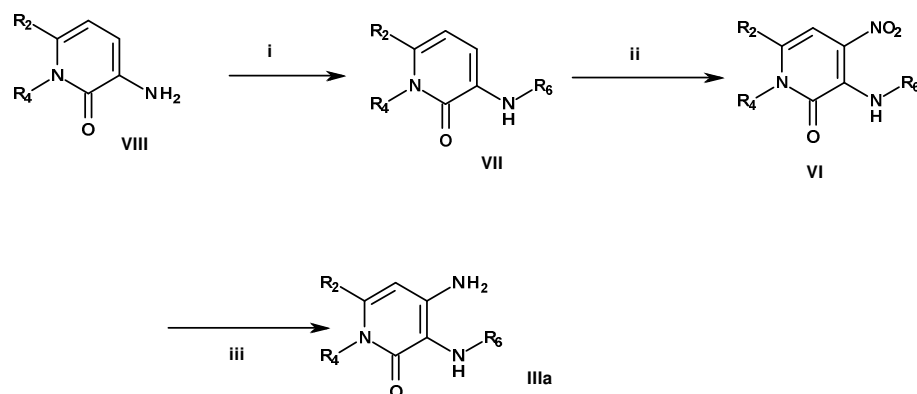
10 Alternativamente, esta reacción se puede llevar a cabo en presencia de un catalizador de paladio, tal como tris(dibencilidena)acetona)dipaladio(0), en presencia de un ligando de fósforo, tal como xanthphos, en un disolvente inerte, por ejemplo, xileno a temperaturas entre 100-160°C, preferiblemente 140°C, tal como se describe por Perrio et al. en Tetrahedron 2005, 61, 5253-5259.

15 El subgrupo de compuestos de fórmula I, en donde X es SO (sulfóxido) y/o SO₂ (sulfona), se puede obtener por medio de una reacción de oxidación de los correspondientes compuestos de sulfuro de fórmula I, en donde X es S (es decir, un compuesto de fórmula Ib anterior), que implica reactivos, tales como, por ejemplo, ácido m-cloroperoxibenzoico (mCPBA), peróxido de hidrógeno, oxona, peryodato de sodio, hipoclorito de sodio o hipoclorito de terc.-butilo, entre otros oxidantes. La reacción de oxidación se lleva a cabo generalmente en presencia de un disolvente. Ejemplos del disolvente a utilizar en la reacción incluyen hidrocarburos halogenados alifáticos tales como diclorometano y cloroformo; alcoholes tales como metanol y etanol; ácido acético; agua; y mezclas de los mismos. La cantidad del oxidante que se utilizará en la reacción es generalmente de 1 a 3 moles, preferiblemente de 1 a 1.2 moles, con relación a 1 mol de los compuestos de sulfuro Ib para producir los compuestos de sulfóxido I (en donde X = SO), y preferiblemente de 2 a 2.2 moles de oxidante, con relación a 1 mol de los compuestos de sulfuro Ib para producir los compuestos de sulfona I (en donde X=SO₂). Tales reacciones de oxidación se describen, por ejemplo, en el documento WO 2013/018928.

30 La secuencia para preparar compuestos de fórmula IIIa, en donde R₂, R₄ y R₆ son como se describen bajo la fórmula I anterior, a partir de compuestos de fórmula VIII, puede implicar i. alquilación del compuesto VIII con R₆-X_{LG}, en donde R₆ es como se describe en la fórmula I anterior y en donde X_{LG} es un grupo lábil, tal como halógeno, preferiblemente yodo, bromo o cloro, en presencia de una base, tal como carbonato de sodio, carbonato de potasio o carbonato de cesio, o hidruro de sodio, en un disolvente apropiado, tal como, por ejemplo, N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida o acetonitrilo, para generar un compuesto de fórmula VII, en donde R₆, R₄ y R₂ son como se describen en la fórmula I anterior. Alternativamente, la alquilación podría realizarse a través de amino-reducción (véase, por ejemplo Comprehensive Organic Transformations: A Guide to Functional Group Preparations. Editado por Richard C. Larock 1989 p 421, VCH editores) o acoplamiento de cobre (p. ej. acoplamiento de Chan-Lam Véase, por ejemplo, Org. Lett., Vol. 11, Nº 8, 2009, 1677-1680).; ii. una reacción de nitración del compuesto VII en condiciones clásicas, por ejemplo, véase, por ejemplo, Advanced Organic Chemistry: Reactions, Mechanisms, and Structure, Cuarta Edición por Jerry March, 1992 (Editorial Wiley Nueva York, N. Y.) páginas 523-525; y finalmente iii. una reacción de reducción del compuesto VI en condiciones clásicas, por ejemplo, véase, por ejemplo, Advanced Organic Chemistry: Reactions, Mechanisms, and Structure, Cuarta Edición de Jerry March, 1992 (Editorial Wiley Nueva York, N. Y.) p 1216-1217. Véase el esquema 4.

45

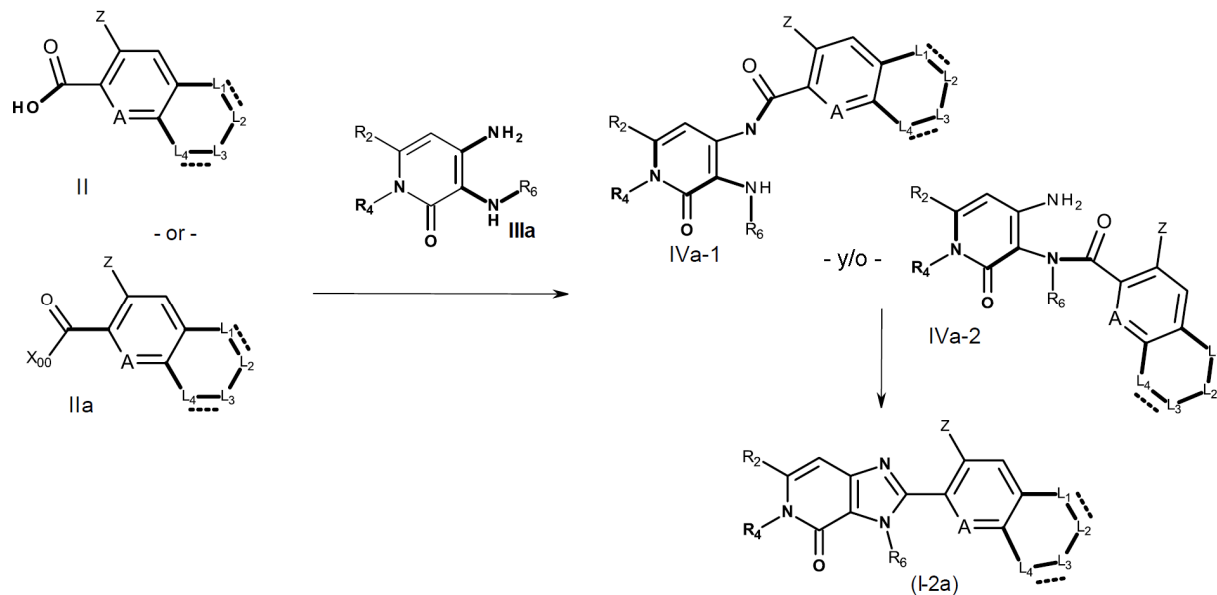
Esquema 4



Compuestos de fórmula VIII pueden prepararse por métodos conocidos por una persona experta en la técnica, por ejemplo, *Synthesis* 2005, Nº 8, págs 1269-1278 y *Synthesis* 2011, Nº 7, págs. 1149-1156.

5 Compuestos de fórmula 1-2a, en donde Z es X-R₁ o un grupo lábil, por ejemplo, halógeno, y en donde X, R₁, R₄, R₆, A y R₂ son como se describen bajo la fórmula I anterior, pueden prepararse por reacción entre compuestos de fórmula II, respectivamente IIa, en donde Z es X-R₁ o un grupo lábil, por ejemplo halógeno, y en donde X, R₁ y A son como se describen bajo la fórmula I anterior, y en la que X₀₀ es como se describió arriba, y compuestos de fórmula IIIa, en donde R₆ y R₂ son como se describen bajo la fórmula I anterior, bajo condiciones similares a las de la preparación de compuestos de fórmula la a partir de compuestos de fórmula II/IIa y III arriba descritos (véanse los esquemas 1 y 2). Esto se ilustra para compuestos de fórmula IIIa en el esquema 5:

Esquema 5

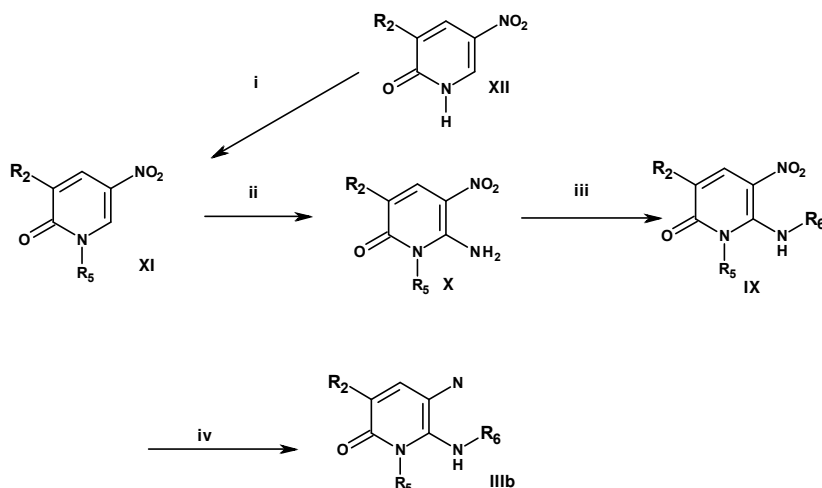


15 La secuencia para preparar compuestos de fórmula IIIb, en donde R₂, R₅ y R₆ son como se describen bajo la fórmula I anterior, a partir de compuestos de fórmula XII, puede implicar i. alquilación del compuesto XII con R₅-X_{LG}, en donde R₅ es como se describe bajo la fórmula I anterior y en donde X_{LG} es un grupo lábil, tal como halógeno, preferiblemente yodo, bromo o cloro, en presencia de una base, tal como carbonato de sodio, carbonato de potasio o carbonato de cesio, o hidruro de sodio, en un disolvente apropiado, tal como, por ejemplo, N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida o acetonitrilo, para generar un compuesto de fórmula XI, en donde R₆ y R₅ son como se describen bajo la fórmula I anterior. Alternativamente, la alquilación podría realizarse a través de amino-reducción (véase, por ejemplo *Comprehensive Organic Transformations: A Guide to Functional Group Preparations*. Editado por Richard C. Larock 1989 p 421, VCH editores) o acoplamiento de cobre (p. ej. acoplamiento de Chan-Lam Véase, por ejemplo, *Org. Lett.*, Vol. 11, Nº. 8, 2009, 1677-1680).; una reacción de la reacción de sustitución nucleófila vicaria (VNS) del compuesto XI en condiciones clásicas, por ejemplo, *J. Org. Chem.*, Vol. 61, Nº 2, 1996 p. 442; iii. alquilación del compuesto X con R₆-X_{LG}, en donde R₆ es como se describe bajo la fórmula I anterior y en donde X_{LG} es un grupo lábil, tal como halógeno, preferiblemente yodo, bromo o cloro, en presencia de una base, tal como carbonato de sodio, carbonato de potasio o carbonato de cesio, o hidruro de sodio, en un disolvente apropiado, tal como, por ejemplo, N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida o acetonitrilo, para generar un compuesto de

fórmula IX, en donde R_6 , R_5 y R_2 son como se describen bajo la fórmula I anterior y finalmente iv. una reacción de reducción del compuesto IX en condiciones clásicas, por ejemplo, véase, por ejemplo, *Advanced Organic Chemistry: Reactions, Mechanisms, and Structure*, Cuarta Edición de Jerry March, 1992 (Editorial Wiley Nueva York, N. Y.) p 1216-1217. Véase el esquema 6.

5

Esquema 6

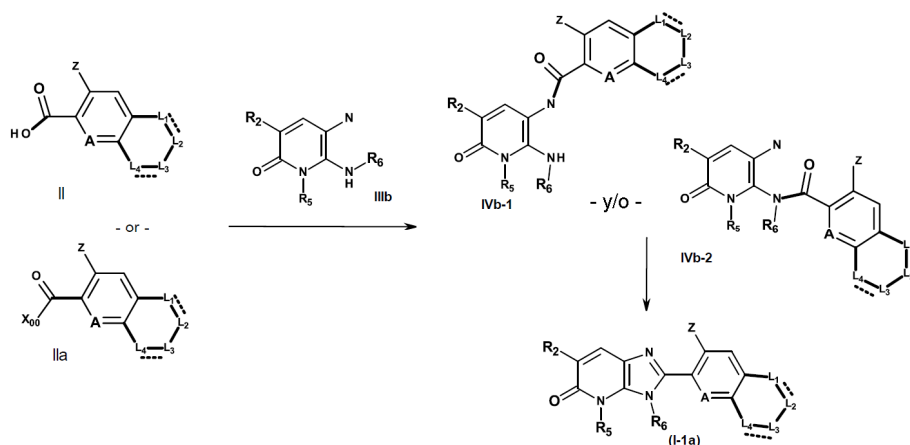


10 Compuestos de fórmula XII están disponibles comercialmente o pueden prepararse por métodos conocidos por una persona experta en la técnica.

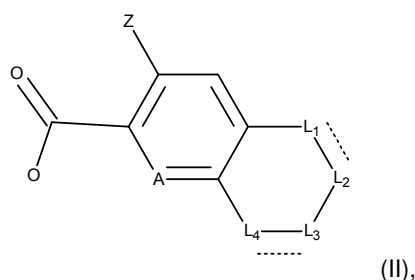
15 Compuestos de fórmula I-1a, en donde Z es X-R₁ o un grupo lábil, por ejemplo, halógeno, y en donde X, R₁, R₂, R₅, R₆ y A son como se describen bajo la fórmula I anterior, pueden prepararse por reacción entre compuestos de fórmula II, respectivamente IIa, en donde Z es X-R₁ o un grupo lábil, por ejemplo halógeno, y en donde X, R₁ y A son como se describen bajo la fórmula I anterior, y en la que X₀₀ es como se describió arriba, y compuestos de fórmula IIIb, en donde R₅, R₆ y R₂ son como se describen bajo la fórmula I anterior, bajo condiciones similares a las de la preparación de compuestos de fórmula I a partir de compuestos de fórmula II/IIa y III arriba descritos (véanse los esquemas 1 y 2). Esto se ilustra en el esquema 7:

20

Esquema 7

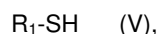


25 Compuestos de fórmula II,

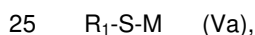


5 en donde Z es X-R₁ o un grupo lábil o un grupo que pueda ser transformado en un grupo lábil, tal como, por ejemplo amina o nitro, y en donde X, R₁, L₁, L₂, L₃, L₄ y A son como se describe bajo la fórmula I anterior, puede ser conocidos, comercialmente disponibles o pueden hacerse mediante métodos conocidos por una persona experta en la técnica.

10 Compuestos de fórmula IIc, en donde Q es como se define arriba, y en donde Z es un grupo lábil, por ejemplo halógeno, preferiblemente flúor o cloro, y en donde A, L₁, L₂, L₃ y L₄ son como se describen bajo la fórmula I anterior, y en donde R es alquilo o hidrógeno, pueden reaccionar con compuestos de fórmula V

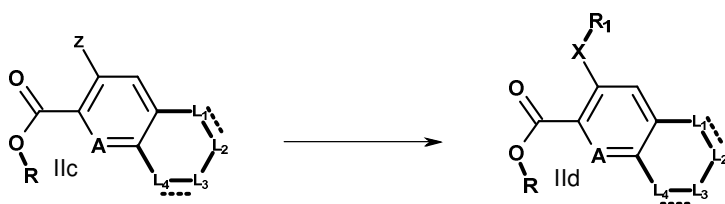


15 o una de sus sales, en donde R₁ es como se define en la fórmula I, opcionalmente en presencia de una base adecuada, tal como carbonatos de metales alcalinos, por ejemplo carbonato de sodio y carbonato de potasio, o hidruros de metales alcalinos, tales como hidruro de sodio, o hidróxidos de metales alcalinos, tales como hidróxido de sodio e hidróxido de potasio, en un disolvente inerte a temperaturas preferiblemente entre 25-120°C, para generar compuestos de fórmula IIc, en donde R es alquilo o hidrógeno, R₁ es como se describe bajo la fórmula I anterior, y en que A, L₁, L₂, L₃ y L₄ son como se describen bajo la fórmula I anterior. Ejemplos de disolventes a utilizar incluyen éteres, tales como THF, etilenglicol dimetiléter, terc.-butilmetiléter y 1,4-dioxano, hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno y xileno, nitrilos, tales como acetonitrilo o disolventes apróticos polares, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metil-2-pirrolidona o dimetilsulfóxido. Ejemplos de sales del compuesto de fórmula V incluyen compuestos de fórmula Va



en donde R₁ es como se define anteriormente y en donde M es, por ejemplo, sodio o potasio. Esto se ilustra para compuestos de fórmula IIc en el esquema 8:

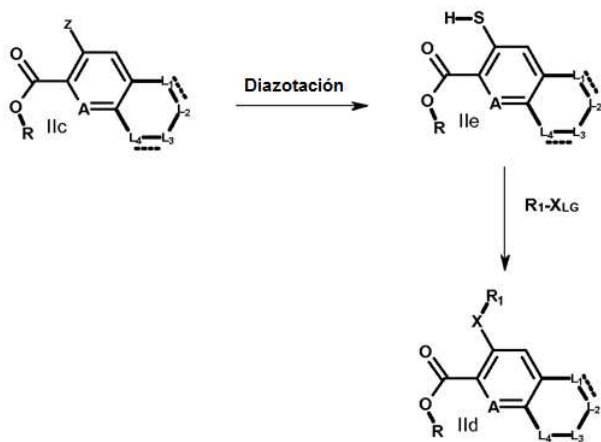
30 Esquema 8



35 Alternativamente, compuestos de fórmula IIc, en donde Z es una amina y en donde A, L₁, L₂, L₃ y L₄ son como se describen bajo la fórmula I anterior, y en donde R es alquilo o hidrógeno se pueden transformar en compuestos de fórmula IIc a través de diazotación y reacción con disulfuro de dialquilo. Esta transformación es bien conocida y podría realizarse por métodos conocidos por una persona experta en la técnica (véase, por ejemplo: Synthetic Communications, 31(12), 1857-1861; 2001 u Organic & Biomolecular Chemistry, 6(4), 745-761; 2008).

40 Compuestos de fórmula IIc, en donde Z es una amina y en donde A, L₁, L₂, L₃ y L₄ son como se describen bajo la fórmula I anterior, y en donde R es alquilo o hidrógeno se pueden transformar en compuestos de fórmula IIc a través de diazotación y reacción con sulfuro de sodio, seguido de reducción. Esta transformación es bien conocida y podría realizarse por métodos conocidos por una persona experta en la técnica (véase, por ejemplo: documento US 20040116734 o Chemische Berichte, 120(7), 1151-73; 1987). La alquilación del compuesto IIc con R₁-X_{LG}, en donde R₁ es como se describen bajo la fórmula I anterior, y en donde X_{LG} es un grupo lábil, tal como halógeno, preferiblemente yodo, bromo o cloro, en presencia de una base, tal como carbonato de sodio, carbonato de potasio o carbonato de cesio, o hidruro de sodio, en un disolvente apropiado, tal como, por ejemplo, N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida o acetonitrilo, para generar un compuesto de fórmula IIc, en donde R₁ es como se describe bajo la fórmula I anterior. Véase el esquema 9.

Esquema 9

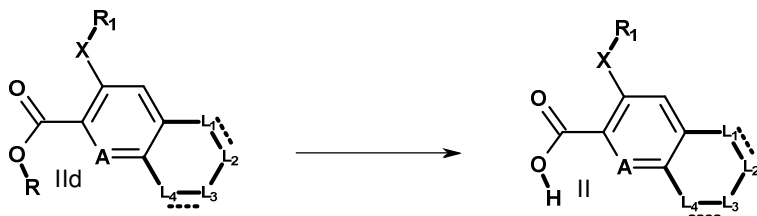


5

10

El compuesto de fórmula (II) se puede preparar por reacción de un compuesto de fórmula (IIId), en donde R es alquilo a través de hidrólisis. Por ejemplo, en el caso en que R sea metilo o etilo, la hidrólisis se puede hacer con agua y una base, tal como hidróxido de potasio o hidróxido de litio, en ausencia o en presencia de un disolvente, tal como, por ejemplo, tetrahidrofurano o metanol. En el caso en el que R sea, por ejemplo, *tert.*-butilo, la hidrólisis se realiza en presencia de ácido, tal como ácido trifluoroacético o ácido clorhídrico. La reacción se lleva a cabo a una temperatura de -120°C a $+130^{\circ}\text{C}$, preferiblemente de -100°C a 100°C . Véase el esquema 10.

Esquema 10



15

20

Alternativamente, el compuesto de fórmula II se puede preparar por reacción de un compuesto de fórmula (XIII), en donde Z es un grupo lábil, tal como nitro, o halógeno, tal como flúor, y en donde A, L₁, L₂, L₃ y L₄ son como se describe bajo la fórmula I anterior por reacción de un compuesto de fórmula V o Va

R₁-SH (V),

R₁-S-M (Va),

25

30

para dar compuestos de fórmula XIIIId o una sal de los mismos, en donde X y R₁ son como se definen en la fórmula I y en que A, L₁, L₂, L₃ y L₄ son como se describe bajo la fórmula I anterior, opcionalmente en presencia de una base adecuada, tal como carbonatos de metales alcalinos, por ejemplo carbonato de sodio y carbonato de potasio, o hidruros de metales alcalinos tal como hidruro de sodio, o hidróxidos de metales alcalinos, tal como hidróxido de sodio e hidróxido de potasio, en un disolvente inerte a temperaturas preferiblemente entre $25-120^{\circ}\text{C}$. Ejemplos de disolventes a utilizar incluyen éteres, tales como THF, etilenglicoldimetiléter, *tert.*-butilmetiléter y 1,4-dioxano, hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno y xileno, nitrilos, tales como acetonitrilo o disolventes apróticos polares, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metil-2-pirrolidona o dimetilsulfóxido.

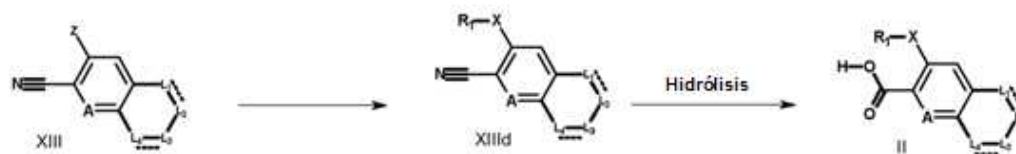
35

Compuestos de fórmula II se pueden preparar por hidrólisis del ciano del compuesto de fórmula XIIIId en condiciones ácidas o básicas. Esta transformación es bien conocida y podría realizarse por métodos conocidos por una persona experta en la técnica (véase, por ejemplo: *Comprehensive Organic Transformations: A Guide to Functional Group Preparations*. Editado por Richard C. Larock **1989** p 993, editores VCH).

40

Esto se ilustra para compuestos de fórmula II en el esquema 11:

Esquema 11

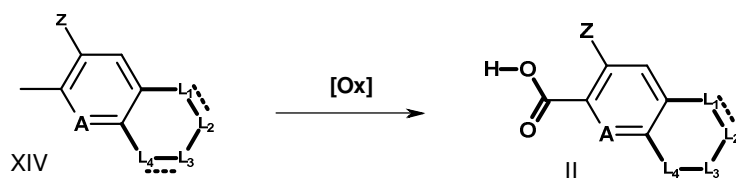


5 Compuestos de fórmula XIII son conocidos, están disponibles comercialmente o pueden prepararse mediante métodos conocidos por una persona experta en la técnica.

10 Alternativamente, el compuesto de fórmula II se puede preparar por reacción de un compuesto de fórmula (XIV), en donde Z es un grupo lábil, tal como nitro, o halógeno, tal como flúor, y en donde A, L₁, L₂, L₃ y L₄ son como se describe bajo la fórmula I anterior por oxidación en presencia de un oxidante, tal como oxígeno, peróxido de hidrógeno o un óxido metálico, tal como trióxido de cromo con o sin ácido tal como ácido sulfúrico con o sin catalizador metálico. Esta transformación es bien conocida y podría realizarse por métodos conocidos por una persona experta en la técnica (véase, por ejemplo: *Comprehensive Organic Transformations: A Guide to Functional Group Preparations*. Editado por Richard C. Larock **1989** p 823, editores VCH). Esto se ilustra para compuestos de fórmula II en el esquema 12:

15

Esquema 12



20 Compuestos de fórmula XIV son conocidos, están disponibles comercialmente o pueden prepararse mediante métodos conocidos por una persona experta en la técnica.

25 Alternativamente, la síntesis de compuestos de fórmula I (bencimidazoles (J₁₉ y J₂₃), en donde: L₁ = N o NR_{10a}, L₂ = C-R_{10b}, L₃ = N o N-R_{10c}, L₄ = enlace; benzotiadiazoles (J₂₀): L₁ = N, L₂ = S, L₃ = N, L₄ = enlace; benzotiazoles (J₁₂): L₁ = N, L₂ = C-R_{10b}, L₃ = S, L₄ = enlace; benzotriazoles (J₁₈, J₁₇ y J₂₄): L₁ = N o N-R_{10a}, L₂ = N o N-R_{10b}, L₃ = N o N-R_{10c}, L₄ = enlace; benzoxazoles (J₂₅): L₁ = N, L₂ = C-R_{10b}, L₃ = O, L₄ = enlace) puede hacerse a través de la ciclación de compuestos intermedios de fórmulas XVII o XVIII tal como se representa en el esquema 13.

30 La síntesis de compuestos cíclicos tal como se describe en el esquema 13 es muy conocida y podría realizarse mediante métodos conocidos por una persona experta en la técnica por analogía a lo que se describió anteriormente en la bibliografía.

35 Por ejemplo, para la síntesis de bencimidazoles partiendo del tipo intermedio XVIII, véase *Monatshefte fuer Chemie* **2011**, 142(1), 87-91; *Organic Preparations and Procedures International* **2013**, 45(1), 57-65; *Organic Preparations and Procedures International* **2013**, 45(2), 162-167; *Tetrahedron Letters* **2007** 48(18), 3251-3254; o partiendo del tipo intermedio XVII, véase, por ejemplo, *Journal of Organic Chemistry* **2011**, 76(23), 9577-9583 o *Tetrahedron* **2013**, 69(6), 1717-1719. De manera general, véase para la revisión sobre la preparación de bencimidazoles: *The Chemistry of Heterocyclic Compounds*; Weissberger, A., Taylor, E. C., Eds.; Wiley-VCH: Nueva York, NY, 1981; Vol. 40, págs. 6-60.

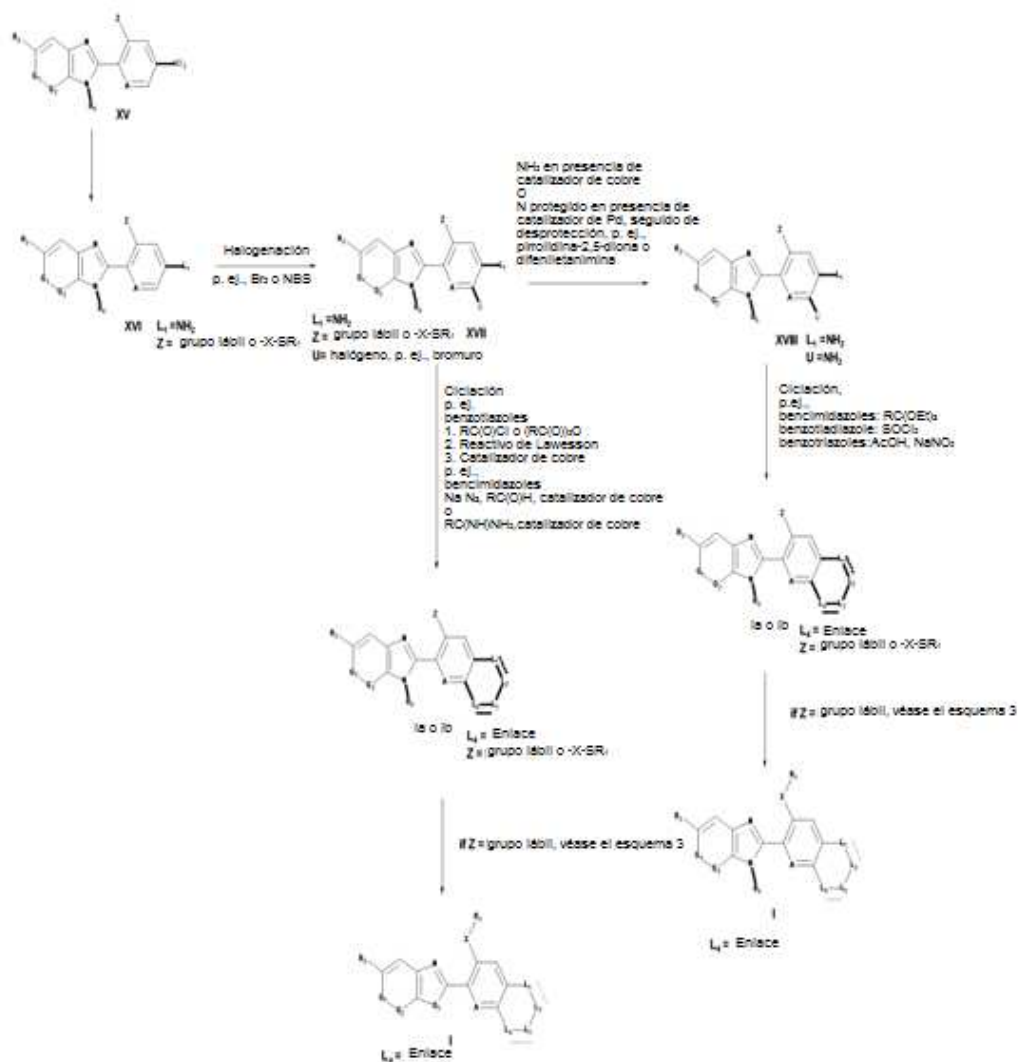
40 Por ejemplo, para la síntesis de benzotiadiazoles partiendo del compuesto intermedio tipo XVIII, véase *Tetrahedron* **2005**, 61(46), 10975-10982. Véase para una revisión más general sobre la preparación y las propiedades de bencimidazoles: *Eur. J. Org. Chem.* **2013**, 228-255.

45 Por ejemplo, para la síntesis de benzotriazoles partiendo del compuesto intermedio tipo XVIII, véase, por ejemplo, *Bioorganic & Medicinal Chemistry* **2010**, 18(24), 8457-8462, utilizando ciclocondensación tal como se describe en el esquema 13 (p. ej., AcOH, NaNO₂). Para una revisión más general sobre la preparación de benzotriazoles, véase, por ejemplo, *Journal Chem. Pharm. Res.*, 2011, 3(6) p375-381.

50 Por ejemplo, para la síntesis de benzotiazoles partiendo del compuesto intermedio tipo XVII, véase, por ejemplo, *Journal of Combinatorial Chemistry* **2009**, 11(6), 1047-1049; *Chemistry - A European Journal* **2012**, 18(16), 4840-4843, S4840/1-S4840/35; o documento WO13066729. Además, la síntesis de benzotiazoles es bien conocida y podría hacerse fácilmente mediante métodos conocidos por una persona experta en la técnica a través de otro tipo

de compuestos intermedios; por ejemplo, Journal of Current Pharmaceutical Research 2010; 3 (1): 13-23.

Esquema 13: Preparación alternativa de compuestos de fórmula I



5

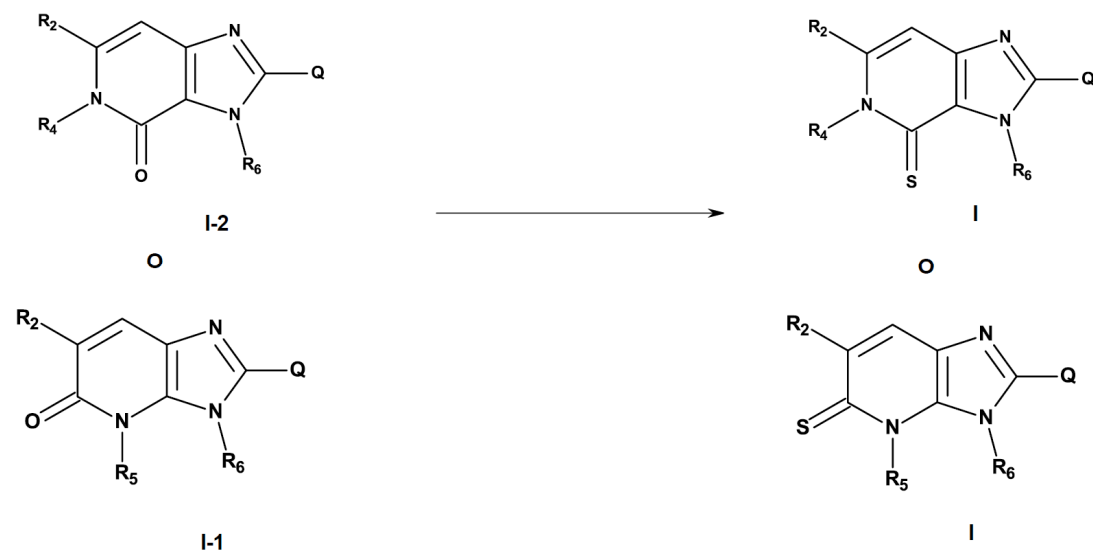
Compuestos de fórmula XV se pueden preparar por reacción idéntica descrita en los esquemas 1 a 6, en donde L₁ es NO₂ o los compuestos de fórmula XV se pueden preparar por reacción idéntica descrita en los esquemas 1 a 6, en donde L₁ es un nitrógeno protegido, por ejemplo, L₁ podría ser pirrolidina-2,5-diona, seguida de desprotección, por ejemplo con hidrazina.

Compuestos de fórmula Ia, Ib e I que contienen un N-H como L₁, L₂ o L₃ podrían reaccionar con un agente de alquilación, tal como yoduro de metilo en presencia de una base, tal como carbonato de potasio o hidruro de sodio, para dar compuestos de fórmula Ia, Ib e I, en donde L₁, L₂ o L₃ es, por ejemplo, un N-CH₃.

Compuestos de fórmula I, en donde Y es S, pueden prepararse (esquema 14) haciendo reaccionar compuestos de fórmula I-1 o I-2, en donde Y es O, con un reactivo que podría transferir un átomo de azufre, tal como, por ejemplo, el reactivo de Lawesson, en un disolvente, tal como, por ejemplo, dimetilformamida o tolueno, habitualmente a una temperatura entre 50 y 150°C. Una persona experta en la técnica conoce este tipo de transformación y, por ejemplo, se describe en Tetrahedron (2007), 63(48), 11862-11877 o el documento US20120309796.

20

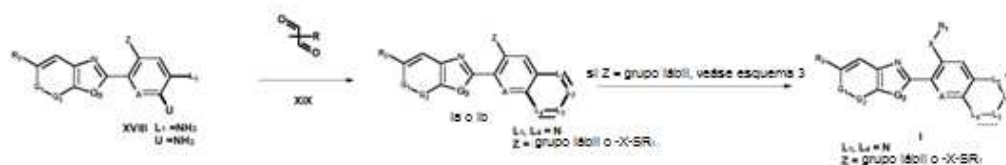
Esquema 14



Alternativamente, el O de C(O) se puede transformar en S en un compuesto intermedio de vista previa, tal como, por ejemplo, los compuestos de fórmula XII u XI.

Preparación de derivados de Quinoxalinas: El compuesto de fórmula Ia o Ib, en donde R₂, G₁, G₂ y G₃ son como se definen en la fórmula I, L₁ y L₂ son nitrógeno, L₂ y L₃ son, respectivamente, C-R_{10b} y C-R_{10c}, y Z es un grupo lábil o X-R₁, puede producirse haciendo reaccionar un compuesto de fórmula XVIII (por ejemplo, preparado tal como se describe en el esquema 15) con análogos de Glioxal (XIX) y puede transformarse en el compuesto de fórmula I (si Z es un grupo lábil) a través de las condiciones descritas, por ejemplo, en el esquema 3. Una transformación de este tipo es bien conocida por los expertos en la técnica y se ha descrito, por ejemplo, en Journal of Heterocyclic Chemistry, 51(5), 1504-1508; 2014, Synthesis, 45(11), 1546-1552; 2013 y referencias citadas.

Esquema 17



Para preparar todos los otros compuestos de fórmula (I) funcionalizados de acuerdo con las definiciones de fórmula III y Q, existe un gran número de métodos estándares conocidos adecuados, por ejemplo alquilación, halogenación, acilación, amidación, oximación, oxidación y reducción, la elección de los métodos de preparación que son adecuados dependiendo de las propiedades (reactividad) de los sustituyentes en los compuestos intermedios.

Los reaccionantes pueden reaccionar en presencia de una base. Ejemplos de bases adecuadas son hidróxidos de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos, hidruros de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos, amidas de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos, alcóxidos de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos, acetatos de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos, carbonatos de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos, dialquilamidas de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos o alquilsililamidas de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos, alquilaminas, alquilendiaminas, cicloalquilaminas saturadas o insaturadas, libres o N-alquiladas, heterociclos de carácter básico, hidróxidos de amonio y aminas carbocíclicas. Algunos ejemplos que se pueden mencionar son hidróxido de sodio, hidruro de sodio, amiduro de sodio, metóxido de sodio, acetato de sodio, carbonato de sodio, terc.-butóxido de potasio, hidróxido de potasio, carbonato de potasio, hidruro de potasio, diisopropilamido de litio, bis(trimetilsilil)amiduro de potasio, hidruro de calcio, trietilamina, diisopropiletamina, trietilendiamina, ciclohexilamina, N-ciclohexil-N,N-dimetilamina, N,N-dietilanilina, piridina, 4-(N,N-dimetilamino)piridina, quinuclidina, N-metilmorfolina, hidróxido de benciltrimetilamonio y 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno (DBU).

Los reaccionantes pueden reaccionar entre sí como tales, es decir, sin añadir un disolvente o diluyente. En la

mayoría de los casos, sin embargo, es ventajoso añadir un disolvente o diluyente inerte o una mezcla de estos. Si la reacción se lleva a cabo en presencia de una base, las bases que se emplean en exceso, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina o N,N-dietilanilina, también pueden actuar como disolventes o diluyentes.

5 La reacción se lleva a cabo ventajosamente a una temperatura comprendida en el intervalo de aproximadamente -80°C a aproximadamente +140°C, preferiblemente de aproximadamente -30°C a aproximadamente +100°C, en muchos casos en el intervalo comprendido entre la temperatura ambiente y aproximadamente +80°C.

10 Un compuesto de fórmula I se puede convertir de manera per se conocida en otro compuesto de fórmula I reemplazando uno o más sustituyentes del compuesto de partida de fórmula I de la manera habitual por (un) otro(s) sustituyente(s) de acuerdo con la invención.

15 Dependiendo de la elección de las condiciones de reacción y los materiales de partida que son adecuados en cada caso, es posible, por ejemplo, en una etapa de reacción reemplazar solamente un sustituyente por otro sustituyente de acuerdo con la invención, o puede reemplazarse una pluralidad de sustituyentes por otros sustituyentes de acuerdo con la invención en la misma etapa de reacción.

20 Sales de los compuestos de fórmula I pueden prepararse de un modo conocido per se. Así, por ejemplo, sales por adición de ácidos de compuestos de fórmula I se obtienen por tratamiento con un ácido adecuado o un reactivo intercambiador de iones adecuado y las sales con bases se obtienen por tratamiento con una base adecuada o con un reactivo intercambiador de iones adecuado.

25 Sales de los compuestos de fórmula I pueden convertirse de la manera habitual en los compuestos I libres, sales por adición de ácidos, por ejemplo, mediante el tratamiento con un compuesto de carácter básico adecuado o con un reactivo intercambiador de iones adecuado y sales con bases, por ejemplo, mediante el tratamiento con un ácido adecuado o con un reactivo intercambiador de iones adecuado.

30 Sales de compuestos de fórmula I se pueden convertir de manera conocida per se en otras sales de compuestos de fórmula I, sales por adición de ácidos, por ejemplo, en otras sales por adición de ácidos, por ejemplo, por tratamiento de una sal de ácido inorgánico tal como hidrocloruro con una sal metálica adecuada tal como una sal de sodio, bario o plata, de un ácido, por ejemplo con acetato de plata, en un disolvente adecuado en el que una sal inorgánica que forma, por ejemplo, cloruro de plata, es insoluble y precipita de la mezcla de reacción.

35 Dependiendo del procedimiento o las condiciones de reacción, los compuestos de fórmula I, que tienen propiedades de formación de sal, pueden obtenerse en forma libre o en forma de sales.

40 Los compuestos de fórmula I y, cuando sea apropiado, el tautómero de los mismos, en cada caso en forma libre o en forma de sal, pueden estar presentes en forma de uno de los isómeros que son posibles o como una mezcla de estos, por ejemplo en forma de isómeros puros, tales como antípodas y/o diastereómeros, o como mezclas de isómeros, tales como mezclas de enantiómeros, por ejemplo racematos, mezclas de diastereómeros o mezclas de racematos, dependiendo del número, de la configuración absoluta y relativa de los átomos de carbono asimétricos que aparecen en el molécula y/o dependiendo de la configuración de los dobles enlaces no aromáticos que aparecen en la molécula; la invención se refiere a los isómeros puros y también a todas las mezclas de isómeros que son posibles y deben entenderse en cada caso, en este sentido, en lo que antecede y más adelante, incluso cuando en cada caso no se mencionen específicamente detalles estereoquímicos.

50 Mezclas de diastereómeros o mezclas de racemato de compuestos de fórmula I, en forma libre o en forma de sal, que se pueden obtener dependiendo de qué materiales de partida y procedimientos se hayan elegido, se pueden separar de forma conocida en los diastereómeros puros o racematos sobre la base de las diferencias físico-químicas de los componentes, por ejemplo mediante cristalización fraccionada, destilación y/o cromatografía.

