

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 735 749**

51 Int. Cl.:

**C07D 498/04** (2006.01)

**C07D 498/14** (2006.01)

**A61K 31/553** (2006.01)

**A01N 43/90** (2006.01)

**A01P 7/04** (2006.01)

**A61P 33/10** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **18.08.2015 PCT/JP2015/073063**

87 Fecha y número de publicación internacional: **25.02.2016 WO16027790**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **18.08.2015 E 15833026 (6)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **19.06.2019 EP 3184528**

54 Título: **Compuesto de oxazepina, plaguicida para su uso agrícola y hortícola que contiene dicho compuesto como principio activo y método de uso de dicho plaguicida para su uso agrícola y hortícola**

30 Prioridad:

**19.08.2014 JP 2014166390**

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

**20.12.2019**

73 Titular/es:

**NIHON NOHYAKU CO., LTD. (100.0%)  
19-8, Kyobashi 1-chome, Chuo-ku  
Tokyo 104-8386, JP**

72 Inventor/es:

**HAYASHI, NOBUYUKI;  
SHIGENARI, TOSHIHIKO y  
FUKATSU, KOSUKE**

74 Agente/Representante:

**MILTENYI , Peter**

ES 2 735 749 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

Compuesto de oxazepina, plaguicida para su uso agrícola y hortícola que contiene dicho compuesto como principio activo y método de uso de dicho plaguicida para su uso agrícola y hortícola

**Campo técnico**

La presente invención se refiere a un insecticida agrícola/hortícola que contiene un compuesto de oxazepina o sal del mismo como su principio activo, así como un método para usar el mismo.

**Técnica antecedente**

La bibliografía de patente 1 y la bibliografía de patente 2 describen que un determinado tipo de compuesto de dibenzoxazepina posee actividad insecticida.

**Bibliografía de técnica antecedente**

**Bibliografía de patente**

Bibliografía de patente 1: Patente internacional abierta a inspección n.º WO2003/039255  
Bibliografía de patente 2: Patente internacional abierta a inspección n.º WO2004/026030

**Sumario de la invención**

**Problemas a solucionar mediante la invención**

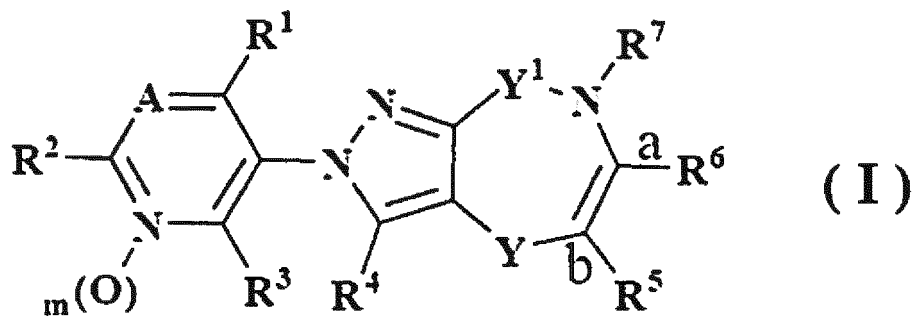
Los insectos plaga, etc., aún están provocando graves daños a la producción agrícola, hortícola y otras cosechas y, debido a las razones tales como aparición de insectos plaga que son resistentes a los químicos existentes, etc., existe la necesidad de desarrollar nuevos insecticidas y acaricidas agrícolas/hortícolas. Según envejecen los trabajadores agrícolas, también existe la necesidad de diversas aplicaciones que ahorren trabajo de insecticidas agrícolas/hortícolas, así como la necesidad de crear insecticidas agrícolas/hortícolas que tengan propiedades adecuadas para tales aplicaciones.

**Medios para resolver los problemas**

Mediante repetidos estudios con el afán de desarrollar un nuevo insecticida agrícola/hortícola, los inventores de la presente invención hallaron que un compuesto de oxazepina o sal del mismo expresado en la Fórmula General (I), tal como se propone mediante la presente invención, resultaría útil como insecticida agrícola/hortícola y, por consiguiente, completaron la presente invención.

Para ser específicos, la presente invención se refiere a lo siguiente:

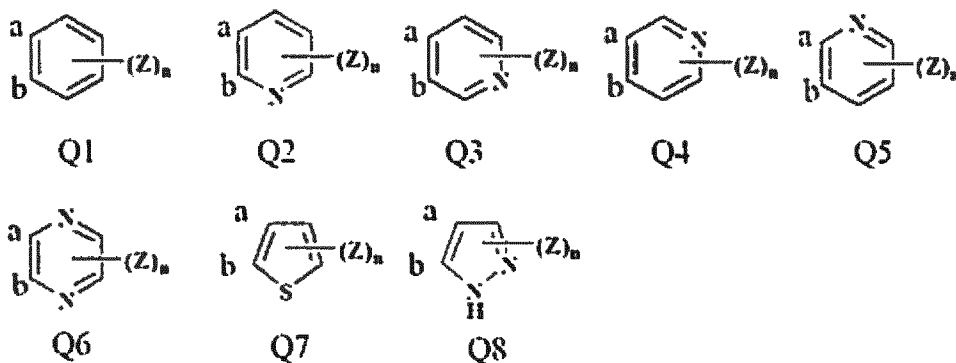
[1] Un compuesto de oxazepina o sal del mismo, expresado por la Fórmula General (1):



en donde, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> pueden ser iguales o diferentes, que representan:

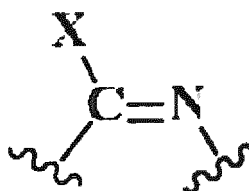
- (a1) un átomo de hidrógeno;
- (a2) un átomo de halógeno;
- (a3) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);
- (a4) un grupo cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>);
- (a5) un grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);
- (a6) un grupo haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);
- (a7) un grupo alquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

- (a8) un grupo alquilsulfinilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
 (a9) un grupo alquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
 (a10) un grupo fenilsulfonilo;  
 (a11) un grupo amino; o  
 5 (a12) un grupo alquilcarbonilamino (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
 R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> pueden ser iguales o diferentes, que representan:  
 (b1) un átomo de hidrógeno;  
 (b3) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>); o  
 10 (b4) R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> que forman la Fórmula Estructural Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, Q<sup>3</sup>, Q<sup>4</sup>, Q<sup>5</sup>, Q<sup>6</sup>, Q<sup>7</sup> o Q<sup>8</sup> a continuación, junto con átomos de carbono a los que se unen grupos de sustitución:



- en donde, Z puede ser igual o diferente, que representa (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (d) un grupo amino, (e) un grupo dialquilamino (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) (alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) puede ser igual o diferente), (f) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (g) un grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (h) un grupo haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (i) un grupo haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (p) un grupo hidroxilo, (q) un grupo nitro, (r) un grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (s) un grupo dialcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), en donde el alquilo en el dialcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) puede ser igual o diferente y puede estar unido a un átomo de carbono igual o diferente), (t) un grupo fenilo, (u) un grupo monoalquilamino (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (v) un grupo monoformilamino, (w) un grupo monoalquilcarbonilamino (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (x) un grupo monoalquilsulfonilamino (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (y) un grupo bis alquilsulfonilamino (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), en donde el alquilo en el bis alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) puede ser igual o diferente, (z) un grupo alcoxicarbonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (aa) un grupo hidroxicarbonilo, (ab) un grupo alquilaminosulfonilocarbonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (ac) un grupo alquilsulfinilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (ad) un grupo haloalquilsulfinilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) o (ae) un grupo aminosulfinilo y n representa un número entero de 0 a 2; y a y b cada uno representa una posición de unión);  
 25 R<sup>7</sup> representa:  
 (c1) un átomo de hidrógeno;  
 (c2) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>);  
 (c3) un grupo alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>);  
 (c4) un grupo alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>);  
 30 (c5) un grupo cianoalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
 (c6) un grupo cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>);  
 (c7) un grupo haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
 (c8) un grupo haloalquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>);  
 (c9) un grupo haloalquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>);  
 35 (c10) un grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
 (c11) un grupo alquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
 (c12) un grupo alquilsulfinilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
 (c13) un grupo alquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
 (c14) un grupo alquilcarbonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
 40 (c15) un grupo alcoxicarbonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
 (c16) un grupo alcoxicarbonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
 (c17) un grupo aminoalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
 (c18) un grupo di(alquilamino (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) (en la fórmula alquilo en dialquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) puede ser igual o diferente);  
 45 (c19) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) heterocíclico no aromático;  
 (c20) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) heterocíclico no aromático, que tiene, en su anillo, de uno a cinco grupo(s) de sustitución que puede(n) ser igual(es) o diferente(s) y seleccionado(s) de (a) átomo de halógeno, (b) grupo ciano, (c) grupo nitro, (af) grupo formilo, (f) grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) y (g) grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>);  
 (c21) un grupo fenilo;  
 50 (c22) un grupo fenilo que tiene, en su anillo, de uno a cinco grupo(s) de sustitución que puede(n) ser igual(es) o diferente(s) y seleccionado(s) de (a) átomo de halógeno, (b) grupo ciano, (c) grupo nitro, (af) grupo formilo, (f) grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (h) grupo haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (g) grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (i) grupo haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (ag) cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (j) grupo alquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (k) grupo haloalquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (l) grupo alquilsulfinilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (m)

- grupo haloalquilsulfino (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (n) grupo alquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) y (o) grupo haloalquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>);  
 (c23) un grupo fenilalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
 (c24) un grupo fenilalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) que tiene, en su anillo, de uno a cinco grupo(s) de sustitución que puede(n) ser igual(es) o diferente(s) y seleccionado(s) de (a) átomo de halógeno, (b) grupo ciano, (c) grupo nitro, (af) grupo formilo, (f) grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (h) grupo haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (g) grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (i) grupo haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (ag) cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (j) grupo alquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (k) grupo haloalquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (l) grupo alquilsulfino (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (m) grupo haloalquilsulfino (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (n) grupo alquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) y (o) grupo haloalquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>);  
 (c25) un grupo fenilcarbonilalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>);  
 (c26) un grupo fenilcarbonilalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) que tiene, en su anillo, de uno a cinco grupo(s) de sustitución que puede(n) ser igual(es) o diferente(s) y seleccionado(s) de (a) átomo de halógeno, (b) grupo ciano, (c) grupo nitro, (af) grupo formilo, (f) grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (h) grupo haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (g) grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (i) grupo haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (ag) cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (j) grupo alquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (k) grupo haloalquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (l) grupo alquilsulfino (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (m) grupo haloalquilsulfino (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (n) grupo alquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) y (o) grupo haloalquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>);  
 (c27) un grupo heterocíclico aromático;  
 (c28) un grupo heterocíclico aromático que tiene, en su anillo, de uno a tres grupo(s) de sustitución que puede(n) ser igual(es) o diferente(s) y seleccionado(s) de (a) átomo de halógeno, (b) grupo ciano, (c) grupo nitro, (af) grupo formilo, (f) grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (h) grupo haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (g) grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (i) grupo haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (ag) cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (j) grupo alquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (k) grupo haloalquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (l) grupo alquilsulfino (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (m) grupo haloalquilsulfino (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (n) grupo alquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) y (o) grupo haloalquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>);  
 (c29) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) heterocíclico aromático;  
 (c30) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) heterocíclico aromático que tiene, en su anillo, de uno a tres grupo(s) de sustitución que puede(n) ser igual(es) o diferente(s) y seleccionado(s) de (a) átomo de halógeno, (b) grupo ciano, (c) grupo nitro, (af) grupo formilo, (f) grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (h) grupo haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (g) grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (i) grupo haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (ag) cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (j) grupo alquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (k) grupo haloalquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (l) grupo alquilsulfino (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (m) grupo haloalquilsulfino (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (n) grupo alquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) y (o) grupo haloalquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>);  
 (c31) un grupo alquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
 (c32) un grupo aminocarbonilalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
 (c33) un grupo di(alquilamino (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) (en la fórmula alquilo en dialquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) puede ser igual o diferente);  
 (c34) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) carbonilalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
 (c35) un grupo dialcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), en donde el alquilo en el dialquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) puede ser igual o diferente y puede estar unido a un carbono igual o diferente);  
 (c36) un grupo formilo;  
 (c37) un grupo di(alquilaminocarbonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), en donde el alquilo en el dialquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) puede ser igual o diferente);  
 (c38) un grupo formilalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
 (c39) un grupo alcoxiimino (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
 (c40) un grupo haloalquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
 (c41) un grupo haloalquilsulfino (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
 (c42) un grupo haloalquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
 (c43) un grupo cicloquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>); o (c44) un grupo cianohaloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
 A representa un CH, C-R<sup>8</sup> (en la fórmula, R<sup>8</sup> representa (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (af) un grupo formilo, (f) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (h) un grupo haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (g) un grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) o (i) un grupo haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) o átomo de nitrógeno;  
 Y representa un átomo de oxígeno, S o NH;  
 Y<sup>1</sup> representa un C=O, C=S o grupo CH<sub>2</sub> o un grupo químico expresado mediante la siguiente fórmula junto con un átomo de nitrógeno contiguo:



- en donde X representa:
- (d1) un átomo de halógeno;
- (d2) un grupo ciano;
- (d3) un grupo trialquilsililo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) alquino (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), en donde el grupo alquilo en el grupo trialquilsililo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) puede ser igual o diferente);
- (d4) un NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>, en donde R<sup>10</sup>R<sup>11</sup> puede ser igual o diferente, que representa un átomo de hidrógeno, un grupo hidroxilo, grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), grupo alqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), grupo cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), grupo haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) o grupo

heterocíclico no aromático);

(d5) un grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>);

(d6) un grupo alquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>);

(d7) un grupo alquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>);

5 (d8) un grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>); o

(d9) un grupo haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>); y

m representa un número entero de 0 a 1.

[2] Un compuesto de oxazepina o sal del mismo, según [1] anterior, en donde:

10 R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> pueden ser iguales o diferentes, que representan:

(a1) un átomo de hidrógeno;

(a2) un átomo de halógeno;

(a3) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

(a10) un grupo fenilsulfonilo;

15 (a11) un grupo amino; o

(a12) un grupo alquilcarbonilamino (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> pueden ser iguales o diferentes, que representan:

(b1) un átomo de hidrógeno;

(b3) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>); o

20 (b4) R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> que forman la Fórmula Estructural Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, Q<sup>3</sup>, Q<sup>4</sup>, Q<sup>5</sup>, Q<sup>6</sup>, Q<sup>7</sup>, o Q<sup>8</sup> junto con átomos de carbono a los que están unidos;

R<sup>7</sup> es:

(c1) un átomo de hidrógeno;

(c2) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>);

25 (c3) un grupo alqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>);

(c4) un grupo alquino (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>);

(c5) un grupo cianoalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

(c6) un grupo cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>);

(c7) un grupo haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

30 (c10) un grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

(c11) un grupo alquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

(c12) un grupo alquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

(c13) un grupo alquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

(c14) un grupo alquilcarbonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

35 (c16) un grupo alcoxycarbonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

(c18) un grupo di(alquilamino (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) (en la fórmula alquilo en dialquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) puede ser igual o diferente);

(c19) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) heterocíclico no aromático;

40 (c20) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) heterocíclico no aromático que tiene, en su anillo, de uno a cinco grupo(s) de sustitución que puede(n) ser igual(es) o diferente(s) y seleccionado(s) de (a) átomo de halógeno, (b) grupo ciano, (c) grupo nitro, (af) grupo formilo, (f) grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) y (g) grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>);

(c21) un grupo fenilo;

(c23) un grupo fenilalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

45 (c24) un grupo fenilalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) que tiene, en su anillo, de uno a cinco grupo(s) de sustitución que puede(n) ser igual(es) o diferente(s) y seleccionado(s) de (a) átomo de halógeno, (b) grupo ciano, (c) grupo nitro, (af) grupo formilo, (f) grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (h) grupo haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (g) grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (i) grupo haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (ag) cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (j) grupo alquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (k) grupo haloalquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (l) grupo alquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (m) grupo haloalquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (n) grupo alquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) y (o) grupo haloalquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>);

50 (c26) un grupo fenilcarbonilalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) que tiene, en su anillo, de uno a cinco grupo(s) de sustitución que puede(n) ser igual(es) o diferente(s) y seleccionado(s) de (a) átomo de halógeno, (b) grupo ciano, (c) grupo nitro, (af) grupo formilo, (f) grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (h) grupo haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (g) grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (i) grupo haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (ag) cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (j) grupo alquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (k) grupo haloalquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (l) grupo alquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (m) grupo haloalquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (n) grupo alquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) y (o) grupo haloalquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>);

55 (c27) un grupo heterocíclico aromático;

(c29) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) heterocíclico aromático;

60 (c30) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) heterocíclico aromático que tiene, en su anillo, de uno a tres grupo(s) de sustitución que puede(n) ser igual(es) o diferente(s) y seleccionado(s) de (a) átomo de halógeno, (b) grupo ciano, (c) grupo nitro, (af) grupo formilo, (f) grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (h) grupo haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (g) grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (i) grupo haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (ag) cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (j) grupo alquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (k) grupo haloalquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (l) grupo alquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (m) grupo haloalquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (n) grupo alquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) y (o) grupo haloalquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>);

(c31) un grupo alquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

(c32) un grupo aminocarbonilalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

65 (c33) un grupo dialquilamino (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), en donde el alquilo en el dialquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) puede ser igual o diferente;

- (c34) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) carbonilalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
(c35) un grupo dialcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), en donde el alquilo en el dialquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) puede ser igual o diferente);  
(c36) un grupo formilo;  
5 (c37) un grupo di(alquilaminocarbonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), en donde el alquilo en el dialquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) puede ser igual o diferente);  
(c38) un grupo formilalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
(c39) un grupo alcoxiimino (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
(c40) un grupo haloalquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
(c41) un grupo haloalquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
10 (c42) un grupo haloalquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
(c43) un grupo cicloquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>); o  
(c44) un grupo cianoalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
A es un CH, C-R<sup>8</sup> (en la fórmula, R<sup>8</sup> representa (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (af) un grupo formilo, (f) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (h) un grupo haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (g) un grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) o (i) un  
15 grupo haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) o átomo de nitrógeno;  
Y es un átomo de oxígeno, S o NH;  
Y<sup>1</sup> es un C=O, C=S o grupo CH<sub>2</sub>; y  
m es 0 o 1.
- 20 [3] Un compuesto de oxazepina o sal del mismo, según [1] o [2] anterior, en donde: R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> pueden ser iguales o diferentes, que representan:  
(a1) un átomo de hidrógeno; o  
(a2) un átomo de halógeno;  
R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> forman la Fórmula Estructural Q<sup>1</sup> o Q<sup>7</sup> junto con átomos de carbono a los que están unidos;  
25 R<sup>7</sup> es:  
(c1) un átomo de hidrógeno;  
(c2) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>);  
(c4) un grupo alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>);  
(c5) un grupo cianoalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>); o  
30 (c10) un grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
A es un CH;  
Y es un átomo de oxígeno;  
Y<sup>1</sup> es un C=O; y  
m es 0.
- 35 [4] Un insecticida agrícola/hortícola caracterizado por que contiene, como su principio activo, un compuesto o sal del mismo según cualquiera una de [1] a [3] anterior.
- [5] Un método para el uso de un insecticida agrícola/hortícola, caracterizado por que un insecticida agrícola/hortícola según [4] anterior se aplica a plantas o suelo mediante una cantidad eficaz.
- [6] Uso de un compuesto o sal del mismo según cualquiera una de [1] a [3] anterior, como un insecticida agrícola/hortícola.
- 45 **Efectos de la invención**
- El compuesto de oxazepina o sal del mismo como se propone mediante la presente invención tiene efectos excelentes como insecticida agrícola/hortícola. También es eficaz sobre insectos plaga que habitan en perros, gatos u otros animales domésticos o vacas, ovejas y otro ganado.
- 50 **Modo para llevar a cabo la invención**
- En la definición de la Fórmula General (I) que expresa el compuesto de oxazepina propuesto mediante la presente invención:
- 55 "Halo" se refiere a un "átomo de halógeno" y representa un átomo de cloro, átomo de bromo, átomo de yodo o átomo de flúor;
- "Grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)" representa, por ejemplo, un grupo metilo, grupo etilo, grupo propilo normal, grupo isopropilo, grupo butilo normal, grupo isobutilo, grupo butilo secundario, grupo butilo terciario, grupo pentilo normal, grupo isopentilo, grupo pentilo terciario, grupo neopentilo, grupo 2,3-dimetil propilo, grupo 1-etil propilo, grupo 1-metil butilo, grupo 2-metil butilo, grupo hexilo normal, grupo isohexilo, grupo 2-hexilo, grupo 3-hexilo, grupo 2-metil pentilo, grupo 3-metil pentilo, grupo 1,1,2-trimetil propilo, grupo 3,3-dimetil butilo, grupo heptilo normal, grupo 2-heptilo, grupo 3-heptilo, grupo 2-metil hexilo, grupo 3-metil hexilo, grupo 4-metil hexilo, grupo isoheptilo, grupo octilo normal u otro  
65 grupo alquilo de cadena lineal o ramificada con un número de átomos de carbono de 1 a 8;

"Grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)" representa, por ejemplo, un grupo metilo, grupo etilo, grupo propilo normal, grupo isopropilo, grupo butilo normal, grupo isobutilo, grupo butilo secundario, grupo butilo terciario, grupo pentilo normal, grupo isopentilo, grupo pentilo terciario, grupo neopentilo, grupo 2,3-dimetil propilo, grupo 1-etil propilo, grupo 1-metil butilo, grupo hexilo normal, grupo isohexilo, grupo 1,1,2-trimetil propilo, grupo heptilo, grupo octilo, grupo nonilo, grupo decilo, grupo undecilo, grupo dodecilo u otro grupo alquilo de cadena lineal o ramificada con un número de átomos de carbono de 1 a 12;

"Grupo alqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)" representa, por ejemplo, un grupo vinilo, grupo alilo, grupo isopropenilo, grupo 1-butenilo, grupo 2-butenilo, grupo 2-metil-2-propenilo, grupo 1-metil-2-propenilo, grupo 2-metil-1-propenilo, grupo pentenilo, grupo 1-hexenilo, grupo 3,3-dimetil-1-butenilo, grupo heptenilo, grupo octenilo u otro grupo alqueno de cadena lineal o ramificada con un número de átomos de carbono de 2 a 8; y

"Grupo alquino (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)" representa, por ejemplo, un grupo etinilo, grupo 1-propinilo, grupo 2-propinilo, grupo 1-butenilo, grupo 2-butenilo, grupo 3-butenilo, grupo 3-metil-1-propinilo, grupo 2-metil-3-propinilo, grupo pentinilo, grupo 1-hexinilo, grupo 3-metil-1-butenilo, grupo 3,3-dimetil-1-butenilo, grupo heptinilo, grupo octinilo u otro grupo alquino de cadena lineal o ramificada con un número de átomos de carbono de 2 a 8.

"Grupo cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)" representa, por ejemplo, un grupo ciclopropilo, grupo ciclobutilo, grupo ciclopentilo, grupo ciclohexilo, grupo cicloheptilo, grupo ciclooctilo y otro grupo alquilo cíclico con un número de átomos de carbono de 3 a 8;

"Grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)" representa, por ejemplo, un grupo metoxi, grupo etoxi, grupo propoxi normal, grupo isopropoxi, grupo butoxi normal, grupo butoxi secundario, grupo butoxi terciario, grupo pentiloxi normal, grupo isopentiloxi, grupo pentiloxi terciario, grupo neopentiloxi, grupo 2,3-dimetil propiloxi, grupo 1-etil propiloxi, grupo 1-metil butiloxi, grupo hexiloxi normal, grupo isohexiloxi, grupo 1,1,2-trimetil propiloxi, grupo heptiloxi normal, grupo octiloxi normal u otro grupo alcoxi de cadena lineal o ramificada con un número de átomos de carbono de 1 a 8;

"Grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)tío" representa, por ejemplo, un grupo metil tío, grupo etil tío, grupo propil tío normal, grupo isopropil tío, grupo butil tío normal, grupo butil tío secundario, grupo butil tío terciario, grupo pentil tío normal, grupo isopentil tío, grupo pentil tío terciario, grupo nopentil tío, grupo 2,3-dimetil propil tío, grupo 1-etil propil tío, grupo 1-metil butiltío, grupo hexil tío normal, grupo isohexil tío, grupo 1,1,2-trimetil propiltío, grupo heptil tío normal, grupo octil tío normal u otro grupo alquil tío de cadena lineal o ramificada con un número de átomos de carbono de 1 a 8;

"Grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)sulfínilo" representa, por ejemplo, un grupo metil sulfínilo, grupo etil sulfínilo, grupo propil sulfínilo normal, grupo isopropil sulfínilo, grupo butil sulfínilo normal, grupo butil sulfínilo secundario, grupo butil sulfínilo terciario, grupo pentil sulfínilo normal, grupo isopentil sulfínilo, grupo pentil sulfínilo terciario, grupo neopentil sulfínilo, grupo 2,3-dimetil propil sulfínilo, grupo 1-etil propil sulfínilo, grupo 1-metil butil sulfínilo, grupo hexil sulfínilo normal, grupo isohexil sulfínilo, grupo 1,1,2-trimetil propil sulfínilo, grupo heptil sulfínilo normal, grupo sulfínilo normal u otro grupo alquil sulfínilo de cadena lineal o ramificada con un número de átomos de carbono de 1 a 8; y

"Grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)sulfonilo" representa, por ejemplo, un grupo metil sulfonilo, grupo etil sulfonilo, grupo propil sulfonilo normal, grupo isopropil sulfonilo, grupo butil sulfonilo normal, grupo butil sulfonilo secundario, grupo butil sulfonilo terciario, grupo pentil sulfonilo normal, grupo isopentil sulfonilo, grupo pentil sulfonilo terciario, grupo neopentil sulfonilo, grupo 2,3-dimetil propil sulfonilo, grupo 1-etil propil sulfonilo, grupo 1-metil butil sulfonilo, grupo hexil sulfonilo normal, grupo isohexil sulfonilo, grupo 1,1,2-trimetil propil sulfonilo, grupo heptil sulfonilo normal, grupo octil sulfonilo normal u otro grupo alquil sulfonilo de cadena lineal o ramificada con un número de átomos de carbono de 1 a 8.

"Grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)carbonilo" representa, por ejemplo, un grupo metil carbonilo (grupo acetilo), grupo etil carbonilo, grupo propil carbonilo normal, grupo isopropil carbonilo, grupo butil carbonilo normal, grupo butil carbonilo secundario, grupo butil carbonilo terciario, grupo pentil carbonilo normal, grupo isopentil carbonilo, grupo pentil carbonilo terciario, grupo neopentil carbonilo, grupo 2,3-dimetil propil carbonilo, grupo 1-etil propil carbonilo, grupo 1-metil butil carbonilo, grupo hexil carbonilo normal, grupo isohexil carbonilo, grupo 1,1,2-trimetil propil carbonilo, grupo heptil carbonilo normal, grupo octil carbonilo normal u otro grupo alquil carbonilo de cadena lineal o ramificada con un número de átomos de carbono de 1 a 8.

"Grupo alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)carbonilo" representa, por ejemplo, un grupo metoxi carbonilo, un grupo etoxi carbonilo, un grupo propoxi carbonilo normal, grupo isopropoxi carbonilo, grupo butoxi carbonilo normal, grupo butoxi carbonilo terciario, grupo pentiloxi carbonilo normal, grupo isopentoxi carbonilo, grupo pentiloxi carbonilo terciario, grupo neopentiloxi carbonilo, grupo 2,3-dimetil propiloxi carbonilo, grupo 1-etil propiloxi carbonilo, grupo 1-metil butiloxi carbonilo, grupo hexiloxi carbonilo normal, grupo isohexiloxi carbonilo, grupo 1,1,2-trimetil propiloxi carbonilo, grupo heptiloxi carbonilo normal, grupo octiloxi carbonilo normal u otro grupo alcoxi carbonilo de cadena lineal o ramificada con un número de átomos de carbono de 1 a 8.

"Grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)" representa, por ejemplo, un grupo metilo, grupo etilo, grupo propilo normal, grupo isopropilo, grupo butilo normal, grupo isobutilo, grupo butilo secundario, grupo butilo terciario, grupo pentilo normal, grupo

isopentilo, grupo pentilo terciario, grupo neopentilo, grupo 2,3-dimetil propilo, grupo 1-etil propilo, grupo 1-metil butilo, grupo 2-metil butilo, grupo hexilo normal, grupo isohexilo, grupo 2-hexilo, grupo 3-hexilo, grupo 2-metil pentilo, grupo 3-metil pentilo, grupo 1,1,2-trimetil propilo, grupo 3,3-dimetil butilo u otro grupo alquilo de cadena lineal o ramificada con un número de átomos de carbono de 1 a 6;

5 "Grupo alqueno ( $C_2-C_6$ )" representa, por ejemplo, un grupo vinilo, grupo alilo, grupo isopropenilo, grupo 1-butenilo, grupo 2-butenilo, grupo 2-metil-2-propenilo, grupo 1-metil-2-propenilo, grupo 2-metil-1-propenilo, grupo pentenilo, grupo 1-hexenilo, grupo 3,3-dimetil-1-butenilo u otro grupo alqueno de cadena lineal o ramificada con un número de átomos de carbono de 2 a 6; y

10 "Grupo alquino ( $C_2-C_6$ )" representa, por ejemplo, un grupo etinilo, grupo 1-propinilo, grupo 2-propinilo, grupo 1-butenilo, grupo 2-butenilo, grupo 3-butenilo, grupo 3-metil-1-propinilo, grupo 2-metil-3-propinilo, grupo pentinilo, grupo 1-hexinilo, grupo 3-metil-1-butenilo, grupo 3,3-dimetil-1-butenilo u otro grupo alquino de cadena lineal o ramificada con un número de átomos de carbono de 2 a 6.

15 "Grupo cicloalquilo ( $C_3-C_6$ )" representa, por ejemplo, un grupo ciclopropilo, grupo ciclobutilo, grupo ciclopentilo, grupo ciclohexilo y otro grupo alquilo cíclico con un número de átomos de carbono de 3 a 6;

20 "Grupo alcoxi ( $C_1-C_6$ )" representa, por ejemplo, un grupo metoxi, grupo etoxi, grupo propoxi normal, grupo isopropoxi, grupo butoxi normal, grupo butoxi secundario, grupo butoxi terciario, grupo pentiloxi normal, grupo isopentiloxi, grupo pentiloxi terciario, grupo neopentiloxi, grupo 2,3-dimetil propiloxi, grupo 1-etil propiloxi, grupo 1-metil butiloxi, grupo hexiloxi normal, grupo isohexiloxi, grupo 1,1,2-trimetil propiloxi u otro grupo alcoxi de cadena lineal o ramificada con un número de átomos de carbono de 1 a 6;

25 "Grupo alquiltio ( $C_1-C_6$ )" representa, por ejemplo, un grupo metil tío, grupo etil tío, grupo propil tío normal, grupo isopropil tío, grupo butil tío normal, grupo butil tío secundario, grupo butil tío terciario, grupo pentil tío normal, grupo isopentil tío, grupo pentil tío terciario, grupo neopentil tío, grupo 2,3-dimetil propil tío, grupo 1-etil propil tío, grupo 1-metil butiltío, grupo hexil tío normal, grupo isohexil tío, grupo 1,1,2-trimetil propil tío u otro grupo alquil tío de cadena lineal o ramificada con un número de átomos de carbono de 1 a 6;

30 "Grupo alquilsulfino ( $C_1-C_6$ )" representa, por ejemplo, un grupo metil sulfino, grupo etil sulfino, grupo propil sulfino normal, grupo isopropil sulfino, grupo butil sulfino normal, grupo butil sulfino secundario, grupo butil sulfino terciario, grupo pentil sulfino normal, grupo isopentil sulfino, grupo pentil sulfino terciario, grupo neopentil sulfino, grupo 2,3-dimetil propil sulfino, grupo 1-etil propil sulfino, grupo 1-metil butil sulfino, grupo hexil sulfino normal, grupo isohexil sulfino, grupo 1,1,2-trimetil propil sulfino u otro grupo alquil sulfino de cadena lineal o ramificada con un número de átomos de carbono de 1 a 6; y

35 "grupo alquilsulfonilo ( $C_1-C_6$ )" representa, por ejemplo, un grupo metil sulfonilo, grupo etil sulfonilo, grupo propil sulfonilo normal, grupo isopropil sulfonilo, grupo butil sulfonilo normal, grupo butil sulfonilo secundario, grupo butil sulfonilo terciario, grupo pentil sulfonilo normal, grupo isopentil sulfonilo, grupo pentil sulfonilo terciario, grupo neopentil sulfonilo, grupo 2,3-dimetil propil sulfonilo, grupo 1-etil propil sulfonilo, grupo 1-metil butil sulfonilo, grupo hexil sulfonilo normal, grupo isohexil sulfonilo, grupo 1,1,2-trimetil propil sulfonilo u otro grupo alquil sulfonilo de cadena lineal o ramificada con un número de átomos de carbono de 1 a 6.

45 Con el "grupo alquilo", "grupo alqueno", "grupo alquino", "grupo alcoxi", "grupo alquiltio", "grupo alquilsulfino" y "grupo alquilsulfonilo" anteriormente mencionados, se puede sustituir uno, dos o más átomo(s) de halógeno en una posición sustituible y si dos o más átomos de halógenos se sustituyen, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes. Cuando está sustituido con átomo de halógeno, se denominan como "grupo haloalquilo", "grupo haloalqueno", "grupo haloalquino", "grupo haloalcoxi", "grupo haloalquiltio", "grupo haloalquilsulfino", y "grupo haloalquilsulfonilo", respectivamente.

50 Las expresiones " $(C_1-C_6)$ ", " $(C_1-C_8)$ ", " $(C_2-C_6)$ ", " $(C_2-C_8)$ ", " $(C_3-C_6)$ ", " $(C_3-C_8)$ ", etc., representan cada una un intervalo de números de átomos de carbono para cada uno de los diversos grupos de sustitución. La definición anteriormente mencionada también se aplica a grupos a los que los grupos de sustitución anteriormente están unidos; por ejemplo, "grupo alcoxi ( $C_1-C_8$ ) alquilo ( $C_1-C_8$ )" indica que un grupo alcoxi de cadena lineal o cadena ramificada con un número de carbono de 1 a 8 está unido a un grupo alquilo de cadena lineal o cadena ramificada con un número de carbono de 1 a 8.

60 Dos grupos de sustitución  $R^5$  y  $R^6$  pueden formar juntos un anillo aromático o grupo heterocíclico aromático. En este caso, el anillo aromático es un grupo fenilo, mientras que el grupo heterocíclico aromático puede ser piridilo, pirimidinilo, pirididinilo, piradinilo, triadinilo, tienilo, furanilo, tiazolo, oxazolo, etc., pero entre estos, son preferentes un grupo fenilo, grupo piridilo, grupo piradinilo, grupo tienilo y grupo tiazolo.

65 Mediante la presente invención, un "anillo hexacíclico aromático" puede ser piridilo, pirimidinilo, pirididinilo, piradinilo, triadinilo, tienilo, furanilo, tiazolo, oxazolo, etc.



Asimismo, según la presente invención, un "anillo heterocíclico no aromático" puede ser, por ejemplo, pirrolidinilo, piperidinilo, morfolinilo, tiomorfolinilo, piperadinilo, 4-metil piperadinilo, oxazolidinilo, tiazolidinilo, imidazolidinilo, oxazolinilo, tiazolinilo, isoxazolinilo, imidazolinilo, dioxolanilo, tetrahidrofuranilo, dihidrofuran-2-(3H)-ona u otro grupo heterocíclico no aromático monocíclico.

5 La sal del compuesto de oxazepina expresada por la Fórmula General (I) según la presente invención puede ser, por ejemplo, sal de clorhidrato, sal de sulfato, sal de nitrato, sal de fosfato u otra sal de ácido inorgánico o sal de acetato, sal fumarato, sal de maleato, sal de oxalato, sal de metano sulfonato, sal de benceno sulfonato, sal de paratolueno sulfonato u otra sal de ácido orgánico o sal realizada con un ion de sodio, ion de potasio, ion de calcio, trimetil amonio u otra base inorgánica u orgánica.

15 El compuesto de oxazepina o sal del mismo expresado por la Fórmula General (I) según la presente invención puede tener uno o más centros asimétricos o dos o más tipos de isómeros ópticos y diastereómeros, en su forma estructural, y la presente invención cubre isómeros ópticos individuales, así como todas las mezclas que contienen tales isómeros ópticos en cualquier relación. Asimismo, el compuesto de oxazepina o sal del mismo expresado por la Fórmula General (I) según la presente invención puede tener dos tipos de isómeros geométricos que proceden de los enlaces dobles carbono-carbono en su fórmula estructural y la presente invención cubre isómeros geométricos individuales así como todas las mezclas que contienen tales isómeros geométricos en cualquier relación.

20 Se muestra a continuación una realización preferente del compuesto de oxazepina expresado por la Fórmula General (I) según la presente invención.