55 Mezclas de enantiómeros, tales como racematos, que pueden obtenerse de manera similar pueden resolverse en los antípodas ópticas por métodos conocidos, por ejemplo mediante recristalización en un disolvente ópticamente activo, mediante cromatografía en adsorbentes quirales, por ejemplo cromatografía líquida de alto rendimiento (HPLC) en acetilcelulosa, con la ayuda de microorganismos adecuados, mediante escisión con enzimas inmovilizadas específicas, a través de la formación de compuestos de inclusión, por ejemplo utilizando éteres corona quirales, en que solo un enantiómero está complejado, o por conversión en sales diastereoméricas, por ejemplo haciendo reaccionar un racemato de carácter básico del producto final con un ácido ópticamente activo, tal como un ácido carboxílico, por ejemplo alcanfor, ácido tartárico o málico, o ácido sulfónico, por ejemplo ácido canfosulfónico, y separando la mezcla de diastereómeros que se puede obtener de esta manera, por ejemplo, mediante cristalización fraccionada basada en sus diferentes solubilidades, para dar los diastereoisómeros, a partir de los cuales se puede liberar el enantiómero deseado mediante la acción de agentes adecuados, por ejemplo, agentes de carácter básico.

65 Diastereómeros o enantiómeros puros pueden obtenerse de acuerdo con la invención no solo separando mezclas de isómeros adecuadas, sino también mediante métodos de síntesis diastereoselectivos o enantioselectivos

generalmente conocidos, por ejemplo llevando a cabo el procedimiento de acuerdo con la invención con materiales de partida de una estereoquímica adecuada.

5 N-óxidos se pueden preparar haciendo reaccionar un compuesto de la fórmula I con un agente oxidante adecuado, por ejemplo el aducto de H₂O₂/urea en presencia de un anhídrido de ácido, p. ej., anhídrido trifluoroacético. Oxidaciones de este tipo se conocen de la bibliografía, por ejemplo de *J. Med. Chem.* **1989**, 32, 2561 o

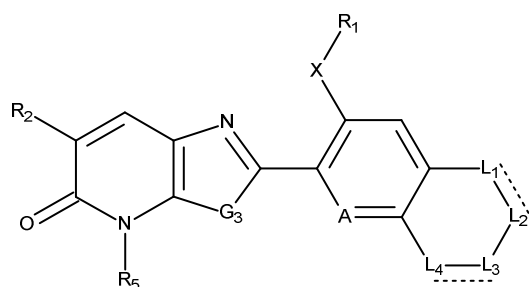
el documento WO 2000/15615.

10 Es ventajoso aislar o sintetizar en cada caso el isómero biológicamente más eficaz, por ejemplo enantiómero o diastereómero, o mezcla de isómeros, por ejemplo mezcla de enantiómeros o mezcla de diastereómeros, si los componentes individuales tienen una actividad biológica diferente.

15 Los compuestos de fórmula I y, cuando sea apropiado, los tautómeros de los mismos, en cada caso en forma libre o en forma de sal, pueden obtenerse también, si es apropiado, en forma de hidratos y/o pueden incluir otros disolventes, por ejemplo los que pueden haber sido utilizados para la cristalización de compuestos que están presentes en forma sólida.

20 Los compuestos de acuerdo con las siguientes tablas 1 a 4 que figuran a continuación pueden prepararse de acuerdo con los métodos descritos anteriormente. Los ejemplos que siguen pretenden ilustrar la invención y mostrar compuestos preferidos de fórmula I. "Ph" representa el grupo fenilo.

Tabla 1: Esta tabla describe los 264 compuestos de la fórmula I-1a:



25 (I-1a).

Tabla 1:

Comp. N.º	G ₃	X	R ₁	A	R ₂	R ₅	L ₁	L ₂	L ₃	L ₄
1,001	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
1,002	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
1,003	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	SCF ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
1,004	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	SCF ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
1,005	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₂ C F ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
1,006	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₂ C F ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
1,007	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
1,008	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH

ES 2 731 078 T3

Comp. N.º	G ₃	X	R ₁	A	R ₂	R ₅	L ₁	L ₂	L ₃	L ₄
1,009	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	SCF ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
1,010	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	SCF ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
1,011	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₂ C F ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
1,012	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₂ C F ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
1,013	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	N	N-CH ₃	enlace
1,014	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	N	N-CH ₃	enlace
1,015	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	N-CH ₃	N	enlace
1,016	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	N-CH ₃	N	enlace
1,017	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	N	N-CH ₃	enlace
1,018	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	N	N-CH ₃	enlace
1,019	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	N-CH ₃	N	enlace
1,020	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	N-CH ₃	N	enlace
1,021	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	CH	CH	CH
1,022	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	CH	CH	CH
1,023	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	CH	CH	CH
1,024	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	CH	CH	CH
1,025	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	N	CH	CH
1,026	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	N	CH	CH
1,027	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	N	CH	CH
1,028	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	N	CH	CH
1,029	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N- CH ₃	N	CH	Enlace
1,030	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N- CH ₃	N	CH	Enlace

ES 2 731 078 T3

Comp. N.º	G ₃	X	R ₁	A	R ₂	R ₅	L ₁	L ₂	L ₃	L ₄
1,031	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	N	CH	Enlace
1,032	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	N	CH	Enlace
1,033	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	N-CH ₃	CH	Enlace
1,034	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	N-CH ₃	CH	Enlace
1,035	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	N-CH ₃	CH	Enlace
1,036	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	N-CH ₃	CH	Enlace
1,037	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	N-H	CH	Enlace
1,038	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	N-H	CH	Enlace
1,039	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	N-H	CH	Enlace
1,040	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	N-H	CH	Enlace
1,041	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	N	N-H	enlace
1,042	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	N	N-H	enlace
1,043	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	N	N-H	enlace
1,044	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	N	N-H	enlace
1,045	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	S	N	enlace
1,046	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	S	N	enlace
1,047	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	S	N	enlace
1,048	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	S	N	enlace
1,049	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	NH	N	enlace
1,050	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	NH	N	enlace
1,051	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	NH	N	enlace
1,052	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	NH	N	enlace

ES 2 731 078 T3

Comp. N.º	G ₃	X	R ₁	A	R ₂	R ₅	L ₁	L ₂	L ₃	L ₄
1,053	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	N-CH ₃	N	enlace
1,054	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	N-CH ₃	N	enlace
1,055	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	N-CH ₃	N	enlace
1,056	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	N-CH ₃	N	enlace
1,057	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	N	N-CH ₃	enlace
1,058	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	N	N-CH ₃	enlace
1,059	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	N	N-CH ₃	enlace
1,060	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	N	N-CH ₃	enlace
1,061	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	N	N	enlace
1,062	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	N	N	enlace
1,063	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	N	N	enlace
1,064	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	N	N	enlace
1,065	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	C-CF ₃	CH	CH
1,066	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	C-CF ₃	CH	CH
1,067	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	C-CF ₃	CH	CH
1,068	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	C-CF ₃	CH	CH
1,069	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	C-F	CH	CH
1,070	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	C-F	CH	CH
1,071	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	C-F	CH	CH
1,072	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	C-F	CH	CH
1,073	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-H	S	enlace
1,074	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-H	S	enlace

ES 2 731 078 T3

Comp. N.º	G ₃	X	R ₁	A	R ₂	R ₅	L ₁	L ₂	L ₃	L ₄
1,075	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-H	S	enlace
1,076	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-H	S	enlace
1,077	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-CH ₃	S	enlace
1,078	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-CH ₃	S	enlace
1,079	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-CH ₃	S	enlace
1,080	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-CH ₃	S	enlace
1,081	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-CF ₃	S	enlace
1,082	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-CF ₃	S	enlace
1,083	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-CF ₃	S	enlace
1,084	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-CF ₃	S	enlace
1,085	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	S	C-H	N	enlace
1,086	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	S	C-H	N	enlace
1,087	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	S	C-H	N	enlace
1,088	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	S	C-H	N	enlace
1,089	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	S	C-CH ₃	N	enlace
1,090	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	S	C-CH ₃	N	enlace
1,091	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	S	C-CH ₃	N	enlace
1,092	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	S	C-CH ₃	N	enlace
1,093	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	S	C-CF ₃	N	enlace
1,094	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	S	C-CF ₃	N	enlace
1,095	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	S	C-CF ₃	N	enlace
1,096	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	S	C-CF ₃	N	enlace

ES 2 731 078 T3

Comp. N.º	G ₃	X	R ₁	A	R ₂	R ₅	L ₁	L ₂	L ₃	L ₄
1,097	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-H	C-CF ₃	N	enlace
1,098	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-H	C-CF ₃	N	enlace
1,099	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-H	C-CF ₃	N	enlace
1,100	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-H	C-CF ₃	N	enlace
1,101	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-H	C-CH ₃	N	enlace
1,102	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-H	C-CH ₃	N	enlace
1,103	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-H	C-CH ₃	N	enlace
1,104	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-H	C-CH ₃	N	enlace
1,105	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-H	CH	N	enlace
1,106	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-H	CH	N	enlace
1,107	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-H	CH	N	enlace
1,108	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-H	CH	N	enlace
1,109	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	CH	N	enlace
1,110	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	CH	N	enlace
1,111	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	CH	N	enlace
1,112	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	CH	N	enlace
1,113	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	C-CH ₃	N	enlace
1,114	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	C-CH ₃	N	enlace
1,115	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	C-CH ₃	N	enlace
1,116	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	C-CH ₃	N	enlace
1,117	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	C-CF ₃	N	enlace
1,118	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	C-CF ₃	N	enlace

ES 2 731 078 T3

Comp. N.º	G ₃	X	R ₁	A	R ₂	R ₅	L ₁	L ₂	L ₃	L ₄
1,119	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	C-CF ₃	N	enlace
1,120	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	C-CF ₃	N	enlace
1,121	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	CH	N-CH ₃	enlace
1,122	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	CH	N-CH ₃	enlace
1,123	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	CH	N-CH ₃	enlace
1,124	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	CH	N-CH ₃	enlace
1,125	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-CH ₃	N-CH ₃	enlace
1,126	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-CH ₃	N-CH ₃	enlace
1,127	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-CH ₃	N-CH ₃	enlace
1,128	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-CH ₃	N-CH ₃	enlace
1,129	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-CF ₃	N-CH ₃	enlace
1,130	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-CF ₃	N-CH ₃	enlace
1,131	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-CF ₃	N-CH ₃	enlace
1,132	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-CF ₃	N-CH ₃	Enlace
1,133	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
1,134	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
1,135	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	SCF ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
1,136	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	SCF ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
1,137	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₂ C F ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
1,138	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₂ C F ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
1,139	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
1,140	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH

ES 2 731 078 T3

Comp. N.º	G ₃	X	R ₁	A	R ₂	R ₅	L ₁	L ₂	L ₃	L ₄
1,141	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	SCF ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
1,142	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	SCF ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
1,143	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₂ C F ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
1,144	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₂ C F ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
1,145	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	N	N-CH ₃	enlace
1,146	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	N	N-CH ₃	enlace
1,147	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	N-CH ₃	N	enlace
1,148	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	N-CH ₃	N	enlace
1,149	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	N	N-CH ₃	enlace
1,15	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	N	N-CH ₃	enlace
1,151	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	N-CH ₃	N	enlace
1,152	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	N-CH ₃	N	enlace
1,153	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	CH	CH	CH
1,154	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	CH	CH	CH
1,155	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	CH	CH	CH
1,156	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	CH	CH	CH
1,157	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	N	CH	CH
1,158	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	N	CH	CH
1,159	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	N	CH	CH
1,160	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	N	CH	CH
1,161	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N- CH ₃	N	CH	Enlace
1,162	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N- CH ₃	N	CH	Enlace

ES 2 731 078 T3

Comp. N.º	G ₃	X	R ₁	A	R ₂	R ₅	L ₁	L ₂	L ₃	L ₄
1,163	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	N	CH	Enlace
1,164	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	N	CH	Enlace
1,165	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	N-CH ₃	CH	Enlace
1,166	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	N-CH ₃	CH	Enlace
1,167	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	N-CH ₃	CH	Enlace
1,168	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	N-CH ₃	CH	Enlace
1,169	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	N-H	CH	Enlace
1,170	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	N-H	CH	Enlace
1,171	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	N-H	CH	Enlace
1,172	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	N-H	CH	Enlace
1,173	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	N	N-H	enlace
1,174	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	N	N-H	enlace
1,175	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	N	N-H	enlace
1,176	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	N	N-H	enlace
1,177	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	S	N	enlace
1,178	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	S	N	enlace
1,179	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	S	N	enlace
1,180	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	S	N	enlace
1,181	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	NH	N	enlace
1,182	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	NH	N	enlace
1,183	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	NH	N	enlace
1,184	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	NH	N	enlace

ES 2 731 078 T3

Comp. N.º	G ₃	X	R ₁	A	R ₂	R ₅	L ₁	L ₂	L ₃	L ₄
1,185	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	N-CH ₃	N	enlace
1,186	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	N-CH ₃	N	enlace
1,187	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	N-CH ₃	N	enlace
1,188	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	N-CH ₃	N	enlace
1,189	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	N	N-CH ₃	enlace
1,190	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	N	N-CH ₃	enlace
1,191	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	N	N-CH ₃	enlace
1,192	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	N	N-CH ₃	enlace
1,193	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	N	N	enlace
1,194	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	N	N	enlace
1,195	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	N	N	enlace
1,196	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	N	N	enlace
1,197	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	C-CF ₃	CH	CH
1,198	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	C-CF ₃	CH	CH
1,199	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	C-CF ₃	CH	CH
1,200	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	C-CF ₃	CH	CH
1,201	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	C-F	CH	CH
1,202	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	C-F	CH	CH
1,203	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	C-F	CH	CH
1,204	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	C-F	CH	CH
1,205	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-H	S	enlace
1,206	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-H	S	enlace

ES 2 731 078 T3

Comp. N.º	G ₃	X	R ₁	A	R ₂	R ₅	L ₁	L ₂	L ₃	L ₄
1,207	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-H	S	enlace
1,208	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-H	S	enlace
1,209	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-CH ₃	S	enlace
1,210	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-CH ₃	S	enlace
1,211	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-CH ₃	S	enlace
1,212	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-CH ₃	S	enlace
1,213	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-CF ₃	S	enlace
1,214	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-CF ₃	S	enlace
1,215	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-CF ₃	S	enlace
1,216	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-CF ₃	S	enlace
1,217	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	S	C-H	N	enlace
1,218	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	S	C-H	N	enlace
1,219	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	S	C-H	N	enlace
1,220	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	S	C-H	N	enlace
1,221	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	S	C-CH ₃	N	enlace
1,222	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	S	C-CH ₃	N	enlace
1,223	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	S	C-CH ₃	N	enlace
1,224	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	S	C-CH ₃	N	enlace
1,225	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	S	C-CF ₃	N	enlace
1,226	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	S	C-CF ₃	N	enlace
1,227	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	S	C-CF ₃	N	enlace
1,228	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	S	C-CF ₃	N	enlace

ES 2 731 078 T3

Comp. N.º	G ₃	X	R ₁	A	R ₂	R ₅	L ₁	L ₂	L ₃	L ₄
1,229	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-H	C-CF ₃	N	enlace
1,230	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-H	C-CF ₃	N	enlace
1,231	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-H	C-CF ₃	N	enlace
1,232	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-H	C-CF ₃	N	enlace
1,233	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-H	C-CH ₃	N	enlace
1,234	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-H	C-CH ₃	N	enlace
1,235	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-H	C-CH ₃	N	enlace
1,236	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-H	C-CH ₃	N	enlace
1,237	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-H	CH	N	enlace
1,238	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-H	CH	N	enlace
1,239	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-H	CH	N	enlace
1,240	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-H	CH	N	enlace
1,241	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	CH	N	enlace
1,242	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	CH	N	enlace
1,243	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	CH	N	enlace
1,244	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	CH	N	enlace
1,245	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	C-CH ₃	N	enlace
1,246	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	C-CH ₃	N	enlace
1,247	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	C-CH ₃	N	enlace
1,248	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	C-CH ₃	N	enlace
1,249	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	C-CF ₃	N	enlace
1,250	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	C-CF ₃	N	enlace

Comp. N.º	G ₃	X	R ₁	A	R ₂	R ₅	L ₁	L ₂	L ₃	L ₄
1,251	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	C-CF ₃	N	enlace
1,252	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	C-CF ₃	N	enlace
1,253	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	CH	N-CH ₃	enlace
1,254	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	CH	N-CH ₃	enlace
1,255	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	CH	N-CH ₃	enlace
1,256	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	CH	N-CH ₃	enlace
1,257	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-CH ₃	N-CH ₃	enlace
1,258	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-CH ₃	N-CH ₃	enlace
1,259	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-CH ₃	N-CH ₃	enlace
1,260	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-CH ₃	N-CH ₃	enlace
1,261	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-CF ₃	N-CH ₃	enlace
1,262	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-CF ₃	N-CH ₃	enlace
1,263	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-CF ₃	N-CH ₃	enlace
1,264	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-CF ₃	N-CH ₃	enlace

y los N-óxidos o tautómeros de los compuestos de la Tabla 1.

Tabla 2: Esta tabla describe los 264 compuestos de la fórmula I-1b:

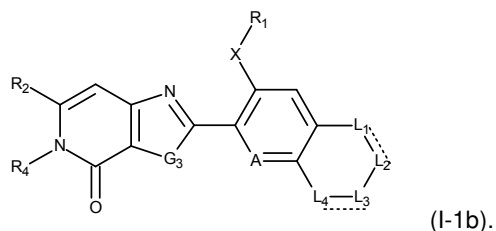


Tabla 2:

Comp. N.º	G ₃	X	R ₁	A	R ₂	R ₄	L ₁	L ₂	L ₃	L ₄
2,001	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH

ES 2 731 078 T3

Comp. N.º	G ₃	X	R ₁	A	R ₂	R ₄	L ₁	L ₂	L ₃	L ₄
2,002	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
2,003	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	SCF ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
2,004	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	SCF ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
2,005	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₂ C F ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
2,006	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₂ C F ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
2,007	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
2,008	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
2,009	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	SCF ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
2,010	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	SCF ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
2,011	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₂ C F ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
2,012	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₂ C F ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
2,013	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	N	N-CH ₃	enlace
2,014	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	N	N-CH ₃	enlace
2,015	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	N-CH ₃	N	enlace
2,016	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	N-CH ₃	N	enlace
2,017	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	N	N-CH ₃	enlace
2,018	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	N	N-CH ₃	enlace
2,019	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	N-CH ₃	N	enlace
2,020	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	N-CH ₃	N	enlace
2,021	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	CH	CH	CH
2,022	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	CH	CH	CH
2,023	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	CH	CH	CH

ES 2 731 078 T3

Comp. N.º	G ₃	X	R ₁	A	R ₂	R ₄	L ₁	L ₂	L ₃	L ₄
2,024	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	CH	CH	CH
2,025	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	N	CH	CH
2,026	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	N	CH	CH
2,027	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	N	CH	CH
2,028	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	N	CH	CH
2,029	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	N	CH	Enlace
2,030	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	N	CH	Enlace
2,031	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	N	CH	Enlace
2,032	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	N	CH	Enlace
2,033	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	N-CH ₃	CH	Enlace
2,034	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	N-CH ₃	CH	Enlace
2,035	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	N-CH ₃	CH	Enlace
2,036	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	N-CH ₃	CH	Enlace
2,037	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	N-H	CH	Enlace
2,038	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	N-H	CH	Enlace
2,039	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	N-H	CH	Enlace
2,040	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	N-H	CH	Enlace
2,041	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	N	N-H	enlace
2,042	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	N	N-H	enlace
2,043	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	N	N-H	enlace
2,044	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	N	N-H	enlace
2,045	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	S	N	enlace

ES 2 731 078 T3

Comp. N.º	G ₃	X	R ₁	A	R ₂	R ₄	L ₁	L ₂	L ₃	L ₄
2,046	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	S	N	enlace
2,047	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	S	N	enlace
2,048	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	S	N	enlace
2,049	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	NH	N	enlace
2,050	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	NH	N	enlace
2,051	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	NH	N	enlace
2,052	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	NH	N	enlace
2,053	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	N-CH ₃	N	enlace
2,054	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	N-CH ₃	N	enlace
2,055	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	N-CH ₃	N	enlace
2,056	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	N-CH ₃	N	enlace
2,057	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	N	N-CH ₃	enlace
2,058	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	N	N-CH ₃	enlace
2,059	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	N	N-CH ₃	enlace
2,060	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	N	N-CH ₃	enlace
2,061	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	N	N	enlace
2,062	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	N	N	enlace
2,063	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	N	N	enlace
2,064	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	N	N	enlace
2,065	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	C-CF ₃	CH	CH
2,066	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	C-CF ₃	CH	CH
2,067	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	C-CF ₃	CH	CH

ES 2 731 078 T3

Comp. N.º	G ₃	X	R ₁	A	R ₂	R ₄	L ₁	L ₂	L ₃	L ₄
2,068	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	C-CF ₃	CH	CH
2,069	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	C-F	CH	CH
2,070	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	C-F	CH	CH
2,071	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	C-F	CH	CH
2,072	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	C-F	CH	CH
2,073	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-H	S	enlace
2,074	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-H	S	enlace
2,075	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-H	S	enlace
2,076	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-H	S	enlace
2,077	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-CH ₃	S	enlace
2,078	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-CH ₃	S	enlace
2,079	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-CH ₃	S	enlace
2,080	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-CH ₃	S	enlace
2,081	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-CF ₃	S	enlace
2,082	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-CF ₃	S	enlace
2,083	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-CF ₃	S	enlace
2,084	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-CF ₃	S	enlace
2,085	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	S	C-H	N	enlace
2,086	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	S	C-H	N	enlace
2,087	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	S	C-H	N	enlace
2,088	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	S	C-H	N	enlace
2,089	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	S	C-CH ₃	N	enlace

ES 2 731 078 T3

Comp. N.º	G ₃	X	R ₁	A	R ₂	R ₄	L ₁	L ₂	L ₃	L ₄
2,090	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	S	C-CH ₃	N	enlace
2,091	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	S	C-CH ₃	N	enlace
2,092	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	S	C-CH ₃	N	enlace
2,093	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	S	C-CF ₃	N	enlace
2,094	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	S	C-CF ₃	N	enlace
2,095	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	S	C-CF ₃	N	enlace
2,096	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	S	C-CF ₃	N	enlace
2,097	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-H	C-CF ₃	N	enlace
2,098	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-H	C-CF ₃	N	enlace
2,099	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-H	C-CF ₃	N	enlace
2,100	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-H	C-CF ₃	N	enlace
2,101	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-H	C-CH ₃	N	enlace
2,102	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-H	C-CH ₃	N	enlace
2,103	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-H	C-CH ₃	N	enlace
2,104	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-H	C-CH ₃	N	enlace
2,105	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-H	CH	N	enlace
2,106	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-H	CH	N	enlace
2,107	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-H	CH	N	enlace
2,108	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-H	CH	N	enlace
2,109	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	CH	N	enlace
2,110	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	CH	N	enlace
2,111	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	CH	N	enlace

ES 2 731 078 T3

Comp. N.º	G ₃	X	R ₁	A	R ₂	R ₄	L ₁	L ₂	L ₃	L ₄
2,112	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	CH	N	enlace
2,113	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	C-CH ₃	N	enlace
2,114	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	C-CH ₃	N	enlace
2,115	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	C-CH ₃	N	enlace
2,116	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	C-CH ₃	N	enlace
2,117	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	C-CF ₃	N	enlace
2,118	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	C-CF ₃	N	enlace
2,119	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	C-CF ₃	N	enlace
2,120	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	C-CF ₃	N	enlace
2,121	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	CH	N-CH ₃	enlace
2,122	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	CH	N-CH ₃	enlace
2,123	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	CH	N-CH ₃	enlace
2,124	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	CH	N-CH ₃	enlace
2,125	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-CH ₃	N-CH ₃	enlace
2,126	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-CH ₃	N-CH ₃	enlace
2,127	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-CH ₃	N-CH ₃	enlace
2,128	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-CH ₃	N-CH ₃	enlace
2,129	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-CF ₃	N-CH ₃	enlace
2,130	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-CF ₃	N-CH ₃	enlace
2,131	N-CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-CF ₃	N-CH ₃	enlace
2,132	N-CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-CF ₃	N-CH ₃	Enlace
2,133	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH

ES 2 731 078 T3

Comp. N.º	G ₃	X	R ₁	A	R ₂	R ₄	L ₁	L ₂	L ₃	L ₄
2,134	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
2,135	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	SCF ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
2,136	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	SCF ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
2,137	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₂ C F ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
2,138	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₂ C F ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
2,139	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
2,140	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
2,141	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	SCF ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
2,142	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	SCF ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
2,143	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₂ C F ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
2,144	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₂ C F ₃	CH ₃	CH	CH	CH	CH
2,145	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	N	N-CH ₃	enlace
2,146	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	N	N-CH ₃	enlace
2,147	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	N-CH ₃	N	enlace
2,148	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	N-CH ₃	N	enlace
2,149	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	N	N-CH ₃	enlace
2,15	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	N	N-CH ₃	enlace
2,151	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	N-CH ₃	N	enlace
2,152	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	N-CH ₃	N	enlace
2,153	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	CH	CH	CH
2,154	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	CH	CH	CH
2,155	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	CH	CH	CH

ES 2 731 078 T3

Comp. N.º	G ₃	X	R ₁	A	R ₂	R ₄	L ₁	L ₂	L ₃	L ₄
2,156	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	CH	CH	CH
2,157	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	N	CH	CH
2,158	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	N	CH	CH
2,159	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	N	CH	CH
2,160	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	N	CH	CH
2,161	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	N	CH	Enlace
2,162	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	N	CH	Enlace
2,163	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	N	CH	Enlace
2,164	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	N	CH	Enlace
2,165	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	N-CH ₃	CH	Enlace
2,166	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	N-CH ₃	CH	Enlace
2,167	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	N-CH ₃	CH	Enlace
2,168	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	N-CH ₃	CH	Enlace
2,169	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	N-H	CH	Enlace
2,170	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	N-H	CH	Enlace
2,171	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	N-H	CH	Enlace
2,172	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	N-H	CH	Enlace
2,173	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	N	N-H	enlace
2,174	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	N	N-H	enlace
2,175	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	N	N-H	enlace
2,176	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	N	N-H	enlace
2,177	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	S	N	enlace

ES 2 731 078 T3

Comp. N.º	G ₃	X	R ₁	A	R ₂	R ₄	L ₁	L ₂	L ₃	L ₄
2,178	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	S	N	enlace
2,179	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	S	N	enlace
2,180	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	S	N	enlace
2,181	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	NH	N	enlace
2,182	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	NH	N	enlace
2,183	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	NH	N	enlace
2,184	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	NH	N	enlace
2,185	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	N-CH ₃	N	enlace
2,186	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	N-CH ₃	N	enlace
2,187	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	N-CH ₃	N	enlace
2,188	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	N-CH ₃	N	enlace
2,189	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	N	N-CH ₃	enlace
2,190	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	N	N-CH ₃	enlace
2,191	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	N	N-CH ₃	enlace
2,192	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	N	N-CH ₃	enlace
2,193	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	N	N	enlace
2,194	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	N	N	enlace
2,195	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	N	N	enlace
2,196	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	N	N	enlace
2,197	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	C-CF ₃	CH	CH
2,198	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	C-CF ₃	CH	CH
2,199	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	C-CF ₃	CH	CH

ES 2 731 078 T3

Comp. N.º	G ₃	X	R ₁	A	R ₂	R ₄	L ₁	L ₂	L ₃	L ₄
2,200	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	C-CF ₃	CH	CH
2,201	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	C-F	CH	CH
2,202	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	CH	C-F	CH	CH
2,203	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	C-F	CH	CH
2,204	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	CH	C-F	CH	CH
2,205	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-H	S	enlace
2,206	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-H	S	enlace
2,207	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-H	S	enlace
2,208	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-H	S	enlace
2,209	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-CH ₃	S	enlace
2,210	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-CH ₃	S	enlace
2,211	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-CH ₃	S	enlace
2,212	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-CH ₃	S	enlace
2,213	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-CF ₃	S	enlace
2,214	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-CF ₃	S	enlace
2,215	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-CF ₃	S	enlace
2,216	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-CF ₃	S	enlace
2,217	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	S	C-H	N	enlace
2,218	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	S	C-H	N	enlace
2,219	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	S	C-H	N	enlace
2,220	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	S	C-H	N	enlace
2,221	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	S	C-CH ₃	N	enlace

ES 2 731 078 T3

Comp. N.º	G ₃	X	R ₁	A	R ₂	R ₄	L ₁	L ₂	L ₃	L ₄
2,222	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	S	C-CH ₃	N	enlace
2,223	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	S	C-CH ₃	N	enlace
2,224	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	S	C-CH ₃	N	enlace
2,225	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	S	C-CF ₃	N	enlace
2,226	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	S	C-CF ₃	N	enlace
2,227	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	S	C-CF ₃	N	enlace
2,228	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	S	C-CF ₃	N	enlace
2,229	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-H	C-CF ₃	N	enlace
2,230	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-H	C-CF ₃	N	enlace
2,231	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-H	C-CF ₃	N	enlace
2,232	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-H	C-CF ₃	N	enlace
2,233	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-H	C-CH ₃	N	enlace
2,234	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-H	C-CH ₃	N	enlace
2,235	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-H	C-CH ₃	N	enlace
2,236	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-H	C-CH ₃	N	enlace
2,237	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-H	CH	N	enlace
2,238	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-H	CH	N	enlace
2,239	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-H	CH	N	enlace
2,240	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-H	CH	N	enlace
2,241	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	CH	N	enlace
2,242	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	CH	N	enlace
2,243	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	CH	N	enlace

ES 2 731 078 T3

Comp. N.º	G ₃	X	R ₁	A	R ₂	R ₄	L ₁	L ₂	L ₃	L ₄
2,244	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	CH	N	enlace
2,245	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	C-CH ₃	N	enlace
2,246	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	C-CH ₃	N	enlace
2,247	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	C-CH ₃	N	enlace
2,248	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	C-CH ₃	N	enlace
2,249	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	C-CF ₃	N	enlace
2,250	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	C-CF ₃	N	enlace
2,251	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	C-CF ₃	N	enlace
2,252	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N-CH ₃	C-CF ₃	N	enlace
2,253	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	CH	N-CH ₃	enlace
2,254	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	CH	N-CH ₃	enlace
2,255	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	CH	N-CH ₃	enlace
2,256	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	CH	N-CH ₃	enlace
2,257	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-CH ₃	N-CH ₃	enlace
2,258	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-CH ₃	N-CH ₃	enlace
2,259	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-CH ₃	N-CH ₃	enlace
2,260	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-CH ₃	N-CH ₃	enlace
2,261	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-CF ₃	N-CH ₃	enlace
2,262	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	C-H	CF ₃	CH ₃	N	C-CF ₃	N-CH ₃	enlace
2,263	N-CH ₂ CH ₃	S	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-CF ₃	N-CH ₃	enlace
2,264	N-CH ₂ CH ₃	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₃	N	C-CF ₃	N-CH ₃	enlace

y los N-óxidos y tautómeros de los compuestos de la Tabla 2.

Los compuestos de fórmula I de acuerdo con la invención son ingredientes activos preventivos y/o curativos valiosos

en el campo del control de plagas, incluso a bajas tasas de aplicación, que tienen un espectro biocida muy favorable y son bien tolerados por especies de sangre caliente, peces y plantas. Los principios activos de acuerdo con la invención actúan contra todas las fases de desarrollo o individuales de plagas de animales normalmente sensibles, pero también resistentes, tales como insectos o representantes del orden Acarina. La actividad insecticida o acaricida de los ingredientes activos de acuerdo con la invención puede manifestarse directamente, es decir, en la destrucción de las plagas, que tiene lugar inmediatamente o solo después de que haya transcurrido un tiempo, por ejemplo durante la ecdisis, o indirectamente, por ejemplo, en una tasa de oviposición y/o incubación reducida.

Ejemplos de las plagas de animales arriba mencionadas son:

del orden *Acarina*, por ejemplo,

Acalitus spp, *Aculus* spp, *Acaricalus* spp, *Aceria* spp, *Acarus* siro, *Amblyomma* spp., *Argas* spp., *Boophilus* spp., *Brevipalpus* spp., *Bryobia* spp, *Calipitimerus* spp., *Chorioptes* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Dermatophagoides* spp, *Eotetranychus* spp, *Eriophyes* spp., *Hemitarsonemus* spp, *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Olygonychus* spp, *Ornithodoros* spp., *Polyphagotarsonema latus*, *Panonychus* spp., *Phyllocoptura oleivora*, *Phytonemus* spp, *Polyphagotarsonemus* spp, *Psoroptes* spp., *Rhipicephalus* spp., *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., *Steneotarsonemus* spp, *Tarsonemus* spp. y *Tetranychus* spp.;

del orden *Anoplura*, por ejemplo,

Haematopinus spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Pemphigus* spp. y *Phylloxera* spp.;

del orden *Coleoptera*, por ejemplo,

Agriotes spp., *Amphimallon majale*, *Anomala orientalis*, *Anthonomus* spp., *Aphodius* spp, *Astylus atromaculatus*, *Ataenius* spp, *Atomaria linearis*, *Chaetocnema tibialis*, *Cerotoma* spp, *Conoderus* spp, *Cosmopolites* spp., *Cotinis nitida*, *Curculio* spp., *Cyclocephala* spp, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., *Diloboderus abderus*, *Epilachna* spp., *Eremnus* spp., *Heteronychus arator*, *Hypothenemus hampei*, *Lagria vilosa*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Lissorhoptrus* spp., *Liogenys* spp, *Maecolaspis* spp, *Maladera castanea*, *Megascelis* spp, *Melighetes aeneus*, *Melolontha* spp., *Myochrous armatus*, *Orycaephilus* spp., *Otiorynchus* spp., *Phyllophaga* spp, *Phlyctinus* spp., *Popillia* spp., *Psylliodes* spp., *Rhyssomatus aubtilis*, *Rhizopertha* spp., *Scarabeidae*, *Sitophilus* spp., *Sitotroga* spp., *Somaticus* spp, *Sphenophorus* spp, *Sternechus subsignatus*, *Tenebrio* spp., *Tribolium* spp. y *Trogoderma* spp.;

del orden *Diptera*, por ejemplo,

Aedes spp., *Anopheles* spp, *Antherigona soccata*, *Bactrocea oleae*, *Bibio hortulanus*, *Bradysia* spp, *Calliphora erythrocephala*, *Ceratitis* spp., *Chrysomyia* spp., *Culex* spp., *Cuterebra* spp., *Dacus* spp., *Delia* spp, *Drosophila melanogaster*, *Fannia* spp., *Gastrophilus* spp., *Geomyza tripunctata*, *Glossina* spp., *Hypoderma* spp., *Hyppobosca* spp., *Liriomyza* spp., *Lucilia* spp., *Melanagromyza* spp., *Musca* spp., *Oestrus* spp., *Orseolia* spp., *Oscinella frit*, *Pegomyia hyoscyami*, *Phorbia* spp., *Rhagoletis* spp, *Rivelia quadrifasciata*, *Scatella* spp, *Sciara* spp., *Stomoxys* spp., *Tabanus* spp., *Tannia* spp. y *Tipula* spp.;

del orden *Hemiptera*, por ejemplo,

Acanthocoris scabrator, *Acrosternum* spp, *Adelphocoris lineolatus*, *Amblypelta nitida*, *Bathycyba thalassina*, *Blissus* spp, *Cimex* spp., *Clavigralla tomentosicollis*, *Creontiades* spp, *Distantiella theobroma*, *Dichelops furcatus*, *Dysdercus* spp., *Edessa* spp, *Euchistus* spp., *Eurydema pulchrum*, *Eurygaster* spp., *Halyomorpha halys*, *Horcias nobilellus*, *Leptocoris* spp., *Lygus* spp, *Margarodes* spp, *Murgantia histrionica*, *Neomegalotomus* spp, *Nesidiocoris tenuis*, *Nezara* spp., *Nysius simulans*, *Oebalus insularis*, *Piesma* spp., *Piezodorus* spp, *Rhodnius* spp., *Sahlbergella singularis*, *Scaptocoris castanea*, *Scotinophara* spp. , *Thyanta* spp , *Triatoma* spp., *Vatiga illudens*;

Acyrtosium pisum, *Adalges* spp, *Agalliana ensigera*, *Agonoscaena targionii*, *Aleurodicus* spp, *Aleurocanthus* spp, *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus floccosus*, *Aleyrodes brassicae*, *Amarasca biguttula*, *Amritodus atkinsoni*, *Aonidiella* spp., *Aphididae*, *Aphis* spp., *Aspidiotus* spp., *Aulacorthum solani*, *Bactericera cockerelli*, *Bemisia* spp, *Brachycaudus* spp, *Brevicoryne brassicae*, *Cacopsylla* spp, *Cavariella aegopodii* Scop., *Ceroplaster* spp., *Chrysomphalus aonidium*, *Chrysomphalus dictyospermi*, *Cicadella* spp, *Cofana spectra*, *Cryptomyzus* spp, *Cicadulina* spp, *Coccus hesperidum*, *Dalbulus maidis*, *Dialeurodes* spp, *Diaphorina citri*, *Diuraphis noxia*, *Dysaphis* spp, *Empoasca* spp., *Eriosoma larigerum*, *Erythroneura* spp., *Gascardia* spp., *Glycaspis brimblecombei*, *Hyadaphis pseudobrassicae*, *Hyalopterus* spp, *Hyperomyzus pallidus*, *Idioscopus clypealis*, *Jacobiasca lybica*, *Laodelphax* spp., *Lecanium corni*, *Lepidosaphes* spp., *Lopaphis erysimi*, *Lyogenys maidis*, *Macrosiphum* spp., *Mahanarva* spp, *Metcalfa pruinosa*, *Metopolophium dirhodum*, *Myndus crudus*, *Myzus* spp., *Neotoxoptera* sp, *Nephotettix* spp., *Nilaparvata* spp., *Nippolachnus piri* Mats, *Odonaspis ruthae*, *Oregma lanigera* Zehnter, *Parabemisia myricae*, *Paratrioxa cockerelli*, *Parlatoria* spp., *Pemphigus* spp., *Peregrinus maidis*, *Perkinsiella* spp, *Phorodon humuli*, *Phylloxera* spp, *Planococcus* spp., *Pseudaulacaspis* spp., *Pseudococcus* spp., *Pseudatomoscelis seriatus*, *Psylla* spp., *Pulvinaria aethiopica*, *Quadraspidotus* spp., *Quesada gigas*, *Recilia dorsalis*, *Rhopalosiphum* spp., *Saissetia*

spp., Scaphoideus spp., Schizaphis spp., Sitobion spp., Sogatella furcifera, Spissistilus festinus, Tarophagus Proserpina, Toxoptera spp, Trialeurodes spp, Tridiscus sporoboli, Trionymus spp, Trioza erytreae , Unaspis citri, Zyginia flammigera, Zyginidia scutellaris;

5 del orden *Hymenoptera*, por ejemplo,

Acromyrmex, Arge spp, Atta spp., Cephus spp., Diprion spp., Diprionidae, Gilpinia polytoma, Hoplocampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Neodiprion spp., Pogonomyrmex spp, Slenopsis invicta, Solenopsis spp. y Vespa spp.;

10 del orden *Isoptera*, por ejemplo,

Coptotermes spp, Cornitermes cumulans, Incisitermes spp, Macrotermes spp, Mastotermes spp, Microtermes spp, Reticulitermes spp.; Solenopsis geminata

15 del orden *Lepidoptera*, por ejemplo,

Acleris spp., Adoxophyes spp., Aegeria spp., Agrotis spp., Alabama argillaceae, Amylois spp., Anticarsia gemmatilis, Archips spp., Argyresthia spp, Argyrotaenia spp., Autographa spp., Bucculatrix thurberiella, Busseola fusca, Cadra cautella, Carposina nipponensis, Chilo spp., Choristoneura spp., Chrysoteuchia topiaria, Clysia ambiguella, Cnaphalocrocis spp., Cnephasia spp., Cochylis spp., Coleophora spp., Colias lesbia, Cosmophila flava, Crambus spp, Crocidolomia binotalis, Cryptophlebia leucotreta, Cydalima perspectalis, Cydia spp., Diaphania perspectalis, Diatraea spp., Diparopsis castanea, Earias spp., Eldana saccharina, Ephestia spp., Epinotia spp, Estigmene acrea, Etiella zinckenella, Eucosma spp., Eupoecilia ambiguella, Euproctis spp., Euxoa spp., Feltia jaculiferia, Grapholita spp., Hedyia nubiferana, Heliothis spp., Hellula undalis, Herpetogramma spp, Hyphantria cunea, Keiferia lycopersicella, Lasmopalpus lignosellus, Leucoptera scitella, Lithocollethis spp., Lobesia botrana, Loxostege bifidalis, Lymantria spp., Lyonetia spp., Malacosoma spp., Mamestra brassicae, Manduca sexta, Mythimna spp, Noctua spp, Operophtera spp., Orniodes indica, Ostrinia nubilalis, Pammene spp., Pandemis spp., Panolis flammea, Papaipema nebris, Pectinophora gossypiella, Perileucoptera coffeella, Pseudaletia unipuncta, Phthorimaea operculella, Pieris rapae, Pieris spp., Plutella xylostella, Prays spp., Pseudoplusia spp, Rachiplusia nu, Richia albicosta, Scirpophaga spp., Sesamia spp., Sparganothis spp., Spodoptera spp., Sylepta derogate, Synanthedon spp., Thaumetopoea spp., Tortrix spp., Trichoplusia ni, Tuta absoluta, y Yponomeuta spp.;

35 del orden de los *malófagos*, por ejemplo,

Damalinea spp. y Trichodectes spp.;

del orden *Orthoptera*, por ejemplo,

40 Blatta spp., Blattella spp., Gryllotalpa spp., Leucophaea maderae, Locusta spp., Neocurtilla hexadactyla, Periplaneta spp. , Scapteriscus spp, y Schistocerca spp.;

del orden *Psocoptera*, por ejemplo

45 Liposcelis spp.;

del orden *Siphonaptera*, por ejemplo,

50 Ceratophyllus spp., Ctenocephalides spp. y Xenopsylla cheopis;

del orden de los tisanópteros, por ejemplo,

Calliothrips phaseoli, Frankliniella spp., Heliothrips spp, Hercinothrips spp., Parthenothrips spp, Scirtothrips aurantii, Sericothrips variabilis, Taeniothrips spp., Thrips spp;

55 del orden *Thysanura*, por ejemplo, Lepisma saccharina.

60 Los ingredientes activos de acuerdo con la invención pueden utilizarse para controlar, es decir, contener o destruir plagas del tipo arriba mencionado que se manifiestan particularmente en plantas, especialmente en plantas útiles y ornamentales en agricultura, en horticultura y en bosques, o en órganos, tales como frutos, flores, follaje, tallos, tubérculos o raíces de dichas plantas y, en algunos casos, incluso los órganos de las plantas que se forman posteriormente se mantienen protegidos contra estas plagas.

65 Cultivos diana adecuados son, en particular, cereales, tales como trigo, cebada, centeno, avena, arroz, maíz o sorgo; remolacha, tal como remolacha azucarera o forrajera; frutos, por ejemplo frutos de pepita, frutos de hueso o frutos blandos, tales como manzanas, peras, ciruelas, melocotones, almendras, cerezas o bayas, por ejemplo fresas, frambuesas o moras; cultivos leguminosos, tales como habas, lentejas, guisantes o soja; cultivos oleaginosos, tales como colza, mostaza, amapola, aceitunas, girasoles, coco, ricino, cacao o nueces molidas; cucurbitáceas, tales

como calabazas, pepinos o melones; plantas de fibra, tales como algodón, lino, cáñamo o yute; cítricos, tales como naranjas, limones, pomelos o mandarinas; verduras, tales como espinacas, lechugas, espárragos, coles, zanahorias, cebollas, tomates, patatas o pimientos; Lauraceae, tales como aguacate, Cinnamomum o alcanfor; y también tabaco, nueces, café, berenjenas, caña de azúcar, té, pimienta, vides, lúpulo, la familia de plátanos y plantas de látex.

5 Las composiciones y/o los métodos de la presente invención también se pueden utilizar en cualquier cultivo ornamental y/o vegetal, incluyendo flores, arbustos, árboles de hoja ancha y árboles de hoja perenne.

10 Por ejemplo, la invención se puede utilizar en cualquiera de las siguientes especies ornamentales: *Ageratum* spp., *Alonsoa* spp., *Anemone* spp., *Anisodonteia capensis*, *Anthemis* spp., *Antirrhinum* spp., *Aster* spp., *Begonia* spp. (p. ej. *B. elatior*, *B. semperflorens*, *B. tubéux*), *Bougainvillea* spp., *Brachycome* spp., *Brassica* spp. (ornamental), *Calceolaria* spp., *Capsicum annuum*, *Catharanthus roseus*, *Canna* spp., *Centaurea* spp., *Chrysanthemum* spp., *Cineraria* spp. (*C. maritime*), *Coreopsis* spp., *Crassula coccinea*, *Cuphea ignea*, *Dahlia* spp., *Delphinium* spp., *Dicentra spectabilis*, *Dorotheantus* spp., *Eustoma grandiflorum*, *Forsythia* spp., *Fuchsia* spp., *Geranium gnaphalium*, *Gerbera* spp., *Gomphrena globosa*, *Heliotropium* spp., *Helianthus* spp., *Hibiscus* spp., *Hortensia* spp., *Hydrangea* spp., *Hypoestes phyllostachya*, *Impatiens* spp. (*I. Walleriana*), *Iresines* spp., *Kalanchoe* spp., *Lantana camara*, *Lavatera trimestris*, *Leonotis leonurus*, *Lilium* spp., *Mesembryanthemum* spp., *Mimulus* spp., *Monarda* spp., *Nemesia* spp., *Tagetes* spp., *Dianthus* spp. (clavel), *Canna* spp., *Oxalis* spp., *Bellis* spp., *Pelargonium* spp. (*P. peltatum*, *P. Zonale*), *Viola* spp. (pensamiento), *Petunia* spp., *Phlox* spp., *Plecthranthus* spp., *Poinsettia* spp., *Parthenocissus* spp. (*P. quinquefolia*, *P. tricuspidata*), *Primula* spp., *Ranunculus* spp., *Rhododendron* spp., *Rosa* spp. (rosa), *Rudbeckia* spp., *Saintpaulia* spp., *Salvia* spp., *Scaevola aemola*, *Schizanthus wisetonensis*, *Sedum* spp., *Solanum* spp., *Surfinia* spp., *Tagetes* spp., *Nicotinia* spp., *Verbena* spp., *Zinnia* spp. y otras plantas de jardín.

25 Por ejemplo, la invención se puede utilizar en cualquiera de las siguientes especies de hortalizas: *Allium* spp. (*A. sativum*, *A. cepa*, *A. oschaninii*, *A. Porrum*, *A. ascalonicum*, *A. fistulosum*), *Anthriscus cerefolium*, *Apium graveolus*, *Asparagus officinalis*, *Beta vulgaris*, *Brassica* spp. (*B. Oleracea*, *B. Pekinensis*, *B. rapa*), *Capsicum annuum*, *Cicer arietinum*, *Cichorium endivia*, *Cichorium* spp. (*C. intybus*, *C. endivia*), *Citrullus lanatus*, *Cucumis* spp. (*C. sativus*, *C. melo*), *Cucurbita* spp. (*C. pepo*, *C. maxima*), *Cyanara* spp. (*C. scolymus*, *C. cardunculus*), *Daucus carota*, *Foeniculum vulgare*, *Hypericum* spp., *Lactuca sativa*, *Lycopersicon* spp. (*L. esculentum*, *L. lycopersicum*), *Mentha* spp., *Ocimum basilicum*, *Petroselinum crispum*, *Phaseolus* spp. (*P. vulgaris*, *P. coccineus*), *Pisum sativum*, *Raphanus sativus*, *Rheum rhaponticum*, *Rosemarinus* spp., *Salvia* spp., *Scorzonera hispanica*, *Solanum melongena*, *Spinacea oleracea*, *Valerianella* spp. (*V. locusta*, *V. eriocarpa*) y *Vicia faba*.

35 Especies ornamentales preferidas incluyen violeta africana, *Begonia*, *Dahlia*, *Gerbera*, *Hydrangea*, *Verbena*, *Rosa*, *Kalanchoe*, *Poinsettia*, *Aster*, *Centaurea*, *Coreopsis*, *Delphinium*, *Monarda*, *Phlox*, *Rudbeckia*, *Sedum*, *Petunia*, *Viola*, *Impatiens*, *Geranium*, *Chrysanthemum*, *Ranunculus*, *Fuchsia*, *Salvia*, *Hortensia*, romero, salvia, St. Johnswort, menta, pimienta, tomate y pepino.

40 Los ingredientes activos de acuerdo con la invención son especialmente adecuados para controlar *Aphis craccivora*, *Diabrotica balteata*, *Heliothis virescens*, *Myzus persicae*, *Plutella xylostella* y *Spodoptera littoralis* en cultivos de algodón, verduras, maíz, arroz y soja. Los ingredientes activos de acuerdo con la invención además son especialmente adecuados para controlar *Mamestra* (preferentemente en hortalizas), *Cydia pomonella* (preferentemente en manzanas), *Empoasca* (preferentemente en hortalizas, viñas), *Leptinotarsa* (preferentemente en patatas) y *Chilo suppressalis* (preferentemente en arroz).

45 En un aspecto adicional, la invención también puede referirse a un método para controlar el daño a la planta y a sus partes por nematodos fitoparásitos (nematodos endoparasítico, semiendoparasíticos y ectoparasíticos), especialmente nematodos fitoparásitos tales como nematodos de nudo de la raíz, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica*, *Meloidogyne arenaria* y otras especies de *Meloidogyne*; nematodos formadores de quistes, *Globodera rostochiensis* y otras especies de *Globodera*; *Heterodera avenae*, *Heterodera glycines*, *Heterodera schachtii*, *Heterodera trifolii* y otras especies de *Heterodera*; nematodos de la vesícula biliar, especies de *Anguina*; Nematodos del tallo y foliares, especies de *Aphelenchoides*; nematodos sting, *Belonolaimus longicaudatus* y otras especies de *Belonolaimus*; nematodos del pino, *Bursaphelenchus xylophilus* y otras especies de *Bursaphelenchus*; nematodos de anillo, especies de *Criconema*, especies de *Criconemella*, especies de *Criconemoides*, especies de *Mesocriconema*; nematodos del tallo y del bulbo, *Ditylenchus destructor*, *Ditylenchus dipsaci* y otras especies de *Ditylenchus*; nematodos de perlas, especies de *Dolichodorus*; nematodos espirales, *Helicotylenchus multicinctus* y otras especies de *Helicotylenchus*; nematodos de la vaina y de la vaina cuticular, especies de *Hemicycliophora* y especies de *Hemicriconemoides*; especies de *Hirshmanniella*; nematodos de lanza, especies de *Hoploaimus*; falsos nematodos del nudo de la raíz, especies de *Nacobbus*; nematodos de aguja, *Longidorus elongatus* y otras especies de *Longidorus*; nematodos pin, especies de *Pratylenchus*; nematodos de la lesión, *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus curvatus*, *Pratylenchus goodeyi* y otras especies de *Pratylenchus*; nematodos barrenadores, *Radopholus similis* y otras especies de *Radopholus*; nematodos reniformes, *Rotylenchus robustus*, *Rotylenchus reniformis* y otras especies de *Rotylenchus*; especies de *Scutellonema*; nematodos de raíz rechoncha, *Trichodorus primitivus* y otras especies de *Trichodorus*, especies de *Paratrichodorus*; nematodos dobles, *Tylenchorhynchus claytoni*, *Tylenchorhynchus dubius* y otras especies de *Tylenchorhynchus*; nematodos de cítricos, especies de *Tylenchulus*; nematodos daga, especies de *Xiphinema*; y

otras especies de nematodos parásitos de plantas, tales como *Subanguina* spp., *Hypsoperine* spp., *Macroposthonia* spp., *Melinius* spp., *Punctodera* spp., y *Quinisulcius* spp..

Los compuestos de la invención también pueden tener actividad contra los moluscos. Ejemplos de los cuales incluyen, por ejemplo, Ampullariidae; *Arion* (*A. ater*, *A. circumscriptus*, *A. hortensis*, *A. rufus*); Bradybaenidae (*Bradybaena fruticum*); *Cepaea* (*C. hortensis*, *C. Nemoralis*); ochlodina; *Deroceras* (*D. agrestis*, *D. empiricum*, *D. laeve*, *D. reticulatum*); *Discus* (*D. rotundatus*); *Euomphalia*; *Galba* (*G. trunculata*); *Helicella* (*H. itala*, *H. obvia*); *Helicidae* *Helicigona arbustorum*); *Helicodiscus*; *Helix* (*H. aperta*); *Limax* (*L. cinereoniger*, *L. flavus*, *L. marginatus*, *L. maximus*, *L. tenellus*); *Lymnaea*; *Milax* (*M. gagates*, *M. marginatus*, *M. sowerbyi*); *Opeas*; *Pomacea* (*P. canaticulata*); *Vallonia* y *Zanitoides*

El término "cultivos" debe entenderse que incluye también plantas de cultivo que se han transformado de este modo mediante el uso de técnicas de ADN recombinante que son capaces de sintetizar una o más toxinas de acción selectiva, tales como las conocidas, por ejemplo, a partir de bacterias productoras de toxinas, especialmente las del género *Bacillus*.

Las toxinas que pueden ser expresadas por tales plantas transgénicas incluyen, por ejemplo, proteínas insecticidas, por ejemplo, proteínas insecticidas de *Bacillus cereus* o *Bacillus popilliae*; o proteínas insecticidas de *Bacillus thuringiensis* tales como δ -endotoxinas, p. ej., *Cry1Ab*, *Cry1Ac*, *Cry1F*, *Cry1Fa2*, *Cry2Ab*, *Cry3A*, *Cry3Bb1* o *Cry9C*, o proteínas insecticidas vegetativas (*Vip*), p. ej., *Vip1*, *Vip2*, *Vip3* o *Vip3A*; o proteínas insecticidas de bacterias que colonizan nematodos, por ejemplo, *Photorhabdus* spp. o *Xenorhabdus* spp., tales como *Photorhabdus luminescens*, *Xenorhabdus nematophilus*; toxinas producidas por animales tales como toxinas de escorpiones, toxinas de arácnidos, toxinas de avispas y otras neurotoxinas específicas de insectos; toxinas producidas por hongos tales como toxinas de estreptomicetos, lectinas vegetales tales como lectinas de guisantes, lectinas de cebada o lectinas de la campanilla de invierno; aglutininas; inhibidores de proteinasas tales como inhibidores de la tripsina, inhibidores de la serina proteasa, inhibidores de la patatina, cistatina, papaína; proteínas que inactivan ribosomas (RIP) tales como ricina, RIP del maíz, abrina, lufina, saporina o briodina; enzimas que participan en el metabolismo de esteroides tales como 3-hidroxiesteroidoxidasa, ecdiesteroido-UDP-glicosil-transferasa, colesterol-oxidasas, inhibidores de la ecdisona, HMG-COA-reductasa, bloqueadores de los canales iónicos tales como los bloqueadores de los canales de sodio o calcio, esterasa de la hormona juvenil, receptores de hormonas diuréticas, estilbeno-sintasa, bibencilo-sintasa, quitinasas y glucanasas.

En el contexto de la presente invención, debe entenderse por δ -endotoxinas, por ejemplo, *Cry1Ab*, *Cry1Ac*, *Cry1F*, *Cry1Fa2*, *Cry2Ab*, *Cry3A*, *Cry3Bb1* o *Cry9C*, o proteínas insecticidas vegetativas (*Vip*), por ejemplo *Vip1*, *Vip2*, *Vip3* o *Vip3A*, expresamente también toxinas híbridas, toxinas truncadas y toxinas modificadas. Las toxinas híbridas se producen de manera recombinante mediante una nueva combinación de diferentes dominios de esas proteínas (véase, por ejemplo, el documento WO 02/15701). Se conocen toxinas truncadas, por ejemplo una *Cry1Ab* truncada. En el caso de las toxinas modificadas, se reemplazan uno o más aminoácidos de la toxina que se produce de forma natural. En tales reemplazos de aminoácidos preferiblemente se insertan secuencias de reconocimiento de proteasas no presentes de forma natural en la toxina, tal como, por ejemplo, en el caso de *Cry3A055*, una secuencia de reconocimiento de catepsina-G se inserta en una toxina *Cry3A* (véase el documento WO 03/018810).

Ejemplos de tales toxinas o plantas transgénicas capaces de sintetizar tales toxinas se describen, por ejemplo, en los documentos EP-A-0 374 753, WO 93/07278, WO 95/34656, EP-A-0 427 529, EP-A-451 878 y WO 03/052073.

Los procedimientos para la preparación de tales plantas transgénicas son generalmente conocidos por la persona experta en la técnica y se describen, por ejemplo, en las publicaciones arriba mencionadas. Los ácidos desoxirribonucleicos de tipo *Cry1* y su preparación se describen, por ejemplo, en los documentos WO 95/34656, EP-A-0 367 474, EP-A-0 401 979 y WO 90/13651.

La toxina contenida en las plantas transgénicas imparte a las plantas tolerancia a los insectos dañinos. Insectos de este tipo pueden aparecer en cualquier grupo taxonómico de insectos, pero habitualmente se encuentran especialmente en los escarabajos (coleópteros), insectos de dos alas (dípteros) y polillas (lepidópteros).

Se conocen plantas transgénicas que contienen uno o más genes que codifican una resistencia insecticida y expresan una o más toxinas y algunas de ellas están disponibles comercialmente. Ejemplos de plantas de este tipo son: *YieldGard*[®] (variedad de maíz que expresa una toxina *Cry1Ab*); *YieldGard Rootworm*[®] (variedad de maíz que expresa una toxina *Cry3Bb1*); *YieldGard Plus*[®] (variedad de maíz que expresa una toxina *Cry1Ab* y una toxina *Cry3Bb1*); *Starlink*[®] (variedad de maíz que expresa una toxina *Cry9C*); *Herculex I*[®] (variedad de maíz que expresa una toxina *Cry1Fa2* y la enzima fosfinotricina N-acetiltransferasa (PAT) para lograr tolerancia al herbicida glufosinato amonio); *NuCOTN 33B*[®] (variedad de algodón que expresa una toxina *Cry1Ac*); *Bollgard I*[®] (variedad de algodón que expresa una toxina *Cry1Ac*); *Bollgard II*[®] (variedad de algodón que expresa una toxina *Cry1Ac* y una toxina *Cry2Ab*); *VipCot*[®] (variedad de algodón que expresa una toxina *Vip3A* y una toxina *Cry1Ab*); *NewLeaf*[®] (variedad de patata que expresa una toxina *Cry3A*); *NatureGard*[®], *Agrisure*[®] GT Advantage (rasgo tolerante a GA21

glifosato), Agrisure® CB Advantage (rasgo Bt11 del taladrador de maíz (CB)) y Protecta®.

Ejemplos adicionales de cultivos transgénicos de este tipo son:

5 1 **Bt11 Maize** de Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, Francia, número de registro C/FR/96/05/10. *Zea mays* modificado genéticamente que se ha vuelto resistente al ataque del barrenador del maíz europeo (*Ostrinia nubilalis* y *Sesamia nonagrioides*) por expresión transgénica de una toxina Cry1Ab truncada. El maíz Bt11 también expresa transgénicamente la enzima PAT para lograr tolerancia al herbicida glufosinato de amonio.

10 2 **Bt176 Maize** de Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, Francia, número de registro C/FR/96/05/10. *Zea mays* modificado genéticamente que se ha vuelto resistente al ataque del barrenador del maíz europeo (*Ostrinia nubilalis* y *Sesamia nonagrioides*) por expresión transgénica de una toxina Cry1Ab. El maíz Bt176 también expresa transgénicamente la enzima PAT para lograr tolerancia al herbicida glufosinato de amonio.

15 3 **MIR604 Maize** de Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, Francia, número de registro C/FR/96/05/10. Maíz que se ha vuelto resistente a los insectos mediante la expresión transgénica de una toxina Cry3A modificada. Esta toxina es Cry3A055, modificada mediante la inserción de una secuencia de reconocimiento de catepsina-G-proteasa. La preparación de plantas de maíz transgénicas de este tipo se describe en el documento WO 03/018810.

20 4 **MON 863 Maize** de Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Bruselas, Bélgica, número de registro C/DE/02/9. MON 863 expresa una toxina Cry3Bb1 y tiene resistencia a determinados insectos coleópteros.

25 5. **IPC 531 Cotton** de Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Bruselas, Bélgica, número de registro C/ES/96/02.

30 6 **1507 Maize** de Pioneer Overseas Corporation, Avenue Tedesco, 7 B-1160 Bruselas, Bélgica, número de registro C/NL/00/10. Maíz modificado genéticamente para la expresión de la proteína Cry1F para lograr resistencia a determinados insectos lepidópteros y de la proteína PAT para lograr tolerancia al herbicida glufosinato de amonio.

35 7 **NK603 x MON 810 Maize** de Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Bruselas, Bélgica, número de registro C/GB/02/M3/03. Consiste en variedades híbridas de maíz cultivadas convencionalmente cruzando las variedades genéticamente modificadas NK603 y MON 810. El maíz NK603 x MON 810 expresa transgénicamente la proteína CP4 EPSPS, obtenida de la cepa CP4 de *Agrobacterium sp.*, la cual confiere tolerancia al herbicida Roundup® (contiene glifosato), y también expresa una toxina Cry1Ab obtenida a partir de *Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*, la cual proporciona tolerancia a determinados lepidópteros, incluido el barrenador del maíz europeo.

40 Cultivos transgénicos de plantas resistentes a los insectos se describen también en BATS (Centro para la Bioseguridad y Sustentabilidad, Centro de BATS, Clarastrasse 13, 4058 Basilea, Suiza) Informe 2003, (<http://bats.ch>)

45 Se debe sobreentender que el término "cultivos" también incluye plantas cultivadas que han sido transformadas mediante el uso de técnicas de ADN recombinante de tal forma que son capaces de sintetizar sustancias antipatógenas que tienen una acción selectiva, tales como, por ejemplo, las denominadas "proteínas relacionadas con la patogénesis" (PRP, véase, p. ej., el documento EP-A-0 392 225). Ejemplos de estas sustancias antipatógenas y de plantas transgénicas capaces de sintetizar estas sustancias antipatógenas se conocen, por ejemplo, de los documentos EP-A-0 392 225, WO 95/33818 y EP-A-0 353 191. Los métodos de producir plantas transgénicas de este tipo son generalmente conocidos por la persona experta en la técnica y se describen, por ejemplo, en las publicaciones arriba mencionadas.

50 Los cultivos también pueden modificarse para resistencia mejorada a patógenos fúngicos (por ejemplo, Fusarium, Antracnosis o Phytophthora), bacterianos (por ejemplo Pseudomonas) o virales (por ejemplo, virus del enrollamiento de la hoja de la patata, virus del marchitamiento manchado por el tomate, virus del mosaico del pepino).

55 Los cultivos también incluyen aquellos que tienen una resistencia potenciada a los nematodos tal como el nematodo del quiste de la soja.

60 Los cultivos que son tolerantes al estrés abiótico incluyen aquellos que tienen tolerancia mejorada a la sequía, alto contenido de sal, alta temperatura, frío, helada o radiación de luz, por ejemplo, a través de la expresión de NF-YB u otras proteínas conocidas en la técnica.

65 Sustancias antipatógenas que pueden ser expresadas por tales plantas transgénicas incluyen, por ejemplo, bloqueadores de canales de iones, tales como bloqueadores de canales de sodio y calcio, por ejemplo, las toxinas víricas KP1, KP4 o KP6; estilbeno-sintasas; bibencil-sintasas; quitinasas; glucanasas; las denominadas "proteínas

relacionadas con la patogénesis" (PRP; véase, p. ej., el documento EP-A-0 392 225); sustancias antipatógenas producidas por microorganismos, por ejemplo, antibióticos peptídicos o antibióticos heterocíclicos (véase, p. ej., el documento WO 95/33818) o factores proteicos o polipeptídicos implicados en la defensa de la planta contra patógenos (los denominados "genes de resistencia a enfermedades de plantas", tal como se describe en el documento WO 03/000906).

Otras áreas de uso de las composiciones de acuerdo con la invención son la protección de mercancías almacenadas y almacenes y la protección de materias primas, tales como madera, textiles, revestimientos de suelos o edificios, y también en el sector de la higiene, especialmente la protección de seres humanos, animales domésticos y ganado productivo contra plagas del tipo mencionado.

La presente invención también proporciona un método para controlar plagas (tales como mosquitos y otros vectores de enfermedades, véase también http://www.who.int/malaria/vector_control/irs/en/). En una realización, el método para controlar plagas comprende aplicar las composiciones de la invención a las plagas diana, a su locus o a una superficie o sustrato con brocha, con rodillo, mediante pulverización, difusión o inmersión. A modo de ejemplo, el método de la invención contempla una aplicación de IRS (rociado residual interior) de una superficie tal como una pared, techo o superficie del suelo. En otra realización, se contempla la aplicación de dichas composiciones a un sustrato tal como un material de tipo tela o no tejido en forma de (o que puede emplearse para elaborar) mallas, ropa, ropa de cama, cortinas y tiendas de campaña. Un objeto adicional de la invención es, por lo tanto, un sustrato seleccionado de material no tejido y tejido que comprende una composición que contiene un compuesto de fórmula I.

En una realización, el método para controlar plagas de este tipo comprende aplicar una cantidad plaguicidamente efectiva de las composiciones de la invención a las plagas diana, a su locus, o a una superficie o sustrato para proporcionar una actividad plaguicida residual efectiva sobre la superficie o sustrato. Dicha aplicación se puede realizar mediante brocha, rodillo, pulverización, dispersión o inmersión de la composición plaguicida de la invención. A modo de ejemplo, el método de la invención contempla una aplicación de IRS de una superficie tal como una pared, techo o superficie del suelo, con el fin de proporcionar actividad plaguicida residual efectiva sobre la superficie. En otra realización, se contempla la aplicación de dichas composiciones para el control residual de plagas en un sustrato tal como un material de tipo tejido en forma de (o que puede emplearse para elaborar) mallas, ropa, ropa de cama, cortinas y tiendas de campaña.

Los sustratos, incluidos los materiales tela no tejida, tejidos o mallas, que se han de tratar pueden estar hechos de fibras naturales tales como algodón, rafia, yute, lino, sisal, arpillera o lana, o fibras sintéticas tales como poliamida, poliéster, polipropileno, poliacrilonitrilo o similares. Los poliésteres son particularmente adecuados. Los métodos de tratamiento textil se describen, por ejemplo, en los documentos WO 2008/151984, WO 2003/034823, US 5631072, WO 2005/64072, WO 2006/128870, EP 1724392, WO2005113886 o WO 2007/090739.

Otras áreas de uso de las composiciones de acuerdo con la invención son el campo de la inyección de árboles/tratamiento de troncos para todos los árboles ornamentales, así como todo tipo de árboles de frutos secos y frutales.

En el campo de la inyección de árboles/tratamiento de troncos, los compuestos de acuerdo con la presente invención son especialmente adecuados para combatir los insectos barrenadores de la madera del orden *Lepidoptera*, tal como se menciona anteriormente, y del orden *Coleoptera*, especialmente para combatir los barrenadores de la madera que figuran en las siguientes tablas A y B:

Tabla A. Ejemplos de barrenadores de la madera exóticos importantes desde un punto de vista económico.

Familia	Especie	Huésped o Cultivo Infestado
Buprestidae	<i>Agilus planipennis</i>	Fresno
Cerambycidae	<i>Anoplura glabripennis</i>	Maderas duras
Scolytidae	<i>Xylosandrus crassiusculus</i>	Maderas duras
	<i>X. mutilatus</i>	Maderas duras
	<i>Tomicus piniperda</i>	Coníferas

Tabla A. Ejemplos de barrenadores de la madera nativos importantes desde un punto de vista económico.

Familia	Especie	Huésped o Cultivo Infestado
Buprestidae	<i>Agilus anxius</i>	Abedul
	<i>Agilus politus</i>	Sauce, Arce
	<i>Agilus sayi</i>	Arrayán, Helecho
	<i>Agilus vittaticollis</i>	Manzana, Pera, Arándano rojo, Amelanchier, Espino blanco
	<i>Chrysobothris femorata</i>	Manzana, Albaricoque, Haya, Arce

ES 2 731 078 T3

Familia	Especie	Huésped o Cultivo Infestado
		negundo, Cereza, Castaña, Grosella, Olmo, Espino blanco, Almez, Nogal americano, Castaño de Indias, Tilo, Arce, Fresno de Montaña, Roble, Pecán, Pera, Melocotón, Caqui, Ciruela, Álamo, Membrillo, Ciclamor, Amelanchier, Sicomoro, Nuez, Sauce
	<i>Texania campestris</i>	Tilo, Haya, Arce, Roble, Sicómoro, Sauce, Chopo amarillo,
Cerambycidae	<i>Goes pulverulentus</i>	Haya, Olmo, Roble rojo, Roble negro, Roble cereza, Roble de agua, Sicómoro
	<i>Goes tigrinus</i>	Roble
	<i>Neoclytus acuminatus</i>	Fresno, Nogal americano, Roble, Nogal, Abedul, Haya, Arce, Carpe lupulino del este, Cornejo, Caqui, Ciclamor, Acebo, Almez, Falsa Acacia, Acacia de tres espinas, Álamo amarillo, Castaño, Naranja de Luisiana, Sassafras, Lila, Caoba de la montaña, Peral, Cerezo, Ciruelo, Melocotonero, Manzano, Olmo, Tilo americano, Liquidámbar
	<i>Neoptychodes trilineatus</i>	Higuera, Aliso, Morera, Sauce, Almez
	<i>Oberea ocellata</i>	Zumaque, Manzano, Melocotonero, Ciruelo, Peral, Grosella, Mora
	<i>Oberea tripunctata</i>	Cornejo, Viburnum, Olmo, Oxidandro, Arándano azul, Rododendro, Azaleas, Laurel, Álamo, Sauce, Mora
	<i>Oncideres cingulata</i>	Nogal americano, Pecán, Caqui, Olmo, Oxidandro, Tilo, Acacia de tres espinas, Cornejo, Eucalipto, Roble, Almez americano, Arce, Frutales
	<i>Saperda calcarata</i>	Chopo
Scolytidae	<i>Corthylus columbianus</i>	Arce, Roble, Chopo amarillo, Haya, Acer negundo, Sicomoro, Abedul, Tilo, Castaño, Olmo
	<i>Dendroctonus frontalis</i>	Pino
	<i>Dryocoetes betulae</i>	Abedul, Liquidámbar, Cerezo salvaje, Haya, Peral
	<i>Monarthrum fasciatum</i>	Roble, Arce, Abedul, Castaño, Liquidámbar, Tupelo, Álamo, Nogal americano, Mimosa, Manzano, Melocotonero, Pino
	<i>Phloeotribus liminaris</i>	Melocotonero, Cerezo, Ciruelo, Cerezo negra, Olmo, Mora, Fresno de montaña
	<i>Pseudopityophthorus pruinosus</i>	Roble, Haya Americana, Cerezo negra, Ciruelo Chickasaw, Castaño, Arce, Nogal americano, Carpes, Carpe lupulino
Sesiidae	<i>Paranthrene simulans</i>	Roble, Castaño americano
	<i>Sannina uroceriformis</i>	Caqui
	<i>Synanthedon exitiosa</i>	Melocotonero, Ciruelo, Nectarino, Cerezo, Albaricoquero, Almendro, Cerezo negro
	<i>Synanthedon pictipes</i>	Melocotonero, Ciruelo, Cerezo, Haya, Cerezo negro
	<i>Synanthedon rubrofascia</i>	Nyssa
	<i>Synanthedon scitula</i>	Cornejo, Pecan, Nogal americano, Roble, Castaño, Haya, Abedul, Cerezo negro, Olmo, Fresno de montaña, Viburnum, Sauce, Manzano, Níspero, Ninebark, Arrayán
	<i>Vitacea polistiformis</i>	Vid

5 La presente invención también puede utilizarse para controlar cualquier plaga de insectos que pueda estar presente en el césped, incluidos, por ejemplo, escarabajos, orugas, hormigas rojas, perlas del suelo, milpiés, chinches, ácaros, grillos topo, insectos escama, garrapatas harinosas, chicharritas, chinches australes y larvas blancas. La presente invención se puede utilizar para controlar plagas de insectos en diversas etapas de su ciclo de vida, que incluyen huevos, larvas, ninfas y adultos.

10 En particular, la presente invención se puede utilizar para controlar plagas de insectos que se alimentan de las raíces de césped, incluyendo larvas blancas (tales como *Cyclocephala* spp. (p. ej. abejorro enmascarado, *C. lurida*), *Rhizotrogus* spp. (p. ej., abejorro europeo, *R. majalis*), *Cotinus* spp. (p. ej., escarabajo verde de junio, *C. nitida*), *Popillia* spp. (p. ej., escarabajo japonés, *P. japonica*), *Phyllophaga* spp. (p. ej., escarabajo de majo/junio), *Ataenius* spp. (p. ej., ataenius negro del césped, *A. spretulus*), *Maladera* spp. (p. ej., escarabajo asiático del jardín, *M. castanea*) y *Tomarus* spp.), perlas del suelo (*Margarodes* spp.), grillos topo (leonados, del sur y de alas cortas; *Scapteriscus* spp., *Grylotalpa africana*) y típulas (mosca grúa europea, *Tipula* spp.).

15 La presente invención también se puede utilizar para controlar plagas de insectos del césped que habitan en la paja, incluyendo gusanos cogolleros (tales como el cogollero del maíz *Spodoptera frugiperda*, y gusano cogollero común *Pseudaletia unipuncta*), gusanos cortadores, chinches (*Sphenophorus* spp., tales como *S. venatus verstitus* y *S. parvulus*) y gusanos de tela (tales como *Crambus* spp. y el gusano de tela tropical, *Herpetogramma phaeopteralis*).

20 La presente invención también se puede utilizar para controlar plagas de insectos del césped que viven por encima del suelo y se alimentan de las hojas del césped, incluyendo chinches verdaderos *Blissus insularis*, ácaro de hierba Bermuda (*Eriophyes cynodoniensis*), cochinilla de pasto rhodes (*Antonina graminis*), splipbug de dos líneas (*Prospapia bicincta*), chicharritas, gusanos cortadores (*Noctuidae* family) e insectos verdes.

25 La presente invención también se puede utilizar para controlar otras plagas del césped tales como hormigas fuego rojas importadas (*Solenopsis invicta*) que crean montículos de hormigas en el césped.

30 En el sector de la higiene, las composiciones de acuerdo con la invención son activas contra ectoparásitos tales como garrapatas duras, garrapatas blandas, ácaros de la sarna, ácaros de cosechas, moscas (picadoras y chupadoras), larvas de moscas parasitarias, piojos, piojos de pelo, piojos de aves y pulgas.

Ejemplos de parásitos de este tipo son:

35 Del orden Anoplurida: *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp. y *Phtirus* spp., *Solenopotes* spp..

Del orden Mallophagida: *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp. y *Felicola* spp..

40 Del orden Diptera y de los subórdenes Nematocera and Brachycera, por ejemplo *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp., *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides* spp., *Chrysops* spp., *Hybomitra* spp., *Atylotus* spp., *Tabanus* spp., *Haematopota* spp., *Philipomyia* spp., *Braula* spp., *Musca* spp., *Hydrotaea* spp., *Stomoxys* spp., *Haematobia* spp., *Morellia* spp., *Fannia* spp., *Glossina* spp., *Calliphora* spp., *Lucilia* spp., *Chrysomyia* spp., *Wohlfahrtia* spp., *Sarcophaga* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Gasterophilus* spp., *Hippobosca* spp., *Lipoptena* spp. y *Melophagus* spp..

45 Del orden *Siphonaptera*, por ejemplo, *Pulex* spp., *Ctenocephalides* spp., *Xenopsylla* spp., *Ceratophyllus* spp.

Del orden *Heteroptera*, por ejemplo, *Cimex* spp., *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp.

50 Del orden de los blatarios, por ejemplo, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blattelagermanica* y *Supella* spp.

55 De la subclase *Acaria* (*Acarida*) y de los órdenes *Meta-* y *Meso-stigmata*, por ejemplo, *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., *Ixodes* spp., *Amblyomma* spp., *Boophilus* spp., *Dermacentor* spp., *Haemophysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Rhipicephalus* spp., *Dermanyssus* spp., *Raillietia* spp., *Pneumonyssus* spp., *Sternostoma* spp. y *Varroa* spp..

60 De los órdenes *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., *Choriopetes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp. y *Laminosioptes* spp..

Las composiciones de acuerdo con la invención también son adecuadas para la protección contra la infestación de insectos en el caso de materiales tales como madera, textiles, plásticos, adhesivos, pegamentos, pinturas, papel y cartulina, cuero, revestimientos de suelos y edificios.

65 Las composiciones de acuerdo con la invención se pueden utilizar, por ejemplo, contra las siguientes plagas: escarabajos, tales como *Hylotrupes bajulus*, *Chlorophorus pilosis*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufvillosum*,

Ptilinuspecticornis, Dendrobium pertinex, Ernobius mollis, Priobium carpini, Lyctus brunneus, Lyctus africanus, Lyctus planicollis, Lyctus linearis, Lyctus pubescens, Trogoxylon aequale, Minthesrugicollis, Xyleborus spec., Tryptodendron spec., Apate monachus, Bostrychus capucins, Heterobostrychus brunneus, Sinoxylon spec. y Dinoderus minutus y también himenópteros tales como Sirex juvencus, Urocerus gigas, Urocerus gigas taignus y Urocerus augur, y termitas, tales como Kaloterme flavicollis, Cryptoterme brevis, Heteroterme indicola, Reticuliterme flavipes, Reticuliterme santonensis, Reticuliterme lucifugus, Mastoterme darwiniensis, Zootermopsis nevadensis y Coptoterme formosanus, y colas de cerdas tales como Lepisma saccharina.

Los compuestos de acuerdo con la invención se pueden utilizar como agentes plaguicidas en forma no modificada, pero generalmente se formulan en composiciones de diversas maneras utilizando adyuvantes de formulación, tales como soportes, disolventes y sustancias tensioactivas. Las formulaciones pueden estar en diversas formas físicas, p. ej. en forma de polvos secantes, geles, polvos humectables, gránulos dispersables en agua, tabletas dispersables en agua, gránulos efervescentes, concentrados emulsionables, concentrados microemulsionables, emulsiones de aceite en agua, compuestos fluidos de aceite, dispersiones acuosas, dispersiones oleosas, suspo-emulsiones, suspensiones de cápsulas, gránulos emulsionables, líquidos solubles, concentrados solubles en agua (con agua o un disolvente orgánico miscible en agua como soporte), películas de polímero impregnadas o en otras formas conocidas, p. ej. del Manual sobre Desarrollo y Uso de las Especificaciones de la FAO y la OMS para Plaguicidas, Naciones Unidas, Primera edición, Segunda revisión (2010). Formulaciones de este tipo pueden utilizarse directamente o diluirse antes de su uso. Las diluciones se pueden hacer, por ejemplo, con agua, fertilizantes líquidos, micronutrientes, organismos biológicos, aceites o disolventes.

Las formulaciones se pueden preparar, p. ej., mezclando el ingrediente activo con los adyuvantes de la formulación para obtener composiciones en forma de sólidos finamente divididos, gránulos, soluciones, dispersiones o emulsiones. Los ingredientes activos también pueden formularse con otros adyuvantes, tales como sólidos finamente divididos, aceites minerales, aceites de origen vegetal o animal, aceites modificados de origen vegetal o animal, disolventes orgánicos, agua, sustancias tensioactivas o combinaciones de los mismos.

Los ingredientes activos también pueden estar contenidos en microcápsulas muy finas. Las microcápsulas contienen los ingredientes activos en un soporte poroso. Esto permite que los ingredientes activos se liberen en el entorno en cantidades controladas (p. ej., de liberación lenta). Las microcápsulas habitualmente tienen un diámetro de 0,1 a 500 micras. Contienen ingredientes activos en una cantidad de aproximadamente 25 a 95 % en peso del peso de la cápsula. Los ingredientes activos pueden estar en forma de un sólido monolítico, en forma de partículas finas en dispersión sólida o líquida o en forma de una solución adecuada. Las membranas de encapsulación pueden comprender, por ejemplo, cauchos naturales o sintéticos, celulosa, copolímeros de estireno/butadieno, poliacrilonitrilo, poliácrlato, poliésteres, poliamidas, poliureas, poliuretano o polímeros modificados químicamente y xantatos de almidón u otros polímeros que son conocidos por la persona experta en la técnica. Alternativamente, pueden formarse microcápsulas muy finas en las que el ingrediente activo está contenido en forma de partículas finamente divididas en una matriz sólida de sustancia base, pero las microcápsulas no están encapsuladas en sí mismas.

Los adyuvantes de formulación que son adecuados para la preparación de las composiciones de acuerdo con la invención son conocidos *per se*. Como soportes líquidos se pueden utilizar: agua, tolueno, xileno, éter de petróleo, aceites vegetales, acetona, metil etil cetona, ciclohexanona, anhídridos de ácidos, acetonitrilo, acetofenona, acetato de amilo, 2-butanona, carbonato de butileno, clorobenceno, ciclohexano, ciclohexanol, ésteres alquílicos del ácido acético, alcohol de diacetona, 1,2-dicloropropano, dietanolamina, p-dietilbenceno, dietilenglicol, abietato de dietilenglicol, dietilenglicol butil éter, dietilenglicol etil éter, dietilenglicol metil éter, *N,N*-dimetilformamida, dimetilsulfóxido, 1,4-dioxano, dipropilenglicol, dipropilenglicol metil éter, dibenzoato de dipropilenglicol, diproxitol, alquilpirrolidona, acetato de etilo, 2-etilhexanol, carbonato de etileno, 1,1,1-tricloroetano, 2-heptanona, alfa-pineno, d-limoneno, lactato de etilo, etilenglicol, etilenglicol butil éter, etilenglicol metil éter, gamma-butirolactona, glicerol, acetato de glicerol, diacetato de glicerol, triacetato de glicerol, hexadecano, hexilenglicol, acetato de isoamilo, acetato de isobornilo, isooctano, isoforona, isopropilbenceno, miristato de isopropilo, ácido láctico, laurilamina, óxido de mesitilo, metoxipropanol, metil isoamil cetona, metil isobutil cetona, laurato de metilo, octanoato de metilo, oleato de metilo, cloruro de metileno, m-xileno, *n*-hexano, *n*-octilamina, ácido octadecanoico, acetato de octilamina, ácido oleico, oleilamina, o-xileno, fenol, polietilenglicol, ácido propiónico, lactato de propilo, carbonato de propileno, propilenglicol, propilenglicol metil éter, p-xileno, tolueno, fosfato de trietilo, trietilenglicol, ácido xilenosulfónico, parafina, aceite mineral, tricloroetileno, percloroetileno, acetato de etilo, acetato de amilo, acetato de butilo, propilenglicol metil éter, dietilenglicol metil éter, metanol, etanol, isopropanol, y alcoholes de elevado peso molecular, tales como alcohol amílico, alcohol tetrahidrofurfúrico, hexanol, octanol, etilenglicol, propilenglicol, glicerol, *N*-metil-2-pirrolidona y similares.

Soportes sólidos adecuados son, por ejemplo, talco, dióxido de titanio, arcilla pirofilita, sílice, arcilla atapulgita, kieselguhr, piedra caliza, carbonato de calcio, bentonita, montmorillonita de calcio, cáscara de semilla de algodón, harina de trigo, harina de soja, piedra pómez, harina de madera, cáscara de nuez molida, lignina y sustancias similares.