Preferentemente  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  y  $R^4$ , que son iguales o diferentes, son cada uno:

25 un átomo de hidrógeno;  
un átomo de halógeno;  
un grupo alquilo ( $C_1-C_8$ );  
un grupo fenil sulfonilo;  
un grupo amino; o  
un grupo alquil( $C_1-C_8$ ) aminocarbonilo; o  
30 más preferentemente, que son iguales o diferentes, es cada uno un átomo de hidrógeno o átomo de halógeno.

Preferentemente  $R^5$  y  $R^6$ , que son iguales o diferentes, son cada uno:

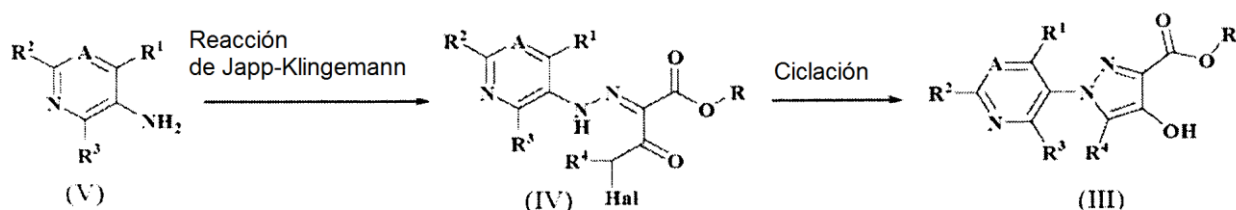
35 un átomo de hidrógeno; o  
un grupo alquilo ( $C_1-C_8$ ); o  
 $R^5$  y  $R^6$  se expresan cada uno por la Fórmula Estructural  $Q^5$ ,  $Q^2$ ,  $Q^3$ ,  $Q^4$ ,  $Q^5$ ,  $Q^6$ ,  $Q^7$  o  $Q^8$  junto con un átomo de carbono unido a él; o  
más preferentemente  $R^5$  y  $R^6$  se expresan cada uno por la Fórmula Estructural  $Q^1$  o  $Q^7$  junto con un átomo de carbono unido a él.

40 Preferentemente  $R^7$  es:

(c1) un átomo de hidrógeno;  
(c2) un grupo alquilo ( $C_1-C_{12}$ );  
(c3) un grupo alqueno ( $C_2-C_8$ );  
(c4) un grupo alquino ( $C_2-C_8$ );  
45 (c5) un grupo cianoalquilo ( $C_1-C_8$ );  
(c6) un grupo cicloalquilo ( $C_3-C_8$ );  
(c7) un grupo haloalquilo ( $C_1-C_8$ );  
(c10) un grupo alcoxi ( $C_1-C_8$ ) alquilo ( $C_1-C_8$ );  
(c11) un grupo alquiltio ( $C_1-C_8$ ) alquilo ( $C_1-C_8$ );  
50 (c12) un grupo alquilsulfonilo ( $C_1-C_8$ ) alquilo ( $C_1-C_8$ );  
(c13) un grupo alquilsulfonilo ( $C_1-C_8$ ) alquilo ( $C_1-C_8$ );  
(c14) un grupo alquilcarbonilo ( $C_1-C_8$ );  
(c16) un grupo alcoxycarbonilo ( $C_1-C_8$ ) alquilo ( $C_1-C_8$ );  
(c18) un grupo di(alquil ( $C_1-C_8$ )) amino alquilo ( $C_1-C_8$ ) en donde el alquilo en dialquilo ( $C_1-C_8$ ) puede ser igual o  
55 diferente);  
(c19) un grupo alquilo ( $C_1-C_8$ ) heterocíclico no aromático;  
(c20) un grupo alquilo ( $C_1-C_8$ ) heterocíclico no aromático igual o diferente que tiene, en su anillo, de uno a cinco grupo(s) de sustitución seleccionados de (a) átomo de halógeno, (b) grupo ciano, (c) grupo nitro, (af) grupo formilo, (f) grupo alquilo ( $C_1-C_6$ ) y (g) grupo alcoxi ( $C_1-C_6$ );  
60 (c21) un grupo fenilo;  
(c23) un grupo fenilalquilo ( $C_1-C_8$ );  
(c24) un grupo fenilalquilo ( $C_1-C_8$ ) igual o diferente que tiene, en su anillo, de uno a cinco grupo(s) de sustitución seleccionados de (a) átomo de halógeno, (b) grupo ciano, (c) grupo nitro, (af) grupo formilo, (f) grupo alquilo ( $C_1-C_6$ ), (h) grupo haloalquilo ( $C_1-C_6$ ), (g) grupo alcoxi ( $C_1-C_6$ ), (i) grupo haloalcoxi ( $C_1-C_6$ ), (ag) cicloalquilo ( $C_3-C_6$ ) alcoxi ( $C_1-C_6$ ), (j) grupo alquiltio ( $C_1-C_6$ ), (k) grupo haloalquiltio ( $C_1-C_6$ ), (l) grupo alquilsulfonilo ( $C_1-C_6$ ), (m) grupo haloalquilsulfonilo ( $C_1-C_6$ ), (n) grupo alquilsulfonilo ( $C_1-C_6$ ) y (o) grupo haloalquilsulfonilo ( $C_1-C_6$ );

- (c26) un grupo alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) fenilcarbonilo igual o diferente que tiene, en su anillo, de uno a cinco grupo(s) de sustitución seleccionados de (a) átomo de halógeno, (b) grupo ciano, (c) grupo nitro, (af) grupo formilo, (f) grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (h) grupo haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (g) grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (i) grupo haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (ag) cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (j) grupo alquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (k) grupo haloalquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (l) grupo alquilsulfinilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (m) grupo haloalquilsulfinilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (n) grupo alquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) y (o) grupo haloalquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>);
- (c27) un grupo heterocíclico aromático;
- (c29) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) heterocíclico aromático;
- (c30) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) heterocíclico aromático igual o diferente que tiene, en su anillo, de uno a tres grupo(s) de sustitución seleccionados de (a) átomo de halógeno, (b) grupo ciano, (c) grupo nitro, (af) grupo formilo, (f) grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (h) grupo haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (g) grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (i) grupo haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (ag) cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (j) grupo alquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (k) grupo haloalquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (l) grupo alquilsulfinilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (m) grupo haloalquilsulfinilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (n) grupo alquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) y (o) grupo haloalquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>);
- (c31) un grupo alquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);
- (c32) un grupo aminocarbonilalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);
- (c33) un grupo di(alquilamino (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) (en la fórmula alquilo en dialquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) puede ser igual o diferente);
- (c34) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) carboniloxialquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);
- (c35) un grupo dialcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), en donde el alquilo en el dialquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) puede ser igual o diferente);
- (c36) un grupo formilo;
- (c37) un grupo di(alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) aminocarbonilo, en donde el alquilo en el dialquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) puede ser igual o diferente);
- (c38) un grupo formilalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);
- (c39) un grupo alcoxiimino (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);
- (c40) un grupo haloalquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);
- (c41) un grupo haloalquilsulfinilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);
- (c42) un grupo haloalquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);
- (c43) un grupo cicloquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>); o (c44) un grupo cianohaloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>); o más preferentemente, R<sup>7</sup> es:
- (c1) un átomo de hidrógeno;
- (c2) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>);
- (c4) un grupo alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>);
- (c5) un grupo cianoalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>); o
- (c10) un grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>).
- 35 Preferentemente A es un CH, C-R<sup>8</sup>, en donde R<sup>8</sup> representa (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (af) un grupo formilo, (f) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (h) un grupo haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (g) un grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) o (i) un grupo haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) o átomo de nitrógeno; o más preferentemente, A es un CH.
- Preferentemente Y es un átomo de oxígeno, S o NH; o
- 40 más preferentemente Y es un átomo de oxígeno.
- Preferentemente Y<sup>1</sup> es un C=O, C=S o grupo CH<sub>2</sub>; o más preferentemente Y<sup>1</sup> es un C=O.
- Preferentemente m es 0.
- 45 Se pueden producir diversos compuestos según la presente invención usando los métodos de producción a continuación, por ejemplo; sin embargo, la presente invención no se limita a lo siguiente.

Método de producción 1



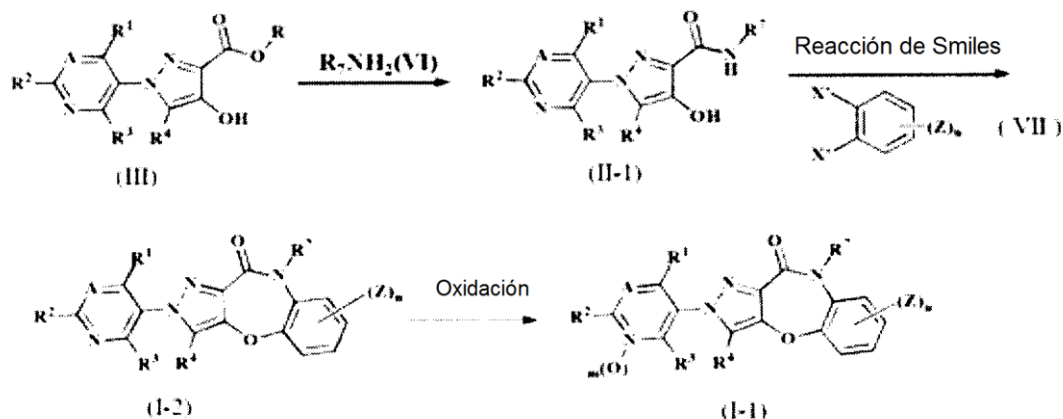
- 50 {En la fórmula, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y A son iguales a los mencionados anteriormente, mientras que Hal representa un átomo de halógeno y R representa un grupo alquilo de C<sub>1</sub> a C<sub>3</sub>.}

55 Método de producción de Fórmula General (III) a partir de Fórmula General (V)

Esta reacción mediante un compuesto amino expresado por la Fórmula General (V) que se fabrique según el método

que se describe en el documento US2013/0210883, J. Med. Chem., 2009, 52, 2652-2655 u Org. React. 1959, 10, 143-178.

Método de producción 2



5

{En la fórmula, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>7</sup>, A, Z, m y n son iguales a los mencionados anteriormente, mientras que X' representa un átomo de halógeno, grupo nitro u otro grupo saliente y R representa un grupo alquilo de C<sub>1</sub> a C<sub>3</sub>.}

10 Método de producción de Fórmula General (II-1) a partir de Fórmula General (III)

Esta reacción mediante un compuesto amida expresado por la Fórmula General (II-1) que se fabrique según el método que se describe en J. Med. Chem., 2009, 52, 2652-2655, que usa un compuesto de 4-hidroxi pirazol expresado por la Fórmula General (III) que se ha realizado según el Método de producción 1 anterior y una amina expresada por la Fórmula General (VI).

15

O, un compuesto amida expresado por la Fórmula General (II-1) puede producirse mediante la hidrólisis de un compuesto de 4-hidroxi pirazol (III) para derivar un ácido carboxílico y, a continuación, hacer que el ácido carboxílico y la amina (VI) reaccionen con un agente de condensación en presencia de un disolvente inerte y una base.

20

La base usada en la reacción hidrolítica puede ser, por ejemplo, hidróxido sódico, hidróxido potásico, carbonato sódico, carbonato de potasio, hidrogenocarbonato sódico, hidrogenocarbonato de potasio u otra base inorgánica, etc., que se usa normalmente mediante una cantidad en un intervalo de 1,0 a 10 tiempos molares la cantidad del compuesto de 4-hidroxi pirazol expresado por la Fórmula General (III).

25

El ácido usado en la reacción hidrolítica puede ser, por ejemplo, ácido clorhídrico, ácido sulfúrico, ácido nítrico, ácido fosfórico, etc., que se usa mediante una cantidad en un intervalo de 1,0 a 10 tiempos molares la cantidad del compuesto de 4-hidroxi pirazol expresado por la Fórmula General (III).

30 El disolvente inerte usado en la reacción hidrolítica puede ser cualquier disolvente siempre y cuando no inhiba significativamente la progresión de esta reacción, tal como metanol, etanol, isopropanol u otro alcohol; dietiléter, éter metil terbutílico (en lo sucesivo en el presente documento denominado como "MTBE"), dioxano, tetrahidrofurano (en lo sucesivo en el presente documento denominado como "THF") u otra cadena o éter cíclico; dimetilformamida, dimetil acetamida u otra amida; acetona, metilacetona u otra cetona; acetonitrilo u otro nitrilo, o agua, donde cualquiera de estos disolventes inertes se puede usar solo o dos o más de ellos se pueden mezclar juntos. La temperatura de reacción puede seleccionarse como cualquiera entre temperatura ambiente y el punto de ebullición del disolvente inerte usado y el tiempo de reacción, que varía dependiendo de la escala de reacción y la temperatura de reacción, puede seleccionarse en un intervalo de varios minutos hasta 48 horas. Una vez ha finalizado la reacción, la sustancia diana puede aislarse usando cualquier método normal del sistema de reacción que contiene la sustancia diana y, si es necesario, la sustancia aislada puede refinarse mediante recristalización, cromatografía en columna, etc., para producir la sustancia diana.

40

Un compuesto amida expresado por la Fórmula General (II-1) puede producirse haciendo que un ácido carboxílico producido mediante la reacción hidrolítica anteriormente mencionada y una amina expresada por la Fórmula General (VI), para reaccionar con agente de condensación en presencia de un disolvente inerte y una base.

45

El agente de condensación usado para la reacción de condensación puede ser, por ejemplo, dietil fosforocianidato (DEPC), carbonil diimidazol (CDI), 1,3-diciclohexil carbodiimida (DCC), éster clorocarbónico, yoduro de 2-cloro-1-metil-piridinio, etc., que puede usarse mediante cualquier cantidad seleccionada como se considere adecuado en un intervalo de 1 a 1,5 tiempos molares la cantidad del ácido carboxílico.

50

5 La base usada para la reacción de condensación puede ser, por ejemplo, hidróxido sódico, hidróxido potásico, carbonato sódico, carbonato de potasio, hidrogenocarbonato sódico, hidrogenocarbonato de potasio u otra base inorgánica; acetato sódico, acetato de potasio u otro acetato; trietil amina, diisopropil etil amina, 1,8-diaza bicyclo [5.4.0] undec-7-eno u otra amina terciaria; piridina, dimetil aminopiridina u otro compuesto aromático que contiene nitrógeno, etc., que se usa normalmente mediante una cantidad en un intervalo de 1 a 10 tiempos molares la cantidad del compuesto de amida expresado por la Fórmula General (II-1).

10 El disolvente inerte usado para la reacción de condensación puede ser cualquier disolvente siempre y cuando no inhiba significativamente la progresión de esta reacción, tal como benceno, tolueno, xileno u otro hidrocarburo aromático; cloruro de metileno, cloroformo, tetracloruro de carbono u otro hidrocarburo halogenado; clorobenceno, diclorobenceno u otro hidrocarburo aromático halogenado; dietiléter, MTBE, dioxano, THF u otra cadena o éter cíclico; etil acetato u otro éster; dimetilformamida, dimetil acetamida u otra amida; acetona, metiletilcetona u otra cetona; u otro disolvente inerte, donde cualquiera de estos disolventes inertes se puede usar solo o dos o más de ellos se pueden mezclar juntos.

20 Puesto que esta es una reacción equimolar, el ácido carboxílico y amina solo necesitan usarse mediante una cantidad equimolar; sin embargo, se puede usar cualquier agente de reacción mediante una cantidad excesiva. La temperatura de reacción puede seleccionarse como cualquiera entre temperatura ambiente y el punto de ebullición del disolvente inerte usado y el tiempo de reacción, que varía dependiendo de la escala de reacción y la temperatura de reacción, puede seleccionarse en un intervalo de varios minutos hasta 48 horas.

25 Una vez ha finalizado la reacción, la sustancia diana puede aislarse usando cualquier método normal del sistema de reacción que contiene la sustancia diana y, si es necesario, la sustancia aislada puede refinarse mediante recristalización, cromatografía en columna, etc., para producir la sustancia diana.

Método de producción de Fórmula General (1-2) a partir de Fórmula General (II-1)

30 Un compuesto de oxazepina expresado por la Fórmula General (1-2) se puede producir según el método descrito en ACS Comb. Sci. 2011, 13, 547-553 (Smiles Rearrangement), que usa un compuesto amida expresado por la Fórmula General (II-1) que se ha producido según el método de producción anteriormente mencionado y un benceno expresado por la Fórmula General (VII).

35 Método de producción de Fórmula General (I-1) a partir de Fórmula General (1 -2)

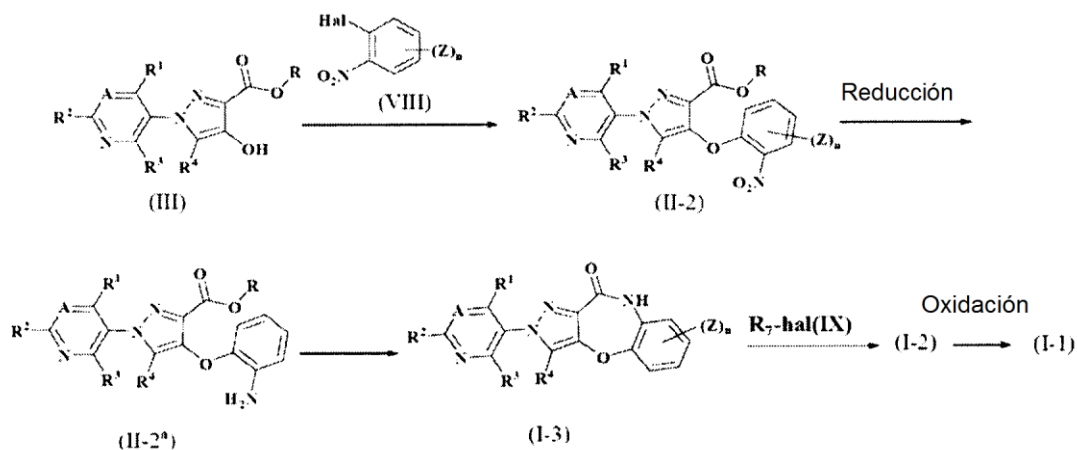
40 Un compuesto de oxazepina expresado por la Fórmula General (I-1) puede producirse haciendo que un compuesto de oxazepina expresado por la Fórmula General (I-2) reacciona con un agente oxidante en un disolvente inerte. El agente oxidante usado para esta reacción puede ser dióxido de manganeso u otro compuesto de manganeso; agente oxidante tal como cromato de sodio y otro cromato; cloro de hierro, yoduro de cobre u otro agente de halogenación de metal, yodo, bromo u otro alógeno; solución de peróxido de hidrógeno, ácido perbenzoico, ácido m-cloroperbenzoico u otro peróxido o similares. Entre otras, solución de peróxido de hidrógeno, ácido perbenzoico o ácido m-cloroperbenzoico es preferente. Cualquiera de estos agentes oxidantes pueden seleccionarse según sea adecuado y usarse mediante una cantidad en un intervalo de 1 a 5 tiempos molares o, preferentemente, en un intervalo de 1 a 2 tiempos molares, la cantidad del compuesto de oxazepina expresado por la Fórmula General (1-2).

45 El disolvente inerte usado para esta reacción puede ser cualquier disolvente siempre y cuando no inhiba significativamente la progresión de esta reacción, tal como benceno, tolueno, xileno u otro hidrocarburo aromático; cloruro de metileno, cloroformo, tetracloruro de carbono u otro hidrocarburo halogenado; clorobenceno, diclorobenceno u otro hidrocarburo aromático halogenado; acetonitrilo u otro nitrilo; etil acetato u otro éster; ácido fórmico, ácido acético u otro ácido orgánico; N,N-dimetilformamida, N,N-dimetil acetamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, agua u otro disolvente polar, donde cualquiera de estos disolventes inertes se puede usar solo o dos o más de ellos se pueden mezclar juntos.

50 Para esta reacción, se puede seleccionar cualquier temperatura de reacción según se considere adecuado en un intervalo de 0 °C a la temperatura de reflujo del disolvente inerte usado. El tiempo de reacción, que varía dependiendo de la escala de reacción y la temperatura de reacción, etc., puede seleccionarse según se considere adecuado en un intervalo de varios minutos hasta 48 horas.

60 Una vez ha finalizado la reacción, la sustancia diana puede aislarse usando cualquier método normal del sistema de reacción que contiene la sustancia diana y, si es necesario, la sustancia aislada puede refinarse mediante recristalización, cromatografía en columna, etc., para producir la sustancia diana.

Método de producción 3



- 5 {En la fórmula, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>7</sup>, A, Z, m y n son iguales a los mencionados anteriormente, mientras que Hal representa un átomo de halógeno y R representa un grupo alquilo de C<sub>1</sub> a C<sub>3</sub>.}

Método de producción de Fórmula General (II-2) a partir de Fórmula General (III)

- 10 Un compuesto de éter de nitrofenilo expresado por la Fórmula General (II-2) puede producirse haciendo que un compuesto de 4-hidroxi pirazol expresado por la Fórmula General (III) reacciona con un nitrobeneno expresado por la Fórmula General (VIII) en presencia de un disolvente inerte y una base.

- 15 La base usada para esta reacción puede ser hidróxido de sodio, hidróxido potásico, carbonato sódico, carbonato de potasio, carbonato de cesio, hidrogenocarbonato sódico, hidrogenocarbonato de potasio u otra base inorgánica, hidruro sódico, hidruro de potasio y otro hidruro de metal alcalino, metóxido de sodio, etóxido de sodio, butoxi potasio terciario y otro alcóxido de metal alcalino, metil-litio, butil-litio normal u otro alquil-litio, etc.

- 20 Esta base se usa normalmente mediante una cantidad en un intervalo de 1,0 a 10 tiempos molares la cantidad del compuesto de 4-hidroxi pirazol expresado por la Fórmula General (III).

- 25 El disolvente inerte usado para esta reacción puede ser cualquier disolvente siempre y cuando no inhiba significativamente la progresión de esta reacción, tal como metanol, etanol, isopropanol u otro alcohol; dietiléter, MTBE, dioxano, THF u otra cadena o éter cíclico; dimetilformamida, dimetil acetamida u otra amida; acetona, metiletilcetona u otra cetona; acetonitrilo u otro nitrilo, etc., donde cualquiera de estos disolventes inertes se puede usar solo o dos o más de ellos se pueden mezclar juntos. Puesto que esta es una reacción equimolar, el compuesto de 4-hidroxi pirazol y nitrobeneno necesitan utilizarse en una cantidad equimolar; sin embargo, se puede usar cualquier agente de reacción mediante una cantidad excesiva.

- 30 Puesto que esta es una reacción equimolar, cada compuesto necesita utilizarse mediante una cantidad equimolar; sin embargo, se puede usar cualquier compuesto mediante una cantidad excesiva. La temperatura de reacción puede seleccionarse como cualquiera entre temperatura ambiente y el punto de ebullición del disolvente inerte usado y el tiempo de reacción, que varía dependiendo de la escala de reacción y la temperatura de reacción, puede seleccionarse en un intervalo de varios minutos hasta 48 horas.

- 35 Una vez ha finalizado la reacción, la sustancia diana puede aislarse usando cualquier método normal del sistema de reacción que contiene la sustancia diana y, si es necesario, la sustancia aislada puede refinarse mediante recristalización, cromatografía en columna, etc., para producir la sustancia diana.

- 40 Método de producción de Fórmula General (II-2<sup>a</sup>) a partir de Fórmula General (II-2)

Un compuesto de éter de aminofenilo expresado por la Fórmula General (II-2<sup>a</sup>) puede producirse reduciendo en un disolvente inerte un compuesto de éter de nitrofenilo expresado por la Fórmula General (II-2).

- 45 Los disolventes inertes que pueden usarse para esta reacción incluyen, por ejemplo, metanol, etanol y otros alcoholes, THF, dioxano y otro éter, ácido acético, ácido clorhídrico, ácido sulfúrico y otros ácidos orgánicos y ácidos inorgánicos, agua, etc., donde cualquiera de estos disolventes inertes se puede usar solo o dos o más de ellos se pueden mezclar juntos.

Adicionalmente, una solución acuosa del ácido usado como agente reductor, como se describe a continuación, puede usarse directamente como un disolvente inerte. Agentes reductores que se pueden usar para esta reacción son, por ejemplo, ácido de metal, sal de metal, etc., donde los ejemplos de metal incluyen hierro, estaño y zinc, ejemplos de ácido incluyen ácido clorhídrico, ácido sulfúrico y otros ácidos minerales, ácido acético y otros ácidos orgánicos y cloruro de estaño y ejemplos de sal incluyen cloruro de amonio. Cualquiera de los anteriores puede combinarse juntos.

El agente reductor puede usarse mediante cualquier cantidad seleccionada como se considere adecuada en un intervalo de 1 a 10 tiempos molares en el caso de un metal o de 0,05 a 10 tiempos molares en el caso de un ácido o una sal, la cantidad del éter de nitrofenilo expresado por la Fórmula General (II-2). La temperatura de reacción puede seleccionarse en un intervalo de 0 a 150 °C, mientras que el tiempo de reacción, que varía dependiendo de la escala de reacción, temperatura de reacción, etc., puede seleccionarse según se considere adecuado en un intervalo de varios minutos hasta 48 horas.

O, el método de hidrogenación por contacto puede usarse en presencia de un catalizador, donde el catalizador puede ser, por ejemplo, paladiocarbono, níquel Raney, etc. La presión de hidrógeno puede seleccionarse en un intervalo de 1 atm a 5 atm. Disolventes inertes que se pueden usar incluyen, por ejemplo, metanol, etanol y otros alcoholes, THF, dioxano y otros éteres, ácido acético u otros ácidos orgánicos, agua, etc.

Una vez ha finalizado la reacción, la sustancia diana puede aislarse usando cualquier método normal del sistema de reacción que contiene la sustancia diana y, si es necesario, la sustancia aislada puede refinarse según el método de recristalización, método de destilación, método de cromatografía en columna, etc., para producir la sustancia diana. Como alternativa, después de finalizar esta reacción, el sistema de reacción se puede usar directamente para la siguiente reacción sin aislar la sustancia diana.

Método de producción de Fórmula General (I-3) a partir de Fórmula General (II-2<sup>a</sup>)

Un compuesto de oxazepina expresado por la Fórmula General (I-3) puede producirse haciendo que un compuesto de éter de aminofenilo expresado por la Fórmula General (II-2<sup>a</sup>) reacciona en presencia de un disolvente inerte y una base.

La base usada para esta reacción puede ser hidróxido de sodio, hidróxido potásico, carbonato sódico, carbonato de potasio, carbonato de cesio, hidrogenocarbonato sódico, hidrogenocarbonato de potasio u otra base inorgánica, hidruro sódico, hidruro de potasio y otro hidruro de metal alcalino, metóxido de sodio, etóxido de sodio, butoxi potasio terciario y otro alcóxido de metal alcalino, metil-litio, butil-litio normal u otro alquil-litio, etc.

Esta base se usa normalmente mediante una cantidad en un intervalo de 1,0 a 10 tiempos molares la cantidad del compuesto de éter de aminofenilo expresado por la Fórmula General (II-2<sup>a</sup>).

El disolvente inerte usado para esta reacción puede ser cualquier disolvente siempre y cuando no inhiba significativamente la progresión de esta reacción, tal como metanol, etanol, isopropanol u otro alcohol; dietiléter, MTBE, dioxano, THF u otra cadena o éter cíclico; dimetilformamida, dimetil acetamida u otra amida; acetona, metilacetona u otra cetona; o acetonitrilo u otro nitrilo, donde cualquiera de estos disolventes inertes se puede usar solo o dos o más de ellos se pueden mezclar juntos. La temperatura de reacción puede seleccionarse como cualquiera entre temperatura ambiente y el punto de ebullición del disolvente inerte usado y el tiempo de reacción, que varía dependiendo de la escala de reacción y la temperatura de reacción, puede seleccionarse en un intervalo de varios minutos hasta 48 horas.

Una vez ha finalizado la reacción, la sustancia diana puede aislarse usando cualquier método normal del sistema de reacción que contiene la sustancia diana y, si es necesario, la sustancia aislada puede refinarse mediante recristalización, cromatografía en columna, etc., para producir la sustancia diana.

Método de producción de Fórmula General (I-2) a partir de Fórmula General (I-3)

Un compuesto expresado por la Fórmula General (I-2) puede producirse haciendo que un compuesto de oxazepina expresado por la Fórmula General (I-3) reacciona con un R<sub>7</sub>-Hal (Hal es el mismo que el descrito anteriormente) expresado por la Fórmula General (IX) en presencia de un disolvente inerte y una base.

La base usada para esta reacción puede ser hidróxido de sodio, hidróxido potásico, carbonato sódico, carbonato de potasio, carbonato de cesio, hidrogenocarbonato sódico, hidrogenocarbonato de potasio u otra base inorgánica, hidruro sódico, hidruro de potasio y otro hidruro de metal alcalino, metóxido de sodio, etóxido de sodio, butoxi potasio terciario y otro alcóxido de metal alcalino, metil-litio, butil-litio normal u otro alquil-litio, etc.

Esta base se usa normalmente mediante una cantidad en un intervalo de 1,0 a 10 tiempos molares la cantidad del compuesto de oxazepina expresado por la Fórmula General (I-3).

5 El disolvente inerte usado para esta reacción puede ser cualquier disolvente siempre y cuando no inhiba significativamente la progresión de esta reacción, tal como metanol, etanol, isopropanol u otro alcohol; dietiléter, MTBE, dioxano, THF u otra cadena o éter cíclico; dimetilformamida, dimetil acetamida u otra amida; acetona, metiletilcetona u otra cetona; o acetonitrilo u otro nitrilo, donde cualquiera de estos disolventes inertes se puede usar solo o dos o más de ellos se pueden mezclar juntos. Puesto que esta es una reacción equimolar, el compuesto de oxazepina expresado por la Fórmula General (I-3) y el R<sub>7</sub>-Hal expresado por la Fórmula General (IX) necesitan usarse mediante una cantidad equimolar; sin embargo, se puede usar cualquier agente de reacción mediante una cantidad excesiva.

10 La temperatura de reacción puede seleccionarse como cualquiera entre temperatura ambiente y el punto de ebullición del disolvente inerte usado y el tiempo de reacción, que varía dependiendo de la escala de reacción y la temperatura de reacción, puede seleccionarse en un intervalo de varios minutos hasta 48 horas.

15 Una vez ha finalizado la reacción, la sustancia diana puede aislarse usando cualquier método normal del sistema de reacción que contiene la sustancia diana y, si es necesario, la sustancia aislada puede refinarse mediante recristalización, cromatografía en columna, etc., para producir la sustancia diana.

20 Asimismo, con respecto al método de producción de un compuesto (I) que tiene una estructura de Q<sup>2</sup>, Q<sup>3</sup>, Q<sup>4</sup> o Q<sup>5</sup> en la Fórmula General (I), este compuesto puede producirse del mismo modo usando una dihalopiridina en lugar del compuesto (VII) desvelado en el Método de producción 2 o usando una 2-halo-3-nitropiridina en lugar del compuesto (VIII) desvelado en el Método de producción 3.

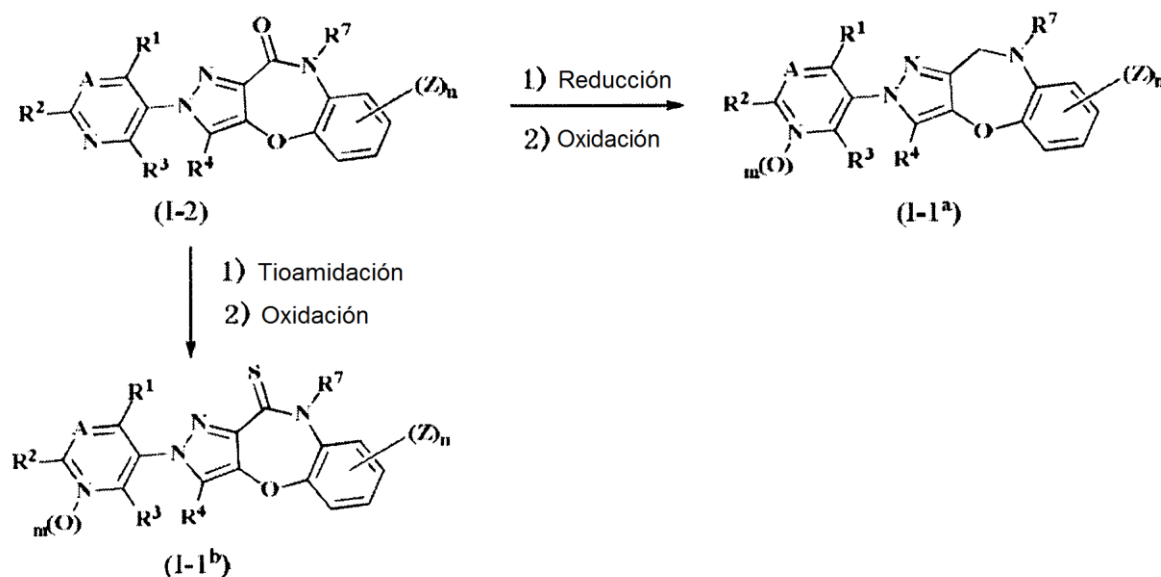
25 Adicionalmente, con respecto a la producción de un compuesto (I) que tiene una estructura de Q<sup>6</sup> en la Fórmula General (I), este compuesto puede producirse del mismo modo usando una dihalopiradina en lugar del compuesto (VII) desvelado en el Método de producción 2 o usando una 2-halo-3-nitropiradina en lugar del compuesto (VIII) desvelado en el Método de producción 3.

30 Además, con respecto a la producción de un compuesto (I) que tiene una estructura de Q<sup>7</sup> o Q<sup>8</sup> en la Fórmula General (I), este compuesto puede producirse del mismo modo usando un 2-halo-3-nitrotiofeno o 5-halo-4-nitropirazol en lugar del compuesto (VIII) desvelado en el Método de producción 3.

Método de producción de Fórmula General (I-1) a partir de Fórmula General (I-2)

35 Un compuesto expresado por la Fórmula General (I-1) puede producirse según el método descrito en el Método de producción 2 anterior.

Método de producción 4



40

{En la fórmula, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>7</sup>, A, Z, m y n son iguales a los mencionados anteriormente.}

Método de producción de Fórmula General (I-1<sup>a</sup>) a partir de Fórmula General (I-2)

Un compuesto expresado por la Fórmula General (I-1<sup>a</sup>) puede producirse reduciendo y, a continuación, oxidando, un compuesto de oxazepina expresado por la Fórmula General (I-2).

5 Entre los agentes reductores que se pueden usar para la reacción de reducción se incluye, por ejemplo, borohidruro sódico, borohidruro de litio, borohidruro de zinc, hidruro de litio y aluminio, hidruro de diisobutilo y aluminio y otros compuestos complejos de hidrógeno de metal. El agente reductor puede usarse mediante una cantidad seleccionada como se considere adecuada en un intervalo de aprox. 0,25 a 10 tiempos molares la cantidad del compuesto de oxazepina expresado por la Fórmula General (I-2).

10 El disolvente inerte usado para esta reacción puede ser cualquier disolvente siempre y cuando no inhiba significativamente la progresión de esta reacción, tal como metanol, etanol u otro alcohol, THF, dioxano u otro éter, cloruro de metileno, cloroformo, tetracloruro de carbono u otro hidrocarburo halogenado, etc., donde cualquiera de estos disolventes inertes se puede usar solo o dos o más de ellos se pueden mezclar juntos. La temperatura de reacción puede seleccionarse como cualquiera entre aprox. -20 °C y el punto de ebullición del disolvente usado y el tiempo de reacción, que varía dependiendo de la escala de reacción, temperatura de reacción, etc., puede seleccionarse según se considere adecuado en un intervalo de varios minutos hasta aprox. 48 horas. Una vez ha finalizado la reacción, la sustancia diana puede aislarse usando cualquier método normal del sistema de reacción que contiene la sustancia diana y, si es necesario, la sustancia aislada puede refinarse según el método de 15 recristalización, método de destilación, método de cromatografía en columna, etc., para producir la sustancia diana. Como alternativa, después de finalizar esta reacción, el sistema de reacción se puede usar directamente para la siguiente reacción sin aislar la sustancia diana.

20 La reacción de oxidación en esta reacción puede producirse según el método descrito en el Método de producción 2 anterior.

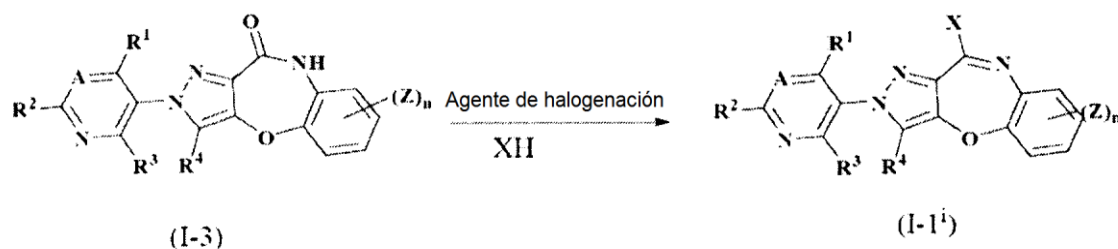
Método de producción de Fórmula General (I-1<sup>b</sup>) a partir de Fórmula General (I-2)

30 Un compuesto de tioamida expresado por la Fórmula General (I-1<sup>b</sup>) puede producirse tiocarbonilando y, a continuación, oxidando, un compuesto de oxazepina expresado por la Fórmula General (I-2).