Ventajosamente, se puede utilizar un gran número de sustancias tensioactivas tanto en formulaciones sólidas como

líquidas, especialmente en aquellas formulaciones que pueden diluirse con un soporte antes de su uso. Sustancias tensioactivas pueden ser aniónicas, catiónicas, no iónicas o poliméricas y pueden utilizarse como emulsionantes, agentes humectantes o agentes de suspensión o para otros fines. Sustancias tensioactivas típicas incluyen, por ejemplo, sales de alquilsulfatos, tales como laurilsulfato de dietanolamónio; sales de alquilarilsulfonatos, tales como dodecylbencenosulfonato de calcio; productos de adición de alquilfenol/óxido de alquileo, tales como etoxilato de nonilfenol; productos de adición de alcohol/óxido de alquileo, tales como etoxilato de alcohol tridecílico; jabones, tales como estearato de sodio; sales de alquilnaftalenosulfonatos, tales como dibutilnaftalensulfonato de sodio; ésteres dialquílicos de sales sulfosuccinato, tales como di(2-etilhexil)sulfosuccinato de sodio; ésteres de sorbitol, tales como oleato de sorbitol; aminas cuaternarias, tales como cloruro de lauriltrimetilamónio, ésteres de polietilenglicol de ácidos grasos, tales como estearato de polietilenglicol; copolímeros de bloque de óxido de etileno y óxido de propileno; y sales de ésteres de mono- y di-alquilsulfato; y también otras sustancias descritas, p. ej., en McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual, MC Publishing Corp., Ridgewood New Jersey (1981).

Adyuvantes adicionales que se pueden utilizar en formulaciones plaguicidas incluyen inhibidores de la cristalización, modificadores de la viscosidad, agentes de suspensión, colorantes, anti-oxidantes, agentes espumantes, absorbentes de la luz, agentes auxiliares de mezcla, anti-espumantes, agentes complejantes, sustancias neutralizantes o modificadoras del pH y tampones, inhibidores de la corrosión, fragancias, agentes humectantes, potenciadores del consumo, micronutrientes, plastificantes, deslizantes, lubricantes, dispersantes, espesantes, anticongelantes, microbicidas y fertilizantes líquidos y sólidos.

Las composiciones de acuerdo con la invención pueden incluir un aditivo que comprende un aceite de origen vegetal o animal, un aceite mineral, ésteres alquílicos de aceites de este tipo o mezclas de aceites de este tipo y derivados de aceites. La cantidad de aditivo de aceite en la composición de acuerdo con la invención es generalmente de 0,01 a 10 %, basado en la mezcla a aplicar. Por ejemplo, el aditivo de aceite se puede añadir a un tanque de rociado en la concentración deseada después de que se haya preparado una mezcla de rociado. Aditivos de aceite preferidos comprenden aceites minerales o un aceite de origen vegetal, por ejemplo, aceite de colza, aceite de oliva o aceite de girasol, aceite vegetal emulsionado, ésteres alquílicos de aceites de origen vegetal, por ejemplo los derivados metílicos, o un aceite de origen animal, tal como aceite de pescado o sebo de ternera. Aditivos de aceite preferidos comprenden ésteres alquílicos de ácidos grasos C₈-C₂₂, especialmente los derivados metílicos de los ácidos grasos C₁₂-C₁₈, por ejemplo, los ésteres metílicos del ácido láurico, el ácido palmítico y el ácido oleico (laurato de metilo, palmitato de metilo y oleato de metilo, respectivamente). Se conocen muchos derivados de aceites del Compendium of Herbicide Adjuvants, 10^a Edición, Southern Illinois University, 2010.

Las composiciones de la invención comprenden generalmente de 0,1 a 99 % en peso, especialmente de 0,1 a 95 % en peso de compuestos de la presente invención y de 1 a 99,9 % en peso de un adyuvante de formulación que incluye preferiblemente de 0 a 25 % en peso de una sustancia tensioactiva. Aunque los productos comerciales pueden formularse preferiblemente como concentrados, el usuario final normalmente empleará formulaciones diluidas.

Las tasas de aplicación varían dentro de amplios límites y dependen de la naturaleza del suelo, del método de aplicación, de la planta de cultivo, de la plaga a controlar, de las condiciones climáticas predominantes y de otros factores que se rigen por el método de aplicación, el tiempo de aplicación y el cultivo objetivo. Como norma general, los compuestos pueden aplicarse a una tasa de 1 a 2000 l/ha, especialmente de 10 a 1000 l/ha.

Formulaciones preferidas pueden tener las siguientes composiciones (% en peso):

Concentrados emulsionables:

ingrediente activo:	de un 1 a un 95%, preferentemente de un 60 a un 90%
agente tensioactivo:	de un 1 a un 30%, preferentemente de un 5 a un 20%
soporte líquido:	de un 1 a un 80%, preferentemente de un 1 a un 35%

Polvos secantes:

ingrediente activo:	de un 0,1 a un 10%, preferentemente de un 0,1 a un 5%
soporte sólido:	de un 99,9 a un 90%, preferentemente de un 99,9 a un 99%

Concentrados en suspensión:

ingrediente activo:	de un 5 a un 75%, preferentemente de un 10 a un 50%
agua:	de un 94 a un 24%, preferentemente de un 88 a un 30%
agente tensioactivo:	de un 1 a un 40%, preferentemente de un 2 a un 30%

Polvos humectables:

ingrediente activo:	de un 0,5 a un 90%, preferentemente de un 1 a un 80%
agente tensioactivo:	de un 0,5 a un 20%, preferentemente de un 1 a un 15%
soporte sólido:	de un 5 a un 95%, preferentemente de un 15 a un 90%

ES 2 731 078 T3

Gránulos:

ingrediente activo: de un 0,1 a un 30%, preferentemente de un 0,1 a un 15%
 soporte sólido: de un 99,5 a un 70%, preferentemente de un 97 a un 85%

Los siguientes Ejemplos ilustran la invención adicionalmente pero sin limitarla.

5

<u>Polvos humectables</u>	a)	b)	c)
principios activos	25 %	50 %	75 %
lignosulfonato de sodio	5 %	5 %	-
laurilsulfato de sodio	3 %	-	5 %
diisobutilnaftalenosulfonato de sodio	-	6 %	10 %
fenol polietilenglicol éter (7-8 moles de óxido de etileno)	-	2 %	-
ácido silícico muy disperso	5 %	10 %	10 %
Caolín	62 %	27 %	-

La combinación se mezcla a fondo con los adyuvantes y la mezcla se muele a fondo en un molino adecuado, proporcionando polvos humectables que se pueden diluir con agua para dar suspensiones de la concentración deseada.

10

<u>Polvos para el tratamiento en seco de semillas</u>	a)	b)	c)
principios activos	25 %	50 %	75 %
aceite mineral ligero	5 %	5 %	5 %
ácido silícico muy disperso	5 %	5 %	-
caolín	65 %	40 %	-
talco	-	-	20

La combinación se mezcla a fondo con los adyuvantes y la mezcla se muele a fondo en un molino adecuado, proporcionando polvos que se pueden utilizar directamente para el tratamiento de las semillas.

15

<u>Concentrado emulsionable</u>	
ingredientes activos	10 %
octilfenol polietilenglicol éter (4-5 moles de óxido de etileno)	3 %
dodecibencenosulfonato de calcio	3 %
éter de aceite de ricino poliglicólico (35 moles de óxido de etileno)	4 %
Ciclohexanona	30 %
mezcla de xilenos	50 %

Se pueden obtener emulsiones con cualquier dilución requerida, que se pueden utilizar para proteger plantas, a partir de este concentrado diluyendo con agua.

<u>Polvos secantes</u>	a)	b)	c)
ingredientes activos	5 %	6 %	4 %
talco	95 %	-	-
caolín	-	94 %	-
carga mineral	-	-	96 %

20 Se obtienen polvos listos para usar mezclando la combinación con el vehículo y moliendo la mezcla en un molino adecuado. Tales polvos también se pueden utilizar en revestimientos en seco para semillas.

<u>Gránulos de la extrusora</u>	
Ingredientes activos	15 %
lignosulfonato de sodio	2 %
carboximetilcelulosa	1 %
caolín	82 %

25 La combinación se mezcla y se muele con los adyuvantes, y la mezcla se humedece con agua. La mezcla se extrude y luego se seca en una corriente de aire.

<u>Gránulos recubiertos</u>	
Ingredientes activos	8 %
polietilenglicol (peso mol. 200)	3 %
caolín	89 %

La combinación finamente molida se aplica uniformemente, en un mezclador, al caolín humedecido con polietilenglicol. De esta forma se obtienen gránulos recubiertos que no generan polvo.

Concentrado en suspensión

Principios activos	40 %
propilenglicol	10 %
éter de polietilenglicol de nonilfenol (15 moles de óxido de etileno)	6 %
lignosulfonato de sodio	10 %
carboximetilcelulosa	1 %
aceite de silicona (en forma de una emulsión al 75 % en agua)	1 %
Agua	32 %

5 La combinación finamente molida se mezcla íntimamente con los adyuvantes, dando un concentrado en suspensión a partir del cual se pueden obtener suspensiones de cualquier dilución deseada mediante dilución con agua. Utilizando diluciones de este tipo se pueden tratar y proteger tanto plantas vivas como el material de propagación vegetal contra la infestación por parte de microorganismos mediante pulverización, vertido o inmersión.

10 Concentrado fluido para el tratamiento de semillas

ingredientes activos	40 %
propilenglicol	5 %
butanol copolímero PO/EO	2 %
Triestirefenol con 10-20 moles de EO	2 %
1,2-benzisotiazolin-3-ona (en forma de una solución al 20% en agua)	0,5 %
sal de calcio de pigmento monoazo	5 %
Aceite de silicona (en forma de una emulsión al 75 % en agua)	0,2 %
Agua	45,3 %

15 La combinación finamente molida se mezcla íntimamente con los adyuvantes, dando un concentrado en suspensión a partir del cual se pueden obtener suspensiones de cualquier dilución deseada mediante dilución con agua. Utilizando tales diluciones se pueden tratar y proteger tanto plantas vivas como el material de propagación vegetal contra la infestación por parte de microorganismos mediante pulverización, vertido o inmersión.

Suspensión de cápsulas de liberación lenta

20 28 partes de la combinación se mezclan con 2 partes de un disolvente aromático y 7 partes de diisocianato de tolueno/mezcla de polimetileno-polifenilisocianato (8: 1). Esta mezcla se emulsiona en una mezcla de 1,2 partes de poli(alcohol vinílico), 0,05 partes de un antiespumante y 51,6 partes de agua hasta que se consigue el tamaño de partícula deseado. A esta emulsión se añade una mezcla de 2,8 partes de 1,6-diaminohexano en 5,3 partes de agua. La mezcla se agita hasta que finaliza la reacción de polimerización. La suspensión de cápsulas obtenida se estabiliza añadiendo 0,25 partes de un espesante y 3 partes de un agente dispersante. La formulación en suspensión de la cápsula contiene 28% de los ingredientes activos. El diámetro medio de cápsula es de 8-15 micras. La formulación resultante se aplica a las semillas en forma de una suspensión acuosa en un aparato adecuado para ese propósito.

30 Tipos de formulación incluyen un concentrado en emulsión (EC), un concentrado en suspensión (SC), una suspo-emulsión (SE), una suspensión de cápsulas (CS), un gránulo dispersable en agua (WG), un gránulo emulsionable (EG), una emulsión, agua en aceite (EO), una emulsión, aceite en agua (EW), una micro-emulsión (ME), una dispersión de aceite (OD), un aceite miscible fluido (OF), un líquido miscible en aceite (OL), un concentrado soluble (SL), una suspensión de volumen ultra bajo (SU), un líquido de volumen ultra bajo (UL), un concentrado técnico (TK), un concentrado dispersable (DC), un polvo humectable (WP), un gránulo soluble (SG) o cualquier formulación técnicamente factible en combinación con adyuvantes agrícolamente aceptables.

Ejemplos de preparación:

40 "P.f." significa punto de fusión en °C. Los radicales libres representan grupos metilo. Las mediciones de ¹H y ¹⁹F RMN se registraron en espectrómetros Bruker de 400 MHz o 300 MHz, los desplazamientos químicos se dan en ppm relevantes para un patrón TMS. Los espectros se miden en disolventes deuterados según se indica.

Métodos LCMS:

45 Método A (SQD13):

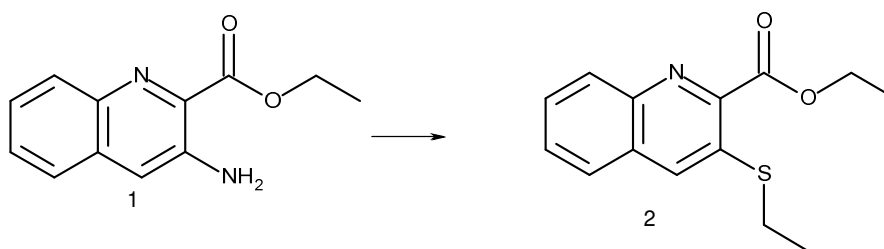
50 Los espectros se registraron en un espectrómetro de masas de Waters (espectrómetro de masas de cuadrupolo simple SQD) equipado con una fuente de electropulverización (polaridad: iones positivos o negativos, Capilar: 3,00 kV, Intervalo del cono: 30-60 V, Extractor: 2,00 V, Temperatura de la Fuente: 150°C, Temperatura de Desolvatación:

350°C, Flujo del Gas del Cono: 0 L/h, Flujo del Gas de Desolvatación: 650 L/h, Intervalo de Masas: 100 a 900 Da) y una UPLC de Acquity de Waters: Bomba binaria, compartimiento de columna calentado y detector de matriz de diodos. Desgasificador de disolvente, bomba binaria, compartimiento de columna calentado y detector de matriz de diodos. Columna: Waters UPLC HSS T3, 1,8 µm, 30 x 2,1 mm, temp: 60 °C, intervalo de Longitudes de onda del DAD (nm): 210 a 500, Gradiente de Disolvente: A = agua + 5% de MeOH + 0,05 % de HCOOH, B= Acetonitrilo + 0,05 % de HCOOH: gradiente: gradiente: 0 min 0 % de B, 100 % de A; 1,2-1,5 min 100 % B; flujo (ml/min) 0,85.

Síntesis de compuestos intermedios:

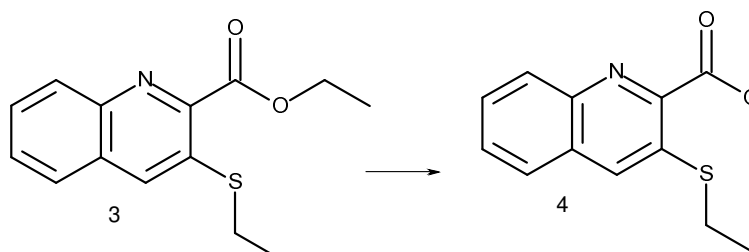
10 **Compuesto intermedio 1:** Síntesis de ácido 3-etilsulfanilquinolina-2-carboxílico

Etapa A: 3-etilsulfanilquinolina-2-carboxilato de etilo:



15 A la solución agitada de compuesto **1** (3.6 g, 16.66 mmol) en DCE (30 ml) se añadió disulfuro de dietilo (4.51 ml, 36.6 mmol), luego se añadió gota a gota nitrito de *t*-butilo a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se calentó a 40 °C durante 2 horas. La reacción se controló por TLC. Después de la terminación del material de partida, la mezcla de reacción se diluyó con CH₂Cl₂ y se lavó con agua (2 X 10 mL). La capa orgánica se secó sobre Na₂SO₄. Se filtró, se concentró y se purificó mediante cromatografía en columna utilizando hexano-acetato de etilo (100-200 gel de sílice) para dar el compuesto deseado en forma de un líquido amarillo (cantidad: 1.0 g; Rendimiento = 23 %). ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃): δ (ppm) 8,14 (d, 1H), 8,06(s, 1H), 7,75 (d, 1H), 7,68 (m, 1H), 7,58 (m, 1H), 4,54 (c, 2H), 3,03(c, 2H), 1,48 (t, 3H), 1,40(t, 3H).

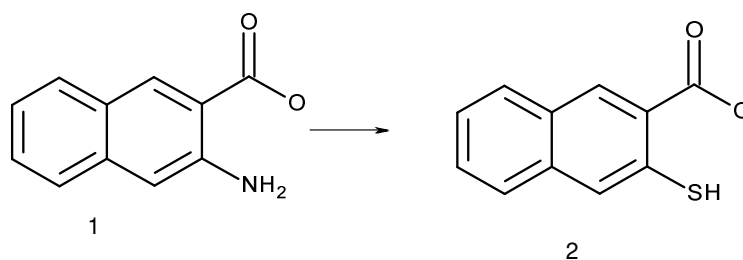
25 **Etapa B: Ácido 3-etilsulfanilquinolina-2-carboxílico**



30 A la solución agitada de compuesto **3** (1 g, 3.8 mmol) en THF (8 ml) se añadió NaOH (2 N, 2,2 eq.) a TA. La mezcla de reacción se agitó durante 16 horas a temperatura ambiente. La reacción se controló por TLC. Después de la terminación del material de partida, la mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo (2 X 10 mL). La parte de agua se acidificó luego a pH = 4 con una solución de ácido cítrico al 10% y se extrajo con acetato de etilo (3 x 20 ml). La capa orgánica se secó sobre Na₂SO₄. Se filtró, se concentró a presión reducida para dar el sólido bruto, que se trituró con éter para dar el compuesto deseado en forma de un sólido amarillo (cantidad: 613 mg; Rendimiento = 68 %). ¹H RMN (400 MHz, DMSO-d₆): δ (ppm) 13,7 (s, 1H), 8,42 (s, 1H), 8,00(m, 2H), 7,75 (m, 1H), 7,68 (m, 1H), 3,09 (c, 2H), 1,29 (t, 3H).

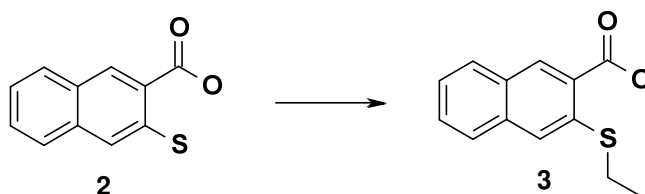
Compuesto intermedio 2: Síntesis de ácido 3-etilsulfanilnaftaleno-2-carboxílico

40 **Etapa A: Ácido 3-etilsulfanilnaftaleno-2-carboxílico**



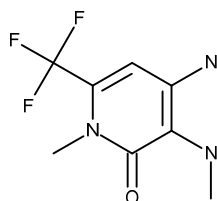
A una suspensión agitada de compuesto **1** (10 g, 53.47 mmol) en agua (28 mL) y HCl concentrado (11.4 mL) a 5°C se añadió gota a gota una solución de NaNO₂ (3.69 g, 53.47 mmol) en agua (14.6 mL) y la solución se mantuvo a 5°C. Se añadió hielo triturado a la mezcla de reacción periódicamente durante la adición para mantener la temperatura por debajo de 5 °C. Mientras tanto, Na₂S·9H₂O (13.7 g, 176.47 mmol) y azufre sublimado (1.88 g, 58.82 mmol) se disolvieron en agua (15 mL) mediante calentamiento y se alcalizaron mediante la adición de NaOH (10 M, 5,5 mL) y la solución de disulfuro alcalino resultante se enfrió a 5 °C en un baño de hielo. La solución fría se añadió gota a gota a la solución de disulfuro alcalino y se añadió hielo triturado periódicamente para mantener la temperatura por debajo de 5 °C. Después, la mezcla se agitó a temperatura ambiente hasta que se detuvo el desprendimiento de gas N₂. Se añadió HCl concentrado a la solución hasta que se completó la precipitación del producto bruto en forma de un sólido amarillo. El precipitado se recogió y se hirvió en una solución saturada de NaHCO₃ (130 mL). Después de hervir durante 15 min, la mezcla se filtró para separar el material insoluble y se añadió HCl conc. al filtrado hasta que el producto bruto precipitó en forma de un sólido amarillo. Exceso de HCl conc. se añadió a la mezcla hasta que se completó la precipitación, y el precipitado se aisló mediante filtración. Este material se hirvió en EtOH absoluto (50 mL) durante 15 min y se filtró y el filtrado se concentró a presión reducida para proporcionar el derivado de ácido ditiosalicílico. El derivado de ácido ditiosalicílico se mezcló luego con polvo de Zn (3.2 g) en CH₃COOH (50 mL) glacial y se mantuvo a reflujo durante 48 horas. La mezcla se enfrió luego y se filtró. El sólido recogido de esta manera se hirvió en NaOH 5 M (100 mL). Después de hervir durante 30 min, el sólido se separó por filtración y el filtrado transparente se acidificó con HCl concentrado hasta que el producto bruto precipitó en forma de un sólido amarillo. Se añadió HCl concentrado a la mezcla hasta que se completó la precipitación. El precipitado se recogió y se llevó a ebullición en EtOH (40 mL) y se filtró y el filtrado se concentró a presión reducida para proporcionar el derivado de ácido tiosalicílico **2**. Este material se llevó directamente a la siguiente etapa sin purificación extra (cantidad: 4 g; Rendimiento = 36 %).

Etapa B: Ácido 3-etilsulfanilnaftaleno-2-carboxílico

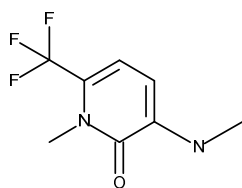


A una solución agitada de compuesto **2** (1.9 g, 9.36) en etanol (10 ml) y NaOH (1M, 10 mL) se añadió Etl (0.75 ml, 9.36 mmol) a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se agitó durante 48 horas. La LC-MS mostró que se formó el producto deseado. El disolvente se evaporó y el producto bruto se acidificó a pH = 2, se extrajo con acetato de etilo (2 x 30 ml). La capa de acetato de etilo se secó sobre Na₂SO₄. Se filtró, se concentró y se purificó mediante cromatografía en columna utilizando hexano-acetato de etilo (100-200 gel de sílice) para dar el compuesto deseado en forma de un sólido amarillo. Rendimiento = cantidad 274 mg; 25 %. ¹H RMN (400 MHz, DMSO-d₆): δ (ppm) 13,14(s, 1H), 8,49 (s, 1H), 7,99 (d, 1H), 7,90 (d, 1H), 7,81 (s, 1H), 7,62 (t, 1H), 7,48 (t, 1H), 3,04 (c, 2 H), 1,32 (t, 3H).

Compuesto intermedio 3: 4-amino-1-metil-3-(metilamino)-6-(trifluorometil)piridin-2-ona:

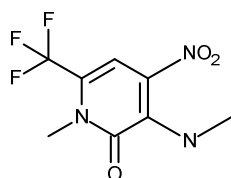


Etapa A: 1-metil-3-(metilamino)-6-(trifluorometil)piridin-2-ona:



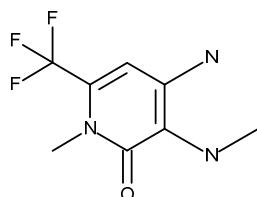
5 A una solución de 3-amino-1-metil-6-(trifluorometil)piridin-2-ona (1.00 g, 5.20 mmol, comercialmente disponible o sintetizada tal como se describe, por ejemplo, en Synthesis 2005, Nº 8, págs. 1269–1278, Synthesis 2011, Nº 7, págs. 1149–1156) en 1,4-dioxano (62.5 mL, 726 mmol) y piridina (1.49 mL, 18.2 mmol), bajo argón, se añadió diacetoxicobre (2.39 g, 13.0 mmol). La mezcla se agitó durante 15 min antes de la adición de ácido metilborónico (0,803 g, 13,0 mmol). La suspensión verde/azul resultante se sometió a reflujo durante 5 horas. Después de enfriar, la solución se filtró a través de una almohadilla de Celite. La solución verde oscura se concentró en vacío y se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice, eluyendo con acetato de etilo / ciclohexano. Las fracciones seleccionadas se evaporaron para proporcionar el compuesto del título (0.71 g). ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 7,27 (s, 1 H); 6,72 (d, 1 H); 6,04 (d, 2 H), 5,46 (s a, 1 H), 3,68 (s, 3H), 2,88 (d, 3H).

Etapa B: 1-metil-3-(metilamino)-4-nitro-6-(trifluorometil)piridin-2-ona:



15 Una solución de 1-metil-3-(metilamino)-6-(trifluorometil)piridin-2-ona (4.00 g, 19.4 mmol) ácido sulfúrico (58.2 mL) se enfrió con un baño de hielo a 0°C. Luego, se añadieron hielo (20.0 g) y ácido nítrico (1.88 g, 1.35 mL, 19.4 mmol). Después de 15 min a 0-10°C, la solución espesa parda se vertió en agua helada. La forma de precipitado de color naranja se separó por filtración, se enjuagó con agua y se secó en vacío para dar un sólido naranja. La fase acuosa se extrajo 3 veces con AcOEt y el sólido naranja, obtenido antes, se añadió a la fase orgánica combinada. La fase orgánica combinada se lavó con una solución saturada de hidrógeno-carbonato de sodio, agua y salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró en vacío para dar el compuesto del título (4,0 g). El compuesto se usó sin purificación extra para la siguiente etapa. LC-MS(Método A) : TR 0,91, 252 (M+H⁺), 250 (M-H⁺).

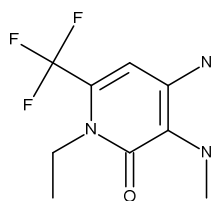
Etapa C: 4-amino-1-metil-3-(metilamino)-6-(trifluorometil)piridin-2-ona:



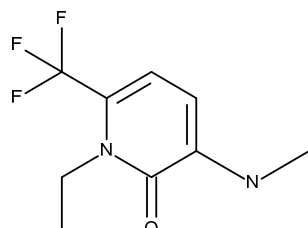
30 A una solución de 1-metil-3-(metilamino)-4-nitro-6-(trifluorometil)piridin-2-ona (3.0 g, 11.9 mmol) en propan-2-ol (98.1 g, 125 mL, 1620 mmol) se añadió cloruro de estaño(II) dihidrato (8.24 g, 43.0 mmol) seguido de cloruro de hidrógeno (10 mL, 120 mmol, 37%) La solución resultante se agitó a 70°C durante una hora y luego se dejó enfriar a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se vertió en agua y el pH se ajustó a 10-12 con una solución concentrada de hidróxido de sodio (al 30%).

35 La fase acuosa se extrajo tres veces con acetato de etilo, las fases orgánicas se combinaron, se secaron sobre sulfato de magnesio y se concentraron en vacío, se sometieron a cromatografía en columna sobre gel de sílice, eluyendo con acetato de etilo / ciclohexano. Las fracciones seleccionadas se evaporaron para proporcionar el compuesto del título (2.15 g). ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 6,30 (s, 1 H); 4,15 (s a, 2 H), 3,8 (s a, 1 H), 3,60 (s, 3H), 2,64 (s, 3H).

Compuesto intermedio 4: 4-amino-1-etil-3-(metilamino)-6-(trifluorometil)piridin-2-ona:



Etapa A: 1-etil-3-(metilamino)-6-(trifluorometil)piridin-2-ona:

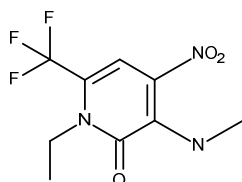


5

A una solución de 3-amino-1-etil-6-(trifluorometil)piridin-2-ona (5.00 g, 24.3 mmol, comercialmente disponible o sintetizada por analogía a la bibliografía, por ejemplo, Synthesis 2005, N° 8, págs. 1269–1278 y Synthesis 2011, N° 7, págs. 1149–1156) en acetonitrilo (150 mL) se añadió formaldehído (al 37 % en masa) en solución ac. (14.5 ml, 194 mmol) y ácido acético (6.96 ml, 121 mmol). La suspensión resultante se agitó durante 1 hora, luego se añadió cianoborohidruro de sodio (6.42 g, 97.0 mmol) en 5 porciones a lo largo de 3 horas y la mezcla se agitó durante la noche. La solución se diluyó con agua y se extrajo con acetato de etilo (3 veces). La capa orgánica combinada se secó sobre Na₂SO₄, se filtró, se concentró y se purificó por cromatografía en columna utilizando ciclohexano-acetato de etilo (100-200 gel de sílice) para dar el compuesto deseado en forma de un sólido blanco. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 6,70 (d, 1 H), 6,04 (d, 1 H), 5,44 (s a, 1 H), 4,15 (c, 2H), 2,85 (s, 3H), 1,32 (t, 3H).

15

Etapa B: 1-etil-3-(metilamino)-4-nitro-6-(trifluorometil)piridin-2-ona:

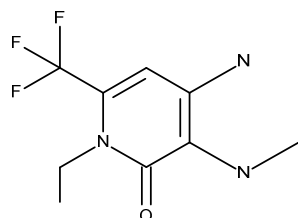


20

La 1-etil-3-(metilamino)-4-nitro-6-(trifluorometil)piridin-2-ona se preparó como en el Ejemplo 3, etapa B. LC-MS(Método A) : TR 0,98, 266 (M+H⁺), 264 (M-H⁺).

Etapa C: 4-amino-1-etil-3-(metilamino)-6-(trifluorometil)piridin-2-ona:

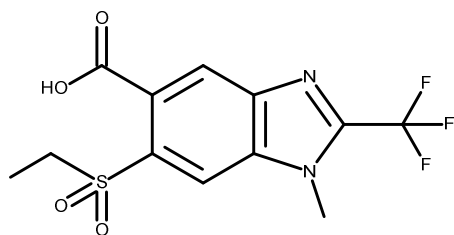
25



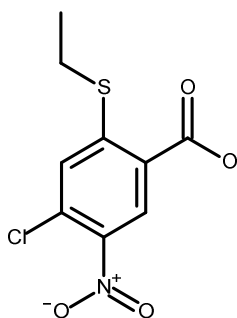
La 4-amino-1-etil-3-(metilamino)-6-(trifluorometil)piridin-2-ona se preparó como en el Ejemplo 3, etapa C. LC-MS(Método A) : TR 0,47, 236 (M+H⁺).

30

Compuesto intermedio 5: Ácido 6-etilsulfonil-1-metil-2-(trifluorometil)bencimidazol-5-carboxílico



Etapa A: Síntesis de ácido 4-cloro-2-etilsulfanil-5-nitro-benzoico



5

A una solución de ácido 4-cloro-2-fluoro-5-nitro-benzoico (20 g, 91.095 mmol, disponible comercialmente) en 1-metil-2-pirrolidona (250 mL) a 90°C se añadió t-butoxido de sodio (9.6302 g, 100.20 mmol). Después de 10 min, se añadió etilsulfanilsodio (9,366 g, 100,20 mmol)

10

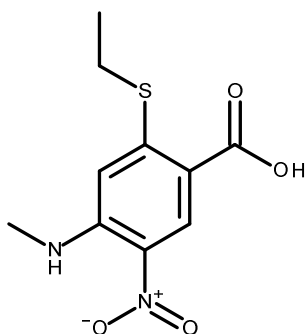
La reacción se agitó a 90°C durante dos horas. La conversión es completa, se formaron dos productos. La mezcla de reacción se vertió en un litro de agua y el pH se acidificó mediante la adición de ácido clorhídrico conc (al 37%) y se formó un precipitado. La filtración del sólido dio la mezcla de dos productos. Se dejó reposar el filtrado. El sólido se suspendió en etiléter y se filtró. El sólido (puro) se identificó como el producto bis-etilsulfanilo. El filtrado se concentró en vacío para dar ácido 4-cloro-2-etilsulfanil-5-nitro-benzoico (8.9 g, 34 mmol, 37% de Rendimiento). LC-MS (Método A): TR 1,00 (260, MH⁻) (262, MH⁺).

15

¹H RMN (300 MHz, CDCl₃) ppm 13,84 (s, 1H) 8,52 (s, 1 H); 7,6 (s, 1 H); 3,09 (c, 2 H); 1,3 (t, 3H).

20

Etapa B: Síntesis de ácido 2-etilsulfanil-4-(metilamino)-5-nitro-benzoico



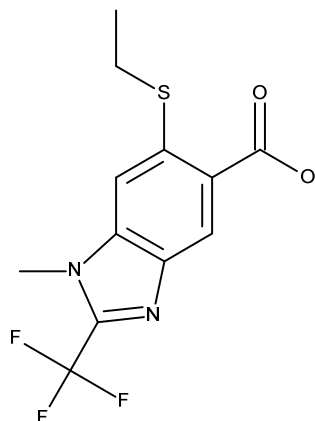
25

A una solución de ácido 4-cloro-2-etilsulfanil-5-nitro-benzoico (8.9 g, 34 mmol) en tetrahidrofurano (20 mL, 244 mmol) se añadió suavemente metilamina (2 mol/L) en tetrahidrofurano (100 mL, 200 mmol). La mezcla se agitó durante la noche a temperatura ambiente. Sólo se observaron unas pocas conversiones. La suspensión se transfirió a un autoclave, se añadieron 30 mL de metilamina 2N y la reacción se agitó a 80°C durante cinco horas. La reacción no está completa y se añadieron 20 mL más de metilamina 2N y luego la reacción se agitó en un autoclave durante el fin de semana. La reacción se terminó y la mezcla de reacción se concentró en vacío. Los sólidos se recogieron en agua y se basificaron con hidróxido de sodio 1 N, luego se extrajeron con acetato de etilo. La fase acuosa se acidificó con ácido clorhídrico conc. al 37% y se extrajo con acetato de etilo. Todas las capas orgánicas se combinaron y se secaron sobre sulfato de magnesio y se concentraron en vacío. El residuo se purificó luego por cromatografía de resolución instantánea para dar ácido 2-etilsulfanil-4-(metilamino)-5-nitro-benzoico (3,95 g, 15,4 mmol, 45% de Rendimiento) en forma de un sólido amarillo parduzco. LC-MS (Método A): TR 1,04 (257, MH⁺). ¹H

30

RMN (300 MHz, CDCl₃) ppm 12,87 (s, 1H) 8,68 (s, 1 H); 6,55 (s, 1 H); 3,05 (s, 3 H); 3,00 (c, 2H) 1,33 (t, 3H).

Etapa C: Síntesis del ácido 6-etilsulfanil-1-metil-2- (trifluorometil) bencimidazol-5-carboxílico



5

A una solución de ácido 2-etilsulfanil-4-(metilamino)-5-nitro-benzoico (0.300 g, 1.17 mmol) en ácido 2,2,2-trifluoroacético (10 mL, 129 mmol) a 0°C, se añadió zinc (0.260 g, 3.98 mmol) y se retiró el baño de enfriamiento. Después de 30 min, la reducción se completa de acuerdo con LC/MS, se observó un poco de producto ciclado. La solución parda se calentó luego a 70°C para ciclar el producto di-amino. Después de una hora, la LC/MS mostró la finalización de la ciclación. La mezcla de reacción se concentró a la mitad, se vertió en agua y se extrajo con acetato de etilo. La fase orgánica se lavó con agua y salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró en vacío.

10

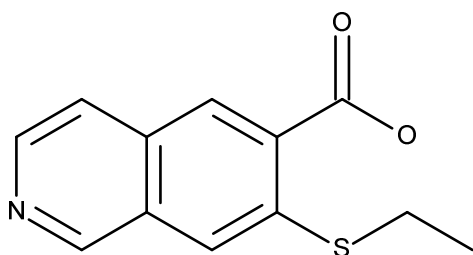
El residuo se purificó por cromatografía de resolución instantánea para dar ácido 6-etilsulfanil-1-metil-2-(trifluorometil)benzimidazol-5-carboxílico (0,14 g, 0,46 mmol, Rendimiento 39.3%)

15

LC-MS (Método A): TR 1,06 (303, MH⁻) (305, MH⁺). ¹H RMN (300 MHz, CDCl₃) ppm 13,03 (s, 1H) 8,30 (s, 1 H); 7,64 (s, 1 H); 4,00 (s, 3 H); 3,06 (c, 2H) 1,32 (t, 3H).

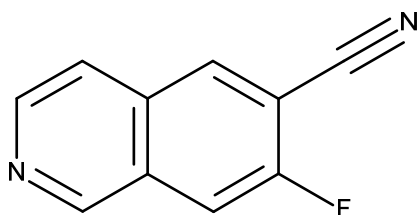
20

Compuesto intermedio 6: Ácido 7-etilsulfanilisoquinolina-6-carboxílico



Etapa A: Síntesis de 7-fluoroisoquinolina-6-carbonitrilo

25



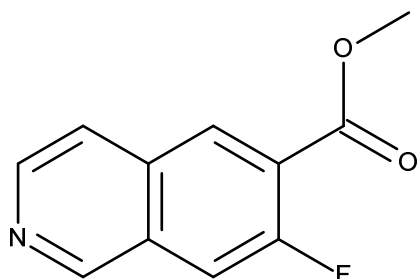
Bajo argón, a una solución de 6-bromo-7-fluoroisoquinolina [1258833-80-5] (228.33 mg, 1 mmol) en N,N-dimetilformamida (5 ml), se añadió cianuro de cobre (134.34 mg, 1 mmol). La mezcla se calentó a 100°C. Después de 24 h, la reacción se filtró a través de Celite y se lavó con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con salmuera, se secó y se concentró. El producto bruto se purificó por cromatografía de resolución instantánea para dar 7-fluoroisoquinolina-6-carbonitrilo (13 mg, 7.5%) en forma de un sólido pardo pálido.

30

^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) ppm 9,33(s, 1 H); 8,68 (d, 1 H); 8,27 (d, 1 H); 7,76 (d, 1 H); 7,72 (d, 1H). PF: 157-158°C.

Etapa B: Síntesis de 7-fluoroisoquinolina-6-carbonitrilo de metilo

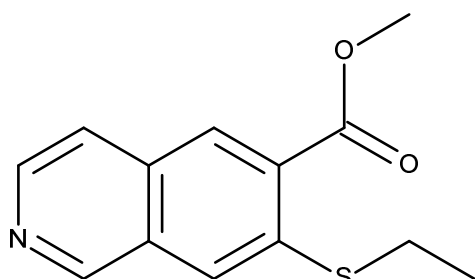
5



En un autoclave, 6-bromo-7-fluoroisoquinolina [1258833-80-5] (452.1 mg, 2 mmol) dicloruro de bis(trifenilfosfina)paladio (71 mg, 0,1 mmol) y trietilamina (404,7 mg, 2 mmol) se añadieron a metanol (40 ml). Luego, la atmósfera interna del autoclave se reemplazó por monóxido de carbono y la presión en el recipiente fue de 20 bares, se calentó a aproximadamente 80°C y se agitó durante 15 h. El disolvente se evaporó, el residuo se disolvió en acetato de etilo, se lavó con salmuera, se secó y se concentró. El residuo se purificó por cromatografía de resolución instantánea para dar 7-fluoroisoquinolina-6-carboxilato de metilo (314 mg, 76.5%) en forma de un sólido blanco. ^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) ppm 9,27(s, 1 H); 8,60 (d, 1 H); 8,50 (d, 1 H); 7,73 (d, 1 H); 7,68 (d, 1H); 4,02 (s, 3H). PF: 89-90 °C.

15

Etapa C: Síntesis del 7-etilsulfanilisoquinolina-6-carboxilato de metilo



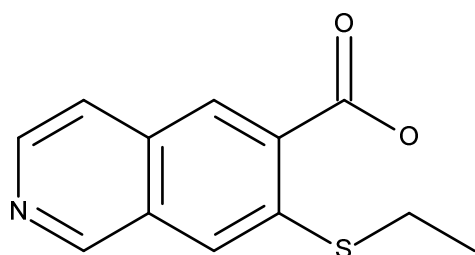
La mezcla de 7-fluoroisoquinolina-6-carboxilato de metilo (324 mg, 1,58 mmol), tioetóxido de sodio (1.62 mg, 1.58 mmol) y N,N-dimetilformamida (3 ml) se agitó a temperatura ambiente durante la noche. El disolvente se evaporó mediante tolueno, el residuo se disolvió en acetato de etilo y se lavó con agua, se secó y se concentró. El producto bruto se purificó por cromatografía de resolución instantánea para dar 7-etilsulfanilisoquinolina-6-carboxilato de metilo (235 mg, 60%) en forma de un sólido amarillo pálido.

25

^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) ppm 9,21(s, 1 H); 8,52 (d, 1 H); 8,42(s, 1 H); 7,76(s, 1 H); 7,64 (d, 1H); 4,00 (s, t); 3,10 (c.,2H); 1,46 (t, 3H). PF: 85-86°C.

Etapa D: Síntesis del ácido 7-etilsulfanilisoquinolina-6-carboxílico.

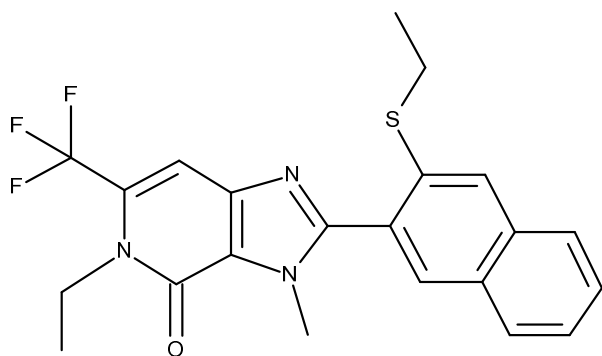
30



7-etilsulfanilisoquinolina-6-carboxilato de metilo (1.1 g, 4.51 mmol) se agitó en una mezcla de hidróxido de sodio

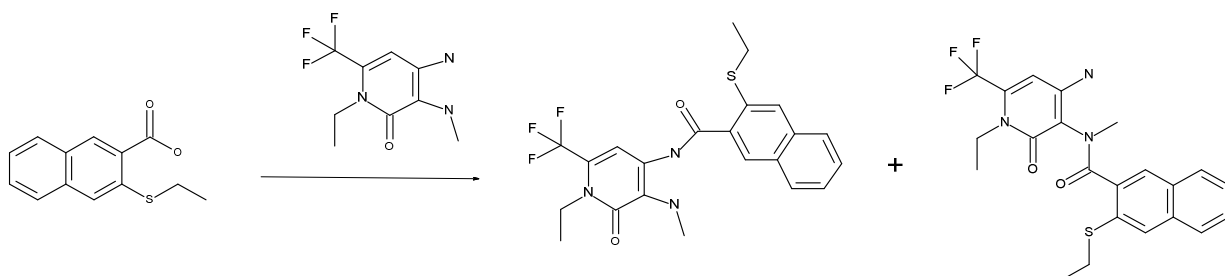
(225 mg, 4.51 mmol), agua (2 ml) y metanol (20 ml) a temperatura ambiente durante la noche. El metanol en la solución de reacción se separó por destilación y el residuo se lavó con acetato de etilo. La capa acuosa se acidificó con ácido clorhídrico diluido (pH 4-5). El precipitado amarillo se separó por filtración y se secó. $^1\text{H RMN}$ (400 MHz, CDCl_3) ppm 9,69(s, 1 H); 8,68 (d, 1 H); 8,61 (d, 1 H); 8,36(2d, 2 H); 3,13 (c.,2H); 1,37 (t, 3H).