35 El reactivo que se puede usar en la reacción de tiocarbonilación no queda limitado de ningún modo y se puede usar pentasulfuro de fósforo, reactivo de Lawesson [2,4-bis (4-metoxi fenil)-1,3-ditia-2,4-difosfetano-2,4-disulfuro], etc. El reactivo de tiocarbonilación se puede usar mediante una cantidad en un intervalo de 0,5 a 5 tiempos molares o, preferentemente 1 a 2 tiempos molares, la cantidad del compuesto de oxazepina expresado por la Fórmula General (I-2). La temperatura de reacción puede ser cualquiera entre 0 °C y el punto de ebullición del disolvente, pero preferentemente se encuentra entre temperatura ambiente y 150 °C. El disolvente inerte usado para esta reacción puede ser cualquier disolvente siempre y cuando no inhiba significativamente la progresión de esta reacción, tal como benceno, tolueno, xileno, dietiléter, THF, dioxano, acetonitrilo o N,N-dimetilformamida. El compuesto de 40 tioamida según la fórmula general, tal como se ha producido mediante esta reacción, puede refinarse mediante recristalización o cromatografía en columna.

45 La reacción de oxidación en esta reacción puede producirse según el método descrito en el Método de producción 2 anterior.

Método de producción 5



50 [En la fórmula, H representa un átomo de hidrógeno, mientras que R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, A, Z, X y n son iguales a los mencionados anteriormente].

55 Un haluro expresado por la Fórmula General (I-1<sup>i</sup>) puede derivarse haciendo que un compuesto (I-3) producido según el Método de producción 3 reacciona con un cloruro de tionilo, oxiclóruo de fósforo, tricloruro de fósforo, tribromuro de fosforo u otro agente de halogenación en presencia de un disolvente o sin ningún disolvente.

La cantidad de agente de halogenación puede seleccionarse según se considere adecuado en un intervalo de 1,0 a



5 tiempos molares la cantidad del compuesto de oxazepina expresado por la Fórmula General (1-3). La temperatura de reacción puede ser cualquiera entre 0 °C y el punto de ebullición del disolvente, pero preferentemente se encuentra entre temperatura ambiente y 150 °C. El disolvente inerte usado para esta reacción puede ser cualquier disolvente siempre y cuando no inhiba significativamente la progresión de esta reacción, tal como benceno, tolueno, xileno u otro hidrocarburo aromático, clorobenceno, diclorobenceno u otro hidrocarburo aromático halogenado, cloruro de metileno, cloroformo, tetracloruro de carbono u otro hidrocarburo halogenado, dietil éter u otro éter, etc. El haluro producido por esta reacción puede refinarse mediante recristalización. Adicionalmente, un compuesto expresado por la Fórmula General (I-1) puede producirse haciendo que el producto aislado o producto sin aislar reaccione con un agente de halogenación HX en presencia de un disolvente y una base.

La cantidad de agente de halogenación XH puede seleccionarse según se considere adecuado en un intervalo de 1,0 a 5 tiempos molares la cantidad del compuesto de oxazepina expresado por la Fórmula General (I-1).

La base usada para esta reacción puede ser hidróxido de sodio, hidróxido potásico, carbonato sódico, carbonato de potasio, carbonato de cesio, hidrogenocarbonato sódico, hidrogenocarbonato de potasio u otra base inorgánica, hidruro sódico, hidruro de potasio y otro hidruro de metal alcalino, metóxido de sodio, etóxido de sodio, butoxi potasio terciario y otro alcóxido de metal alcalino, metil-litio, butil-litio normal u otro alquil-litio, etc. El disolvente inerte usado para esta reacción puede ser cualquier disolvente siempre y cuando no inhiba significativamente la progresión de esta reacción, tal como benceno, tolueno, xileno u otro hidrocarburo aromático; cloruro de metileno, cloroformo, tetracloruro de carbono u otro hidrocarburo halogenado; clorobenceno, diclorobenceno u otro hidrocarburo aromático halogenado; acetonitrilo u otro nitrilo; etil acetato u otro éster; ácido fórmico, ácido acético u otro ácido orgánico; o N,N-dimetilformamida, N,N-dimetil acetamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona u otro disolvente polar, donde cualquiera de estos disolventes inertes se puede usar solo o dos o más de ellos se pueden mezclar juntos.

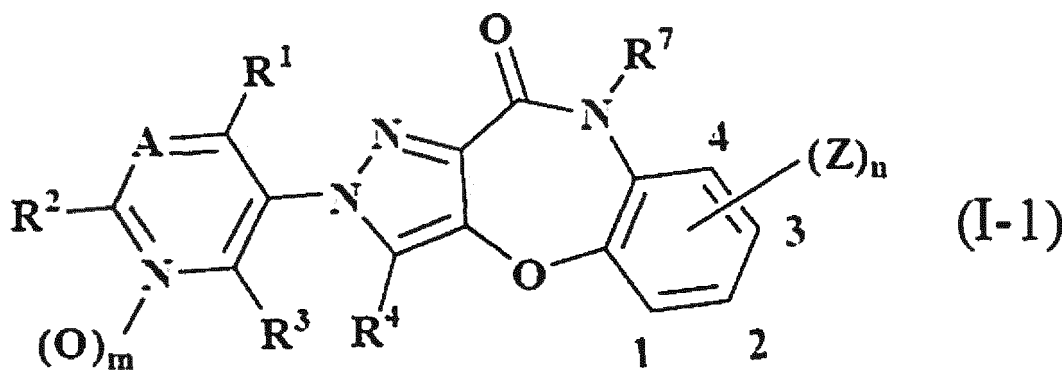
Para esta reacción, se puede seleccionar la temperatura de reacción según se considere adecuado en un intervalo de 0 °C a la temperatura de reflujo del disolvente inerte usado. El tiempo de reacción, que varía dependiendo de la escala de reacción, temperatura de reacción, etc., puede seleccionarse según se considere adecuado en un intervalo de varios minutos hasta 48 horas.

Una vez ha finalizado la reacción, la sustancia diana puede aislarse usando cualquier método normal del sistema de reacción que contiene la sustancia diana y, si es necesario, la sustancia aislada puede refinarse mediante recristalización, cromatografía en columna, etc., para producir la sustancia diana.

Lo siguiente ilustra ejemplos representativos del compuesto de oxazepina expresado por la Fórmula General (I) según la presente invención, en las Tablas 1 a 11 y 13 a 26; debe destacarse, sin embargo, que la presente invención no se limita a estos ejemplos.

En las tablas, "Me" representa un grupo metilo, "Et" representa un grupo etilo, "Pr" representa un grupo propilo, "Bu" representa un grupo butilo, "Hex" representa un grupo hexilo, "Oct" representa un grupo octilo, "Bn" representa un grupo bencilo, "Ph" representa un grupo fenilo, "Py" representa un grupo piridilo, "tiazol" representa un grupo tiazol, "n-" representa "normal", "t-" representa "terciario", y "c-" representa "ciclo". Para la propiedad física, se indica o bien el punto de fusión (°C) o el índice refractivo  $n_D$  (temperatura de medición; °C).

La Tabla 12 muestra los datos de la RMN-<sup>1</sup>H de los compuestos denotados mediante "RMN" en las columnas de "Propiedad física" en las Tablas 1 a 11 y 13 a 26.



[Tabla 1]

Compuesto n.º	A	R <sup>1</sup>	R <sup>7</sup>	(Z) <sub>n</sub>	Propiedad física
1-1	CH	H	H	H	259-262
1-2	CH	H	Me	H	195-196

Compuesto n.º	A	R <sup>1</sup>	R <sup>7</sup>	(Z) <sub>n</sub>	Propiedad física
1-3	CH	H	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	142-146
1-4	CH	H	CH <sub>2</sub> CN	H	213-215
1-5	CH	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	211-213
1-6	CH	H	H	1-F	297-299
1-7	CH	H	Me	1-F	253-255
1-8	CH	H	CH <sub>2</sub> C≡CH	1-F	220-222
1-9	CH	H	CH <sub>2</sub> CN	1-F	195-197
1-10	CH	H	H	2-F	285-288
1-11	CH	H	Me	2-F	225-226
1-12	CH	H	CH <sub>2</sub> C≡CH	2-F	205-209
1-13	CH	H	CH <sub>2</sub> CN	2-F	212-214
1-14	CH	H	H	3-F	294-296
1-15	CH	H	Me	3-F	186-187
1-16	CH	H	CH <sub>2</sub> C≡CH	3-F	90-92
1-17	CH	H	CH <sub>2</sub> CN	3-F	173-175
1-18	CH	H	H	4-F	
1-19	CH	H	Me	4-F	235-237
1-20	CH	H	CH <sub>2</sub> C≡CH	4-F	
R <sup>2</sup> , R <sup>3</sup> R <sup>4</sup> = H, m = 0					

[Tabla 2]

Compuesto n.º	A	R <sup>1</sup>	R <sup>7</sup>	(Z) <sub>n</sub>	Propiedad física
1-21	CH	H	CH <sub>2</sub> CN	4-F	
1-22	CH	H	H	1-Cl	155-159
1-23	CH	H	Me	1-Cl	224-226
1-24	CH	H	CH <sub>2</sub> C≡CH	1-Cl	
1-25	CH	H	CH <sub>2</sub> CN	1-Cl	
1-26	CH	H	H	2-Cl	> 280
1-27	CH	H	Me	2-Cl	241-243
1-28	CH	H	CH <sub>2</sub> C≡CH	2-Cl	193-196
1-29	CH	H	CH <sub>2</sub> CN	2-Cl	239-242
1-30	CH	H	H	2-Me	> 280
1-31	CH	H	Me	2-Me	217-221
1-32	CH	H	CH <sub>2</sub> C≡CH	2-Me	100-105
1-33	CH	H	CH <sub>2</sub> CN	2-Me	234-237
1-34	CH	H	Me	2-CF <sub>3</sub>	211-212
1-35	CH	H	CH <sub>2</sub> C≡CH	2-CF <sub>3</sub>	201-204
1-36	CH	H	CH <sub>2</sub> CN	2-CF <sub>3</sub>	195-196
1-37	CH	H	H	3-CF <sub>3</sub>	238-243

ES 2 735 749 T3

Compuesto n.º	A	R <sup>1</sup>	R <sup>7</sup>	(Z) <sub>n</sub>	Propiedad física
1-38	CH	H	Me	3-CF <sub>3</sub>	174-177
1-39	CH	H	H	2-OMe	289-291
1-40	CH	H	Me	2-OMe	160-162
1-41	CH	H	CH <sub>2</sub> C≡CH	2-OMe	183-187
1-42	CH	H	CH <sub>2</sub> CN	2-OMe	214-215
1-43	CH	H	Me	2-NO <sub>2</sub>	281-282
1-44	CH	H	H	3-NH <sub>2</sub>	296-298
1-45	CH	H	Me	3-NH <sub>2</sub>	195-198

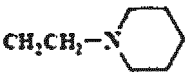
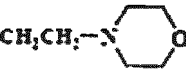

R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> = H, m = 0

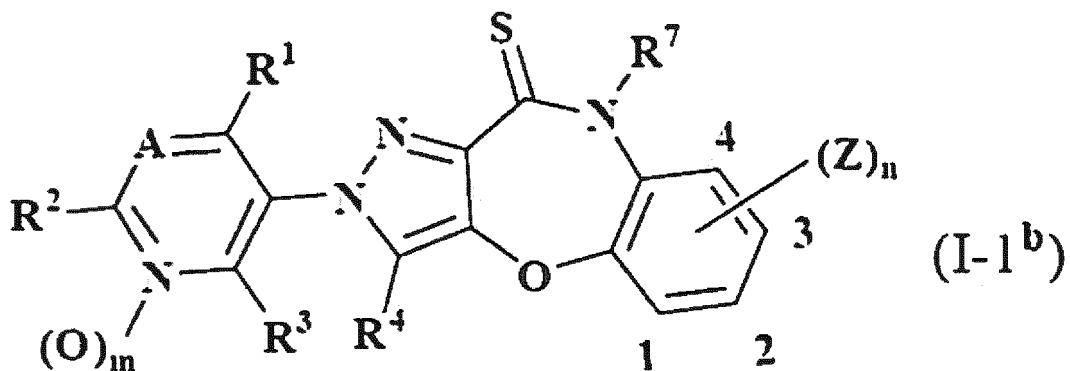
[Tabla 3]

Compuesto n.º	A	R <sup>1</sup>	R <sup>7</sup>	(Z) <sub>n</sub>	Propiedad física
1-46	CH	H	Me	3-NMe <sub>2</sub>	RMN
1-47	CH	H	Me	2-CN	269-271
1-48	CH	H	CH <sub>2</sub> C≡CH	2-CN	255-258
1-49	CH	H	CH <sub>2</sub> CN	2-CN	
1-50	CH	H	H	3-CN	298-300
1-51	CH	H	n-Bu	H	1,3083(24,8 °C)
1-52	CH	H	n-Hex	H	103-105
1-53	CH	H	n-Oct	H	96-98
1-54	CH	H	c-Oct	H	
1-55	CH	H	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	H	1,3384(24,9 °C)
1-56	CH	H	Bn(4-MeO)	H	179-181
1-57	CH	H	CH <sub>2</sub> (Pi-2-ilo)	H	186-188
1-58	CH	H	CH <sub>2</sub> (Pi-3-ilo)	H	110-113
1-59	CH	H	CH <sub>2</sub> (Pi-4-ilo)	H	
1-60	CH	H	CH <sub>2</sub> (2-Cl-Pi-5-ilo)	H	
1-61	CH	H	CH <sub>2</sub> (2-Cl-taizol-5-ilo)	H	
1-62	CH	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	H	1,3182(24,5 °C)
1-63	CH	H	Ph	H	
1-64	CH	H	Pi-2-ilo	H	
1-65	CH	H	Pi-3-ilo	H	
1-66	CH	H	Pi-4-ilo	H	
1-67	CH	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	80-86
1-68	CH	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	132-134
1-69	CH	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	H	> 300

R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> = H, m = 0

[Tabla 4]

Compuesto n.º	A	R <sup>1</sup>	R <sup>7</sup>	(Z) <sub>n</sub>	Propiedad física
1-70	CH	H		H	1,3875(24,8 °C)
1-71	CH	H		H	157-159
1-72	CH	H		H	
1-73	CH	H	C(=O)Me	H	231-234
1-74	CH	H	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	H	95-98
1-75	CH	H	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> t-Bu	H	120-125
1-76	CH	H	CH <sub>2</sub> C(=O)(4-ClPh)	H	RMN
1-77	CH	H	CH(CH <sub>3</sub> )CN	H	1,3527(24,8 °C)
1-78	N	H	H	H	
1-79	N	H	Me	H	225-230
1-80	CF	H	Me	2-F	205-207
1-81	CF	H	CH <sub>2</sub> C≡CH	2-F	137-140
1-82	CF	H	CH <sub>2</sub> CN	2-F	254-255
1-83	CBr	H	Me	H	183-186
1-84	CH	Me	Me	2-F	200-202
1-85	CH	Me	CH <sub>2</sub> C≡CH	2-F	134-136
1-86	CH	Me	CH <sub>2</sub> CN	2-F	212-214
1-87	CH	H	Me	2-NH <sub>2</sub>	211-213

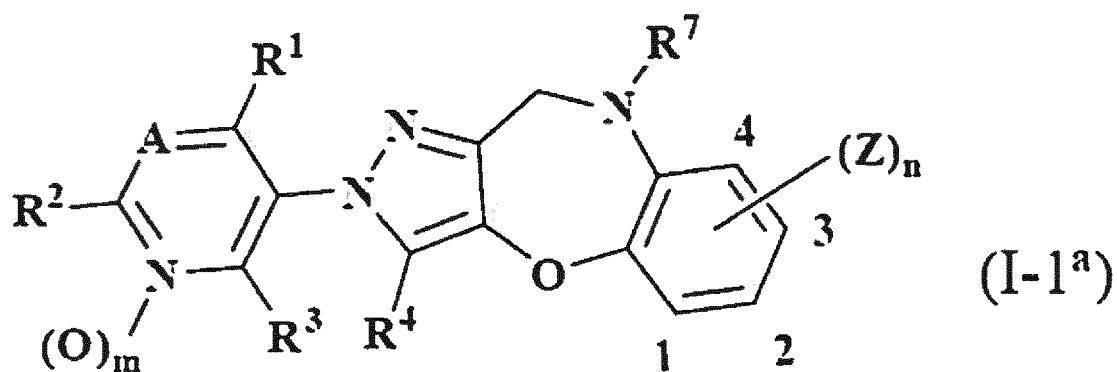
R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> = H, m = 0

5 [Tabla 5]

Compuesto n.º	A	R <sup>7</sup>	(Z) <sub>n</sub>	Propiedad física
2-1	CH	H	H	228-231
2-2	CH	Me	H	206-210
2-3	CH	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	
2-4	CH	CH <sub>2</sub> CN	H	

Compuesto n.º	A	R <sup>7</sup>	(Z) <sub>n</sub>	Propiedad física
2-5	CH	H	3-F	210-211

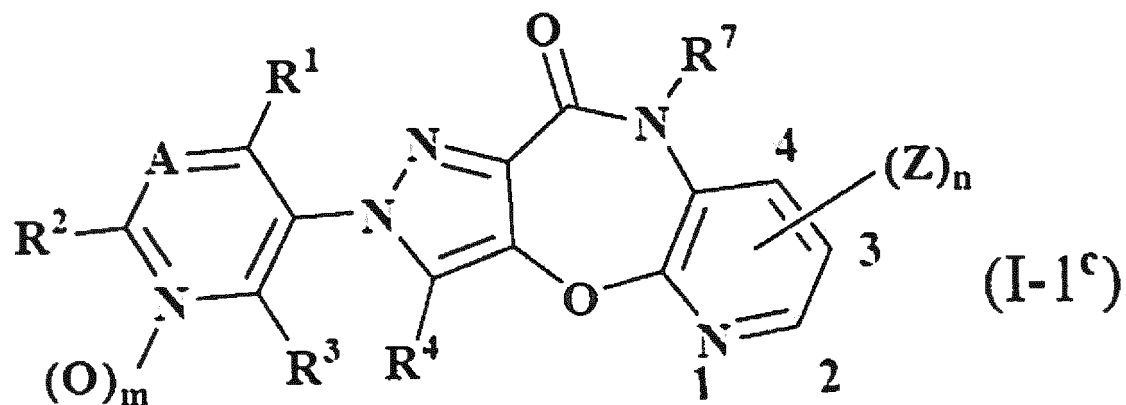
R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> = H, m = 0



[Tabla 6]

Compuesto n.º	A	R <sup>7</sup>	(Z) <sub>n</sub>	Propiedad física
3-1	CH	H	H	238-241
3-2	CH	Me	H	
3-3	CH	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	RMN
3-4	CH	CH <sub>2</sub> CN	H	
3-5	CH	CH <sub>2</sub> CN	2-F	
3-6	CH	H	3-F	186-188
3-7	CH	Me	3-F	
3-8	CH	CH <sub>2</sub> C≡CH	3-F	
3-9	CH	C(=O)Me	3-F	190-191

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> = H, m = 0

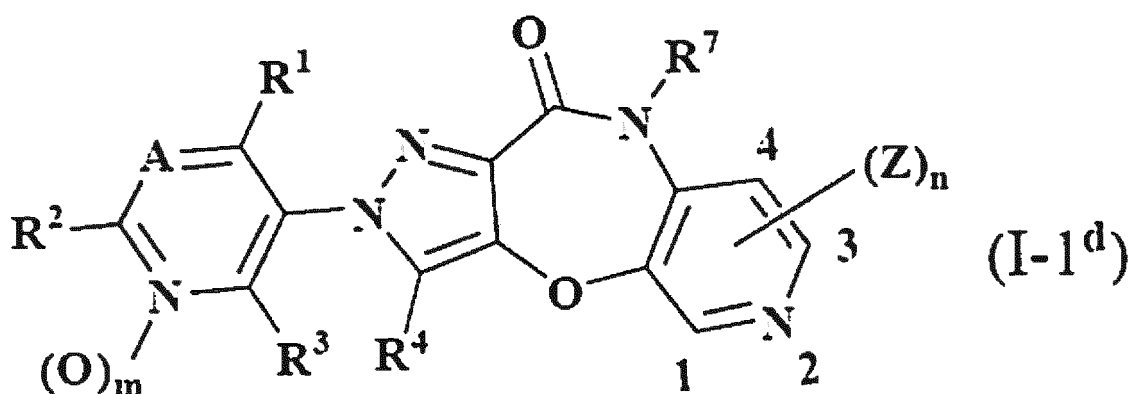


[Tabla 7]

Compuesto n.º	A	R <sup>7</sup>	(Z) <sub>n</sub>	Propiedad física
4-1	CH	H	H	
4-2	CH	Me	H	
4-3	CH	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	

Compuesto n.º	A	R <sup>7</sup>	(Z) <sub>n</sub>	Propiedad física
4-4	CH	CH <sub>2</sub> CN	H	
4-5	CH	H	3-Me	
4-6	CH	Me	3-Me	
4-7	CH	CH <sub>2</sub> C≡CH	3-Me	
4-8	CH	CH <sub>2</sub> CN	3-Me	
4-9	CH	H	3-CF <sub>3</sub>	
4-10	CH	Me	3-CF <sub>3</sub>	216-219
4-11	CH	CH <sub>2</sub> C≡CH	3-CF <sub>3</sub>	
4-12	CH	CH <sub>2</sub> CN	3-CF <sub>3</sub>	

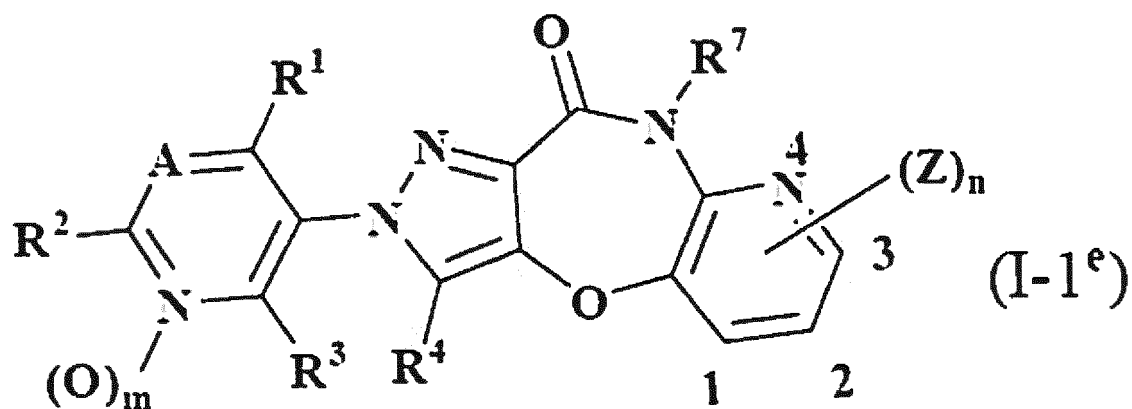
R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> = H, m = 0



[Tabla 8]

Compuesto n.º	A	R <sup>7</sup>	(Z) <sub>n</sub>	Propiedad física
5-1	CH	H	H	
5-2	CH	Me	H	258-262
5-3	CH	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	
5-4	CH	CH <sub>2</sub> CN	H	

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> = H, m = 0



[Tabla 9]

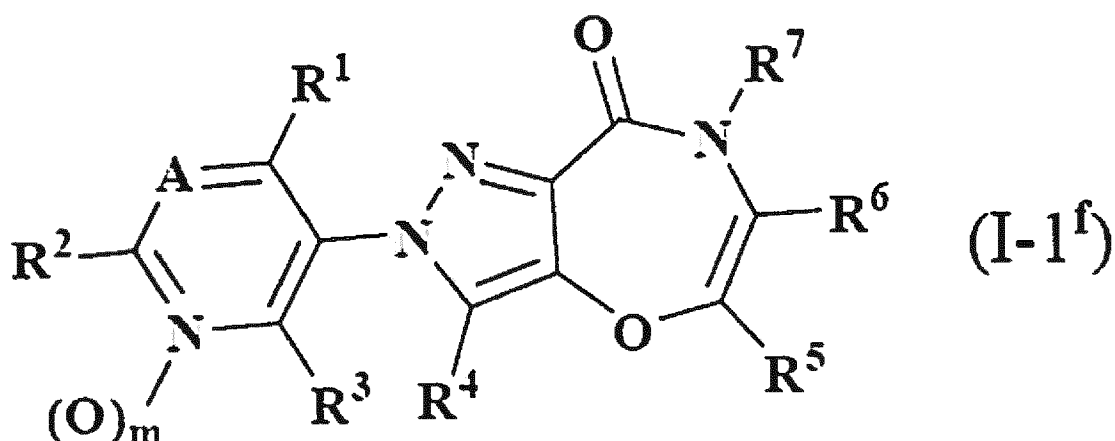
Compuesto n.º	A	R <sup>7</sup>	(Z) <sub>n</sub>	Propiedad física
6-1	CH	H	2-CF <sub>3</sub>	> 280
6-2	CH	Me	2-CF <sub>3</sub>	211-213
6-3	CH	Et	2-CF <sub>3</sub>	135-137
6-4	CH	n-Pr	2-CF <sub>3</sub>	
6-5	CH	i-Pr	2-CF <sub>3</sub>	168-172
6-6	CH	c-Pr	2-CF <sub>3</sub>	145-148
6-7	CH	CH <sub>2</sub> C≡CH	2-CF <sub>3</sub>	176-180
6-8	CH	CH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	2-CF <sub>3</sub>	
6-9	CH	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	2-CF <sub>3</sub>	
6-10	CH	CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	2-CF <sub>3</sub>	
6-11	CH	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	2-CF <sub>3</sub>	140-143
6-12	CH	CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	2-CF <sub>3</sub>	
6-13	CH	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	2-CF <sub>3</sub>	
6-14	CH	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	2-CF <sub>3</sub>	
6-15	CH	CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	2-CF <sub>3</sub>	
6-16	CH	CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	2-CF <sub>3</sub>	
6-17	CH	Bn	2-CF <sub>3</sub>	188-189
6-18	CH	Ph	2-CF <sub>3</sub>	110-113
6-19	CH	Pi-2-ilo	2-CF <sub>3</sub>	
6-20	CH	Pi-3-ilo	2-CF <sub>3</sub>	135-138

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> = H, m = 0

[Tabla 10]

Compuesto n.º	A	R <sup>7</sup>	(Z) <sub>n</sub>	Propiedad física
6-21	CH	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	2-CF <sub>3</sub>	192-193
6-22	CH	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	2-CF <sub>3</sub>	103-106
6-23	CH	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-CF <sub>3</sub>	RMN
6-24	CH	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	2-CF <sub>3</sub>	
6-25	CH	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	2-CF <sub>3</sub>	RMN
6-26	CH	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-CF <sub>3</sub>	
6-27	CH	CH <sub>2</sub> CN	2-CF <sub>3</sub>	177-180
6-28	CH	CH(CH <sub>3</sub> )CN	2-CF <sub>3</sub>	
6-29	CH	Me	2-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	176-179
6-30	CH	CH <sub>2</sub> C≡CH	2-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
6-31	CH	CH <sub>2</sub> CN	2-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	
6-32	CH	Me	H	199-201

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> = H, m = 0



[Tabla 11]

Compuesto n.º	A	R <sup>7</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Propiedad física
7-1	CH	H	H	H	281-284
7-2	CH	Me	H	H	188-191
7-3	CH	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	H	
7-4	CH	CH <sub>2</sub> CN	H	H	
7-5	CH	Me	H	Me	RMN
7-6	CH	Me	Me	H	167-169

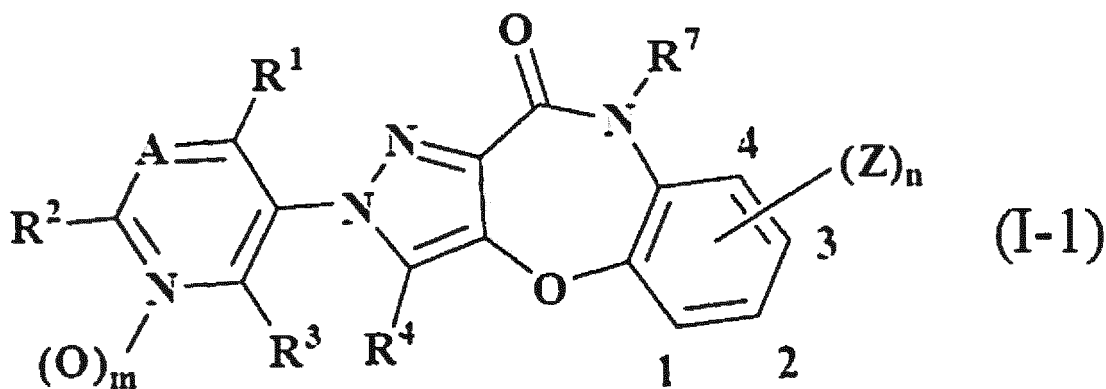
R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> = H, m = 0

5 [Tabla 12]

Compuesto n.º	Datos de la RMN <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> , excepto para 8-49 cuyos datos se basan en DMSO-d <sub>6</sub> )
1-46	8,95-8,90 (1H, m), 8,63-8,55 (1H, m), 8,19-8,10 (1H, m), 7,79 (1H, s), 7,45-7,37 (1H, m), 7,08-7,01 (1 H. m), 6,55-6,34 (2H, m), 3,56 (3H, s), 2,94 (3H, s), 2,83 (3H. s)
1-76	8,95-8,92 (1H, m), 8,61-8,58 (1H, m), 8,16-8,12 (1H, m), 8,02-7,97 (2H, m), 7,86 (1H, s), 7,53-7,48 (2H, m), 7,46-7,39 (1H, m). 7,25-7,13 (4H, m), 5,33 (2H, s)
3-3	8,92-8,88 (1 H. m). 8,53-8,49 (1H, m), 7,98-7,93 (1H, m), 7,81 (1H, s), 7,54-7,50 (1H, m), 7,40-7,35 (1H, m), 7,19-7,13 (2H, m), 7,12-7,06 (1H, m). 4,40 (2H, s), 4,08 (2H, d). 2,43 (1H, t)
6-23	8,99-8,93 (1H, m). 8,69-8,64 (1H, m), 8,61-8,58 (1H, m), 8,17-8,12 (1H, m), 7,92 (1H, s), 7,84-7,80 (1H, m), 7,50-7,43 (1H, m), 4,61-4,54 (2H, m), 3,85-3,78 (2H, m). 3,12 (3H, s)
6-25	8,97-8,93 (1H, m). 8,66-8,60 (2H, m). 8,17-8,10 (1H, m), 7,91 (0.5H, s), 7,90 (0.5H, s). 7,82-7,78 (1H, m). 7,48-7,42 (1H, m). 5,20-5,02 (1H, m), 3,89 (0.5H, dd), 3,66-3,60 (1H, m). 3,24 (0.5H, dd), 2,72 (1.5H, s). 2,64 (1.5H, s), 1,86 (1.5H, d). 1,82 (1.5H, d)
7-5	8,93 (1H, d), 8,60-8,58 (1H, m), 8,16-8,13 (1H, m). 7,66 (1H, s), 7,43-7,41 (1H, m), 6,29 (1H, d), 3,23 (3H, s), 1,88 (1H, d)
8-23	8,93-8,94 (1 H. d). 8,60-8,61 (1H, d), 8,13-8,16 (1H, dd). 7,85 (1H, s). 7,39-7,44 (2H, m). 6,90-6,97 (2H, m). 5,99-6,09 (1H, m), 5,30-5,35 (1 H. dd), 5,25-5,28 (1 H. dd), 4,65-4,67 (2H, dt)
8-25	8,95 (1H, s), 8,63 (1H, s). 8,13-8,19 (1H, m). 7,86 (1H, s), 7,74-7,80 (1H, m), 7,42-7,47 (1H, m), 6,87-6,99 (2H, m). 5,28 (2H, s), 3,62 (3H, s)
8-27	8,93-8,97 (1H, m), 8,60-8,61 (1H, m), 8,13-8,16 (1H, s), 7,85 (1H, s). 7,35-7,46 (2H, m). 6,94-7,02 (2H, m), 3,99-4,01 (2H, d), 2,27 (1H, m). 1,59 (1H, m)
8-28	8,94 (1H, s). 8,60-8,61 (1H, d). 8,13-8,16 (1H, m), 7,86 (1H, s). 7,41-7,44 (1H, m). 7,29-7,31 (1H, m). 6,95-7,01 (2H, m). 3,98-3,99 (2H, d). 1,85-1,87 (1H, m). 1,43 (6H, m)



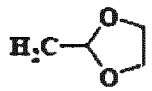
Compuesto n.º	Datos de la RMN <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> , excepto para 8-49 cuyos datos se basan en DMSO-d <sub>6</sub> )
8-34	8,95 (1H, brds). 8,62 (1H, brds), 8,12-8,14 (1H, d). 7,85 (1H, s), 7,42-7,43 (1H, m). 7,28-7,32 (1H, m). 6,96-7,02 (1H, m), 4,15-4,18 (2H, t), 3,38-3,41 (2H, t), 1,89-1,96 (2H, m). 1,79-1,86 (2H, m)
8-40	8,94 (1H, brds). 8,61 (1H, brds), 8,12-8,15 (1H, m). 7,84 (1H, s). 7,41-7,44 (1H, s), 7,21-7,27 (1H, m). 7,04-7,07 (1H, dd), 6,89-6,93 (1H, m), 4,15-4,18 (2H, t), 3,39-3,42 (2H, t). 1,83-1,98 (4H, m)
8-43	8,94 (1H, brds), 8,59 (1H, brds), 8,11-8,13 (1H, m), 7,88 (1H, s). 7,55-7,60 (1H, m), 7,41-7,43 (1H, m), 6,93-6,99 (2H, m), 5,30-5,33 (1H, m), 4,25-4,26 (2H, m), 3,87-4,00 (2H, m)
8-47	8,92-8,94 (1H, d), 8,60-8,62 (1H, d), 8,12-8,15 (1H, m). 7,86 (1H, s), 7,41-7,44 (1H, m), 7,21-7,27 (2H, m). 6,92-6,95 (1H, m), 5,17 (2H, s), 2,30 (3H, s)
8-49	9,08-9,09 (1H, d), 8,82 (1H, s), 8,62-8,63 (1H, dd), 8,24-8,27 (1H, m). 7,59-7,62 (2H, m), 7,40-7,44 (1H, m), 7,18-7,23 (1H, m), 5,62 (2H, s), 3,02 (3H, s)
8-51	8,93-8,94 (1H, d), 8,61-8,63 (1H, dd), 8,12-8,15 (1H, m). 7,86 (1H, s), 7,42-7,45 (1H, m). 7,23-7,27 (1H, m), 7,02-7,05 (1H, dd), 6,94-6,97 (1H, m), 4,22-4,25 (2H, t). 2,45-2,48 (2H, t), 2,12-2,17 (2H, c)
8-115	8,94 (1H, d), 8,62-8,53 (1H, m). 8,16-8,13 (1H, m), 7,86 (1H, s), 7,45-7,42 (1H, m). 7,17 (1H, d), 7,07-7,05 (1H, m). 4,79 (2H, s), 2,39 (1H, s)
8-129	8,98-8,99 (1H, d), 8,63-8,65 (1H, d), 8,14-8,17 (1H, m). 8,04 (1H, brds), 7,97 (1H, s). 7,42-7,47 (1H, m). 6,95-7,01 (1H, m). 6,78-6,80 (1H, m)
15-6	8,71 (1H, s), 8,47 (1H, d), 7,87-7,85 (1H, m), 7,67 (1H, s), 6,66 (1H, d), 6,61 (1H, d), 4,01 (3H, s)



[Tabla 13]

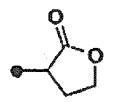
Compuesto n.º	A	R <sup>1</sup>	R <sup>7</sup>	(Z) <sub>n</sub>	Propiedad física
8-1	CH	H	SO <sub>2</sub> Me	H	204-207
8-2	CH	H	CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	H	1,3237 (25,9 °C)
8-3	CH	H	CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	H	185-189
8-4	CH	H	CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	218-220
8-5	CH	H	CH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	H	157-160
8-6	CH	H	CH <sub>2</sub> CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	163-167
8-7	CH	H	CH <sub>2</sub> C(=O)N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	106
8-8	CH	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(=O)NH <sub>2</sub>	H	219-221
8-9	CH	H	CH <sub>2</sub> OC(=O)CH <sub>3</sub>	H	177-179
8-10	CH	H	CH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	147-153

ES 2 735 749 T3

Compuesto n.º	A	R <sup>1</sup>	R <sup>7</sup>	(Z) <sub>n</sub>	Propiedad física
8-11	CH	H		H	163-166
8-12	CH	H	CHO	H	234-235
8-13	CH	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	189-192
8-14	CH	H	C(=O)N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	1,3921 (27,0 °C)
8-15	CH	H	CH <sub>2</sub> CHO	H	185-190
8-16	CH	H	CH <sub>2</sub> C(=NOCH <sub>3</sub> )H	H	156-167
8-17	CH	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	1,3800 (26,4 °C)
8-18	CH	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	120-129
8-19	CH	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	71-78
8-20	CH	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	95-98