5 **Ejemplo P1:** Preparación de 5-etil-2-(3-etilsulfanil-2-naftil)-3-metil-6-(trifluorometil)-3aH-imidazo [4,5-clpiridin-4-ona (**A1**, 2.133):



A1(2.133).

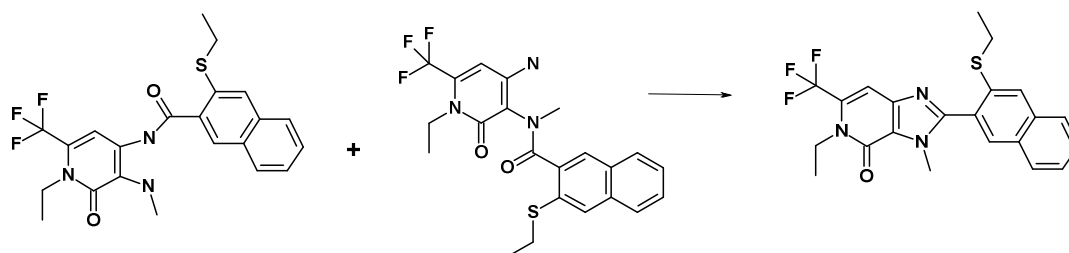
10 **EtapA:** Preparación de N-[1-etil-3-(metilamino)-2-oxo-6-(trifluorometil)-3H-piridin-4-il]-3-etilsulfanil-naftaleno-2-carboxamida y N-[4-amino-1-etil-2-oxo-6-trifluorometil]-3-piridil]-3-etilsulfanil-N-metil-naftaleno-2-carboxamida



15 Ácido 3-etilsulfanilnaftaleno-2-carboxílico (132 mg, 0.570 mmol) se disolvió en diclorometano (1.14 mL) y se añadió dicloruro de oxalilo (0.101 mL, 1.14 mmol) y N,N-dimetilformamida (1 gota). La mezcla se agitó durante 30 min a temperatura ambiente y luego a reflujo durante 30 min. El disolvente se separó y se secó en vacío.

20 El cloruro de 3-etilsulfanilnaftaleno-2-carbonilo (143.0 mg, 0.571 mmol) se diluyó con 0.5 ml de THF y se añadió a una mezcla de 4-amino-1-etil-3-(metilamino)-6-(trifluorometil)piridin-2-ona (Preparada en el ejemplo 4, 122 mg, 0.51869 mmol) en tetrahidrofurano (1.0 mL) y piridina (0.13 mL, 1.55 mmol). La mezcla se agitó a reflujo durante 3 horas. La solución se diluyó con una solución saturada de carbonato de sodio y acetato de etilo y la fase acuosa se extrajo con acetato de etilo (2 veces). La capa orgánica combinada se secó sobre Na_2SO_4 , se filtró, concentró y purificó por cromatografía en columna utilizando ciclohexano-acetato de etilo para dar los compuestos deseados (180 mg). La mezcla se utilizó sin purificación extra para la siguiente etapa LC-MS (Método A): TR 0,99, 450 ($\text{M}+\text{H}^+$).

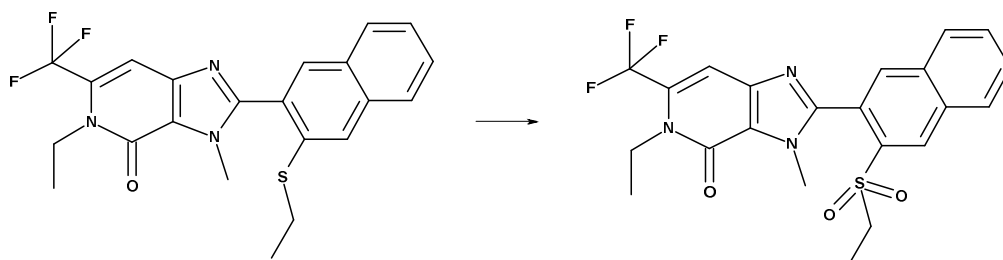
25 **EtapA B:** Preparación de 5-etil-2-(3-etilsulfanil-2-naftil)-3-metil-6-(trifluorometil)-3aH-imidazo [4,5-clpiridin-4-ona (**A1**, 2.133):



30 Un vial de microondas se cargó con una mezcla de N-[1-etil-3-(metilamino)-2-oxo-6-trifluorometil]-3H-piridin-4-il]-3-etilsulfanil-naftaleno-2-carboxamida y N-[4-amino-1-etil-2-oxo-6-trifluorometil]-3-piridil]-3-etilsulfanil-N-metil-naftaleno-2-carboxamida (0.18 g, 0.4004 mmol) y ácido acético (2.0 mL). Después, la mezcla se agitó durante 2 h

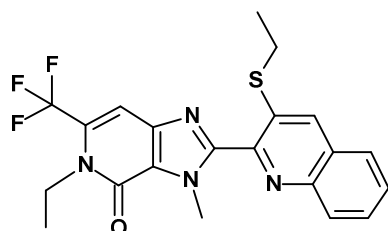
20 a 150°C bajo microondas. La mezcla de reacción se diluyó con agua (10 mL) y se extrajo dos veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se lavaron con agua y salmuera, y se secaron sobre sulfato de magnesio y se concentraron en vacío. El residuo se sometió a cromatografía en columna, eluyendo con acetato de etilo / ciclohexano. Las fracciones seleccionadas se evaporaron para proporcionar el compuesto del título (135 mg). LC-MS(Método A) : TR 1,19, 433 (M+H⁺).

Ejemplo P2: Preparación de 5-etil-2-(3-etilsulfanil-2-naftil)-3-metil-6-(trifluorometil)-6H-imidazo [4,5-clpiridin-4-ona (A2, 2.134):



A una solución agitada de compuesto A1 (125 mg, 0.2897 mmol) e CH₂Cl₂ (5.7 ml) se añadió *m*-CPBA (171.4 mg, 0.6952 mmol) a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se agitó después durante 2 horas. La reacción se controló por TLC. Una vez completado el inicio, la mezcla de reacción se enfrió bruscamente con Na₂S₂O₃ saturado, NaHCO₃ y se extrajo con CH₂Cl₂ (10 X 2 mL). La capa de CH₂Cl₂ se secó sobre Na₂SO₄. Se filtró, se concentró y se purificó mediante cromatografía en columna utilizando ciclohexano-acetato de etilo (100-200 gel de sílice) para dar el compuesto deseado en forma de un sólido blanco.(130 mg). LC-MS(Método A) : TR 1,05, 464 (M+H⁺).

Ejemplo P3: Preparación de 5-etil-2-(3-etilsulfanil-2-quinolil)-3-metil-6-(trifluorometil)-3aH-imidazo[4,5-clpiridin-4-ona (A3, 2.139):

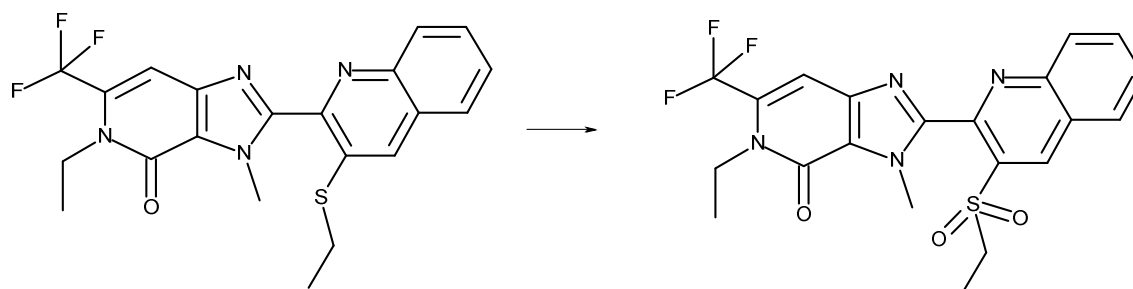


A3(2.139).

Etapa A: La preparación de N-[1-etil-3-(metilamino)-2-oxo-6-(trifluorometil)-3H-piridin-4-il]-3-etilsulfanil-quinolina-2-carboxamida y N-[4-amino-1-etil-2-oxo-6-(trifluorometil)-3-piridil]-3-etilsulfanil-N-metil-quinolina-2-carboxamida se hizo utilizando el mismo protocolo que el descrito en el Ejemplo P1, Etapa A para A1. LC-MS(Método A) : TR 0,94, 451 (M+H⁺), 449 (M-H⁺)..

Etapa B: La preparación de 5-etil-2-(3-etilsulfanil-2-quinolil)-3-metil-6-(trifluorometil)-3aH-imidazo[4,5-clpiridin-4-ona (A3, 2.139) se hizo utilizando el mismo protocolo que el descrito en el Ejemplo P1, Etapa B para A1. LC-MS(Método A) : TR 1,14, 433 (M+H⁺).

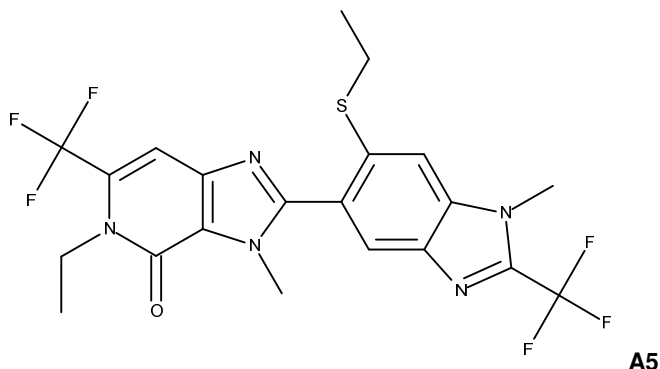
Ejemplo P4: Preparación de 5-etil-2-(3-etilsulfonil-2-quinolil)-3-metil-6-(trifluorometil)-6H-imidazo[4,5-clpiridin-4-ona (A4, 2.140):



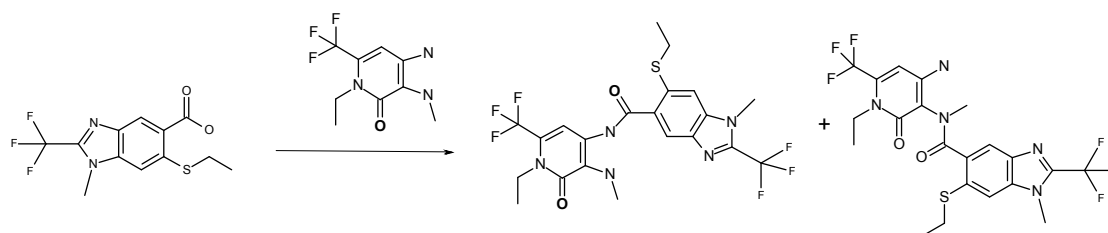
A4

La 5-etil-2-(3-etilsulfonil-2-quinolil)-3-metil-6-(trifluorometil)-6H-imidazo[4,5-clpiridin-4-ona A4 se sintetizó como para A2 en el ejemplo P2. LC-MS(Método A) : TR 1,06, 465 (M+H⁺).

- 5 **Ejemplo P5:** Preparación de 5-etil-2-[6-etilsulfanil-1-metil-2-(trifluorometil)bencimidazol-5-il]-3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-4-ona (**A5**, 2.141)



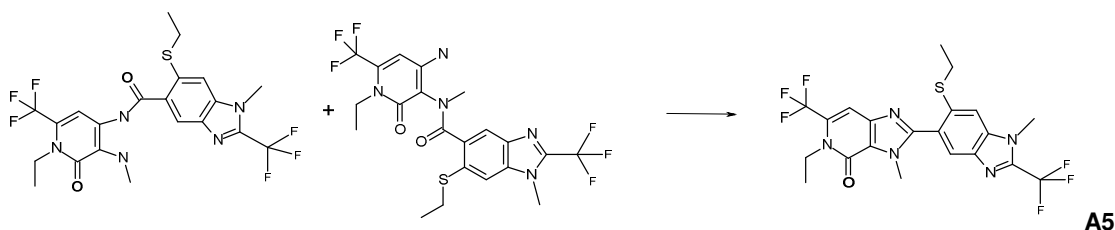
- 10 **Etapa A:** Preparación de N-[1-etil-3-(metilamino)-2-oxo-6-(trifluorometil)-4-piridil]-6-etilsulfanil-1-metil-2-(trifluorometil)bencimidazol-5-carboxamida y N-[4-amino-1-etil-2-oxo-6-(trifluorometil)-3-piridil]-6-etilsulfanil-N,1-dimetil-2-(trifluorometil)bencimidazol-5-carboxamida



- 15 **Ácido 6-etilsulfanil-1-metil-2-(trifluorometil)bencimidazol-5-carboxílico** (162 mg, 0.533 mmol) se disolvió en diclorometano (5 mL) y se añadió dicloruro de oxalilo (0.083 mL, 0.941 mmol) y N,N-dimetilformamida (1 gota). La mezcla se agitó durante 30 min a temperatura ambiente y luego a reflujo durante 30 min. El disolvente se separó y se secó en vacío.

- 20 El cloruro de 3-etilsulfaniinaftaleno-2-carbonilo se diluyó con 3 ml de THF y se añadió a una mezcla de 4-amino-1-etil-3-(metilamino)-6-(trifluorometil)piridin-2-ona (Preparada en el ejemplo 4, 123 mg, 0.523 mmol) en tetrahidrofurano (5.0 mL) y N,N-diétiltanamina (0.184 mL, 1.31 mmol). La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. La solución se diluyó con una solución saturada de carbonato de sodio y acetato de etilo. La fase acuosa se extrajo con acetato de etilo (2 veces). La capa orgánica combinada se secó sobre Na₂SO₄, se filtró, concentró y purificó por cromatografía en columna utilizando ciclohexano-acetato de etilo para dar los compuestos deseados (273 mg). La mezcla se utilizó sin purificación extra para la siguiente etapa LC-MS(Método A) : TR 0,94, 520 (M-H⁺).522 (M+H⁺).

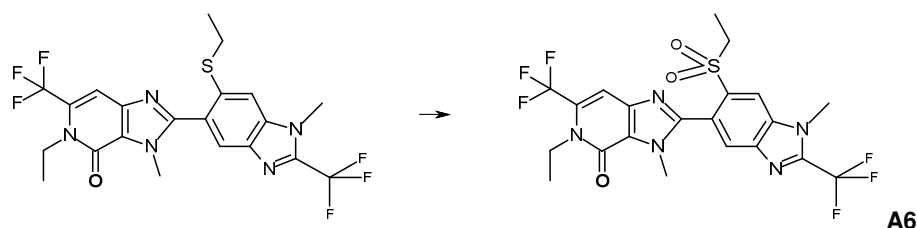
- 30 **Etapa B:** Preparación de 5-etil-2-(3-etilsulfanil-2-naftil)-3-metil-6-(trifluorometil)-3aH-imidazo [4,5-clpiridin-4-ona (**A5**, 2.141):



- 35 Un vial de microondas se cargó con una mezcla de N-[1-etil-3-(metilamino)-2-oxo-6-(trifluorometil)-4-piridil]-6-etilsulfanil-1-metil-2-(trifluorometil)bencimidazol-5-carboxamida y N-[4-amino-1-etil-2-oxo-6-(trifluorometil)-3-piridil]-6-etilsulfanil-N,1-dimetil-2-(trifluorometil)bencimidazol-5-carboxamida (0.273 g, 0.523 mmol) y ácido acético (4.0 mL). Después, la mezcla se agitó durante 1 h a 150°C bajo microondas. La mezcla de reacción se diluyó con agua (10

5 mL) y se extrajo dos veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se lavaron con agua y salmuera, y se secaron sobre sulfato de magnesio y se concentraron en vacío. El residuo se sometió a cromatografía en columna, eluyendo con acetato de etilo / ciclohexano. Las fracciones seleccionadas se evaporaron para proporcionar el compuesto del título (164 mg). LC-MS (Método A) : TR 1,13, 505 (M+H⁺). ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 1,25 (t, 3 H), 1,40 (t, 3 H), 2,89 (c, 2 H), 3,93 (s, 3 H), 4,01 (s, 3 H), 4,26 (c, 2 H), 7,30 (s, 1 H), 7,53 (s, 1 H), 7,89 (s, 1 H).

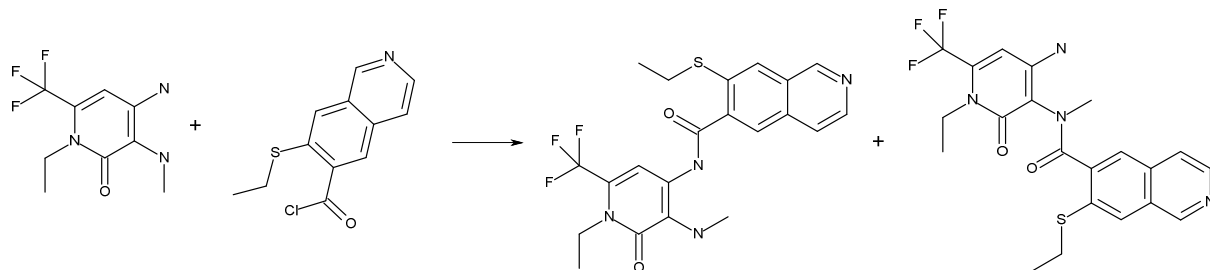
Ejemplo P6 Preparación de 5-etil-2-[6-etilsulfonil-1-metil-2-(trifluorometil)bencimidazol-5-il]-3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-4-ona (**A6**, 2.142):



15 A una solución agitada de compuesto A5 (158 mg, 0.313 mmol) e CH₂Cl₂ (15 ml) se añadió *m*-CPBA (158 mg, 0.690 mmol) a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se agitó después durante la noche. La reacción se controló por TLC. Una vez completado el inicio, la mezcla de reacción se enfrió bruscamente con Na₂S₂O₃ saturado, NaHCO₃ y se extrajo con CH₂Cl₂ (10 X 2 mL). La capa de CH₂Cl₂ se secó sobre Na₂SO₄. Se filtró, se concentró y se purificó mediante cromatografía en columna utilizando ciclohexano-acetato de etilo (100-200 gel de sílice) para dar el compuesto deseado en forma de un sólido blanco. (168 mg). LC-MS(Método A) : TR 1,05, 537 (M+H⁺).

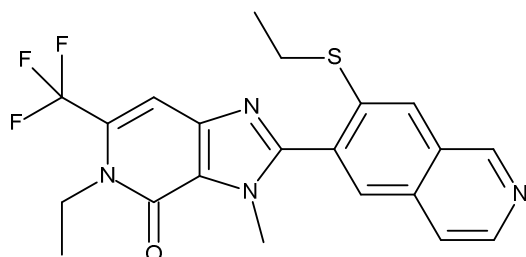
20 ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 1,27 (t, 3 H), 1,41 (t, 3 H), 3,55 (m, 2 H), 3,90 (s, 3 H), 4,14 (s, 3 H), 4,25 (c, 2 H), 7,22 (s, 1 H), 7,98 (s, 1 H), 8,41 (s, 1 H).

Ejemplo P7: Síntesis de N-[1-etil-3-(metilamino)-2-oxo-6-(trifluorometil)-4-piridil]-7-etilsulfanil-isoquinolina-6-carboxamida y N-[4-amino-1-etil-2-oxo-6-(trifluorometil)-3-piridil]-7-etilsulfanil-N-metil-isoquinolina-6-carboxamida



30 Ácido 7-etilsulfanilisoquinolina-6-carboxílico (109 mg, 0.467 mmol) se disolvió en diclorometano (0.934 mL) y se añadió dicloruro de oxalilo (121 mg, 0.0831 mL, 0.934 mmol) y N,N-dimetilformamida (1 gota). La mezcla se agitó durante 30 min a temperatura ambiente y luego a reflujo durante 30 min. Después, el disolvente se separó y se secó en vacío. El cloruro de 7-etilsulfanilisoquinolina-6-carbonilo (118 mg, 0.467 mmol) se diluyó con 0.5 ml de tetrahidrofurano y se añadió a una solución de 4-amino-1-etil-3-(metilamino)-6-(trifluorometil)piridin-2-ona[1643139-91-6] (100 mg, 0.42515 mmol) en tetrahidrofurano (0.85 mL) y piridina (0.10 mL). La mezcla se agitó a reflujo durante 3 horas y se detuvo. Se añadieron acetato de etilo y agua; La fase orgánica se recogió, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró en vacío. El residuo se purificó por cromatografía de resolución instantánea para dar una mezcla de N-[1-etil-3-(metilamino)-2-oxo-6-(trifluorometil)-4-piridil]-7-etilsulfanil-isoquinolina-6-carboxamida y N-[4-amino-1-etil-2-oxo-6-(trifluorometil)-3-piridil]-7-etilsulfanil-N-metil-isoquinolina-6-carboxamida LC-MS (Método A) TR = 0,75 min, m/z = 449 [M-1], 451 [M+1].

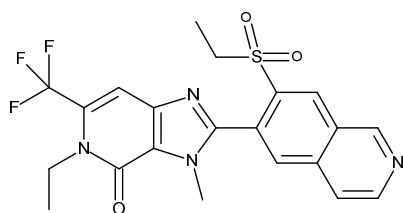
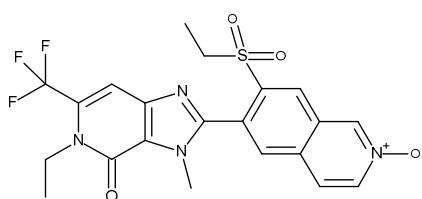
40 **EtapA:** Síntesis de 5-etil-2-(7-etilsulfanil-6-isoquinolil)-3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-4-ona (**A7**):

**A7**

En un vial de microondas, una mezcla de N-[1-etil-3-(metilamino)-2-oxo-6-(trifluorometil)-4-piridil]-7-etilsulfanil-isoquinolina-6-carboxamida y N-[4-amino-1-etil-2-oxo-6-(trifluorometil)-3-piridil]-7-etilsulfanil-N-metil-isoquinolina-6-carboxamida (0.1 g, 0.22 mmol) se resolvió en ácido acético (1.1 mL) y el vial se agitó durante 30 min a 150°C en el sistema de microondas, para completar la reacción, el vial se agitó durante 30 min más a 150°C. Se añadieron agua (10 mL) / acetato de etilo y la fase orgánica se secó sobre sulfato de magnesio y luego se concentró. El residuo se purificó por cromatografía de resolución instantánea para dar Síntesis de 5-etil-2-(7-etilsulfanil-6-isoquinolil)-3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-4-ona (**A7**).

^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 1,34 (t, 3 H), 1,41 (t, 3 H), 3,03 (c, 2 H), 4,00 (s, 3 H), 4,27 (c, 2H), 7,30 (s, 1 H), 7,66 (d, 1 H), 7,90 (d, 2 H), 8,58 (d, 1 H), 9,29 (s, 1 H).

Etapa B: Síntesis de 5-etil-2-(7-etilsulfonil-6-isoquinolil)-3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-4-ona (**A8**) y 5-etil-2-(7-etilsulfonil-2-oxido-isoquinolin-2-io-6-il)-3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-4-ona (**A9**).

**A8****A9**

A 0°C, a una solución de 5-etil-2-(7-etilsulfanil-6-isoquinolil)-3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-4-ona (**A7**) (53 mg, 0.1225 mmol) en diclorometano (2,5 mL) se añadió ácido 3-clorobenzenocarboperoxoico (72.50 mg, 0.2941 mmol). La solución se agitó durante 2 horas a temperatura ambiente. Se añadieron agua y diclorometano, y la capa orgánica se lavó 3 veces con 5 ml de una solución de NaHSO_3 al 10%, a continuación, con una solución de NaOH 1 N, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró en vacío. El residuo se purificó por cromatografía de resolución instantánea para dar 5-etil-2-(7-etilsulfonil-6-isoquinolil)-3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-4-ona (**A8**) (17 mg, 29%) y 5-etil-2-(7-etilsulfonil-2-oxido-isoquinolin-2-io-6-il)-3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-4-ona (**A9**) (29 mg, 50%)..

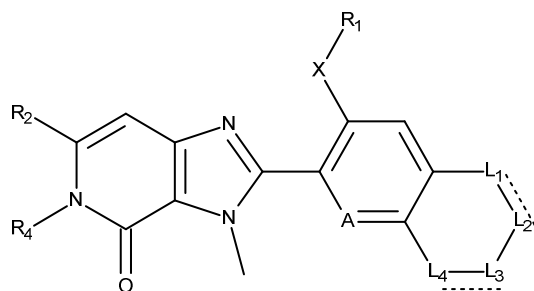
5-etil-2-(7-etilsulfanil-6-isoquinolil)-3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-4-ona (**A8**)

^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 1,29 (t, 3 H) 1,41 (t, 3 H) 3,50 (d, 2 H) 3,96 (s, 3 H) 4,26 (c, 2 H) 7,23 (s, 1 H) 7,75 - 7,86 (m, 1 H) 7,94 - 8,04 (m, 1 H) 8,81 - 8,96 (m, 2 H) 9,57 (s, 1 H).

5-etil-2-(7-etilsulfonil-2-oxido-isoquinolin-2-io-6-il)-3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-4-ona (**A9**):

^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 1,29 (t, 3 H), 1,32 - 1,32 (m, 1 H), 1,41 (t, 3 H), 3,49 (c, 2 H), 3,93 - 4,01 (m, 3 H), 3,97 (s, 3 H), 4,26 (c, 2 H), 7,21 (s, 1 H), 7,75 - 7,85 (m, 1 H), 7,91 (s, 1 H), 8,34 (dd, 1 H), 8,58 (s, 1 H), 8,89 - 8,99 (m, 1 H).

La siguiente Tabla 3 describe compuestos preferidos de la fórmula I-1b:



(I-1b)

Tabla 3:

Comp. N.º	X	R ₁	A	R ₂	R ₄	L ₁	L ₂	L ₃	L ₄
A1 (2,133)	S	CH ₂ CH ₃	CH	CF ₃	CH ₂ CH ₃	CH	CH	CH	CH
A2 (2,134)	SO ₂	CH ₂ CH ₃	CH	CF ₃	CH ₂ CH ₃	CH	CH	CH	CH
A3 (2,139)	S	CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₂ CH ₃	CH	CH	CH	CH
A4 (2,140)	SO ₂	CH ₂ CH ₃	N	CF ₃	CH ₂ CH ₃	CH	CH	CH	CH
A5 (2,141)	S	CH ₂ CH ₃	CH	CF ₃	CH ₂ CH ₃	N-CH ₃	C-CF ₃	N	-
A6 (2,142)	SO ₂	CH ₂ CH ₃	CH	CF ₃	CH ₂ CH ₃	N-CH ₃	C-CF ₃	N	-
A7	S	CH ₂ CH ₃	CH	CF ₃	CH ₂ CH ₃	CH	N	CH	CH
A8	SO ₂	CH ₂ CH ₃	CH	CF ₃	CH ₂ CH ₃	CH	N	CH	CH
A9	SO ₂	CH ₂ CH ₃	CH	CF ₃	CH ₂ CH ₃	CH	N+-O-	CH	CH

- 5 La actividad de las composiciones de acuerdo con la invención puede ampliarse considerablemente y adaptarse a las circunstancias predominantes mediante la adición de otros principios activos como insecticidas, acaricidas y/o fungicidas. Las mezclas de los compuestos de fórmula I con otros principios activos como insecticidas, acaricidas y/o fungicidas también pueden presentar otras ventajas sorprendentes, las cuales también pueden describirse, en un sentido más amplio, como actividad sinérgica. Por ejemplo, mejor tolerancia por las plantas, fitotoxicidad reducida, los insectos se pueden controlar en sus diferentes fases de desarrollo o un comportamiento mejor durante su producción, por ejemplo, durante la molienda o mezclado, durante su almacenamiento o durante su uso.

15 Adiciones adecuadas a los ingredientes activos aquí presentes son, por ejemplo, representantes de las siguientes clases de ingredientes activos: compuestos orgánicos de fósforo, derivados de nitrofenol, tioureas, hormonas juveniles, formamidinas, derivados de benzofenona, ureas, derivados de pirrol, carbamatos, piretroides, hidrocarburos clorados, acilureas, derivados de piridilmetilnamino, macrólidos, neonicotinoides y preparados de *Bacillus thuringiensis*.

20 Se prefieren las siguientes mezclas de los compuestos de fórmula I con ingredientes activos (la abreviatura "TX" significa "un compuesto seleccionado del grupo que consiste en los compuestos descritos en las Tablas 1 a 3 de la presente invención"):

un adyuvante seleccionado del grupo de sustancias que consisten en aceites de petróleo (628) + TX,

- 25 un acaricida seleccionado del grupo de sustancias constituido por 1,1-bis(4-clorofenil)-2-etoxietanol (nombre según la IUPAC) (910) + TX, bencensulfonato de 2,4-diclorofenilo (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1059) + TX, 2-fluoro-*N*-metil-*N*-1-naftilacetamida (nombre según la IUPAC) (1295) + TX, 4-clorofenil fenil sulfona (nombre

según la IUPAC) (981) + TX, abamectina (1) + TX, acequinocil (3) + TX, acetoprol [CCN] + TX, acrinatrina (9) + TX, aldicarb (16) + TX, aldoxicarb (863) + TX, alfa-cipermetrina (202) + TX, amidition (870) + TX amidoflumet [CCN] + TX, amidotioato (872) + TX, amiton (875) + TX, amiton hidrógeno oxalato (875) + TX, amitraz (24) + TX, aramita (881) + TX, óxido arsenoso (882) + TX, AVI 382 (código de compuesto) + TX, AZ 60541 (código de compuesto) + TX azinfos-etil (44) + TX, azinfos-metil (45) + TX, azobenceno (nombre según la IUPAC) (888) + TX, azociclotina (46) + TX, azotoato (889) + TX, benomilo (62) + TX, benoxafos [CCN] + TX, benzoximato (71) + TX, benzoato de bencilo (nombre según la IUPAC) [CCN] + TX, bifenazato (74) + TX, bifentrina (76) + TX, binapacril (907) + TX, brofenvalerato + TX, bromocicleno (918) + TX, bromofos (920) + TX, bromofos-etil (921) + TX, bromopropilato (94) + TX, buprofezin (99) + TX, butocarboxim (103) + TX, butoxicarboxim (104) + TX, butilpiridabeno + TX, polisulfuro de calcio (nombre según la IUPAC) (111) + TX, canfecloro (941) + TX, carbanolato (943) + TX, carbaril (115) + TX, carbofuran (118) + TX, carbofenotion (947) + TX, CGA 50'439 (código de desarrollo) (125) + TX, quinometionato (126) + TX, clorbensida (959) + TX, clordimeform (964) + TX, hidrocloreto de clordimeform (964) + TX, clorfenapir (130) + TX, clorfenetol (968) + TX, clorfenson (970) + TX, sulfuro de clorfenson (971) + TX, clorfenvinfos (131) + TX, clorobencilato (975) + TX, cloromebuform (977) + TX, clorometiuron (978) + TX, cloropropilato (983) + TX, cloropirifos (145) + TX, cloropirifos-metil (146) + TX, clortiofos (994) + TX, cinerina I (696) + TX, cinerina II (696) + TX, cinerinas (696) + TX, clofentezine (158) + TX, closantel [CCN] + TX, coumafós (174) + TX, crotamiton [CCN] + TX, crotoxiños (1010) + TX, cufraneb (1013) + TX, ciantoato (1020) + TX, ciflumetofeno (n.º de Reg. CAS: 400882-07-7) + TX, cihalotrina (196) + TX, cihexatina (199) + TX, cipermetrina (201) + TX, DCPM (1032) + TX, DDT (219) + TX, demefion (1037) + TX, demefion-O (1037) + TX, demefion-S (1037) + TX, demefon (1038) + TX, demeton-metil (224) + TX, demefon-O (1038) + TX, demefon-O-metil (224) + TX, demefon-S (1038) + TX, demeton-S-metil (224) + TX, demefon-S-metilsulfona (1039) + TX, diafentiuron (226) + TX, dialifos (1042) + TX, diazinon (227) + TX, diclofluanida (230) + TX, diclorvos (236) + TX, diclifos + TX, dicofol (242) + TX, dicrotofos (243) + TX, dienoclor (1071) + TX, dimefox (1081) + TX, dimetoato (262) + TX, dinactina (653) + TX, dinex (1089) + TX, dinex-diclexina (1089) + TX, dinobuton (269) + TX, dinocap (270) + TX, dinocap-4 [CCN] + TX, dinocap-6 [CCN] + TX, dinopenton (1090) + TX, dinopenton (1092) + TX, dinosulfon (1097) + TX, dinoterbon (1098) + TX, dioxation (1102) + TX, difenil sulfona (nombre según la IUPAC) (1103) + TX, disulfiram [CCN] + TX, disulfotón (278) + TX, DNOC (282) + TX, dofenapin (1113) + TX, doramectina [CCN] + TX, endosulfano (294) + TX, endotion (1121) + TX, EPN (297) + TX, eprinomectina [CCN] + TX, etión (309) + TX, etoato-metil (1134) + TX, etoxazol (320) + TX, etrimfos (1142) + TX, fenazaflor (1147) + TX, fenazaquin (328) + TX, óxido de fenbutatina (330) + TX, fenotiocarbo (337) + TX, fenpropatrin (342) + TX, fenpirad + TX, fenpiroximato (345) + TX, fenson (1157) + TX, fentrifanilo (1161) + TX, fenvalerato (349) + TX, fipronil (354) + TX, fluacripirim (360) + TX, fluazuron (1166) + TX, flubenzimina (1167) + TX, flucicloxuron (366) + TX, flucitrinato (367) + TX, fluenetil (1169) + TX, flufenoxuron (370) + TX, flumetrina (372) + TX, fluorbensida (1174) + TX, fluvalinato (1184) + TX, FMC 1137 (código de desarrollo) (1185) + TX, formetanato (405) + TX, hidrocloreto de formetanato (405) + TX, formotion (1192) + TX, formparanato (1193) + TX, gamma-HCH (430) + TX, gliodin (1205) + TX, halfenprox (424) + TX, heptenofos (432) + TX, ciclopropanocarboxilato de hexadecilo (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1216) + TX, hexitiazox (441) + TX, yodometano (nombre según la IUPAC) (542) + TX, isocarbofos (473) + TX, O-(metoxiaminotiofosforil)salicilato de isopropilo (nombre según la IUPAC) (473) + TX ivermectina [CCN] + TX, jasmolina I (696) + TX, jasmolin II (696) + TX, jodfenfos (1248) + TX, lindano (430) + TX, lufenuron (490) + TX, malation (492) + TX, malonoben (1254) + TX, mecarbam (502) + TX, mefosolan (1261) + TX, mesulfen [CCN] + TX, metacriños (1266) + TX, metamidofos (527) + TX, metidation (529) + TX, metiocarb (530) + TX, metomilo (531) + TX, bromuro de metilo (537) + TX, metolcarb (550) + TX, mevinfos (556) + TX, mexacarbato (1290) + TX, milbemectina (557) + TX, milbemicina oxima [CCN] + TX, mipafox (1293) + TX, monocrotofos (561) + TX, morfotion (1300) + TX, moxidectina [CCN] + TX, naled (567) + TX, NC-184 (código de compuesto) + TX, NC-512 (código de compuesto) + TX, nifluridida (1309) + TX, nikkomicinas [CCN] + TX, nitrilacarb (1313) + TX, complejo de nitrilacarb y cloruro de zinc 1:1 (1313) + TX, NNI-0101 (código de compuesto) + TX, NNI-0250 (código de compuesto) + TX, ometoato (594) + TX, oxamilo (602) + TX, oxideprofos (1324) + TX, oxidisulfoton (1325) + TX, pp'-DDT (219) + TX, paration (615) + TX, permetrina (626) + TX, aceites del petróleo (628) + TX, fenkaptón (1330) + TX, fentoato (631) + TX, forato (636) + TX, fosalona (637) + TX, fosfolan (1338) + TX, fosmet (638) + TX, fosfamidon (639) + TX, foxim (642) + TX, pirimifos-metil (652) + TX, policloroterpenos (nombre tradicional) (1347) + TX, polinactinas (653) + TX, proclonol (1350) + TX, profenofos (662) + TX, promacil (1354) + TX, propargita (671) + TX, propetamfos (673) + TX, propoxur (678) + TX, protidation (1360) + TX, protoato (1362) + TX, piretrin I (696) + TX, piretrina II (696) + TX, piretrinas (696) + TX, piridaben (699) + TX, piridafention (701) + TX, pirimidifen (706) + TX, piritato (1370) + TX, quinalfos (711) + TX, quintiofos (1381) + TX, R-1492 (código de desarrollo) (1382) + TX, RA-17 (código de desarrollo) (1383) + TX, rotenona (722) + TX, schradan (1389) + TX, sebufos + TX, selamectina [CCN] + TX, SI-0009 (código de compuesto) + TX, sofamida (1402) + TX, spirodiclofen (738) + TX, spiromesifen (739) + TX, SSI-121 (código de desarrollo) (1404) + TX, sulfiram [CCN] + TX, sulfuramida (750) + TX, sulfotep (753) + TX, sulfur (754) + TX, SZI-121 (código de desarrollo) (757) + TX, tau-fluvalinato (398) + TX, tebufenpirad (763) + TX, TEPP (1417) + TX, terbam + TX, tetraclorvinfos (777) + TX, tetradifon (786) + TX, tetranactina (653) + TX, tetrasul (1425) + TX, tiafenox + TX, tiocarboxima (1431) + TX, tiofanox (800) + TX, tiometon (801) + TX, tioquinox (1436) + TX, turingiensina [CCN] + TX, triamifós (1441) + TX, triarateno (1443) + TX, triazofos (820) + TX, triazuron + TX, triclorfón (824) + TX, trifenofos (1455) + TX, trinactina (653) + TX, vamidotión (847) + TX, vaniliprol [CCN] e YI-5302 (código del compuesto) + TX,

65 un algicida seleccionado del grupo de sustancias constituido por betoxazina [CCN] + TX, dioctanoato de cobre

(nombre de la IUPAC) (170) + TX, sulfato de cobre (172) + TX, cibutrina [CCN] + TX, diclono (1052) + TX, diclorofeno (232) + TX, endotal (295) + TX, fentina (347) + TX, cal hidratada [CCN] + TX, nabam (566) + TX, quinoclamina (714) + TX, quinonamida (1379) + TX, simazina(730) + TX, acetato de trifenilestaño (nombre de la IUPAC) (347) e hidróxido de trifenilestaño (nombre de la IUPAC) (347) + TX,

5 un antihelmíntico seleccionado del grupo de sustancias constituido por abamectina (1) + TX, crufomato (1011) + TX, doramectina [CCN] + TX, emamectina (291) + TX, benzoato de emamectina (291) + TX, eprinomectina [CCN] + TX, ivermectina [CCN] + TX, milbemicina oxima [CCN] + TX, moxidectina [CCN] + TX, piperazina [CCN] + TX, selamectina [CCN] + TX, spinosad (737) y tiofanato (1435) + TX,

10 un avicida seleccionado del grupo de sustancias constituido por cloralosa (127) + TX, endrina (1122) + TX, fentiona (346) + TX, piridin-4-amina (nombre de la IUPAC) (23) y estricnina (745) + TX,

15 un bactericida seleccionado del grupo de sustancias constituido por 1-hidroxi-1*H*-piridin-2-tiona (nombre según la IUPAC) (1222) + TX, 4-(quinoxalin-2-ilamino)benzenosulfonamida (nombre de la IUPAC) (748) + TX, sulfato de 8-hidroxiquinolina (446) + TX, bronopol (97) + TX, dioctanoato de cobre (nombre de la IUPAC) (170) + TX, hidróxido de cobre (nombre de la IUPAC) (169) + TX, cresol [CCN] + TX, diclorofeno (232) + TX, dipiritiona (1105) + TX, dodicina (1112) + TX, fenaminosulf (1144) + TX, formaldehído (404) + TX, hidrargafeno [CCN] + TX, kasugamicina (483) + TX, hidrocloreuro de kasugamicina hidrato (483) + TX, bis(dimetilditiocarbamato) de níquel (nombre de la IUPAC) (1308) + TX, nitrapirina (580) + TX, octilinona (590) + TX, ácido oxolínico (606) + TX, oxitetraciclina (611) + TX, hidroxiquinolina sulfato de potasio (446) + TX, probenazol (658) + TX, estreptomocina (744) + TX, sesquisulfato de estreptomocina (744) + TX, tecloftalam (766) + TX, y tiomersal [CCN] + TX,

25 un agente biológico seleccionado del grupo de sustancias que consiste en *Adoxophyes orana* GV (12) + TX, *Agrobacterium radiobacter* (13) + TX, *Amblyseius* spp. (19) + TX, *Anagrapha falcifera* NPV (28) + TX, *Anagrus atomus* (29) + TX, *Aphelinus abdominalis* (33) + TX, *Aphidius colemani* (34) + TX, *Aphidoletes aphidimyza* (35) + TX, *Autographa californica* NPV (38) + TX, *Bacillus firmus* (48) + TX, *Bacillus sphaericus* Neide (nombre científico) (49) + TX, *Bacillus thuringiensis* Berliner (nombre científico) (51) + TX, *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai* (nombre científico) (51) + TX, *Bacillus thuringiensis* subsp. *israelensis* (nombre científico) (51) + TX, *Bacillus thuringiensis* subsp. *japonensis* (nombre científico) (51) + TX, *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki* (nombre científico) (51) + TX, *Bacillus thuringiensis* subsp. *tenebrionis* (nombre científico) (51) + TX, *Beauveria bassiana* (53) + TX, *Beauveria brongniartii* (54) + TX, *Chrysoperla carnea* (151) + TX, *Cryptolaemus montrouzieri* (178) + TX, *Cydia pomonella* GV (191) + TX, *Dacnusa sibirica* (212) + TX, *Diglyphus isaea* (254) + TX, *Encarsia formosa* (nombre científico) (293) + TX, *Eretmocerus eremicus* (300) + TX, *Helicoverpa zea* NPV (431) + TX, *Heterorhabditis bacteriophora* y *H. megidis* (433) + TX, *Hippodamia convergens* (442) + TX, *Leptomastix dactylopii* (488) + TX, *Macrolophus caliginosus* (491) + TX, *Mamestra brassicae* NPV (494) + TX, *Metaphycus helvolus* (522) + TX, *Metarhizium anisopliae* var. *acridum* (nombre científico) (523) + TX, *Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae* (nombre científico) (523) + TX, *Neodiprion sertifer* NPV y *N. lecontei* NPV (575) + TX, *Orius* spp. (596) + TX, *Paecilomyces fumosoroseus* (613) + TX, *Phytoseiulus persimilis* (644) + TX, *Spodoptera exigua* virus de la polihedrosis nuclear multicápside (nombre científico) (741) + TX, *Steinernema bibionis* (742) + TX, *Steinernema carpocapsae* (742) + TX, *Steinernema feltiae* (742) + TX, *Steinernema glaseri* (742) + TX, *Steinernema riobrave* (742) + TX, *Steinernema riobrave* (742) + TX, *Steinernema scapterisci* (742) + TX, *Steinernema* spp. (742) + TX, *Trichogramma* spp. (826) + TX, *Typhlodromus occidentalis* (844) y *Verticillium lecanii* (848) + TX,