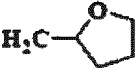
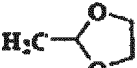
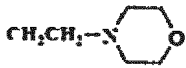
R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> = H, m = 0

[Tabla 14]

Compuesto n.º	A	R <sup>1</sup>	R <sup>7</sup>	(Z) <sub>n</sub>	Propiedad física
8-21	CH	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	133-134
8-22	CH	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	1-F	157-159
8-23	CH	H	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	2-F	RMN
8-24	CH	H	CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	2-F	164-169
8-25	CH	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	2-F	RMN
8-26	CH	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-F	164-165
8-27	CH	H	CH <sub>2</sub> C-PR	2-F	RMN
8-28	CH	H	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2-F	RMN
8-29	CH	H	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-F	1,3456(20 °C)
8-30	CH	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	2-F	134-138
8-31	CH	H		2-F	231-235
8-32	CH	H	CH(CH <sub>3</sub> )C(=O)OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	2-F	97-101
8-33	CH	H	CHFCN	2-F	144-146
8-34	CH	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Br	2-F	RMN
8-35	CH	H	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-F	117-119
8-36	CH	H	CH <sub>2</sub> c-Pr	3-F	178-179
8-37	CH	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>11</sub> CH <sub>3</sub>	3-F	113-115
8-38	CH	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	3-F	154-157
8-39	CH	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3-F	208-211
8-40	CH	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Br	3-F	RMN

R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> = H, m = 0

[Tabla 15]

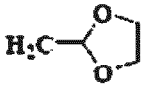
Compuesto n.º	A	R <sup>1</sup>	R <sup>7</sup>	(Z) <sub>n</sub>	Propiedad física
8-41	CH	H		3-F	1,3456 (21 °C)
8-42	CH	H	CH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3-F	220-226
8-43	CH	H		3-F	RMN
8-44	CH	H		3-F	145-146
8-45	CH	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>4</sub>	3-F	117-119
8-46	CH	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-F	157-159
8-47	CH	H	CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	3-F	RMN
8-48	CH	H	CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	3-F	82
8-49	CH	H	CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-F	RMN
8-50	CH	H	CH(CH <sub>3</sub> )CN	3-F	86-91
8-51	CH	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	3-F	RMN
8-52	CH	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NH <sub>2</sub>	3-F	234-238
8-53	CH	H	CHO	3-F	217-218
8-54	CH	H	H	3-Cl	> 300
8-55	CH	H	Me	3-Cl	110-111
8-56	CH	H	CH <sub>2</sub> C≡CH	3-Cl	192-194
8-57	CH	H	CH <sub>2</sub> CN	3-Cl	190-192
8-58	CH	H	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-Cl	145-147
8-59	CH	H	Me	4-Cl	175-181
8-60	CH	H	H	2-Br	296-298
8-61	CH	H	Me	2-Br	226-229
8-62	CH	H	H	3-Br	> 300
8-63	CH	H	Me	3-Br	113-115
8-64	CH	H	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-Br	1,3627 (28,2 °C)
8-65	CH	H	CH <sub>2</sub> C≡CH	3-Br	201-203

R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> = H, m = 0

[Tabla 16]

Compuesto n.º	A	R <sup>1</sup>	R <sup>7</sup>	(Z) <sub>n</sub>	Propiedad física
8-66	CH	H	CH <sub>2</sub> CN	3-Br	178-180
8-67	CH	H	Me	2-1	260-264
8-68	CH	H	H	2-CHF <sub>2</sub>	290-291
8-69	CH	H	Me	2-CF <sub>3</sub>	188-191
8-70	CH	H	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3-CF <sub>3</sub>	82-96
8-71	CH	H	CH <sub>2</sub> CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3-CF <sub>3</sub>	135-137

ES 2 735 749 T3

Compuesto n.º	A	R <sup>1</sup>	R <sup>7</sup>	(Z) <sub>n</sub>	Propiedad física
8-72	CH	H	CH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub>	182
8-73	CH	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub>	150-153
8-74	CH	H	CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub>	136-139
8-75	CH	H	CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub>	117-121
8-76	CH	H	CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub>	199-201
8-77	CH	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub>	1,5235 (26,1 °C)
8-78	CH	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub>	75-82
8-79	CH	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub>	198-201
8-80	CH	H	CH <sub>2</sub> OC(=O)CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>3</sub>	176-177
8-81	CH	H	CH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3-CF <sub>3</sub>	193-195
8-82	CH	H		3-CF <sub>3</sub>	188-190
8-83	CH	H	C(=O)CH <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub>	184-190
8-84	CH	H	C(=O)OCH <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub>	181-193
8-85	CH	H	C(=O)N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3-CF <sub>3</sub>	120-131
8-86	CH	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub>	178-180
8-87	CH	H	CH <sub>2</sub> CHO	3-CF <sub>3</sub>	183
8-88	CH	H	CH <sub>2</sub> C(=NOCH <sub>3</sub> )H	3-CF <sub>3</sub>	172-182
8-89	CH	H	CH <sub>2</sub> C(=O)OCH <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub>	120-122
8-90	CH	H	CH <sub>2</sub> C(=O)N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3-CF <sub>3</sub>	195-196

R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> = H, m = 0

[Tabla 17]

Compuesto n.º	A	R <sup>1</sup>	R <sup>7</sup>	(Z) <sub>n</sub>	Propiedad física
8-91	CH	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(=O)NH <sub>2</sub>	3-CF <sub>3</sub>	95-104
8-92	CH	H	Me	4-CF <sub>3</sub>	160
8-93	CH	H	H	2-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	298-300
8-94	CH	H	Me	2-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	168-170
8-95	CH	H	CH <sub>2</sub> C≡CH	2-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	171-173
8-96	CH	H	CH <sub>2</sub> CN	2-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	280-283
8-97	CH	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	2-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	161-164
8-98	CH	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	2-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	1,4288 (19,9 °C)
8-99	CH	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	111-114
8-100	CH	H	C(=O)CH <sub>3</sub>	2-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	155-157
8-101	CH	H	CH <sub>2</sub> C≡CH	3-CN	225-227
8-102	CH	H	CH <sub>2</sub> CN	3-CN	234-236
8-103	CH	H	Me	2-NHC(=O)Me	250-252
8-104	CH	H	Me	2-NHSO <sub>2</sub> Me	> 300

ES 2 735 749 T3

Compuesto n.º	A	R <sup>1</sup>	R <sup>7</sup>	(Z) <sub>n</sub>	Propiedad física
8-105	CH	H	Me	2-N(SO <sub>2</sub> Me) <sub>2</sub>	228-231
8-106	CH	H	Me	2-C(=O)OMe	233-234
8-107	CH	H	Me	2-C(=O)OH	> 300
8-108	CH	H	Me	2-C(=O)NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	202-204
8-109	CH	H	Me	2-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	267-281
8-110	CH	H	Me	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	187
8-111	CH	H	Me	2-SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	310-312
8-112	CH	H	Me	1-Me	196-199
8-113	CH	H	H	3-Me	277-280
8-114	CH	H	Me	3-Me	174-178
8-115	CH	H	CH <sub>2</sub> CN	3-Me	RMN

R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> = H, m = 0

[Tabla 18]

Compuesto n.º	A	R <sup>1</sup>	R <sup>7</sup>	(Z) <sub>n</sub>	Propiedad física
8-116	CH	H	Me	4-Me	205-208
8-117	CH	H	H	3-Ph	294-296
8-118	CH	H	CH <sub>2</sub> C≡CH	3-Ph	134-137
8-119	CH	H	CH <sub>2</sub> CN	3-Ph	111-115
8-120	CH	H	H	3-CH(OMe) <sub>2</sub>	163-165
8-121	CH	H	H	2-OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	262-264
8-122	CH	H	Me	2-OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	225-228
8-123	CH	H	Me	2-OH	293-295
8-124	CH	H	Me	2-OCHF <sub>2</sub>	157-159
8-125	CH	H	Me	2-OCF <sub>3</sub>	169-172
8-126	CH	H	Me	2-NHMe	251-253
8-127	CH	H	Me	2-NMe <sub>2</sub>	224-226
8-128	CH	H	Me	2-NHC(=O)H	263-266
8-129	CH	H	H	1, 2-F <sub>2</sub>	RMN
8-130	CH	H	Me	1, 2-F <sub>2</sub>	228-233
8-131	CH	H	H	1, 3-F <sub>2</sub>	> 300
8-132	CH	H	Me	1, 3-F <sub>2</sub>	268-270
8-133	CH	H	CH <sub>2</sub> CN	1, 3-F <sub>2</sub>	190-191
8-134	CH	H	Me	2, 4-F <sub>2</sub>	180-185
8-135	CH	H	Me	2-F, 3-Me	161-165
8-136	CH	H	Me	1, 3-Cl <sub>2</sub>	238-244
8-137	CH	H	Me	2, 3-Cl <sub>2</sub>	258-259
8-138	CH	H	Me	2, 4-Cl <sub>2</sub>	206-207
8-139	CH	H	Me	2-Cl, 3-Me	222-227

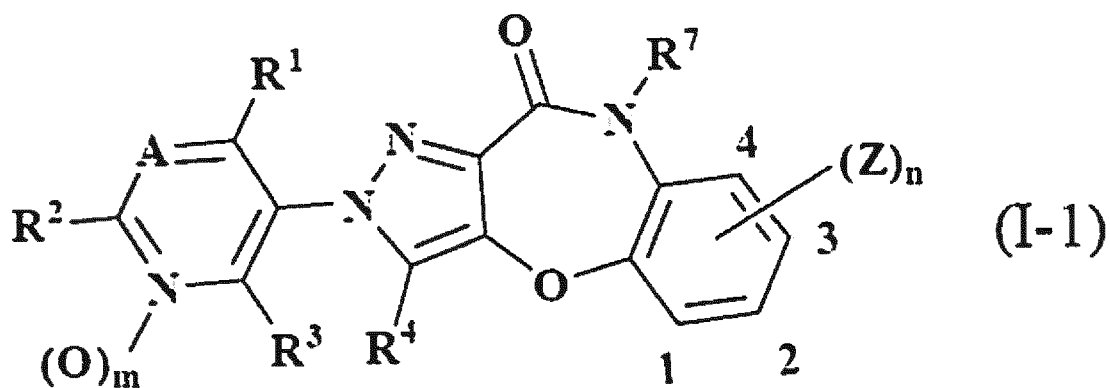
Compuesto n.º	A	R <sup>1</sup>	R <sup>7</sup>	(Z) <sub>n</sub>	Propiedad física
8-140	CH	H	Me	2-Cl, 3-CF <sub>3</sub>	175-179

R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> = H, m = 0

[Tabla 19]

Compuesto n.º	A	R <sup>1</sup>	R <sup>7</sup>	(Z) <sub>n</sub>	Propiedad física
8-141	CH	H	Me	3, 4-Cl <sub>2</sub>	197-199
8-142	CH	H	CH <sub>2</sub> C≡CH	2-NO <sub>2</sub> , 3-F	185-190
8-143	CH	H	Me	2-Me, 3-F	255-258
8-144	CH	H	Me	2-Me, 3-Cl	230-232
8-145	CH	H	Me	2-OMe, 3-Cl	234-237
8-146	CH	CF <sub>3</sub>	Me	2-F	175-178
8-147	CF	H	H	H	186-188
8-148	CF	H	Me	H	212-214
8-149	CF	H	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	153-155
8-150	CF	H	CH <sub>2</sub> CN	H	243-245
8-151	CF	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	157-158
8-152	CF	H	H	2-F	283-285
8-153	CF	H	Me	2-F	243-245
8-154	CF	H	CH <sub>2</sub> C≡CH	2-F	202-205
8-155	CF	H	CH <sub>2</sub> CN	2-F	152-154
8-156	CF	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	2-F	114-117
8-157	CF	H	H	1, 3-F <sub>2</sub>	293-296
8-158	CF	H	Me	1, 3-F <sub>2</sub>	253-255
8-159	CF	H	CH <sub>2</sub> C≡CH	1, 3-F <sub>2</sub>	167-169
8-160	CF	H	CH <sub>2</sub> CN	1, 3-F <sub>2</sub>	236-237
8-161	CF	H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	1, 3-F <sub>2</sub>	152-154
8-162	C-OEt	H	Me	H	215-217
8-163	C-OEt	H	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	183-185
8-164	C-OEt	H	CH <sub>2</sub> CN	H	124-126

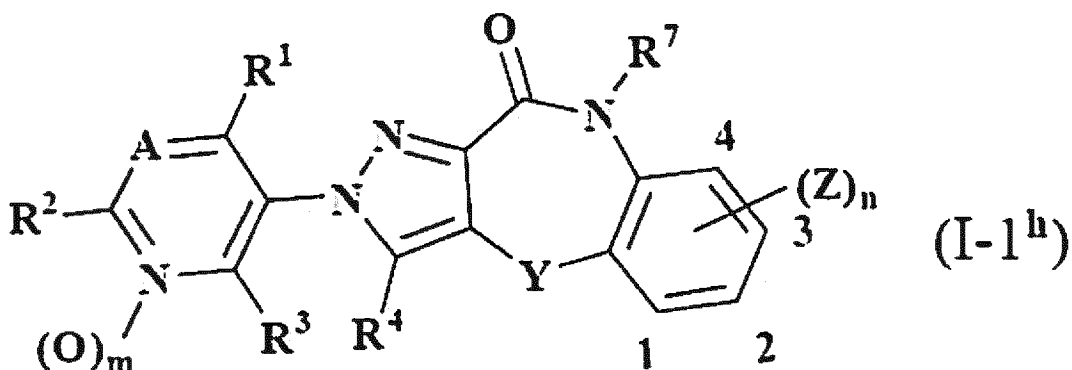
R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> = H, m = 0



[Tabla 20]

Compuesto n.º	A	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>7</sup>	(Z) <sub>n</sub>	m	Propiedad física
9-1	CH	H	H	Me	H	1	260-262
9-2	CH	Cl	H	Me	2-F	0	190-192
9-3	CH	H	F	H	H	0	267-268
9-4	CH	H	Cl	H	2-Cl	0	281-283
9-5	CH	H	Cl	CH <sub>2</sub> CN	2-F	0	100-102
9-6	CH	H	Cl	H	2, 3-Cl <sub>2</sub>	0	> 300
9-7	CH	H	SO <sub>2</sub> Ph	Me	3-F	0	160-167
9-8	CH	H	NH <sub>2</sub>	H	H	0	218-219
9-9	CH	H	NH <sub>2</sub>	H	3-F	0	255-257
9-10	CH	H	NHC(=O)Me	H	H	0	241-243

R<sup>1</sup>, R<sup>3</sup> = H

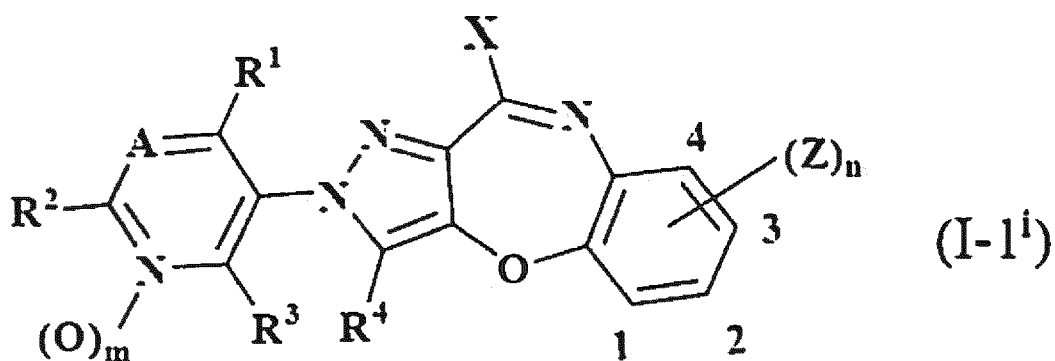


5





[Tabla 21]

Compuesto n.º	A	Y	R <sup>7</sup>	(Z) <sub>n</sub>	Propiedad física
10-1	CH	NH	H	H	> 300
10-2	CH	NH	Me	H	289-290
10-3	CH	S	H	H	256-259
10-4	CH	S	Me	H	226-228
10-5	CH	S	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	201-202
10-6	CH	S	CH <sub>2</sub> CN	H	258-259
10-7	CH	S	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	203-205

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> = H, m = 0

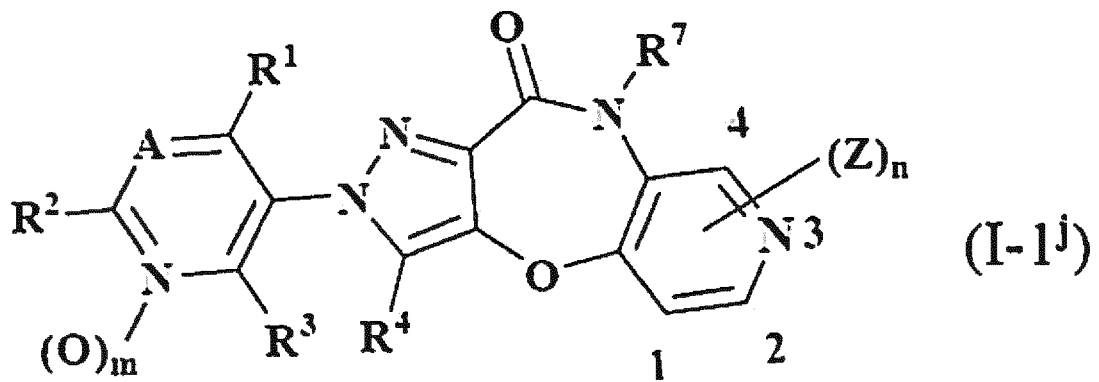


[Tabla 22]

Compuesto n.º	A	X	(Z) <sub>n</sub>	Propiedad física
11-1	CH	Cl	H	126-128
11-2	CH	Cl	3-F	185-186
11-3	CH	CN	3-F	213-214
11-4	CH	C≡CSiMe <sub>3</sub>	H	147-149
11-5	CH	NH <sub>2</sub>	H	190-191
11-6	CH	NHMe	3-F	175-176
11-7	CH	NHc-Pr	H	112-114
11-8	CH	NHCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	3-F	170-171
11-9	CH	NHOH	H	238-240
11-10	CH	NMe <sub>2</sub>	H	126-128
11-11	CH	N(CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>	3-F	1,3165 (21,4 °C)
11-12	CH		H	179-180
11-13	CH		3-F	194-196
11-14	CH		H	177-179
11-15	CH		3-F	192-194
11-16	CH	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	78-81
11-17	CH	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	2-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	99-102
11-18	CH	SMe	3-F	131-132
11-19	CH	SEt	3-F	116-118