45 un esterilizante del suelo seleccionado del grupo de sustancias constituido por yodometano (nombre según la IUPAC) (542) y bromuro de metilo (537) + TX,

50 un quimioesterilizante seleccionado del grupo de sustancias constituido por afolato [CCN] + TX, bisazir [CCN] + TX, busulfan [CCN] + TX, diflubenzurón (250) + TX, dimatif [CCN] + TX, hemel [CCN] + TX, hempa [CCN] + TX, metepa [CCN] + TX, metiotepa [CCN] + TX, afolato de metilo [CCN] + TX, morzid [CCN] + TX, penflurona [CCN] + TX, tepa [CCN] + TX, tiohempa [CCN] + TX, tiotepa [CCN] + TX, tretamina [CCN] y uredepa [CCN] + TX,

55 una feromona de insecto seleccionada del grupo de sustancias constituido por acetato de (*E*)-dec-5-en-1-ilo con (*E*)-dec-5-en-1-ol (nombre según la IUPAC) (222) + TX, acetato de (*E*)-tridec-4-en-1-ilo (nombre de la IUPAC) (829) + TX, (*E*)-6-metilhept-2-en-4-ol (nombre de la IUPAC) (541) + TX, acetato de (*E,Z*)-tetradeca-4,10-dien-1-ilo (nombre de la IUPAC) (779) + TX, acetato de (*Z*)-dodec-7-en-1-ilo (nombre de la IUPAC) (285) + TX, (*Z*)-hexadec-11-enal (nombre de la IUPAC) (436) + TX, acetato de (*Z*)-hexadec-11-en-1-ilo (nombre de la IUPAC) (437) + TX, acetato de (*Z*)-hexadec-13-en-11-in-1-ilo (nombre según la IUPAC) (438) + TX, (*Z*)-icos-13-en-10-ona (nombre de la IUPAC) (448) + TX, (*Z*)-tetradec-7-en-1-al (nombre según la IUPAC) (782) + TX, (*Z*)-tetradec-9-en-1-ol (nombre de la IUPAC) (783) + TX, acetato de (*Z*)-tetradec-9-en-1-ilo (nombre según la IUPAC) (784) + TX, acetato de (*7E,9Z*)-dodeca-7,9-dien-1-ilo (nombre de la IUPAC) (283) + TX, acetato de (*9Z,11E*)-tetradeca-9,11-dien-1-ilo (nombre de la IUPAC) (780) + TX, acetato de (*9Z,12E*)-tetradeca-9,12-dien-1-ilo (nombre de la IUPAC) (781) + TX, 14-metiloctadec-1-eno (nombre de la IUPAC) (545) + TX, 4-metilnonan-5-ol con 4-metilnonan-5-ona (nombre de la IUPAC) (544) + TX, alfa-multistriatina [CCN] + TX, brevicomina [CCN] + TX, codlelura [CCN] + TX, codlemona (167) + TX, cueclura (179) + TX, disarlura (277) + TX, acetato de dodec-8-en-1-ilo (nombre de la IUPAC) (286) + TX, acetato de dodec-9-en-1-ilo (nombre de la IUPAC) (287) + TX, dodeca-8 + TX, acetato de 10-dien-1-ilo (nombre

de la IUPAC) (284) + TX, dominicalura [CCN] + TX, 4-metioctanoato de etilo (nombre de la IUPAC) (317) + TX, eugenol [CCN] + TX, frontalina [CCN] + TX, gossiplure (420) + TX, grandlure (421) + TX, grandlura I (421) + TX, grandlura II (421) + TX, grandlura III (421) + TX, grandlura IV (421) + TX, hexalure [CCN] + TX, ipsdienol [CCN] + TX, ipsenol [CCN] + TX, japonilura (481) + TX, lineatina [CCN] + TX, litlura [CCN] + TX, looplura [CCN] + TX, medlure [CCN] + TX, ácido megatomoico [CCN] + TX, metil eugenol (540) + TX, muscalure (563) + TX, acetato de octadeca-2,13-dien-1-ilo (nombre de la IUPAC) (588) + TX, acetato de octadeca-3,13-dien-1-ilo (nombre de la IUPAC) (589) + TX, orfralura [CCN] + TX, orictalura (317) + TX, ostramona [CCN] + TX, siglura [CCN] + TX, sordidina (736) + TX, sulcatol [CCN] + TX, acetato de tetradec-11-en-1-ilo (nombre de la IUPAC) (785) + TX, trimedlure (839) + TX, trimedlura A (839) + TX, trimedlura B₁ (839) + TX, trimedlura B₂ (839) + TX, trimedlura C (839) y trunc-call [CCN] + TX,

un repelente de insectos seleccionado del grupo de sustancias constituido por 2-(octiltio)etanol (nombre según la IUPAC) (591) + TX, butopionoxilo (933) + TX, butoxi(polipropilenglicol) (936) + TX, adipato de dibutilo (nombre de la IUPAC) (1046) + TX, ftalato de dibutilo (1047) + TX, succinato de dibutilo (nombre de la IUPAC) (1048) + TX, dietiltoluamida [CCN] + TX, carboato de dimetilo [CCN] + TX, ftalato de dimetilo [CCN] + TX, etil hexanodiol (1137) + TX, hexamida [CCN] + TX, metoquin-butilo (1276) + TX, metilneodecanamida [CCN] + TX, oxamato [CCN] y picaridina [CCN] + TX,

un insecticida seleccionado del grupo de sustancias constituido por 1-dicloro-1-nitroetano (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1058) + TX, 1,1-dicloro-2,2-bis(4-etilfenil)etano (nombre de la IUPAC) (1056), + TX, 1,2-dicloropropano (nombre de la IUPAC/Chemical Abstracts) (1062) + TX, 1,2-dicloropropano con 1,3-dicloropropeno (nombre de la IUPAC) (1063) + TX, 1-bromo-2-cloroetano (nombre de la IUPAC/Chemical Abstracts) (916) + TX, acetato de 2,2,2-tricloro-1-(3,4-diclorofenil)etilo (nombre de la IUPAC) (1451) + TX, fosfato de 2,2-diclorovinil 2-etilsulfinitil metilo (nombre de la IUPAC) (1066) + TX, dimetilcarbamato de 2-(1,3-ditiolan-2-il)fenilo (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1109) + TX, tiocianato de 2-(2-butoxi)etilo (nombre de la IUPAC/Chemical Abstracts) (935) + TX, metilcarbamato de 2-(4,5-dimetil-1,3-dioxolan-2-il)fenilo (nombre de la IUPAC/ Chemical Abstracts) (1084) + TX, 2-(4-cloro-3,5-xililoxi)etanol (nombre de la IUPAC) (986) + TX, fosfato de 2-clorovinil dietilo (nombre de la IUPAC) (984) + TX, 2-imidazolidona (nombre de la IUPAC) (1225) + TX, 2-isovalerilindan-1,3-diona (nombre de la IUPAC) (1246) + TX, metilcarbamato de 2-metil(prop-2-inil)aminofenilo (nombre de la IUPAC) (1284) + TX, laurato de 2-tiocianatoetilo (nombre de la IUPAC) (1433) + TX, 3-bromo-1-cloroprop-1-eno (nombre de la IUPAC) (917) + TX, dimetilcarbamato de 3-metil-1-fenilpirazol-5-ilo (nombre de la IUPAC) (1283) + TX, metilcarbamato de 4-metil(prop-2-inil)amino-3,5-xililo (nombre de la IUPAC) (1285) + TX, dimetilcarbamato de 5,5-dimetil-3-oxociclohex-1-enilo (nombre de la IUPAC) (1085) + TX, abamectina (1) + TX, acefato (2) + TX, acetamiprid (4) + TX, acetiona [CCN] + TX, acetoprol [CCN] + TX, acrinatrina (9) + TX, acrilonitrilo (nombre de la IUPAC) (861) + TX, alanicarb (15) + TX, aldcarb (16) + TX, aldoxicarb (863) + TX, aldrina (864) + TX, aletrina (17) + TX, alosamidina [CCN] + TX, alixicarb (866) + TX, alfa-cipermetrina (202) + TX, alfa-ecdisona [CCN] + TX, fosfuro de aluminio (640) + TX, amidition (870) + TX amidotioato (872) + TX, aminocarb (873) + TX, amiton (875) + TX, amiton hidrógeno oxalato (875) + TX, amitraz (24) + TX, anabasina (877) + TX, atidation (883) + TX, AVI 382 (código de compuesto) + TX, AZ 60541 (código de compuesto) + TX, azadiractina (41) + TX, azametifs (42) + TX, azinfos-etil (44) + TX, azinfos-metil (45) + TX, azotoato (889) + TX, delta endotoxinas de *Bacillus thuringiensis* (52) + TX, hexafluorosilicato de bario [CCN] + TX, polisulfuro de bario (nombre de la IUPAC/Chemical Abstracts) (892) + TX, bartrina [CCN] + TX, Bayer 22/190 (código de desarrollo) (893) + TX, Bayer 22408 (código de desarrollo) (894) + TX, bendiocarb (58) + TX, benfurcarb (60) + TX, bensultap (66) + TX, beta-ciflutrina (194) + TX, beta-cipermetrina (203) + TX, bifentrina (76) + TX, bioaletrina (78) + TX, isómero de bioaletrina S-ciclopentenilo (79) + TX, bioetanometrina [CCN] + TX, biopermetrina (908) + TX, bioresmetrina (80) + TX, Bis(2-cloroetil) éter (nombre de la IUPAC) (909) + TX, bistrifluron (83) + TX, bórax (86) + TX, brofenvalerato + TX, bromfenvinfos (914) + TX, bromocicleno (918) + TX, bromo-DDT [CCN] + TX, bromofós (920) + TX, bromofos-etil (921) + TX, bufencarb (924) + TX, buprofezin (99) + TX, butacarb (926) + TX, butatiofos (927) + TX, butocarboxim (103) + TX, butonato (932) + TX, butoxicarboxim (104) + TX, butilpiridabeno + TX, cadusafós (109) + TX, arseniato de calcio [CCN] + TX, cianuro de calcio (444) + TX, polisulfuro de calcio (nombre según la IUPAC) (111) + TX, canfecloro (941) + TX, carbanolato (943) + TX, carbaril (115) + TX, carbofuran (118) + TX, disulfuro de carbono (nombre de la IUPAC/Chemical Abstracts) (945) + TX, tetracloruro de carbono (nombre de la IUPAC) (946) + TX, carbofenotion (947) + TX, carbosulfan (119) + TX, cartap (123) + TX, hidrocloreuro de cartap (123) + TX, cevadina (725) + TX, clorbicleno (960) + TX, clordano (128) + TX, clordecona (963) + TX, clordimeform (964) + TX, hidrocloreuro de clordimeform (964) + TX, cloretofos (129) + TX, clorfenapir (130) + TX, clorfenvinfos (131) + TX, clorfluazuron (132) + TX, clormefos (136) + TX, cloroformo [CCN] + TX, cloropicrina (141) + TX, clorfoxim (989) + TX, clorprozofos (990) + TX, clorpirifos (145) + TX, clorpirifos-metil (146) + TX, clortiofos (994) + TX, cromafenozida (150) + TX, cinerina I (696) + TX, cinerina II (696) + TX, cinerinas (696) + TX, cis-resmetrina + TX, cismetrina (80) + TX, cloctrina + TX, cloetocarb (999) + TX, closantel [CCN] + TX, clotianidina (165) + TX, acetoarsenito de cobre [CCN] + TX, arseniato de cobre [CCN] + TX, oleato de cobre [CCN] + TX, coumafós (174) + TX, coumitoato(1006) + TX, crotamiton [CCN] + TX, crotiofos (1010) + TX, crufomato(1011) + TX, criolita (177) + TX, CS 708 (código de desarrollo) (1012) + TX, cianofenfos (1019) + TX, cianofos (184) + TX, ciantoato (1020) + TX, cicletrina [CCN] + TX, cicloprotrina (188) + TX, ciflutrina (193) + TX, cihalotrina (196) + TX, cipermetrina (201) + TX, cifenotrina (206) + TX, ciromazina (209) + TX, citioato [CCN] + TX, d-limoneno [CCN] + TX, d-tetrametrina (788) + TX, DAEP (1031) + TX, dazomet (216) + TX, DDT (219) + TX, decarbofuran (1034) + TX, deltametrina (223) + TX, demefion (1037) + TX, demefion-O (1037) + TX, demefion-S (1037) + TX, demefon (1038) + TX,

demeton-metil (224) + TX, demefon-O (1038) + TX, demefon--O-metil (224) + TX, demefon-S (1038) + TX, demeton-S-metil (224) + TX, demeton-S-metilsulfona (1039) + TX, diafentiuron (226) + TX, dialifos (1042) + TX, diamidafos (1044) + TX, diazinon (227) + TX, dicapton (1050) + TX, diclofention (1051) + TX, diclorvos (236) + TX, diclifos + TX, dicresilo [CCN] + TX, dicrotofós (243) + TX, diciclanil (244) + TX, dieldrina (1070) + TX, 5-
 5 metilpirazol-3-il fosfato de dietilo (nombre de la IUPAC) (1076) + TX, diflubenzuron (250) + TX, dilor [CCN] + TX, dimeflutrina [CCN] + TX, dimefox (1081) + TX, dimetan (1085) + TX, dimetoato (262) + TX, dimetrina (1083) + TX, dimetilvinfos (265) + TX, dimetilan (1086) + TX, dinex (1089) + TX, dinex-diclexina (1089) + TX, dinoprop (1093) + TX, dinosam (1094) + TX, dinoseb (1095) + TX, dinotefuran (271) + TX, diofenolan (1099) + TX, dioxabenzofos (1100) + TX, dioxacarb (1101) + TX, dioxation (1102) + TX, disulfoton (278) + TX, diticrofos (1108) + TX, DNOC (282) + TX, doramectina [CCN] + TX, DSP (1115) + TX, ecdisterona [CCN] + TX, EI 1642 (código de desarrollo) (1118) + TX, emamectina (291) + TX, benzoato de emamectina (291) + TX, EMPC (1120) + TX, empentrina (292) + TX, endosulfan (294) + TX, endotion (1121) + TX, endrina (1122) + TX, EPBP (1123) + TX, EPN (297) + TX, epofenonano (1124) + TX, eprinomectina [CCN] + TX, esfenvalerato (302) + TX, etafos [CCN] + TX, etiofencarb (308) + TX, etiona (309) + TX, etiprol (310) + TX, etoato-metil (1134) + TX, etoprofos (312) + TX, formiato de etilo (nombre de la IUPAC) [CCN] + TX, etil-DDD (1056) + TX, dibromuro de etileno (316) + TX, dicloruro de etileno (nombre químico) (1136) + TX, óxido de etileno [CCN] + TX, etofenprox (319) + TX, etrimfos (1142) + TX, EXD (1143) + TX, famfur (323) + TX, fenamifos (326) + TX, fenazaflor (1147) + TX, fenclorfos (1148) + TX, fenetacarb (1149) + TX, fenflutrina (1150) + TX, fenitrothion (335) + TX, fenobucarb (336) + TX, fenoxacrim (1153) + TX, fenoxicarb (340) + TX, fenpiritrina (1155) + TX, fenpropatrina (342) + TX, fenpirad + TX, fensulfotión (1158) + TX, fention (346) + TX, fention-etilo [CCN] + TX, fenvalerato (349) + TX, fipronil (354) + TX, flonicamid (358) + TX, flubendiamida (CAS. Nº Reg.: 272451-65-7) + TX, flucofurona (1168) + TX, flucicloxurona (366) + TX, flucitrinato (367) + TX, fluenetil (1169) + TX, flufenerim [CCN] + TX, flufenoxuron (370) + TX, flufenprox (1171) + TX, flumetrins (372) + TX, fluvalinato (1184) + TX, FMC 1137 (código de desarrollo) (1185) + TX, fonofos (1191) + TX, formetanato (405) + TX, hidrocloreto de formetanato (405) + TX, formotion (1192) + TX, formparanato (1193) + TX, fosmetilan (1194) + TX, fospirato (1195) + TX, fostiazato (408) + TX, fostietan (1196) + TX, furatiocarb (412) + TX, furetrina (1200) + TX, gamma-cihalotrina (197) + TX, gamma-HCH (430) + TX, guazatina (422) + TX, acetatos de guazatina (422) + TX, GY-81 (código de desarrollo) (423) + TX, halfenprox (424) + TX, halofenozida (425) + TX, HCH (430) + TX, HEOD (1070) + TX, heptaclor (1211) + TX, heptenofos (432) + TX, heterofos [CCN] + TX, hexaflumuron (439) + TX, HHDN (864) + TX, hidrametilnona (443) + TX, cianuro de hidrógeno (444) + TX, hidropreno (445) + TX, hiquincarb (1223) + TX, imidacloprid (458) + TX, imiprotrins (460) + TX, indoxacarb (465) + TX, yodometano (nombre de la IUPAC) (542) + TX, IPSP (1229) + TX, isazofos (1231) + TX, isobenzan (1232) + TX, isocarbofos (473) + TX, isodrina (1235) + TX, isofenfos (1236) + TX, isolano (1237) + TX, isoprocab (472) + TX, *O*-(metoxiaminotiofosforil)salicilato de isopropilo nombre de la (IUPAC) (473) + TX, isoprotiolano (474) + TX, isotioato (1244) + TX, isoxation (480) + TX, ivermectina [CCN] + TX, jasmolina I (696) + TX, jasmolin II (696) + TX, jodfenfos (1248) + TX, hormona juvenil I [CCN] + TX, hormona juvenil II [CCN] + TX, hormona juvenil III [CCN] + TX, kelevan (1249) + TX, kinopreno (484) + TX, lambda-cihalotrina (198) + TX, arsenato de plomo [CCN] + TX, lepimectina (CCN) + TX, leptofos (1250) + TX, lindano (430) + TX, lirimfos (1251) + TX, lufenuron (490) + TX, litidation (1253) + TX, metilcarbamato de *m*-cumenilo (nombre de la IUPAC) (1014) + TX, fosfuro de magnesio (nombre de la IUPAC) (640) + TX, malation (492) + TX, malonoben (1254) + TX, mazidox (1255) + TX, mecarbam (502) + TX, mecarfon (1258) + TX, menazon (1260) + TX, mefosfolan (1261) + TX, cloruro mercurioso (513) + TX, mesulfenfos (1263) + TX, metaflumizona (CCN) + TX, metam (519) + TX, metam-potasio (519) + TX, metam-sodio (519) + TX, metacrifos (1266) + TX, metamidofos (527) + TX, fluoruro de metanosulfonilo (nombre de la IUPAC/Chemical Abstracts) (1268) + TX, metidation (529) + TX, metiocarb (530) + TX, metocrotofos (1273) + TX, metomilo (531) + TX, metopreno (532) + TX, metoquin-butilo (1276) + TX, metotrina (533) + TX, metoxiclor (534) + TX, metoxifenozida (535) + TX, bromuro de metilo (537) + TX, isotiocianato de metilo (543) + TX, metilcloroformo [CCN] + TX, cloruro de metileno [CCN] + TX, metoflutrina [CCN] + TX, metolcarb (550) + TX, metoxadiazona (1288) + TX, mevinfos (556) + TX, mexacarbato (1290) + TX, milbemectina (557) + TX, milbemicina oxima [CCN] + TX, mipafox (1293) + TX, mirex (1294) + TX, monocrotofos (561) + TX, morfotion (1300) + TX, moxidectina [CCN] + T naftalofos [CCN] + TX, naled (567) + TX, naftaleno (nombre de la IUPAC/Chemical Abstracts) (1303) + TX, NC-170 (código de desarrollo) (1306) + TX, NC-184 (código de compuesto) + TX, nicotina (578) + TX, sulfato de nicotina (578) + TX, nifluridida (1309) + TX, nitenpiram (579) + TX, nitiazina (1311) + TX, nitrilacarb (1313) + TX, complejo de nitrilacarb y cloruro de zinc 1:1 (1313) + TX, NNI-0101 (código de compuesto) + TX, NNI-0250 (código de compuesto) + TX, nornicotina (nombre tradicional) (1319) + TX, novaluron (585) + TX, noviflumuron (586) + TX, etilfosfonotioato de *O*-5-dicloro-4-yodofenil *O*-etilo (nombre de la IUPAC) (1057) + TX, fosforotioato de *O,O*-dietil *O*-4-metil-2-oxo-2*H*-cromen-7-ilo (nombre de la IUPAC) (1074) + TX, fosforotioato de *O,O*-dietil *O*-6-metil-2-propilpirimidin-4-ilo (nombre de la IUPAC) (1075) + TX, ditiopirofosfato de *O,O,O*-tetrapropilo (nombre IUPAC) (1424) + TX, ácido oleico (nombre de la IUPAC) (593) + TX, ometoato (594) + TX, oxamilo (602) + TX, oxidemeton-metilo (609) + TX, oxideprofos (1324) + TX, oxidisulfoton (1325) + TX, pp'-DDT (219) + TX, para-diclorobenceno [CCN] + TX, paration (615) + TX, paration-metilo (616) + TX, penfluron [CCN] + TX, pentaclorofenol (623) + TX, laurato de pentaclorofenilo (nombre de la IUPAC) (623) + TX, permetrina (626) + TX, aceites del petróleo (628) + TX, PH 60-38 (código de desarrollo) (1328) + TX, fenkapton (1330) + TX, fenotrina (630) + TX, fentoato (631) + TX, forato (636) + TX, fosalona (637) + TX, fosfolan (1338) + TX, fosmet (638) + TX, fosnicloro (1339) + TX, fosfamidon (639) + TX, fosfina (nombre de la IUPAC) (640) + TX, foxim (642) + TX, foxim-metilo (1340) + TX, pirimetafos (1344) + TX, pirimicarb (651) + TX, pirimifos-etilo (1345) + TX, pirimifos-metilo (652) + TX, isómeros de policlorodociclopentadieno (nombre de la IUPAC) (1346) + TX, policloroterpenos (nombre tradicional) (1347) + TX, arsenito de potasio [CCN] + TX, tiocianato de potasio [CCN] + TX, praletrina

(655) + TX, precoceno I [CCN] + TX, precoceno II [CCN] + TX, precoceno III [CCN] + TX, primidofos (1349) + TX, profenofos (662) + TX, proflutrina [CCN] + TX, promacilo (1354) + TX, promecarb (1355) + TX, propafos (1356) + TX, propetamfos (673) + TX, propoxur (678) + TX, protidation (1360) + TX, protiofos (686) + TX, protoato (1362) + TX, protrifenbuto [CCN] + TX, pimetrozina (688) + TX, piraclufos (689) + TX, pirazofos (693) + TX, piresmetrina (1367) + TX, piretrina I (696) + TX, piretrina II (696) + TX, piretrinas (696) + TX, piridaben (699) + TX, piridalil (700) + TX, piridafention (701) + TX, pirimidifen (706) + TX, pirimitato (1370) + TX, piriproxifen (708) + TX, quassia [CCN] + TX, quinalfós (711) + TX, quinalfós-metilo (1376) + TX, quinotiona (1380) + TX, quintiofos (1381) + TX, R-1492 (código de desarrollo) (1382) + TX, rafoxanida [CCN] + TX, resmetrina (719) + TX, rotenona (722) + TX, RU 15525 (código de desarrollo) (723) + TX, RU 25475 (código de desarrollo) (1386) + TX, riania (1387) + TX, rianodina (nombre tradicional) (1387) + TX, sabadilla (725) + TX, escradán (1389) + TX, sebufos + TX, selamectina [CCN] + TX, SI-0009 (código de compuesto) + TX, SI-0205 (código de compuesto) + TX, SI-0404 (código de compuesto) + TX, SI-0405 (código de compuesto) + TX, silafluofen (728) + TX, SN 72129 (código de desarrollo) (1397) + TX, arseniato de sodio [CCN] + TX, cianuro de sodio (444) + TX, fluoruro de sodio (nombre de la IUPAC/Chemical Abstracts) (1399) + TX, hexafluorosilicato de sodio (1400) + TX, pentaclorofenóxido de sodio (623) + TX, seleniato de sodio (nombre según la IUPAC) (1401) + TX, tiocianato de sodio [CCN] + TX, sofamida (1402) + TX, spinosad (737) + TX, spiromesifen (739) + TX, spirotetmat (CCN) + TX, sulcofuron (746) + TX, sulcofuron-sodio (746) + TX, sulfluramid (750) + TX, sulfotep (753) + TX, fluoruro de sulfurrilo (756) + TX, sulprofos (1408) + TX, aceites de alquitrán (758) + TX, tau-fluvalinato (398) + TX, tazimcarb (1412) + TX, TDE (1414) + TX, tebufenozida (762) + TX, tebufenpirad (763) + TX, tebupirimfos (764) + TX, teflubenzuron (768) + TX, teflutrina (769) + TX, temefos (770) + TX, TEPP (1417) + TX, teraletrina (1418) + TX, terbam + TX, terbufós (773) + TX, tetracloroetano [CCN] + TX, tetraclorvinfos (777) + TX, tetrametrina (787) + TX, teta-cipermetrina (204) + TX, tiacloprid (791) + TX, tiafenox + TX, tiametoxam (792) + TX, ticofos (1428) + TX, tiocarboxima (1431) + TX, tiociclám (798) + TX, hidrógeno-oxalato de tiociclám (798) + TX, tiodicarb (799) + TX, tiofanox (800) + TX, tiometon (801) + TX, tionazina (1434) + TX, tiosultap (803) + TX, tiosultap-sodio (803) + TX, turingiensina [CCN] + TX, tolfenpirad (809) + TX, tralometrina (812) + TX, transflutrina (813) + TX, transpermetrina (1440) + TX, triamifos (1441) + TX, triazamato (818) + TX, triazofos (820) + TX, triazuron + TX, triclorfón (824) + TX, triclormetafos-3 [CCN] + TX, tricloronat (1452) + TX, trifenofos (1455) + TX, triflumuron (835) + TX, trimetacarb (840) + TX, tripreno (1459) + TX, vamidotion (847) + TX, vaniliprol [CCN] + TX, veratrídina (725) + TX, veratrina (725) + TX, XMC (853) + TX, xililcarb (854) + TX, YI-5302 (código de compuesto) + TX, zeta-cipermetrina (205) + TX, zetametrina + TX, fosfuro de zinc (640) + TX, zolaprofos (1469) y ZXI 8901 (código de desarrollo) (858) + TX, ciantraniliprol [736994-63-19 + TX, clorantraniliprol [500008-45-7] + TX, cienopirafen [560121-52-0] + TX, ciflumetofen [400882-07-7] + TX, pirifluquinazon [337458-27-2] + TX, spinetoram [187166-40-1 + 187166-15-0] + TX, spirotetmat [203313-25-1] + TX, sulfoxaflor [946578-00-3] + TX, flufiprol [704886-18-0] + TX, meperflutrina [915288-13-0] + TX, tetrametilflutrina [84937-88-2] + TX, Triflumezopirim (descrito en el documento WO 2012/092115) + TX, fluxametamida (documento WO 2007/026965) + TX,

un moluscicida seleccionado del grupo de sustancias constituido por óxido de bis(tributilestaño) (nombre según la IUPAC) (913) + TX, bromoacetamida [CCN] + TX, arseniato de calcio [CCN] + TX, cloetocarb (999) + TX, acetoarsenato de cobre [CCN] + TX, sulfato de cobre (172) + TX, fentina (347) + TX, fosfato férrico (nombre de la IUPAC) (352) + TX, metaldehído (518) + TX, metiocarb (530) + TX, niclosamida (576) + TX, niclosamida-olamina (576) + TX, pentaclorofenol (623) + TX, pentaclorofenóxido de sodio (623) + TX, tazimcarb (1412) + TX, tiodicarb (799) + TX, óxido de tributilestaño (913) + TX, trifenmorf (1454) + TX, trimetacarb (840) + TX, acetato de trifenilestaño (nombre de la IUPAC) (347) e hidróxido de trifenilestaño (nombre de la IUPAC) (347) + TX, piriprol [394730-71-3] + TX,

un nematocida seleccionado del grupo de sustancias constituido por AKD-3088 (código de compuesto) + TX, 1,2-dibromo-3-cloropropano (nombre de la IUPAC/Chemical Abstracts) (1045) + TX, 1,2-dicloropropano (nombre de la IUPAC/ Chemical Abstracts) (1062) + TX, 1,2-dicloropropano con 1,3-dicloropropeno (nombre de la IUPAC) (1063) + TX, 1,3-dicloropropeno (233) + TX, 3,4-diclorotetrahidrotiofeno 1,1-dióxido (nombre de la IUPAC/Chemical Abstracts) (1065) + TX, 3-(4-clorofenil)-5-metilrodanina (nombre de la IUPAC) (980) + TX, ácido 5-metil-6-tioxo-1,3,5-tiadiazinan-3-ilacético (nombre de la IUPAC) (1286) + TX, 6-isopentenilaminopurina (210) + TX, abamectina (1) + TX, acetoprol [CCN] + TX, alanicarb (15) + TX, aldicarb (16) + TX, aldoxicarb (863) + TX, AZ 60541 (código de compuesto) + TX, benclotiaz [CCN] + TX, benomilo (62) + TX, butilpiridabeno + TX, cadusafós (109) + TX, carbofuran (118) + TX, disulfuro de carbono (945) + TX, carbosulfan (119) + TX, cloropicrina (141) + TX, ccloropirifos (145) + TX, cloetocarb (999) + TX, citoquininas (210) + TX, dazomet (216) + TX, DBCP (1045) + TX, DCIP (218) + TX, diamidafos (1044) + TX, diclofention (1051) + TX, diclifos + TX, dimetoato (262) + TX, doramectina [CCN] + TX, emamectina (291) + TX, benzoato de emamectina (291) + TX, eprinomectina [CCN] + TX, etoprofós (312) + TX, dibromuro de etileno (316) + TX, fenamifos (326) + TX, fenpirad + TX, fensulfotión (1158) + TX, fostiazato (408) + TX, fostietan (1196) + TX, furfural [CCN] + TX, GY-81 (código de desarrollo) (423) + TX, heterofos [CCN] + TX, yodometano (nombre IUPAC) (542) + TX, isamidofos (1230) + TX, isazofos (1231) + TX, ivermectina [CCN] + TX, kinetina (210) + TX, mecarfón (1258) + TX, metam (519) + TX, metam-potasio (519) + TX, metam-sodio (519) + TX, bromuro de metilo (537) + TX, isotiocianato de metilo (543) + TX, milbemcina oxima [CCN] + TX, moxidectina [CCN] + TX, composición de *Myrothecium verrucaria* (565) + TX, NC-184 (código de compuesto) + TX, oxamilo (602) + TX, forato (636) + TX, fosfamidon (639) + TX, fosfocarb [CCN] + TX, sebufos + TX, selamectina [CCN] + TX, espinosad (737) + TX, terbam + TX, terbufós (773) + TX, tetraclorotiofeno (nombre de la IUPAC/ Chemical Abstracts) (1422) + TX, tiafenox + TX, tionazina (1434) + TX,

triazofos (820) + TX, triazuron + TX, xilenoles [CCN] + TX, YI-5302 (código de compuesto) y zeatina (210) + TX, fluensulfona [318290-98-1] + TX,

5 un inhibidor de la nitrificación seleccionado del grupo de sustancias constituido por etilxantato potásico [CCN] y nitrapirina (580) + TX,

un activador vegetal seleccionado del grupo de sustancias constituido por acibenzolar (6) + TX, acibenzolar-S-metilo (6) + TX, probenazole (658) y extracto de *Reynoutria sachalinensis* (720) + TX,

10 un rodenticida seleccionado del grupo de sustancias constituido por 2-isovalerilindan-1,3-diona (nombre según la IUPAC) (1246) + TX, 4-(quinoxalin-2-ilamino)benzenosulfonamida (nombre de la IUPAC) (748) + TX, alfa-clorohidrina [CCN] + TX, fosfuro de aluminio (640) + TX, antu (880) + TX, óxido arsenoso (882) + TX, carbonato de bario (891) + TX, bistiosemi (912) + TX, brodifacoum (89) + TX, bromadiolona (91) + TX, brometalina (92) + TX, cianuro de calcio (444) + TX, cloralosa (127) + TX, clorofacinona (140) + TX, colecalciferol (850) + TX, coumacloro (1004) + TX, coumafurilo (1005) + TX, coumatetralilo (175) + TX, crimidina (1009) + TX, difenacoum (246) + TX, difetialona (249) + TX, difacinona (273) + TX, ergocalciferol (301) + TX, flocoumafen (357) + TX, fluoroacetamida (379) + TX, flupropadina (1183) + TX, hidrocloreuro de flupropadina (1183) + TX, gamma-HCH (430) + TX, HCH (430) + TX, cianuro de hidrógeno (444) + TX, yodometano (nombre de la IUPAC) (542) + TX, lindano (430) + TX, fosfito de magnesio (nombre de la IUPAC) (640) + TX, bromuro de metilo (537) + TX, norbormida (1318) + TX, fosacetim (1336) + TX, fosfina (nombre de la IUPAC) (640) + TX, fosforoso [CCN] + TX, pindona (1341) + TX, arsenito de potasio [CCN] + TX, pirinurón (1371) + TX, escillirosida (1390) + TX, arseniato de sodio [CCN] + TX, cianuro de sodio (444) + TX, fluoroacetato de sodio (735) + TX, estricnina (745) + TX, sulfato de talio [CCN] + TX, warfarina (851) y fosfuro de zinc (640) + TX,

25 un compuesto sinérgico seleccionado del grupo de sustancias constituido por piperonilato de 2-(2-butoxi)etilo (nombre según la IUPAC) (934) + TX, 5-(1,3-benzodioxol-5-il)-3-hexilciclohex-2-enona (nombre de la IUPAC) (903) + TX, farnesol con nerolidol (324) + TX, MB-599 (código de desarrollo) (498) + TX, MGK 264 (código de desarrollo) (296) + TX, piperonil butóxido (649) + TX, piprotal (1343) + TX, isómero de propilo (1358) + TX, S421 (código de desarrollo) (724) + TX, sesamex (1393) + TX, sesasmolin (1394) y sulfóxido (1406) + TX,

30 un repelente de animales seleccionado del grupo de sustancias constituido por antraquinona (32) + TX, cloralosa (127) + TX, naftenato de cobre [CCN] + TX, oxiclورو de cobre (171) + TX, diazinon (227) + TX, dicitlopentadieno (nombre químico) (1069) + TX, guazatina (422) + TX, acetatos de guazatina (422) + TX, metiocarb (530) + TX, piridin-4-amina (nombre de la IUPAC) (23) + TX, tiram (804) + TX, trimetacarb (840) + TX, naftenato de zinc [CCN] y ziram (856) + TX,

un virucida seleccionado del grupo de sustancias que consiste en manina [CCN] y ribavirina [CCN] + TX,

40 un protector de lesiones seleccionado del grupo de sustancias constituido por óxido de mercurio (512) + TX, Octilina (590) y tiofanato-metilo (802) + TX,

y compuestos biológicamente activos seleccionados del grupo constituido por azaconazol (60207-31-0) + TX, bitertanol [70585-36-3] + TX, bromuconazol [116255-48-2] + TX, ciproconazol [94361-06-5] + TX, difenoconazol [119446-68-3] + TX, diniconazol [83657-24-3] + TX, epoxiconazol [106325-08-0] + TX, fenbuconazol [114369-43-6] + TX, fluquinconazol [136426-54-5] + TX, flusilazol [85509-19-9] + TX, flutriafol [76674-21-0] + TX, hexaconazol [79983-71-4] + TX, imazalil [35554-44-0] + TX, imibenconazol [86598-92-7] + TX, ipconazol [125225-28-7] + TX, metconazol [125116-23-6] + TX, miclobutanil [88671-89-0] + TX, pefurazoato [101903-30-4] + TX, penconazol [66246-88-6] + TX, protioconazol [178928-70-6] + TX, pirifenox [88283-41-4] + TX, procloraz [67747-09-5] + TX, propiconazol [60207-90-1] + TX, simeconazol [149508-90-7] + TX, tebuconazol [107534-96-3] + TX, tetraconazol [112281-77-3] + TX, triadimefon [43121-43-3] + TX, triadimenol [55219-65-3] + TX, triflumizol [99387-89-0] + TX, triticonazol [131983-72-7] + TX, ancimidol [12771-68-5] + TX, fenarimol [60168-88-9] + TX, nuarimol [63284-71-9] + TX, bupirimato [41483-43-6] + TX, dimetirimol [5221-53-4] + TX, etirimol [23947-60-6] + TX, dodemorf [1593-77-7] + TX, fenpropidina [67306-00-7] + TX, fenpropimorf [67564-91-4] + TX, espiroxamina [118134-30-8] + TX, tridemorf [81412-43-3] + TX, ciprodinil [121552-61-2] + TX, mepanipirim [110235-47-7] + TX, pirimetanil [53112-28-0] + TX, fenpiclonil [74738-17-3] + TX, fludioxonil [131341-86-1] + TX, benalaxil [71626-11-4] + TX, furalaxil [57646-30-7] + TX, metalaxil [57837-19-1] + TX, R-metalaxil [70630-17-0] + TX, ofurace [58810-48-3] + TX, oxadixil [77732-09-3] + TX, benomil [17804-35-2] + TX, carbendazim [10605-21-7] + TX, debacarb [62732-91-6] + TX, fuberidazol [3878-19-1] + TX, tiabendazol [148-79-8] + TX, clozolinato [84332-86-5] + TX, diclozolina [24201-58-9] + TX, iprodiona [36734-19-7] + TX, miclozolina [54864-61-8] + TX, procimidona [32809-16-8] + TX, vinclozolina [50471-44-8] + TX, boscalid [188425-85-6] + TX, carboxina [5234-68-4] + TX, fenfuram [24691-80-3] + TX, flutolanil [66332-96-5] + TX, mepronil [55814-41-0] + TX, oxicarboxina [5259-88-1] + TX, pentiopirad [183675-82-3] + TX, tifulzamida [130000-40-7] + TX, guazatina [108173-90-6] + TX, dodina [2439-10-3] [112-65-2] (base libre) + TX, iminocadina [13516-27-3] + TX, azoxiestrobina [131860-33-8] + TX, dimoxiestrobina [149961-52-4] + TX, enestroburina {Proc. BCPC, Congr. Int., Glasgow, 2003, 1, 93} + TX, fluoxaestrobina [361377-29-9] + TX, kresoxim-metilo [143390-89-0] + TX, metominostrobina [133408-50-1] + TX, trifloxestrobina [141517-21-7] + TX, orisaestrobina [248593-16-0] + TX, picoxiestrobina [117428-22-5] + TX, piraclóestrobina [175013-18-0] + TX,

- ferbam [14484-64-1] + TX, mancozeb [8018-01-7] + TX, maneb [12427-38-2] + TX, metiram [9006-42-2] + TX, propineb [12071-83-9] + TX, tiram [137-26-8] + TX, zineb [12122-67-7] + TX, ziram [137-30-4] + TX, captafol [2425-06-1] + TX, captan [133-06-2] + TX, diclofluanida [1085-98-9] + TX, fluoroimida [41205-21-4] + TX, folpet [133-07-3] + TX, tolifluanida [731-27-1] + TX, mezcla de Burdeos [8011-63-0] + TX, hidróxido de cobre [20427-59-2] + TX, oxiclóruo de cobre [1332-40-7] + TX, sulfato de cobre [7758-98-7] + TX, óxido de cobre [1317-39-1] + TX, mancozeb [53988-93-5] + TX, oxina-cobre [10380-28-6] + TX, dinocap [131-72-6] + TX, nitrotil-isopropilo [10552-74-6] + TX, edifenfos [17109-49-8] + TX, iprobenfos [26087-47-8] + TX, isoprotiolano [50512-35-1] + TX, fosfodifen [36519-00-3] + TX, pirazofos [13457-18-6] + TX, tolclofos-metilo [57018-04-9] + TX, acibenzolar-S-metilo [135158-54-2] + TX, anilazina [101-05-3] + TX, bentiavalicarb [413615-35-7] + TX, blasticidina-S [2079-00-7] + TX, quinometionato [2439-01-2] + TX, cloroneb [2675-77-6] + TX, clorotalonil [1897-45-6] + TX, ciflufenamida [180409-60-3] + TX, cimoxanil [57966-95-7] + TX, diclona [117-80-6] + TX, diclocimet [139920-32-4] + TX, diclomezina [62865-36-5] + TX, dicloran [99-30-9] + TX, dietofencarb [87130-20-9] + TX, dimetomorf [110488-70-5] + TX, SYP-LI90 (Flumorf) [211867-47-9] + TX, ditionona [3347-22-6] + TX, etaboxam [162650-77-3] + TX, etridiazol [2593-15-9] + TX, famoxadona [131807-57-3] + TX, fenamidona [161326-34-7] + TX, fenoxanil [115852-48-7] + TX, fentina [668-34-8] + TX, ferimzona [89269-64-7] + TX, fluazinam [79622-59-6] + TX, fluopicolida [239110-15-7] + TX, flusulfamida [106917-52-6] + TX, fenhexamida [126833-17-8] + TX, foseetil-aluminio [39148-24-8] + TX, himexazol [10004-44-1] + TX, iprovalicarb [140923-17-7] + TX, IKF-916 (Ciazofamida) [120116-88-3] + TX, kasugamicina [6980-18-3] + TX, metasulfocarb [66952-49-6] + TX, metrafenona [220899-03-6] + TX, pencicuron [66063-05-6] + TX, ftalida [27355-22-2] + TX, polioxinas [11113-80-7] + TX, probenazol [27605-76-1] + TX, propamocarb [25606-41-1] + TX, proquinazid [189278-12-4] + TX, piroquilon [57369-32-1] + TX, quinoxifen [124495-18-7] + TX, quintozeno [82-68-8] + TX, azufre [7704-34-9] + TX, tiadinil [223580-51-6] + TX, triazóxido [72459-58-6] + TX, triciclazol [41814-78-2] + TX, triforina [26644-46-2] + TX, validamicina [37248-47-8] + TX, zoxamida (RH7281) [156052-68-5] + TX, mandipropamida [374726-62-2] + TX, isopirazam [881685-58-1] + TX, sedaxano [874967-67-6] + TX, (9-diclorometilen-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il)amida del ácido 3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico (descrita en el documento WO 2007/048556) + TX, (3',4',5'-trifluorobifenil-2-il)amida del ácido 3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico (dada a conocer en el documento WO 2006/087343) + TX, [(3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bS)-3-[(ciclopropilcarbonil)oxi]-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-decahidro-6,12-dihidroxi-4,6a,12b-trimetil-11-oxo-9-(3-piridinil)-2H,11H-nafto[2,1-b]pirano[3,4-e]piran-4-il]metil-
- 30 ciclopropanocarboxilato [915972-17-7] + TX y 1,3,5-trimetil-N-(2-metil-1-oxopropil)-N-[3-(2-metilpropil)-4-[2,2,2-trifluoro-1-metoxi-1-(trifluorometil)etil]fenil]-1H-pirazol-4-carboxamida [926914-55-8] + TX;
- microbacterias, incluyendo *Acinetobacter lwoffii* + TX, *Acremonium alternatum* + TX + TX, *Acremonium cephalosporium* + TX + TX *Acremonium diospyri* + TX, *Acremonium obclavatum* + TX, *Adoxophyes orana granulovirus* (AdoxGV) (Capex®) + TX, *Agrobacterium radiobacter* cepa K84 (Galltrol-A®) + TX, *Alternaria alternate* + TX, *Alternaria cassia* + TX, *Alternaria destruens* (Smolder®) + TX, *Ampelomyces quisqualis* (AQ10®) + TX, *Aspergillus flavus* AF36 (AF36®) + TX, *Aspergillus flavus* NRRL 21882 (Aflaguard®) + TX, *Aspergillus* spp. + TX *Aureobasidium pullulans* + TX, *Azospirillum* + TX, (MicroAZ® + TX, TAZO B®) + TX, *Azotobacter* + TX, *Azotobacter chroococcum* (Azotomeal®) + TX, *Azotobacter* quistes (Bionatural Blooming Blossoms®) + TX, *Bacillus amyloliquefaciens* + TX, *Bacillus cereus* + TX, *Bacillus chitinosporus* cepa CM-1 + TX, *Bacillus chitinosporus* cepa AQ746 + TX, *Bacillus licheniformis* cepa HB-2 (Biostart™ RhizoBoost®) + TX, *Bacillus licheniformis* cepa 3086 (EcoGuard® + TX, Green Releaf®) + TX, *Bacillus circulans* + TX, *Bacillus firmus* (BioSafe® + TX, BioNem-WP® + TX, VOTIVO®) + TX, *Bacillus firmus* cepa I-1582 + TX, *Bacillus macerans* + TX, *Bacillus marismortui* + TX, *Bacillus megaterium* + TX, *Bacillus mycoides* cepa AQ726 + TX, *Bacillus papillae* (Milky Spore Powder®) + TX, *Bacillus pumilus* spp. + TX, *Bacillus pumilus* cepa GB34 (Yield Shield®) + TX, *Bacillus pumilus* cepa AQ717 + TX, *Bacillus pumilus* cepa QST 2808 (Sonata® + TX, Ballad Plus®) + TX, *Bacillus spahericus* (VectoLex®) + TX, *Bacillus* spp. + TX, *Bacillus* spp. cepa AQ175 + TX, *Bacillus* spp. cepa AQ177 + TX, *Bacillus* spp. cepa AQ178 + TX, *Bacillus subtilis* cepa QST 713 (CEASE® + TX, Serenade® + TX, Rhapsody®) + TX, *Bacillus subtilis* cepa QST 714 (JAZZ®) + TX, *Bacillus subtilis* cepa AQ153 + TX, *Bacillus subtilis* cepa AQ743 + TX, *Bacillus subtilis* cepa QST3002 + TX, *Bacillus subtilis* cepa QST3004 + TX, *Bacillus subtilis* var. *amyloliquefaciens* cepa FZB24 (Taegro® + TX, Rhizopro®) + TX, *Bacillus thuringiensis* Cry 2Ae + TX, *Bacillus thuringiensis* Cry1Ab + TX *Bacillus thuringiensis aizawai* GC 91 (Agree®) + TX *Bacillus thuringiensis israelensis* (BMP123® + TX, Aquabac® + TX, VectoBac®) + TX, *Bacillus thuringiensis kurstaki* (Javelin® + TX, Deliver® + TX, CryMax® + TX, Bonide® + TX, Scutella WP® + TX, Turilav WP® + TX, Astuto® + TX, Dipel WP® + TX, Biobit® + TX, Foray®) + TX, *Bacillus thuringiensis kurstaki* BMP 123 (Baritone®) + TX, *Bacillus thuringiensis kurstaki* HD-1 (Bioprotec-CAF / 3P®) + TX, *Bacillus thuringiensis* cepa BD#32 + TX, *Bacillus thuringiensis* cepa AQ52 + TX, *Bacillus thuringiensis* var. *aizawai* (XenTari® + TX, DiPel®) + TX, bacterias spp. (GROWMEND® + TX, GROWSWEET® + TX, Shootup® + TX, bacteriófago de *Clavipacter michiganensis* (AgriPhage®) + TX, Bakflor® + TX, *Beauveria bassiana* (Beaugenic® + TX, Brocaril WP®) + TX, *Beauveria bassiana* GHA (Mycotrol ES® + TX, Mycotrol O® + TX, BotaniGuard®) + TX, *Beauveria brongniartii* (Engerlingspilz® + TX, Schweizer Beauveria® + TX, Melocont®) + TX, *Beauveria* spp. + TX, *Botrytis cineria* + TX, *Bradyrhizobium japonicum* (TerraMax®) + TX, *Brevibacillus brevis* + TX, *Bacillus thuringiensis tenebrionis* (Novodor®) + TX, BtBooster + TX, *Burkholderia cepacia* (Deny® + TX, Intercept® + TX, Blue Circle®) + TX, *Burkholderia gladii* + TX, *Burkholderia gladioli* + TX, *Burkholderia* spp. + TX, Hongo del cardo canadiense (CBH Canadian Bioherbicide®) + TX, *Candida butyri* + TX, *Candida famata* + TX, *Candida fructus* + TX, *Candida glabrata* + TX, *Candida guilliermondii* + TX, *Candida melibiosica* + TX, *Candida oleophila* cepa O + TX, *Candida parapsilosis* + TX, *Candida pelliculosa* + TX, *Candida pulcherrima* + TX, *Candida reukaufii* + TX, *Candida saitoana* (Bio-Coat® +

TX, Biocure®) + TX, *Candida sake* + TX, *Candida* spp. + TX, *Candida tenuis* + TX, *Cedecea dravisae* + TX, *Cellulomonas flavigena* + TX, *Chaetomium cochliodes* (Nova-Cide®) + TX, *Chaetomium globosum* (Nova-Cide®) + TX, *Chromobacterium subtsugae* cepa PRAA4-1T (Grandevo®) + TX, *Cladosporium cladosporioides* + TX, *Cladosporium oxysporum* + TX, *Cladosporium chlorocephalum* + TX, *Cladosporium* spp. + TX, *Cladosporium tenuissimum* + TX, *Clonostachys rosea* (EndoFine®) + TX, *Colletotrichum acutatum* + TX, *Coniothyrium minitans* (Cotans WG®) + TX, *Coniothyrium* spp. + TX, *Cryptococcus albidus* (YIELDPLUS®) + TX, *Cryptococcus humicola* + TX, *Cryptococcus infirmo-miniatus* + TX, *Cryptococcus laurentii* + TX, *Cryptophlebia leucotreta granulovirus* (Cryptex®) + TX, *Cupriavidus campinensis* + TX, *Cydia pomonella granulovirus* (CYD-X®) + TX, *Cydia pomonella granulovirus* (Madex® + TX, Madex Plus® + TX, Madex Max/ Carpovirusine®) + TX, *Cylindrobasidium laeve* (Stumpout®) + TX, *Cylindrocladium* + TX, *Debaryomyces hansenii* + TX, *Drechslera hawaiiensis* + TX, *Enterobacter cloacae* + TX, *Enterobacteriaceae* + TX, *Entomophthora virulenta* (Vektor®) + TX, *Epicoccum nigrum* + TX, *Epicoccum purpurascens* + TX, *Epicoccum* spp. + TX, *Filobasidium floriforme* + TX, *Fusarium acuminatum* + TX, *Fusarium chlamydosporum* + TX, *Fusarium oxysporum* (Fusaclean® / Biofox C®) + TX, *Fusarium proliferatum* + TX, *Fusarium* spp. + TX, *Galactomyces geotrichum* + TX, *Gliocladium catenulatum* (Primastop® + TX, Prestop®) + TX, *Gliocladium roseum* + TX, *Gliocladium* spp. (SoilGard®) + TX, *Gliocladium virens* (Soilgard®) + TX, *Granulovirus* (Granupom®) + TX, *Halobacillus halophilus* + TX, *Halobacillus litoralis* + TX, *Halobacillus trueperi* + TX, *Halomonas* spp. + TX, *Halomonas subglaciescola* + TX, *Halovibrio variabilis* + TX, *Hanseniaspora uvarum* + TX, *Helicoverpa armigera virus de la nucleopolihedrosis* (Helicovex®) + TX, *Helicoverpa zea virus de la polihedrosis nuclear* (Gemstar®) + TX, Isoflavona- formononetina (Myconate®) + TX, *Kloeckera apiculata* + TX, *Kloeckera* spp. + TX, *Lagenidium giganteum* (Laginex®) + TX, *Lecanicillium longisporum* (Vertiblast®) + TX, *Lecanicillium muscarium* (Vertikil®) + TX, *Lymantria Dispar virus de la polihedrosis nuclear* (Disparvirus®) + TX, *Marinococcus halophilus* + TX, *Meira geulakonigii* + TX, *Metarhizium anisopliae* (Met52®) + TX, *Metarhizium anisopliae* (Destruxin WP®) + TX, *Metschnikowia fruticola* (Shemer®) + TX, *Metschnikowia pulcherrima* + TX, *Microdochium dimerum* (Antibot®) + TX, *Micromonospora coerulea* + TX, *Microsphaeropsis ochracea* + TX, *Muscodor albus* 620 (Muscudor®) + TX, *Muscodor roseus* cepa A3-5 + TX, *Mycorrhizae* spp. (AMykor® + TX, Root Maximizer®) + TX, *Myrothecium verrucaria* cepa AARC-0255 (DiTera®) + TX, BROS PLUS® + TX, *Ophiostoma piliferum* cepa D97 (Sylvanex®) + TX, *Paecilomyces farinosus* + TX, *Paecilomyces fumosoroseus* (PFR-97® + TX, PreFeRal®) + TX, *Paecilomyces linacinus* (Biostat WP®) + TX, *Paecilomyces lilacinus* cepa 251 (MeloCon WG®) + TX, *Paenibacillus polymyxa* + TX, *Pantoea agglomerans* (BlightBan C9-1®) + TX, *Pantoea* spp. + TX, *Pasteuria* spp. (Econem®) + TX, *Pasteuria nishizawae* + TX, *Penicillium aurantiogriseum* + TX, *Penicillium billai* (Jumpstart® + TX, TagTeam®) + TX, *Penicillium brevicompactum* + TX, *Penicillium frequentans* + TX, *Penicillium griseofulvum* + TX, *Penicillium purpurogenum* + TX, *Penicillium* spp. + TX, *Penicillium viridicatum* + TX, *Phlebiopsis gigantea* (Rotstop®) + TX, bacterias solubilizantes del fosfato (Phosphomeal®) + TX, *Phytophthora cryptogea* + TX, *Phytophthora palmivora* (Devine®) + TX, *Pichia anomala* + TX, *Pichia guilhermondii* + TX, *Pichia membranaefaciens* + TX, *Pichia onychis* + TX, *Pichia stipites* + TX, *Pseudomonas aeruginosa* + TX, *Pseudomonas aureofasciens* (Spot-Less Biofungicide®) + TX, *Pseudomonas cepacia* + TX, *Pseudomonas chlororaphis* (AtEze®) + TX, *Pseudomonas corrugate* + TX, *Pseudomonas fluorescens* cepa A506 (BlightBan A506®) + TX, *Pseudomonas putida* + TX, *Pseudomonas reactans* + TX, *Pseudomonas* spp. + TX, *Pseudomonas syringae* (Bio-Save®) + TX, *Pseudomonas viridiflava* + TX, *Pseudomonas fluorescens* (Zequanox®) + TX, *Pseudozyma flocculosa* cepa PFA22 UL (Sporodex L®) + TX, *Puccinia canaliculata* + TX, *Puccinia thlaspeos* (Wood Warrior®) + TX, *Pythium paroecandrum* + TX, *Pythium oligandrum* (Polygandron® + TX, Polyversum®) + TX, *Pythium periplocum* + TX, *Rhanelia aquatilis* + TX, *Rhanelia* spp. + TX, *Rhizobia* (Dormal® + TX, Vault®) + TX, *Rhizoctonia* + TX, *Rhodococcus globerulus* cepa AQ719 + TX, *Rhodospiridium diobovatum* + TX, *Rhodospiridium turuloides* + TX, *Rhodotorula* spp. + TX, *Rhodotorula glutinis* + TX, *Rhodotorula graminis* + TX, *Rhodotorula mucilagnosa* + TX, *Rhodotorula rubra* + TX, *Saccharomyces cerevisiae* + TX, *Salinococcus roseus* + TX, *Sclerotinia minor* + TX, *Sclerotinia minor* (SARRITOR®) + TX, *Scytalidium* spp. + TX, *Scytalidium uredinicola* + TX, *Spodoptera exigua nuclear polyhedrosis virus* (Spod-X® + TX, Spexit®) + TX, *Serratia marcescens* + TX, *Serratia plymuthica* + TX, *Serratia* spp. + TX, *Sordaria fimicola* + TX, *Spodoptera littoralis nucleopolyhedrovirus* (Littovir®) + TX, *Sporobolomyces roseus* + TX, *Stenotrophomonas maltophilia* + TX, *Streptomyces ahygroscopicus* + TX, *Streptomyces albaduncus* + TX, *Streptomyces exfoliates* + TX, *Streptomyces galbus* + TX, *Streptomyces griseoplanus* + TX, *Streptomyces griseoviridis* (Mycostop®) + TX, *Streptomyces lydicus* (Actinovate®) + TX, *Streptomyces lydicus* WYEC-108 (ActinoGrow®) + TX, *Streptomyces violaceus* + TX, *Tilletiopsis minor* + TX, *Tilletiopsis* spp. + TX, *Trichoderma asperellum* (T34 Biocontrol®) + TX, *Trichoderma gamsii* (Tenet®) + TX, *Trichoderma atroviride* (Plantmate®) + TX, *Trichoderma hamatum* TH 382 + TX, *Trichoderma harzianum rifai* (Mycostar®) + TX, *Trichoderma harzianum* T-22 (Trianum-P® + TX, PlantShield HC® + TX, RootShield® + TX, Trianum-G®) + TX, *Trichoderma harzianum* T-39 (Trichodex®) + TX, *Trichoderma inhamatum* + TX, *Trichoderma koningii* + TX, *Trichoderma* spp. LC 52 (Sentinel®) + TX, *Trichoderma lignorum* + TX, *Trichoderma longibrachiatum* + TX, *Trichoderma polysporum* (Binab T®) + TX, *Trichoderma taxi* + TX, *Trichoderma virens* + TX, *Trichoderma virens* (anteriormente Gliocladium virens GL-21) (SoilGuard®) + TX, *Trichoderma viride* + TX, *Trichoderma viride* cepa ICC 080 (Remedier®) + TX, *Trichosporon pullulans* + TX, *Trichosporon* spp. + TX, *Trichothecium* spp. + TX, *Trichothecium roseum* + TX, *Typhula phacorrhiza* cepa 94670 + TX, *Typhula phacorrhiza* cepa 94671 + TX, *Ulocladium atrum* + TX, *Ulocladium oudemansii* (Botry-Zen®) + TX, *Ustilago maydis* + TX, diversas bacterias y micronutrientes complementarios (Natural II®) + TX, diversos hongos (Millennium Microbes®) + TX, *Verticillium chlamydosporium* + TX, *Verticillium lecanii* (Mycotal® + TX, Vertalec®) + TX, Vip3Aa20 (VIPtera®) + TX, *Virgibacillus marismortui* + TX *Xanthomonas campestris* pv. *Poae* (Camperico®) + TX, *Xenorhabdus bovienii* + TX, *Xenorhabdus nematophilus* + TX

- extractos vegetales, incluyendo aceite de pino (Retenol®) + TX, azadiractina (Plasma Neem Oil® + TX, AzaGuard® + TX, MeemAzal® + TX, Molt-X® + TX, IGR botánica (Neemazad® + TX, Neemix®) + TX, aceite de colza (Lilly Miller Vegol®) + TX, *Chenopodium ambrosioides near ambrosioides* (Requiem®) + TX, *Chrysanthemum* extracto (Crisant®) + TX, extracto de aceite de nim (Trilogy®) + TX, aceites esenciales de *Labiateae* (Botania®) + TX, extractos de aceite de hierbabuena de romero de clavo y aceite de tomillo (Garden insect killer®) + TX, Glicinbetaina (Greenstim®) + TX, ajo + TX, aceite de limoncillo (GreenMatch®) + TX, aceite de nim + TX, *Nepeta cataria* (aceite de hierba gatera) + TX, *Nepeta catarina* + TX, nicotina + TX, aceite de orégano (MossBuster®) + TX, aceite de *Pedaliaceae* (Nematon®) + TX, piretrum + TX, *Quillaja saponaria* (NemaQ®) + TX, *Reynoutria sachalinensis* (Regalia® + TX, Sakalia®) + TX, rotenona (Eco Roten®) + TX, extracto vegetal de *Rutaceae* (Soleo®) + TX, aceite de soja (Ortho ecosense®) + TX, aceite del árbol de té (Timorex Gold®) + TX, aceite de tomillo + TX, AGNIQUE® MMF + TX, BugOil® + TX, mezcla de extractos de romero, sésamo, menta piperita, tomillo y canela (EF 300®) + TX, mezcla de extracto de clavo, romero y menta piperita (EF 400®) + TX, mezcla de aceite de clavo, menta piperita, ajo y menta (Soil Shot®) + TX, caolín (Screen®) + TX, glucam de almacenamiento de algas pardas (Laminarin®); y
- feromonas, incluyendo: feromonas de la polilla de la hoja de acebo (Sprayable Blackheaded Fireworm Pheromone® de 3M) + TX, Feromona de la polilla del manzano (Paramount dispenser-(CM)/ Isomate C-Plus®) + TX, Feromona de la polilla de la vid (3M MEC-GBM Sprayable Pheromone®) + TX, Feromona del rodillo de hoja (MEC – LR Sprayable Pheromone® de 3M) + TX, Muscamona (Snip7 Fly Bait® + TX, Starbar Premium Fly Bait®) + TX, Feromona de la polilla de la fruta oriental (oriental fruit moth sprayable pheromone® de 3M) + TX, Feromona del barrenador del melocotonero (Isomate-P®) + TX, Feromona del oxiuero del tomate (Sprayable pheromone® de 3M) + TX, Polvo Entostat (extracto de aceite de palma) (Exosona CM®) + TX, (E + TX,Z + TX,Z)-3 + TX,8 + TX,11 acetato de tetradecatrienilo + TX, (Z + TX,Z + TX,E)-7 + TX,11 + TX,13-hexadecatrienal + TX, (E + TX,Z)-7 + TX,9-acetato de dodecadien-1-ilo + TX, 2-metil-1-butanol + TX, Acetato de calcio + TX, Scenturion® + TX, Biolure® + TX, Check-Mate® + TX, Lavandulil senecioato; y
- Macrobacterias, incluyendo: *Aphelinus abdominalis* + TX, *Aphidius ervi* (Aphelinus-System®) + TX, *Acerophagus papaya* + TX, *Adalia bipunctata* (Adalia-System®) + TX, *Adalia bipunctata* (Adaline®) + TX, *Adalia bipunctata* (Aphidalia®) + TX, *Ageniaspis citricola* + TX, *Ageniaspis fuscicollis* + TX, *Amblyseius andersoni* (Anderline® + TX, Andersoni-System®) + TX, *Amblyseius californicus* (Amblyline® + TX, Spical®) + TX, *Amblyseius cucumeris* (Thripex® + TX, Bugline cucumeris®) + TX, *Amblyseius fallacis* (Fallacis®) + TX, *Amblyseius swirskii* (Bugline swirskii® + TX, Swirskii-Mite®) + TX, *Amblyseius womersleyi* (WomerMite®) + TX, *Amitus hesperidum* + TX, *Anagrus atomus* + TX, *Anagrus fusciventris* + TX, *Anagrus kamali* + TX, *Anagrus loecki* + TX, *Anagrus pseudococci* (Citripar®) + TX, *Anicetus benefices* + TX, *Anisopteromalus calandrae* + TX, *Anthocoris nemoralis* (Anthocoris-System®) + TX, *Aphelinus abdominalis* (Apheline® + TX, Aphiline®) + TX, *Aphelinus asychis* + TX, *Aphidius colemani* (Aphipar®) + TX, *Aphidius ervi* (Ervipar®) + TX, *Aphidius gifuensis* + TX, *Aphidius matricariae* (Aphipar-M®) + TX, *Aphidoletes aphidimyza* (Aphidend®) + TX, *Aphidoletes aphidimyza* (Aphidoline®) + TX, *Aphytis lingnanensis* + TX, *Aphytis melinus* + TX, *Aprostocetus hagenowii* + TX, *Atheta coriaria* (Staphyline®) + TX, *Bombus* spp. + TX, *Bombus terrestris* (Natupol Beehive®) + TX, *Bombus terrestris* (Beeline® + TX, Tripol®) + TX, *Cephalonomia stephanoderis* + TX, *Chilocorus nigritus* + TX, *Chrysoperla carnea* (Chrysoline®) + TX, *Chrysoperla carnea* (Chrysopa®) + TX, *Chrysoperla rufilabris* + TX, *Cirrospilus ingenuus* + TX, *Cirrospilus quadristriatus* + TX, *Citrostichus phyllocnistoides* + TX, *Closterocerus chamaeleon* + TX, *Closterocerus* spp. + TX, *Coccidoxenoides perminutus* (Planopar®) + TX, *Coccophagus cowperi* + TX, *Coccophagus lycimnia* + TX, *Cotesia flavipes* + TX, *Cotesia plutellae* + TX, *Cryptolaemus montrouzieri* (Cryptobug®) + TX, *Cryptolaema* + TX, *Cybocephalus nipponicus* + TX, *Dacnusa sibirica* + TX, *Dacnusa sibirica* (Minusa®) + TX, *Diglyphus isaea* (Diminex®) + TX, *Delphastus catalinae* (Delphastus®) + TX, *Delphastus pusillus* + TX, *Diachasmimorpha krausii* + TX, *Diachasmimorpha longicaudata* + TX, *Diaparsis jucunda* + TX, *Diaphorencyrtus aligarhensis* + TX, *Diglyphus isaea* + TX, *Diglyphus isaea* (Miglyphus® + TX, Digline®) + TX, *Dacnusa sibirica* (DaDigline® + TX, Minex®) + TX, *Diversinervus* spp. + TX, *Encarsia citrina* + TX, *Encarsia formosa* (Encarsia max® + TX, Encarline® + TX, En-Strip®) + TX, *Eretmocerus eremicus* (Enermix®) + TX, *Encarsia guadeloupae* + TX, *Encarsia haitiensis* + TX, *Episyrphus balteatus* (Syrphidend®) + TX, *Eretmocerus siphonini* + TX, *Eretmocerus californicus* + TX, *Eretmocerus eremicus* (Ercal® + TX, Eretline e®) + TX, *Eretmocerus eremicus* (Bemimix®) + TX, *Eretmocerus hayati* + TX, *Eretmocerus mundus* (Bemipar® + TX, Eretline m®) + TX, *Eretmocerus siphonini* + TX, *Exochomus quadripustulatus* + TX, *Feltiella acarisuga* (Spidend®) + TX, *Feltiella acarisuga* (Feltiline®) + TX, *Fopius arisanus* + TX, *Fopius ceratitivorus* + TX, Formononetina (Wirless Beehome®) + TX, *Franklinothrips vespiformis* (Vespop®) + TX, *Galendromus occidentalis* + TX, *Goniozus legneri* + TX, *Habrobracon hebetor* + TX, *Harmonia axyridis* (HarmoBeetle®) + TX, *Heterorhabditis* spp. (Lawn Patrol®) + TX, *Heterorhabditis bacteriophora* (NemaShield HB® + TX, Nemaseek® + TX, Terranem-Nam® + TX, Terranem® + TX, Larvanem® + TX, B-Green® + TX, NemAttack® + TX, Nematop®) + TX, *Heterorhabditis megidis* (Nemasys H® + TX, BioNem H® + TX, Exhibitline hm® + TX, Larvanem-M®) + TX, *Hippodamia convergens* + TX, *Hypoaspis aculeifer* (Aculeifer-System® + TX, Entomite-A®) + TX, *Hypoaspis miles* (Hypoline m® + TX, Entomite-M®) + TX, *Lbalia leucospoides* + TX, *Lecanoideus floccissimus* + TX, *Lemophagus errabundus* + TX, *Leptomastidea abnormis* + TX, *Leptomastix dactylopii* (Leptopar®) + TX, *Leptomastix epona* + TX, *Lindorus lophanthae* + TX, *Lipolexis oregmae* + TX, *Lucilia caesar* (NatuFly®) + TX, *Lysiphlebus testaceipes* + TX, *Macrolophus caliginosus* (Mirical-N® + TX, Macroline c® + TX, Mirical®) + TX, *Mesoseiulus longipes* + TX, *Metaphycus flavus* + TX, *Metaphycus lounsburyi* + TX, *Micromus angulatus* (Milacewing®) + TX, *Microterys flavus* + TX, *Muscidifurax raptorellus* y *Spalangia cameroni* (Biopar®) + TX, *Neodryinus typhlocybae* + TX, *Neoseiulus californicus* + TX, *Neoseiulus cucumeris* (THRYPEX®) + TX, *Neoseiulus fallacis* + TX, *Nesideocoris tenuis*

- (NesidioBug® + TX, Nesibug®) + TX, *Ophyra aenescens* (Biofly®) + TX, *Orius insidiosus* (Thripor-l® + TX, Oriline i®) + TX, *Orius laevigatus* (Thripor-L® + TX, Oriline l®) + TX, *Orius majusculus* (Oriline m®) + TX, *Orius strigicollis* (Thripor-S®) + TX, *Pauesia juniperorum* + TX, *Pediobius foveolatus* + TX, *Phasmarhabditis hermaphrodita* (Nemaslug®) + TX, *Phymastichus coffea* + TX, *Phytoseiulus macropilus* + TX, *Phytoseiulus persimilis* (Spidex® + TX, Phytoline p®) + TX, *Podisus maculiventris* (Podisus®) + TX, *Pseudacteon curvatus* + TX, *Pseudacteon obtusus* + TX, *Pseudacteon tricuspis* + TX, *Pseudaphycus maculipennis* + TX, *Pseudoleptomastix mexicana* + TX, *Psyllaephagus pilosus* + TX, *Psytalia concolor* (complejo) + TX, *Quadrastichus* spp. + TX, *Rhyzobius lophanthae* + TX, *Rodolia cardinalis* + TX, *Rumina decollate* + TX, *Semielaecher petiolatus* + TX, *Sitobion avenae* (Ervibank®) + TX, *Steinernema carpocapsae* (Nematac C® + TX, Millenium® + TX, BioNem C® + TX, NemAttack® + TX, Nemastar® + TX, Capsanem®) + TX, *Steinernema feltiae* (NemaShield® + TX, Nemasys F® + TX, BioNem F® + TX, Steinernema-System® + TX, NemAttack® + TX, Nemaplus® + TX, Exhibitline sf® + TX, Scia-rid® + TX, Entonem®) + TX, *Steinernema kraussei* (Nemasys L® + TX, BioNem L® + TX, Exhibitline srb®) + TX, *Steinernema riobrave* (BioVector® + TX, BioVektor®) + TX, *Steinernema scapterisci* (Nematac S®) + TX, *Steinernema* spp. + TX, *Steinernematid* spp. (Guardian Nematodes®) + TX, *Stethorus punctillum* (Stethorus®) + TX, *Tamarixia radiata* + TX, *Tetrastichus setifer* + TX, *Thripobius semiluteus* + TX, *Torymus sinensis* + TX, *Trichogramma brassicae* (Tricholine b®) + TX, *Trichogramma brassicae* (Tricho-Strip®) + TX, *Trichogramma evanescens* + TX, *Trichogramma evanescens* + TX, *Trichogramma ostrinia* + TX, *Trichogramma platneri* + TX, *Trichogramma pretiosum* + TX, *Xanthopimpla stemmator*, y
- 20 otros compuestos biológicos, incluyendo: ácido abscísico + TX, bioSea® + TX, *Chondrostereum purpureum* (Chontrol Paste®) + TX, *Colletotrichum gloeosporioides* (Collego®) + TX, Octanoato de Cobre (Cueva®) + TX, Trampas delta (Trapline d®) + TX, *Erwinia amylovora* (Harpin) (ProAct® + TX, Ni-HIBIT Gold CST®) + TX, Ferrifosfato (Ferramol®) + TX, Trampas embudo (Trapline y®) + TX, Gallex® + TX, Grower's Secret® + TX, Homobrasonolida + TX, Fosfato de hierro (Lilly Miller Worry Free Ferramol Slug & Snail Bait®) + TX, MCP trampa granizo (Trapline f®) + TX, *Microctonus hyperodae* + TX, *Mycyleptodiscus terrestris* (Des-X®) + TX, BioGain® + TX, Aminomite® + TX, Zenox® + TX, Trampa de feromonas (Thripline ams®) + TX, bicarbonato de potasio (MilStop®) + TX, sales de potasio de ácidos grasos (Sanova®) + TX, solución de silicato de potasio (Sil-Matrix®) + TX, yoduro de potasio + tiocianato de potasio (Enzicur®) + TX, SuffOil-X® + TX, Veneno de araña + TX, *Nosema locustae* (Semaspore Organic Grasshopper Control®) + TX, Trampas pegajosas (Trapline YF® + TX, Rebell Amarillo®) + TX y Trampas (Takitrapline y + b®) + TX.

Las referencias entre corchetes tras los principios activos, p. ej. [3878-19-1], se refieren al número de registro del Chemical Abstracts. Los componentes de las mezclas descritos anteriormente son conocidos. Cuando los ingredientes activos están incluidos en "The Pesticide Manual" [The Pesticide Manual - A World Compendium; decimotercera edición; Editor: C. D. S. Tomlin; Consejo Británico para la Protección de los Cultivos], se describen en este con el número de entrada facilitado entre paréntesis anteriormente en la presente para el compuesto particular; por ejemplo, el compuesto "abamectina" se describe con el número de entrada (1). Cuando se ha añadido "[CCN]" anteriormente en la presente al compuesto particular, el compuesto en cuestión está incluido en el "Compendium of Pesticide Common Names", disponible en internet [A. Wood; Compendium of Pesticide Common Names, Copyright © 1995-2004]; por ejemplo, el compuesto "acetoprol" se describe en la dirección de internet <http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprol.html>.

Se hace referencia a la mayoría de los principios activos descritos anteriormente en la presente mediante el denominado "nombre común", utilizándose el "nombre común ISO" u otro "nombre común" relevante en casos individuales. Si la denominación no es un "nombre común", la naturaleza de la denominación empleada en su lugar se indica entre paréntesis para el compuesto particular; en este caso, se emplea el nombre según la IUPAC, el nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts, un "nombre químico", un "nombre tradicional", un "nombre de compuesto" o un "código de desarrollo" o, si no se emplea ninguna de estas denominaciones ni ningún "nombre común", se empleará un "nombre alternativo". "N.º de Reg. CAS" se refiere al número de registro del Chemical Abstracts.

La mezcla de principios activos de los compuestos de fórmula I seleccionados de la Tablas 1 a 3 con principios activos arriba descritos comprende un compuesto seleccionado de la Tablas 1 a 3 y un principio activo tal como se describe arriba, preferiblemente en una relación de mezclado de 100:1 a 1:6000, especialmente de 50:1 a 1:50, más especialmente en una relación de 20:1 a 1:20, incluso más especialmente de 10:1 a 1:10, muy especialmente de 5:1 y 1:5, dándose especial preferencia a una relación de 2:1 a 1:2, y siendo igualmente preferida una relación de 4:1 a 2:1, sobre todo en una relación de 1:1, o 5:1, o 5:2, o 5:3, o 5:4, o 4:1, o 4:2, o 4:3, o 3:1, o 3:2, o 2:1, o 1:5, o 2:5, o 3:5, o 4:5, o 1:4, o 2:4, o 3:4, o 1:3, o 2:3, o 1:2, o 1:600, o 1:300, o 1:150, o 1:35, o 2:35, o 4:35, o 1:75, o 2:75, o 4:75, o 1:6000, o 1:3000, o 1:1500, o 1:350, o 2:350, o 4:350, o 1:750, o 2:750, o 4:750. Estas relaciones de mezclado son en peso.

Las mezclas arriba descritas pueden emplearse en un método para controlar plagas, que comprende aplicar una composición que comprende una mezcla tal como se ha descrito arriba a las plagas o a su entorno, con la excepción de un método para tratar el cuerpo humano o animal mediante cirugía o terapia y métodos de diagnóstico practicados en el cuerpo humano o animal.

- 5 Las mezclas que comprenden un compuesto de fórmula I seleccionado de las Tablas 1 a 3 y uno o más ingredientes activos como se describió arriba se pueden aplicar, por ejemplo, en una forma de "mezcla lista» única, en una mezcla combinada en aerosol compuesta de formulaciones separadas de los componentes del ingrediente activo único, tal como una "mezcla de tanque", y en un uso combinado de los ingredientes activos individuales cuando se aplican de manera secuencial, es decir, uno después del otro con un período razonablemente corto, tales como unas pocas horas o días. El orden de aplicación de los compuestos de fórmula I seleccionados de las Tablas 1 a 3 y los ingredientes activos tal como se describió arriba no es esencial para poner en práctica la presente invención.
- 10 Las composiciones de acuerdo con la invención también pueden comprender otros auxiliares sólidos o líquidos tales como estabilizantes, por ejemplo, aceites vegetales epoxidados o no epoxidados (por ejemplo, aceite de coco, aceite de colza o aceite de soja epoxidados), antiespumantes, por ejemplo, aceite de silicona, conservantes, reguladores de la viscosidad, aglutinantes y/o adherentes, fertilizantes u otros principios activos para obtener efectos específicos, por ejemplo, bactericidas, fungicidas, nematocidas, activadores de plantas, molusquicidas o herbicidas.
- 15 Las composiciones de acuerdo con la invención se preparan de forma conocida per se, en ausencia de agentes auxiliares, por ejemplo, moliendo, tamizando y/o comprimiendo un ingrediente activo sólido y, en presencia de al menos un agente auxiliar, por ejemplo, mezclando íntimamente y/o moliendo el ingrediente activo con el agente auxiliar (agentes auxiliares). Estos procedimientos para la preparación de las composiciones y el uso de los compuestos I para la preparación de estas composiciones también son un objeto de la invención.
- 20 Los métodos de aplicación para las composiciones, es decir, los métodos para controlar las plagas del tipo mencionado anteriormente, por ejemplo, mediante pulverización, atomización, espolvoreación, con cepillo, revestimiento, dispersión o vertido, que deben seleccionarse para adecuarse a los fines deseados de las circunstancias predominantes, y el uso de las composiciones para controlar las plagas del tipo mencionado anteriormente son otros objetos de la invención. Tasas típicas de concentración están entre 0,1 y 1000 ppm, preferiblemente entre 0,1 y 500 ppm, de ingrediente activo. La tasa de aplicación por hectárea es generalmente de 1 a 2000 g de ingrediente activo por hectárea, en particular de 10 a 1000 g/ha, preferentemente de 10 a 600 g/ha.
- 25 Un método preferido de aplicación en el campo de la protección de cultivos es la aplicación al follaje de las plantas (aplicación foliar), siendo posible seleccionar la frecuencia y la tasa de aplicación para que coincida con el peligro de infestación con la plaga en cuestión. Como alternativa, el principio activo puede llegar a las plantas mediante el sistema radicular (acción sistémica), empapando la ubicación de las plantas con una composición líquida o incorporando el principio activo en forma sólida en el emplazamiento de las plantas, por ejemplo, en el suelo, por ejemplo, en forma de gránulos (aplicación al suelo). En el caso de los cultivos de arrozales, dichos gránulos pueden introducirse en forma dosificada en el arrozal anegado.
- 30 Los compuestos de la invención y sus composiciones también son adecuados para la protección del material de propagación vegetal, por ejemplo, semillas, tales como frutos, tubérculos o granos, o plantas de vivero, contra plagas del tipo arriba mencionado. El material de propagación puede tratarse con el compuesto antes de la siembra, por ejemplo, la semilla puede tratarse antes de la siembra. Como alternativa, el compuesto puede aplicarse a los granos de las semillas (recubrimiento), ya sea empapando los granos en una composición líquida o aplicando una capa de una composición sólida. También es posible aplicar las composiciones cuando el material de propagación se planta en el sitio de aplicación, por ejemplo en el surco de siembra durante la perforación. Estos métodos de tratamiento para material de propagación vegetal y el material de propagación vegetal así tratado son objetos adicionales de la invención. Tasas de tratamiento típicas dependerán de la planta y las plagas/los hongos a controlar y generalmente están entre 1 y 200 gramos por 100 kg de semillas, preferiblemente entre 5 y 150 gramos por 100 kg de semillas, tal como entre 10 y 100 gramos por 100 kg de semillas.
- 35 El término semilla abarca semillas y propágulos vegetales de todo tipo, que incluyen, sin carácter limitante, semillas propiamente dichas, trozos de semillas, brotes nuevos, mies, bulbos, frutos, tubérculos, granos, rizomas, esquejes, brotes cortados y similares, y en una realización preferida se refiere a las semillas propiamente dichas.
- 40 La presente invención también comprende semillas recubiertas o tratadas con o que contienen un compuesto de fórmula I. El término "recubierto o tratado con y/o que contiene" generalmente significa que el ingrediente activo está en su mayor parte en la superficie de la semilla en el momento de aplicación, aunque una parte mayor o menor del ingrediente puede penetrar en el material de semilla, dependiendo del método de aplicación. Cuando dicho producto de semilla se (re)planta, puede absorber el ingrediente activo. En una realización, la presente invención pone a disposición un material de propagación vegetal adherido al mismo con un compuesto de fórmula I. Además, se pone a disposición de esta manera una composición que comprende un material de propagación vegetal tratado con un compuesto de fórmula I.
- 45 El tratamiento de semillas comprende todas las técnicas adecuadas de tratamiento de semillas conocidas en la técnica, tales como la desinfección de semillas, el recubrimiento de semillas, el espolvoreado de semillas, el remojo de semillas y la granulación de semillas. La aplicación de tratamiento de semillas del compuesto de fórmula I puede llevarse a cabo mediante cualquier método conocido, tal como pulverización o espolvoreo de las semillas antes de la siembra o durante la siembra / plantación de las semillas.
- 50
- 55
- 60
- 65

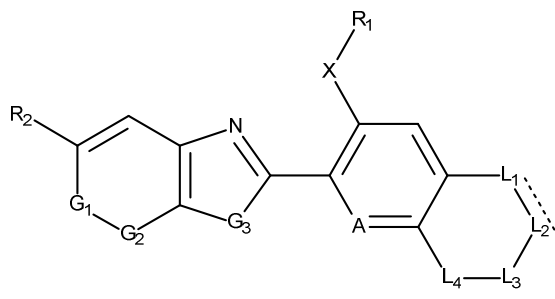
Ejemplos Biológicos:

<u>Ejemplo B1: <i>Bemisia tabaci</i> (mosca blanca del algodón): Actividad de alimentación/contacto</u>
Se colocaron discos de hojas de algodón sobre agar en placas de microtitulación de 24 pocillos y se pulverizaron con soluciones de ensayo acuosas preparadas a partir de soluciones madre de DMSO de 10.000 ppm. Después de secar, los discos de hojas se infestaron con moscas blancas adultas. Las muestras se verificaron para determinar la mortalidad 6 días después de la incubación.
El siguiente compuesto resultó en al menos un 80% de mortalidad a una tasa de aplicación de 200 ppm:
A6
<u>Ejemplo B2: <i>Diabrotica balteata</i> (gusano de la raíz del maíz):</u>
Brotos de maíz colocados en una capa de agar en placas de microtitulación de 24 pocillos se trataron con soluciones de ensayo acuosas preparadas a partir de soluciones madre de 10.000 ppm de DMSO mediante pulverización. Después del secado, las placas se infestaron con larvas L2 (de 6 a 10 por pocillo). Las muestras se evaluaron en cuanto a la mortalidad y la inhibición del crecimiento en comparación con muestras no tratadas 4 días después de la infestación.
Los siguientes compuestos dieron un efecto de al menos 80% en al menos una de las dos categorías (mortalidad o inhibición del crecimiento) a una tasa de aplicación de 200 ppm:
A1, A2, A3, A4 y A8.
<u>Ejemplo B3: <i>Euschistus heros</i> (Chinche Marrón Neotropical):</u>
Hojas de soja en una capa de agar en placas de microtitulación de 24 pocillos se pulverizaron con soluciones de ensayo acuosas preparadas a partir de soluciones madre de 10.000 ppm de DMSO. Después de secar, las hojas se infestaron con ninfas N2. Las muestras se evaluaron en cuanto a la mortalidad y la inhibición del crecimiento en comparación con muestras no tratadas 5 días después de la infestación.
Los siguientes compuestos dieron un efecto de al menos 80% en al menos una de las dos categorías (mortalidad o inhibición del crecimiento) a una tasa de aplicación de 200 ppm:
A1, A2, A4, A5, A6 y A8.
<u>Ejemplo B4: <i>Frankliniella occidentalis</i> (trips occidental de las flores): Actividad de alimentación/contacto</u>
Discos de hojas de girasol se colocaron sobre agar en placas de microtitulación de 24 pocillos y se pulverizaron con soluciones de ensayo acuosas preparadas a partir de soluciones madre de DMSO de 10 000 ppm. Después del secado, los discos de hojas se infestaron con una población de <i>Frankliniella</i> de edades mixtas. Las muestras se evaluaron en cuanto a la mortalidad 7 días después de la infestación.
Los siguientes compuestos dieron provocaron al menos un 80 % de mortalidad a una tasa de aplicación de 200 ppm:
A2 y A6.
<u>Ejemplo B5: <i>Myzus persicae</i> (áfido verde del melocotón): Actividad de alimentación/contacto</u>
Discos foliares de girasol se colocaron en un agar en una placa de microtitulación de 24 pocillos y se pulverizaron con soluciones de ensayo acuosas preparadas a partir de soluciones madre de 10.000 ppm de DMSO. Tras secar, los discos foliares se infestaron con una población de áfidos de edades mixtas. Las muestras se evaluaron en cuanto a la mortalidad 6 días después de la infestación.
Los siguientes compuestos dieron como resultado al menos 80% de mortalidad a una tasa de aplicación de 200 ppm:
A2, A3, A4 y A6
<u>Ejemplo B6: <i>Myzus persicae</i> (áfido verde del melocotón): Actividad sistémica</u>
Raíces de plántulas de guisantes infestadas con una población de áfidos de edades mixtas se colocaron directamente en soluciones de ensayo acuosas preparadas a partir de soluciones madre de 10.000 ppm de DMSO. Las muestras se evaluaron para determinar la mortalidad 6 días después de colocar las plántulas en soluciones de ensayo.
Los siguientes compuestos resultaron en al menos 80% de mortalidad a una tasa de ensayo de 24 ppm:
A6 y A9.
<u>Ejemplo B7: <i>Plutella xylostella</i> (palomilla dorso de diamante):</u>
Placas de microtitulación de 24 pocillos se trataron con dieta artificial con soluciones de ensayo acuosas preparadas a partir de soluciones madre de DMSO de 10.000 ppm mediante pipeteo. Después del secado, las placas se infestaron con larvas L2 (de 10 a 15 por pocillo). Las muestras se evaluaron en cuanto a la mortalidad y la inhibición del crecimiento en comparación con muestras no tratadas 5 días después de la infestación.
Los siguientes compuestos dieron un efecto de al menos 80% en al menos una de las dos categorías (mortalidad o inhibición del crecimiento) a una tasa de aplicación de 200 ppm:
A1, A2, A3, A4, A6, A8 y A9.
<u>Ejemplo B8: <i>Spodoptera littoralis</i> (gusano de la hoja de algodón egipcio):</u>

Discos foliares de algodón se colocaron en un agar en placas de microtitulación de 24 pocillos y se pulverizaron con soluciones de ensayo acuosas preparadas a partir de soluciones madre de 10.000 ppm de DMSO. Después de secar, los discos de hojas se infestaron con cinco larvas L1. Las muestras se evaluaron para determinar la mortalidad, el efecto anti-alimentación y la inhibición del crecimiento en comparación con las muestras no tratadas 3 días después de la infestación. El control de <i>Spodoptera littoralis</i> mediante una muestra de ensayo se da cuando al menos una de las categorías de mortalidad, efecto anti-alimentador e inhibición del crecimiento es mayor que la muestra no tratada.
Los siguientes compuestos dieron como resultado un control de al menos 80% a una tasa de aplicación de 200 ppm: A1, A2, A3, A4, A5, A6, A8 y A9.
<u>Ejemplo B9: <i>Spodoptera littoralis</i> (gusano de la hoja de algodón egipcio):</u>
Compuestos de ensayo se aplicaron mediante pipeta desde soluciones madre de DMSO de 10.000 ppm en placas de 24 pocillos y se mezclaron con agar. Semillas de lechuga se colocaron en el agar y la placa de múltiples pocillos se cerró con otra placa que también contenía agar. Después de 7 días, el compuesto fue absorbido por las raíces y la lechuga creció en la placa de la tapa. Las hojas de lechuga se cortaron en la placa de la tapa. Huevos de <i>Spodoptera</i> se pipetearon a través de una plantilla de plástico en un papel de transferencia de gel húmedo y la placa de la tapa se cerró con él. Las muestras se evaluaron para determinar la mortalidad, el efecto anti-alimentario y la inhibición del crecimiento en comparación con las muestras no tratadas 6 días después de la infestación
Los siguientes compuestos dieron un efecto de al menos el 80% en al menos una de las tres categorías (mortalidad, anti-alimentación o inhibición del crecimiento) a una tasa de ensayo de 12.5 ppm: A2, A4 y A6.
<u>Ejemplo B10: <i>Tetranychus urticae</i> (ácaro araña con dos manchas): Actividad de alimentación/contacto</u>
Discos de hojas de habas sobre agar en placas de microtitulación de 24 pocillos se pulverizaron con soluciones de ensayo acuosas preparadas a partir de soluciones madre de DMSO de 10.000 ppm. Después del secado, los discos de hojas se infestaron con una población de ácaros de edades mixtas. Las muestras se evaluaron en cuanto a la mortalidad en la población mixta (fases móviles) 8 días después de la infestación.
Los siguientes compuestos dieron como resultado al menos 80 % de mortalidad a una tasa de aplicación de 200 ppm: A2 y A4.
<u>Ejemplo B11 <i>Aedes aegypti</i> (Mosquito de la fiebre amarilla):</u>
Se aplicaron soluciones de ensayo, a una tasa de aplicación de 200 ppm en etanol, a placas de cultivo tisular de 12 pocillos. Una vez que los depósitos estuvieron secos, se añadieron cinco <i>Aedes aegypti</i> hembra adultos de dos a cinco días de edad a cada pocillo, y se mantuvieron con una solución de sacarosa al 10 % en un tapón de lana de algodón. Se evaluó la paralización una hora después de la introducción, y se evaluó la mortalidad 24 y 48 horas después de la introducción.
Los siguientes compuestos dieron al menos un 80% de control de <i>Aedes aegypti</i> después de 48 h y/o 24 h. A2, A4 y A6.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula I



(I),

donde

A es CH o N;

X es S, SO o SO₂

R₁ es alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄; o es cicloalquilo C₃-C₆ mono- o poli-sustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano, haloalquilo C₁-C₄ y alquilo C₁-C₄; o es cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ mono- o poli-sustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano, haloalquilo C₁-C₄ y alquilo C₁-C₄;

R₂ es hidrógeno, halógeno, haloalquil C₁-C₄sulfanilo, haloalquil C₁-C₄sulfinilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, O(haloalquilo C₁-C₄), -SF₅, -C(O)haloalquilo C₁-C₄, ciano, haloalquilo C₁-C₆ o es haloalquilo C₁-C₆ sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en hidroxilo, metoxi y ciano; o es cicloalquilo C₃-C₆, que puede estar mono- o poli-sustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano, haloalquilo C₁-C₄ y alquilo C₁-C₄;

G₁ es NR₄ y G₂ es C(Y); o

G₁ es C(Y) y G₂ es NR₅;

Y es O o S;

G₃ es NR₆;

R₆ es alquilo C₁-C₄, que puede estar mono- o poli-sustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno y alquil C₁-C₂sulfinilo;

R₄ es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, o son cicloalquilo C₃-C₆, que puede estar mono- o poli-sustituido con R₇; o es cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, que puede estar mono- o poli-sustituido con R₇; o

R₄ es alquilo C₁-C₄ sustituido con ciano, alquil C₁-C₄sulfanilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfinilo,

alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ o con fenilo que, por sí mismo, puede estar mono- o poli-sustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y alcoxi C₁-C₄; o

R₄ es alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₆sulfanilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₆sulfinilo, haloalquil C₁-C₆sulfanilo, haloalquil C₁-C₆sulfonilo, haloalquil C₁-C₆sulfinilo, amina o hidroxilo; o

R₄ es alquenilo C₂-C₆ sustituido con R₁₁ o alquinilo C₂-C₆ sustituido con R₁₁; o

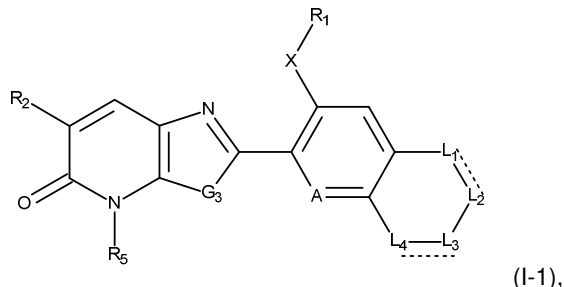
R₄ es un sistema de anillo de cinco a seis miembros, aromático, parcialmente saturado o totalmente saturado, dicho sistema de anillo puede estar mono- o poli-sustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄sulfanilo, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil

- C₁-C₄sulfonilo y -C(O)alquilo C₁-C₄, haloalquil C₁-C₄sulfanilo, haloalquil C₁-C₄sulfinilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo y
 -C(O)haloalquilo C₁-C₄; y dicho sistema de anillo puede contener 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados del grupo
 que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre, en que dicho sistema de anillo puede no contener más de un átomo de
 5 oxígeno y no más de un átomo de azufre;
- R₄ es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, o son cicloalquilo C₃-C₆, que puede estar mono- o poli-sustituido
 con R₇; o son cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, que puede estar mono- o poli-sustituido con R₇; o
- 10 R₅ es alquilo C₁-C₄ sustituido con ciano, alquil C₁-C₄sulfanilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfinilo,
 alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ o con fenilo que, por sí mismo, puede estar mono- o poli-
 sustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y
 15 alcoxi C₁-C₄; o
- R₄ es alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alcoxi
 C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₆sulfanilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₆sulfinilo, haloalquil C₁-C₆sulfanilo,
 haloalquil C₁-C₆sulfonilo, haloalquil C₁-C₆sulfinilo, amina o hidroxilo; o
- 20 R₅ es alqueno C₂-C₆ sustituido con R₁₁ o alquino C₂-C₆ sustituido con R₁₁; o
- R₄ es un sistema de anillo de cinco a seis miembros, aromático, parcialmente saturado o totalmente saturado, dicho
 sistema de anillo puede estar mono- o poli-sustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en
 halógeno, ciano, nitro, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, alcoxi C₁-C₄-alquilo
 25 C₁-C₄, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄sulfanilo, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil
 C₁-C₄sulfonilo y -C(O)alquilo C₁-C₄, haloalquil C₁-C₄sulfanilo, haloalquil C₁-C₄sulfinilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo y
- C(O)haloalquilo C₁-C₄; y dicho sistema de anillo puede contener 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados del grupo
 que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre, en que dicho sistema de anillo puede no contener más de un átomo de
 30 oxígeno y no más de un átomo de azufre;
- R₇ es ciano, halógeno, alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₄;
- L₁, L₂, L₃ y L₄ forman, junto con los dos átomos de carbono a los que L₁ y L₄ están unidos, un sistema de anillo
 35 aromático parcialmente saturado carbocídico o heterocídico o totalmente saturado; en donde
- L₁ es nitrógeno, S(O)_n, oxígeno, N-R_{10a} o C(R_{10a})_m;
- L₂ es nitrógeno, S(O)_n, oxígeno, N-R_{10b} o C(R_{10b})_m;
- 40 L₃ es nitrógeno, S(O)_n, oxígeno, N-R_{10c} o C(R_{10c})_m;
- L₄ es nitrógeno, S(O)_n, oxígeno, un enlace directo, N-R_{10d} o C(R_{10d})_m; con las condiciones de que no más de 2
 sustituyentes seleccionados de L₁, L₂, L₃ y L₄ pueden ser oxígeno o azufre; y si dos grupos L son oxígeno, no son
 45 adyacentes entre sí y no más de tres grupos L pueden ser nitrógeno;
- n es 0, 1 o 2;
- m es 1 o 2;
- 50 R_{10a}, R_{10b}, R_{10c} y R_{10d}, independientemente uno de otro, son hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, hidroxilo, alquilo C₁-
 C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalqueno C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆,
 halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆tio, alquil C₁-C₆sulfinilo,
 alquil C₁-C₆sulfonilo, haloalquil C₁-C₆tio, haloalquil C₁-C₆sulfinilo, haloalquil C₁-C₆sulfonilo, alquil C₂-C₆carbonilo,
 55 alcoxi C₂-C₆carbonilo, haloalquil C₂-C₆ carbonilo, haloalcoxi C₂-C₆carbonilo, (alquil C₁-C₆)NH, (alquil C₁-C₆)₂N,
 (cicloalquil C₁-C₆)NH, (cicloalquil C₁-C₆)₂N, alquil C₁-C₆carbonilamino, cicloalquil C₁-C₆ carbonilamino o -SF₅;
 adicionalmente, uno de R_{10a}, R_{10b}, R_{10c} y R_{10d} puede ser oxo; o
- R_{10a}, R_{10b}, R_{10c}, y R_{10d}, independientemente uno de otro, son cicloalquilo C₃-C₆mono- a poli-sustituido con
 60 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, haloalquilo C₁-C₄, alquilo C₁-C₄ y ciano; o
- R_{10a}, R_{10b}, R_{10c}, y R_{10d}, independientemente uno de otro, son fenilo que puede estar mono- a poli-sustituido con
 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, haloalquilo C₁-C₄, alquilo C₁-C₄ y ciano; y
- 65 R₁₁ es nitro, fenilo, ciano, alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄sulfanilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil
 C₁-C₄sulfinilo, haloalquil C₁-C₄sulfanilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo o haloalquil C₁-C₄sulfinilo;

y sales, estereoisómeros, enantiómeros, tautómeros y N-óxidos agroquímicamente aceptables de esos compuestos.

2. Un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, representado por los compuestos de fórmula I-1

5



en donde los sustituyentes X, A, R₁, R₂, R₅, G₃, L₁, L₂, L₃ y L₄ son como se definen bajo la fórmula I en la reivindicación 1.

10

3. Un compuesto de fórmula I-1 de acuerdo con la reivindicación 2, donde

A es C-H o N;

15

R₁ es alquilo C₁-C₄, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆;

R₂ es halógeno, haloalquil C₁-C₄sulfanilo, haloalquil C₁-C₄sulfinilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, haloalcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, ciano o es cicloalquilo C₃-C₆, que puede estar mono- o poli-sustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano y alquilo C₁-C₄;

20

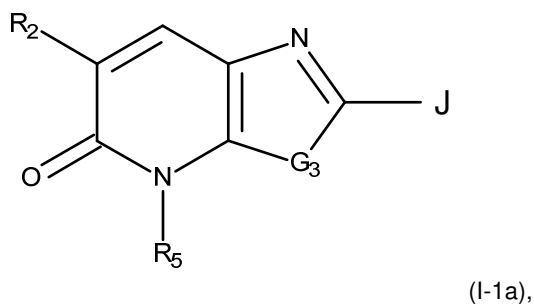
R₅, X, G₃, L₁, L₂, L₃ y L₄ son como se definen bajo la fórmula I en la reivindicación 1; y

R_{10a}, R_{10b}, R_{10c} y R_{10d}, independientemente uno de otro, son hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, hidroxilo, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-cicloalquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, ciclohaloalquil C₃-C₆-cicloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, haloalquil C₁-C₄tio, haloalquil C₁-C₄sulfinilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, -SF₅; adicionalmente uno de R_{10a}, R_{10b}, R_{10c} y R_{10d} pueden ser oxo.

25

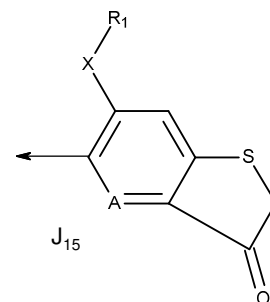
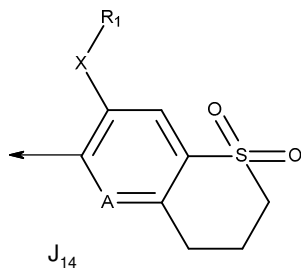
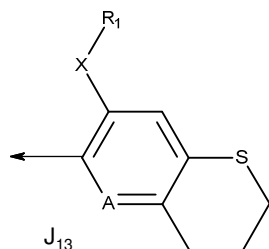
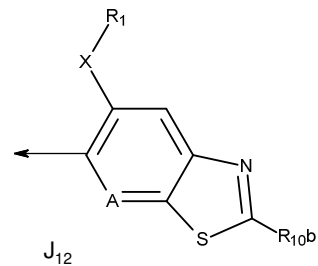
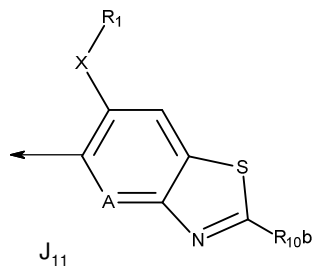
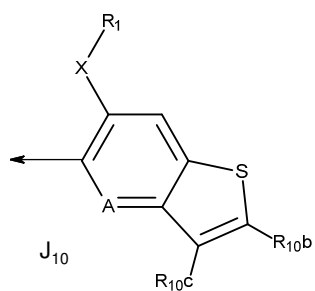
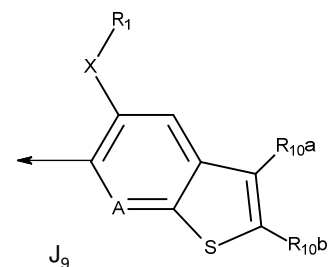
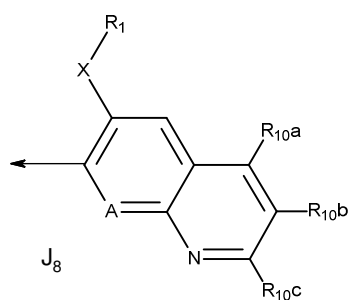
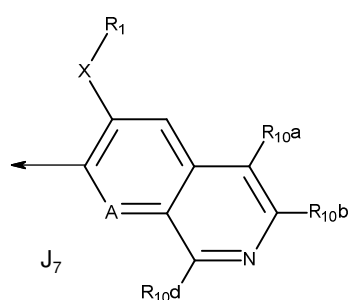
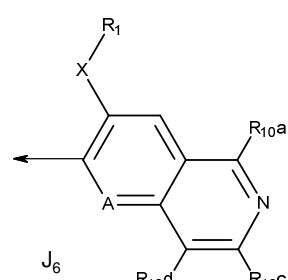
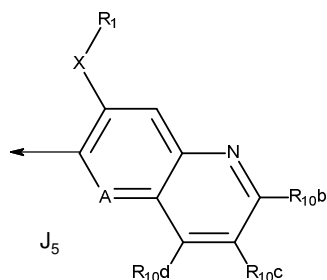
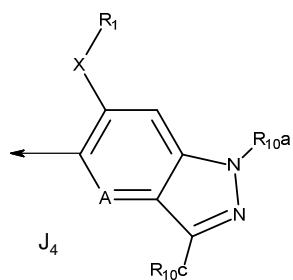
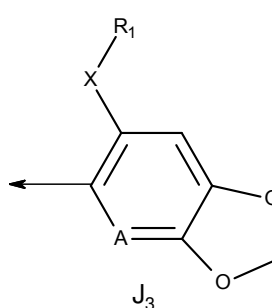
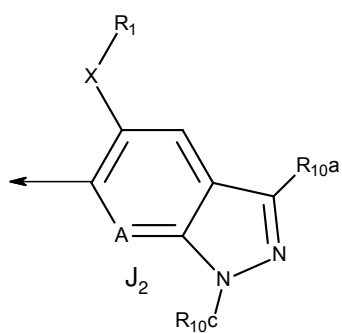
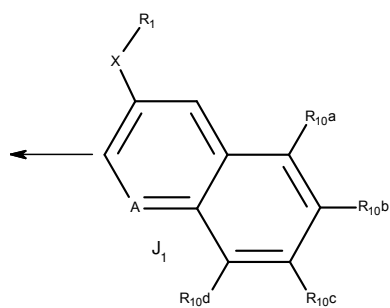
4. Un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, representado por los compuestos de fórmula I-1^a

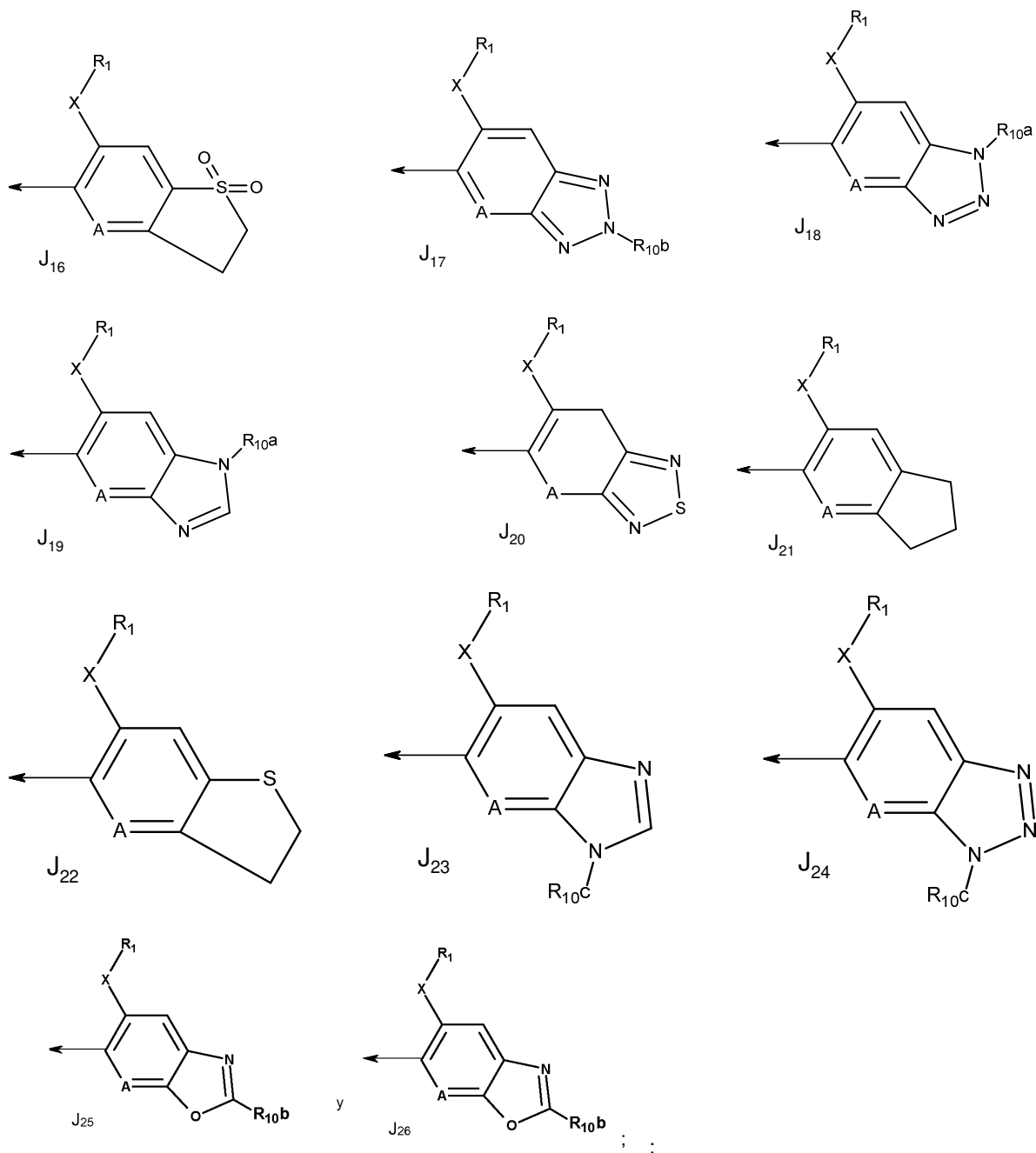
30



en donde J se selecciona del grupo que consiste en

35





5 A es C-H o N;

R₁ es alquilo C₁-C₄, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆;

10 R₂ es halógeno, haloalquil C₁-C₄sulfanilo, haloalquil C₁-C₄sulfinilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, haloalcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, ciano o es cicloalquilo C₃-C₆, que puede estar mono- o poli-sustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano y alquilo C₁-C₄;

15 R₄ es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, o son cicloalquilo C₃-C₆, que puede estar mono- o poli-sustituido con R₇; o son cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, que puede estar mono- o poli-sustituido con R₇;

o R₅ es alquilo C₁-C₄ sustituido con ciano o con fenilo que, por sí mismo, puede estar mono- o poli-sustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y alcoxi C₁-C₄; o

20 R₅ es alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆sulfanilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₆sulfinilo, haloalquil C₁-C₆sulfanilo, haloalquil C₁-C₆sulfonilo, haloalquil

C₁-C₆sulfínico, amina o hidroxilo;

R₇ es ciano, halógeno o haloalquilo C₁-C₂;

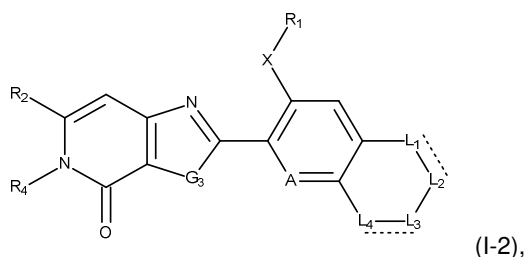
5 X es S, SO o SO₂

G₃ es NR₆;

10 R₆ es alquilo C₁-C₄, que puede estar mono- o poli-sustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno y alquil C₁-C₂sulfínico; y

15 R_{10a}, R_{10b}, R_{10c} y R_{10d}, independientemente uno de otro, son hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, hidroxilo, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-cicloalquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, ciclohaloalquil C₃-C₆-cicloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfínico, alquil C₁-C₄sulfonilo, haloalquil C₁-C₄tio, haloalquil C₁-C₄sulfínico, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, -SF₅; adicionalmente uno de R_{10a}, R_{10b}, R_{10c} y R_{10d} pueden ser oxo.

20 5. Un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, representado por los compuestos de fórmula I-2



25 en donde los sustituyentes X, A, R₁, R₂, R₄, G₃, L₁, L₂, L₃ y L₄ son como se definen bajo la fórmula I en la reivindicación 1.

6. Un compuesto de fórmula I-1 de acuerdo con la reivindicación 5, donde

A es C-H o N;

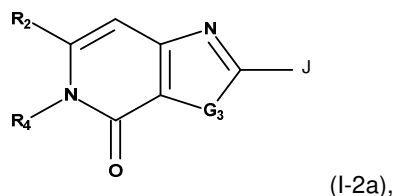
30 R₁ es alquilo C₁-C₄, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆;

R₂ es halógeno, haloalquil C₁-C₄sulfanilo, haloalquil C₁-C₄sulfínico, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, haloalcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, ciano o es cicloalquilo C₃-C₆, que puede estar mono- o poli-sustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano y alquilo C₁-C₄;

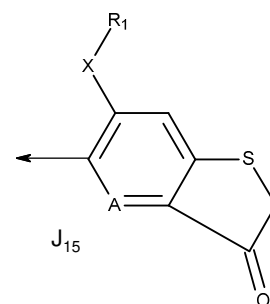
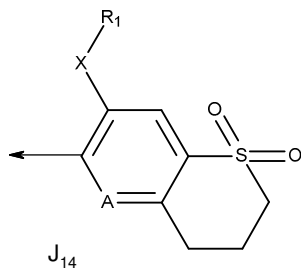
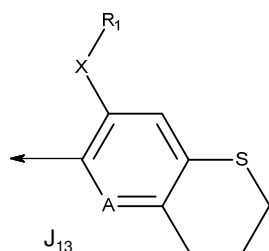
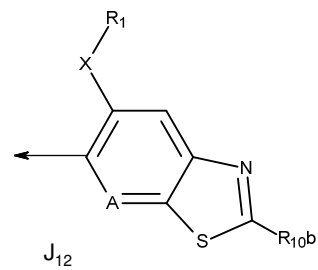
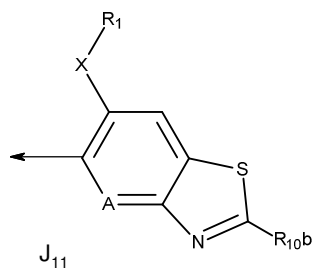
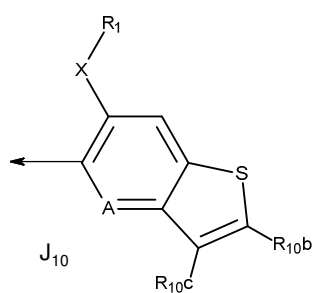
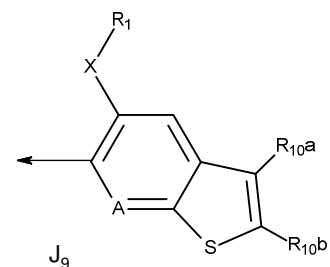
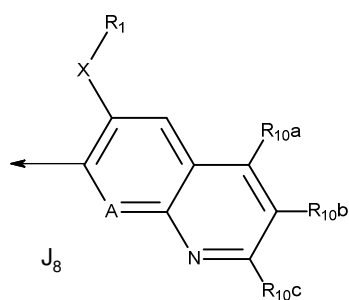
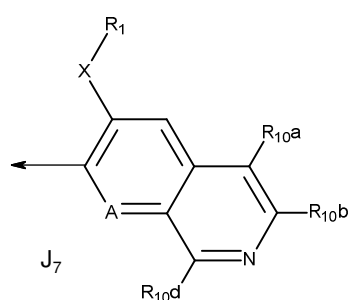
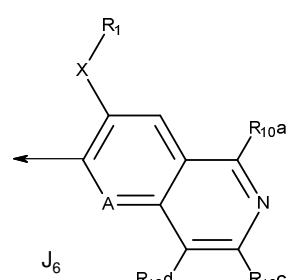
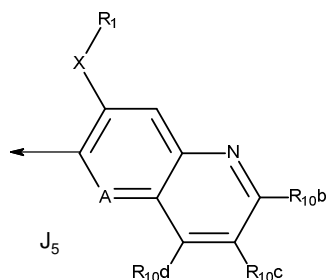
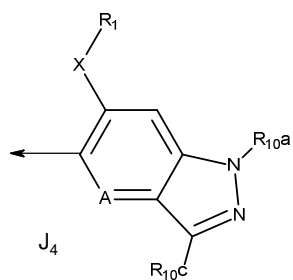
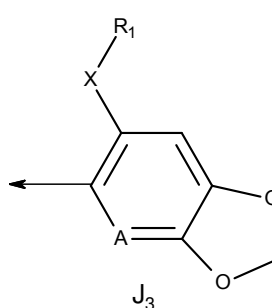
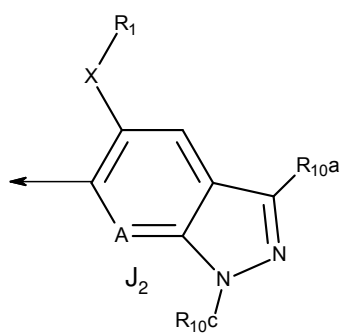
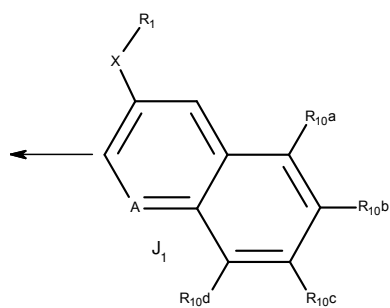
35 R₄, X, G₃, L₁, L₂, L₃ y L₄ son como se definen bajo la fórmula I en la reivindicación 1; y

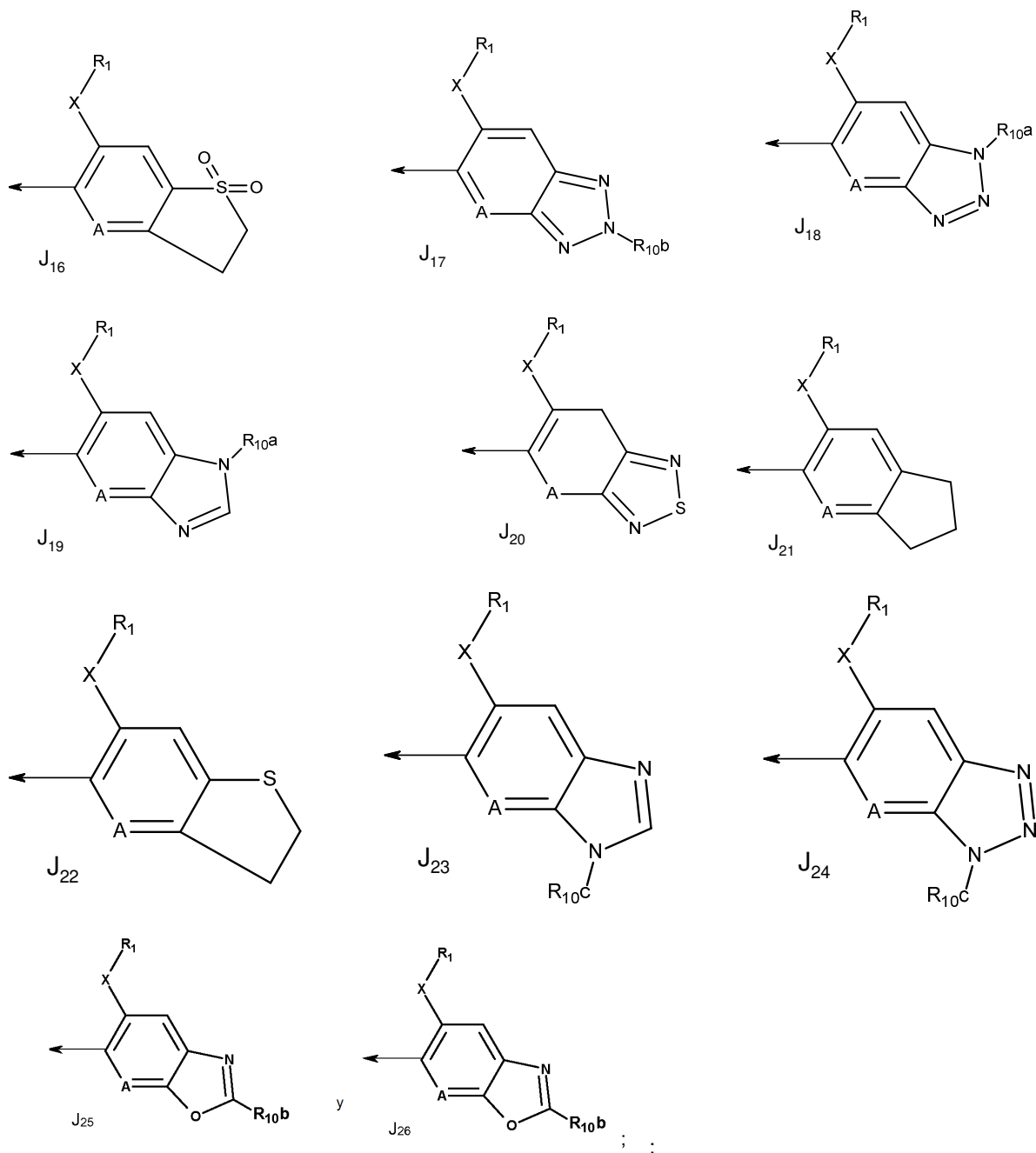
40 R_{10a}, R_{10b}, R_{10c} y R_{10d}, independientemente uno de otro, son hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, hidroxilo, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-cicloalquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, ciclohaloalquil C₃-C₆-cicloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfínico, alquil C₁-C₄sulfonilo, haloalquil C₁-C₄tio, haloalquil C₁-C₄sulfínico, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, -SF₅; adicionalmente uno de R_{10a}, R_{10b}, R_{10c} y R_{10d} pueden ser oxo.

45 7. Un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, representado por los compuestos de fórmula I-2^a



50 en donde J se selecciona del grupo que consiste en





5 A es C-H o N;

R₁ es alquilo C₁-C₄, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆;

10 R₂ es halógeno, haloalquil C₁-C₄sulfanilo, haloalquil C₁-C₄sulfinilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, haloalcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, ciano o es cicloalquilo C₃-C₆, que puede estar mono- o poli-sustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano y alquilo C₁-C₄;

15 R₄ es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, o son cicloalquilo C₃-C₆, que puede estar mono- o poli-sustituido con R₇; o son cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, que puede estar mono- o poli-sustituido con R₇; o

R₄ es alquilo C₁-C₄ sustituido con ciano o con fenilo que, por sí mismo, puede estar mono- o poli-sustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y alcoxi C₁-C₄; o

20 R₄ es alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆sulfanilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₆sulfinilo, haloalquil C₁-C₆sulfanilo, haloalquil C₁-C₆sulfonilo, haloalquil

C₁-C₆sulfino, amina o hidroxilo;

R₇ es ciano, halógeno o haloalquilo C₁-C₂;

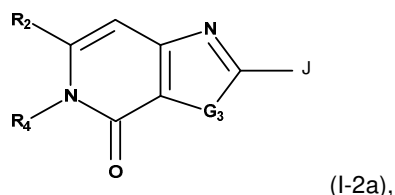
5 X es S, SO o SO₂

G₃ es NR₆;

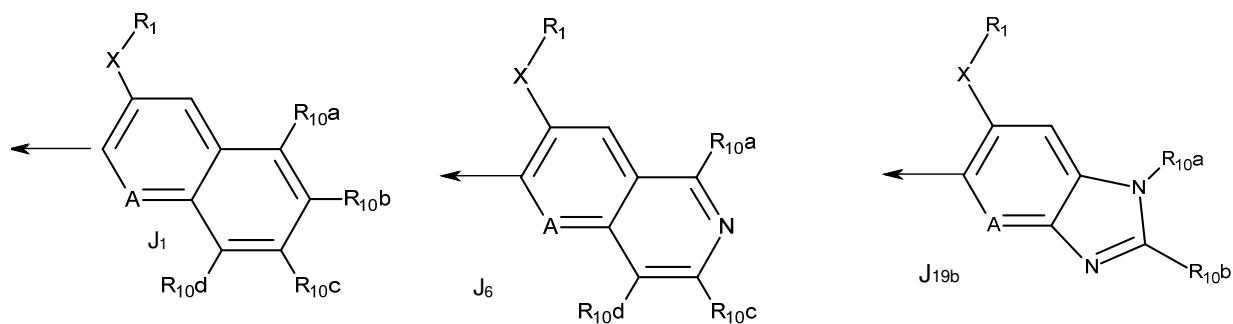
10 R₆ es alquilo C₁-C₄, que puede estar mono- o poli-sustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno y alquil C₁-C₂sulfino; y

15 R_{10a}, R_{10b}, R_{10c} y R_{10d}, independientemente uno de otro, son hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, hidroxilo, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-cicloalquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, ciclohaloalquil C₃-C₆-cicloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfino, alquil C₁-C₄sulfonilo, haloalquil C₁-C₄tio, haloalquil C₁-C₄sulfino, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, -SF₅; adicionalmente uno de R_{10a}, R_{10b}, R_{10c} y R_{10d} pueden ser oxo.

20 8. Un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, representado por los compuestos de fórmula I-2^a



en donde J se selecciona del grupo que consiste en



en donde

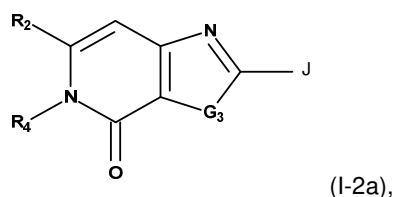
30 A es CH o N;

R₂ es haloalquilo C₁-C₂;

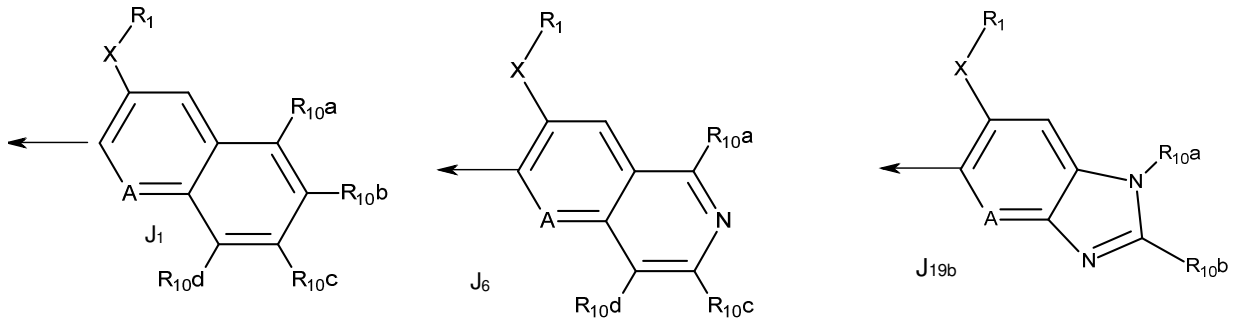
R₄ es alquilo C₁-C₄; y

35 R_{10a}, R_{10b}, R_{10c} y R_{10d}, independientemente uno de otro, son hidrógeno, haloalquilo C₁-C₂ o alquilo C₁-C₂.

9. Un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, representado por los compuestos de fórmula I-2a



40 en donde J se selecciona del grupo que consiste en



en donde

5

A es CH o N;

R₂ es trifluorometilo;

10

R₄ es metilo o etilo; y

R_{10a}, R_{10b}, R_{10c} y R_{10d} independientemente uno de otro, son hidrógeno, trifluorometilo o metilo.

15

10. Una composición plaguicida, que comprende al menos un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1 o, cuando proceda, un tautómero de este, en cada caso en forma libre o en forma salina que se pueda utilizar agroquímicamente, como principio activo y al menos un auxiliar.

20

11. Un método para controlar plagas, que comprende aplicar a las plagas o a su entorno una composición de acuerdo con la reivindicación 10, con la excepción de un método para el tratamiento del cuerpo de un ser humano o animal mediante cirugía o tratamiento y métodos de diagnóstico practicados en el cuerpo de un ser humano o animal.

25

12. Un método para la protección de semillas frente al ataque por plagas, que comprende tratar las semillas o el sitio en el que se plantan las semillas con una composición de acuerdo con la reivindicación 10.