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> = H, m = 0

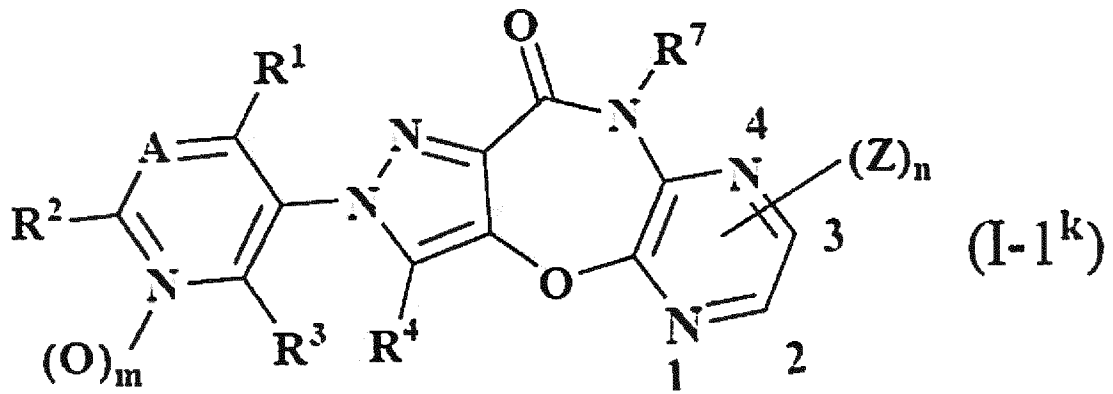




[Tabla 23]

Compuesto n.º	A	R <sup>7</sup>	(Z) <sub>n</sub>	Propiedad física
12-1	CH	Me	H	254-260

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> = H, m = 0

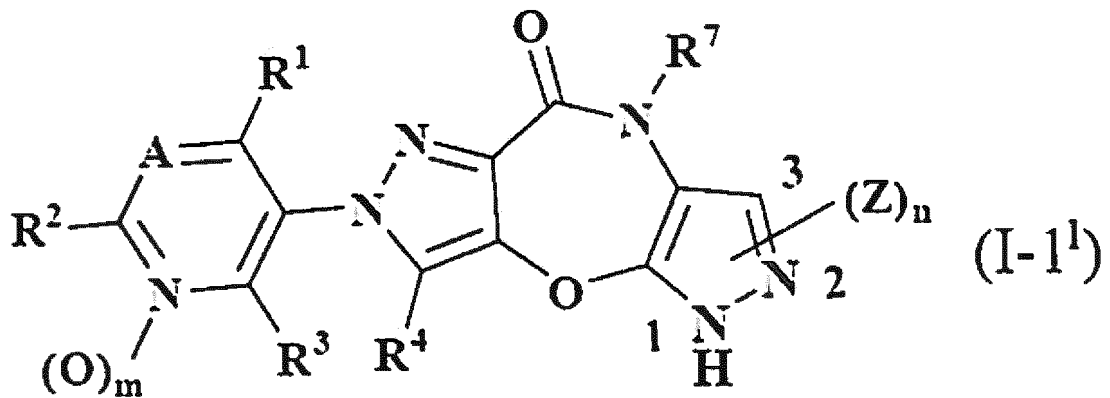


5

[Tabla 24]

Compuesto n.º	A	R <sup>7</sup>	(Z) <sub>n</sub>	Propiedad física
13-1	CH	Me	H	296-298

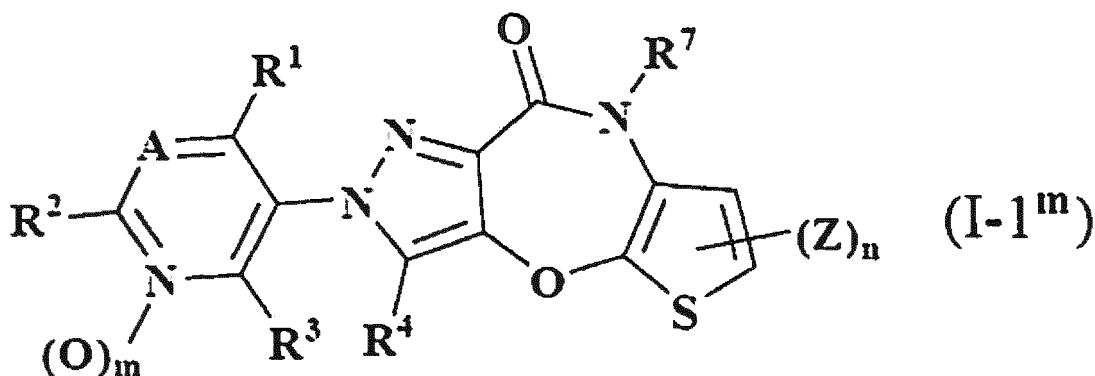
R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> = H, m = 0



10

[Tabla 25]

Compuesto n.º	A	R <sup>7</sup>	(Z) <sub>n</sub>	Propiedad física
14-1	CH	H	1,3-Me <sub>2</sub>	270-272
14-2	CH	Me	1,3-Me <sub>2</sub>	190-192
14-3	CH	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	1,3-Me <sub>2</sub>	1,3071 (25,9 °C)
14-4	CH	CH <sub>2</sub> C≡CH	1,3-Me <sub>2</sub>	172-173
14-5	CH	CH <sub>2</sub> CN	1,3-Me <sub>2</sub>	133-135

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> = H, m = 0

5 [Tabla 26]

Compuesto n.º	A	R <sup>7</sup>	(Z) <sub>n</sub>	Propiedad física
15-1	CH	H	H	290-291
15-2	CH	Me	H	208-210
15-3	CH	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	185-186
15-4	CH	CH <sub>2</sub> CN	H	240-243
15-5	CF	H	H	296-298
15-6	OF	Me	H	RMN
15-7	CF	CH <sub>2</sub> CN	H	219-220
15-8	CF	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	165-168

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> = H, m = 0

Un insecticida agrícola/hortícola que contiene, como su principio activo, un compuesto de oxazepina o sal del mismo expresado por la Fórmula General (I) según la presente invención es adecuado para controlar varios insectos plaga, tales como insectos plaga agrícolas, insectos plaga forestales, insectos plaga hortícolas, insectos plaga de cereales almacenados, insectos plaga de higiene, nematodos, etc., que dañan arroz, árboles frutales, verduras y otros cultivos así como flores.

Ejemplos de los insectos plaga anteriormente mencionados, nematodos, etc., incluyen los siguientes:

- 15 insectos plaga lepidópteros incluyen, por ejemplo, Aoiraga (*Parasa consocia*), Akakiriba (*Anomis mesogona*), Swallowtail (*Papilio xuthus*), Azukisayamushiga (*Matsumuraeses azukivora*), Azukinomeiga (*Ostrinia scapulalis*), Africa Spodoptera (*Spodoptera exempta*), mariposa nocturna (*Hyphantria cunea*), taladro del maíz (*Ostrinia furnacalis*), cogollero del maíz (*Pseudaletia separata*), polilla de la ropa (*Tinea translucens*), Igusashinmushiga (*Bactra furfurana*), mariposa parnara (*Parnara guttata*), Inetatehamaki (*Marasmia exigua*), Inetsutomushi (*Parnara guttata*), Ineyotou (*Sesamia inferens*), Imokibaga (*Brachmia triannulella*), polilla babosa (*Monema flavescens*), Irakusaginuwaba (*Trichoplusia ni*), Ukonnomeiga (*Pleuroptya ruralis*), Umeedashaku (*Cystidia couaggaria*), Uranamishijimi (*Lampides boeticus*), Pelúcida polilla halcón (*Cephonodes hylas*), Gusano cogollero (*Helicoverpa armigera*), Ootobimonshachihoko (*Phalerodonta manleyi*), Oominoga (*Eumeta japonica*), mariposa de la col (*Pieris brassicae*), Malacosoma neustria (*Malacosoma neustria testacea*), Kakinohetamushiga (*Stathmopoda masinissa*),
- 20

- Kakihosoga (*Cuphodes diospyrosella*), Oruga cigarrera (*Archips xylosteanus*), Polilla del nabo (*Agrotis segetum*), Kanshoshinkuihamaki (*Tetramoera schistaceana*), Papilónidos (*Papilio machaon hippocrates*), Endoclyta (*Endoclyta sinensis*), Ginmonhamoguiga (*Lyonetia prunifoliella*), Kinmonhosoga (*Phyllonorycter ringoneella*), Kurimiga (*Cydia kurokoi*), Kurimidorishinkuiga (*Eucoenogenes aestuosa*), polilla de la uva (*Lobesia botrana*), Kuroshitaaoiraga (*Latoia sinica*), Kurofutamonmadarameiga (*Euzophera batangensis*), Kuwaihosoahamaki (*Phalonidia mesotypa*), polilla de la morera (*Spilosoma imparilis*), Kuwanomeiga (*Glyphodes pyloalis*), Kuwahimehamaki (*Olethreutes mori*), polilla de la ropá común (*Tineola bisselliella*), polilla rápida (*Endoclyta excrescens*), polilla europea de los granos (*Nemapogon granellus*), Kosukashiba (*Synanthedon hector*), polilla del manzano (*Cydia pomonella*), palomilla dorso de diamante (*Plutella xylostella*), polimilla de las hojas del arroz (*Cnaphalocrocis medinalis*), barrenador rosa del sur (*Sesamia calamistis*), barrenador del tallo de arroz (*Scirpophaga incertulas*), Shibatsutoga (*Pediasia teterrellus*), polilla de la patata (*Phthorimaea operculella*), polilla de la langosta (*Stauropus fagi persimilis*), Shiroichimonjimadaramameiga (*Etiella zinckenella*), Cogollero de la remolacha (*Spodoptera exigua*), Palpifer sexnotata (*Palpifer sexnotata*), Shironayotou (*Spodoptera mauritia*), pirálido gigante blanco del arroz (*Scirpophaga innotata*), Shiromonyaga (*Xestia c-nigrum*), Sujikiriyotou (*Spodoptera depravata*), polilla de la harina mediterránea (*Ephestia kuehniella*), polilla naranja (*Angerona prunaria*), Seguroshachihoko (*Clostera anastomosis*), gusano falso medidor (*Pseudoplusia includens*), Daizusayamushiga (*Matsumuraeses falcana*), gusano del tabaco (*Helicoverpa assulta*), Tamanaginuwaba (*Autographa nigrisigna*), Gusano cortado negro (*Agrotis ipsilon*), Anna Pseudoconsersa (*Euproctis pseudoconsersa*), Tortricido pequeño del té (*Adoxophyes orana*), barrenador del té (*Caloptilia theivora*), tortrix del té (*Homona magnanima*), polilla del tabaco (*Ephestia elutella*), Chaminoga (*Eumeta minuscula*), Tsumaakashachihoko (*Clostera anachoreta*), Heliiothis maritima (*Heliiothis maritima*), Tenguhamaki (*Sparganothis pilleriana*), Toumorokoshimeiga (*Busseola fusca*), polilla amarilla (*Euproctis subflava*), Tobimonoedashaku (*Biston robustum*), gusano del tomate (*Heliiothis zea*), Nakajiroshitaba (*Aedia leucomelas*), Nashiraga (*Narosoideus flavidorsalis*), Nashikenmon (*Viminia rumericis*), Nashichibiga (*Bucculatrix pyrivorella*), Polilla oriental de la fruta (*Grapholita molesta*), Nashihosoga (*Spulerina astaurota*), Nashimadaramameiga (*Ectomyelois pyrivorella*), barrenador del tallo del arroz (*Chilo suppressalis*), Negikoga (*Acrolepiopsis sapporensis*), polilla india de la harina (*Plodia interpunctella*), Haimadaranomeiga (*Hellula undalis*), polilla dorada Angoumois de los granos (*Sitotroga cerealella*), gusano de las hojas del algodón (*Spodoptera litura*), un tipo de tortricido (*Eucosma aporema*), Barahamaki (*Acleris comariana*), Himekuroiraga (*Scopelodes contractus*), Himeshiromondokuga (*Orgyia thyellina*), cogollero del maíz (*Spodoptera frugiperda*), Fukinomeiga (*Ostrinia zaguliaevi*), Futaobikoyaga (*Naranga aenescens*), Futatenkagibamodoki (*Andraca bipunctata*), polilla de la viña (*Paranthrene regalis*), Acosmeryx castanea (*Acosmeryx castanea*), mosca minadora de la uva (*Phyllocnistis toparcha*), polilla de la uva (*Endopiza viteana*), polilla bombardeadora de la uva (*Eupoecillia ambiguella*), oruga de las leguminosas (*Anticarsia gemmatalis*), Hosobahairohamaki (*Cnephasia cinereipalpana*), lagarta peluda de los encinares (*Lymantria dispar*), polilla del pino (*Dendrolimus spectabilis*), perforador de la soja (*Leguminivora glycinivorella*), perforador de las legumbres (*Maruca testulalis*), Mamehimesayamushiga (*Matsumuraeses phaseoli*), Mamehosoga (*Caloptilia soyella*), minador de las hojas dos cítricos (*Phyllocnistis citrella*), Maeusukinomeiga (*Omiodes indicata*), Midarekakumonhamaki (*Archips fuscocupreanus*), Mitsumonkinuwaba (*Acanthoplusia agnata*), Minoga (*Bambalina* sp.), Momoshinkuiga (*Carposina niponensis*), Momonogomadaranomeiga (*Conogethes punctiferalis*), Momosukashiba (*Synanthedon* sp.), Momohamoguriga (*Lyonetia clerkella*), Monkiageha (*Papilio helenus*), Colias erate (*Colias erate poliographus*), Monkuroshachihoko (*Phalera flavescens*), mariposa de la col (*Pieris rapae crucivora*), mariposa blanca tal como mariposa de la col (*Pieris rapae*), oruga del lupulos (*Euproctis similis*), Yamanoimokoga (*Acrolepiopsis suzukiella*), Taladro del maíz (*Ostrinia nubilalis*), Cogollero de la col (*Mamestra brassicae*), Yomogiedashaku (*Ascotis selenaria*), Yomogiohosohamaki (*Phtheochroides clandestina*), Ringoohamaki (*Hoshinoa adumbratana*), Ringokareha (*Odonestis pruni japonensis*), Ringokenmon (*Triaena intermedia*), Ringokokakumonhamaki (*Adoxophyes orana fasciata*), Ringokoshinkui (*Grapholita inopinata*), Ringoshirohimehamaki (*Spilonota ocellana*), Ringohaiirohamaki (*Spilonota lechriaspis*), Ringohamakikuroba (*Illiberis pruni*), Ringohimeshinkui (*Argyresthia conjugella*), Ringohosoga (*Caloptilia zachrysa*), Ringomonhamaki (*Archips breviplicanus*), Wataakakiriba (*Anomis flava*), oruga rosada del algodón (*Pectinophora gossypiella*), Watanomeiga (*Notarcha derogata*), Wataherikuronomeiga (*Diaphania indica*), gusano de la yema del tabaco (*Heliiothis virescens*), Wataringa (*Earias cupreoviridis*) y similares.
- Insectos plaga hemípteros incluyen, por ejemplo, chinche de hiera azul (*Nezara antennata*), Akasujikasumikame (*Stenotus rubrovittatus*), chinche rallada roja (*Graphosoma rubrolineatum*), Akahigehosomidorikasumikame (*Trigonotylus coelestialium*), etc., Akahimeherikamemushi (*Aeschynteles maculatus*), Akahoshikasumikame (*Creontiades pallidifer*), chinche moteada roja (*Dysdercus cingulatus*), Akahoshimarukaigaramushi (*Chrysomphalus ficus*), piojo rojo (*Aonidiella aurantii*), gran cigarra marrón (*Graptosaltria nigrofuscata*), chinche del prado (*Blissusleucopterus*), cochinilla blanca del naranjo (*Icerya purchasi*), chinche unibanda (*Piezodorus hybneri*), Inekamemushi (*Lagynotomus elongatus*), Inekirohimeyokobai (*Thaia subrufa*), Inekurokamemushi (*Scotinophara lurida*), áfido espinoso (*Sitobion ibarae*), Iwasaki stink bug (*Stariodes iwasakii*), Usuiromarukaigaramushi (*Aspidiotus destructor*), Usumonmidorikasumikame (*Taylorilygus pallidulus*), Umekobuaburamushi (*Myzasmumecola*), Pseudaulacaspis (*Pseudaulacaspis prunicola*), áfido del guisante (*Acyrtosiphon pisum*), Okumoherikamemushi (*Anacanthocoris striicornis*), Okurotobikasumikame (*Ectometopterus micantulus*), Otogeshirahoshikamemushi (*Eysarcoris lewisi*), Oherikamemushi (*Molipteryx fuliginosa*), Ooyokobai (*Cicadella viridis*), Okabonoakaaburamushi (*Rhopalosiphum rufabdrominalis*), Oribukatakaigaramushi (*Saissetia oleae*), mosca blanca de los invernaderos (*Trialetrodes vaporariorum*), Kashihimeyokobai (*Aguriahana quercus*), chinches de Kasumi (*Lygus* spp.), Kabawatafukimadaraaburamushi (*Euceraphis punctipennis*), Kankitsukaigaramushi (*Andaspis kashicola*), Kankitsukatakaigaramushi (*Coccus pseudomagnoliarum*), Kanshakobanenagakamemushi (*Cavelerius*

saccharivorus), Kikugunbai (*Galeatus spinifrons*), Kikuhimehigenagaaburamushi (*Macrosiphoniella sanborni*), Kimarukaigaramushi (*Aonidiella citrina*), chinche marrón marmorada (*Halyomorpha mista*), Kusugunbai (*Stephanitis fasciicarina*), Kusutogarikijirami (*Trioza camphorae*), Kumoharikamemushi (*Leptocoris chinensis*), Kuritogarikijirami (*Trioza quercicola*), Kurumigunbai (*Uhlerites latius*), chicharrita de la vid (*Erythroneura comes*),  
5 Kuroashihosonagakamemushi (*Paromius exiguus*), Kurokatamarukaigaramushi (*Duplaspidiotus claviger*), Kurosujitsumaguroyokobai (*Nephotettix nigropictus*), Kurotobikasumikame (*Halticellus insularis*), Kurofutsunounka (*Perkinsiella saccharicida*), Kuroringokijirami (*Psylla malivorella*), psílido de la morera (*Anomomeura mori*), cochinilla guerrillera (*Pseudococcus longispinis*), cochinilla blanca del duraznero (*Pseudaulacaspis pentagona*), cochinilla blanca del melocotón (*Pulvinaria kuwacola*), Koakasumikame (*Apolygus lucorum*), Kobanehyotannagakamemushi  
10 (Togo hemipterus), Komikanaburamushi (*Toxoptera aurantii*), Satokibikonakaigaramushi (*Saccharicoccus sacchari*), Satokibinewatamushi (*Geoca lucifuga*), Satonusuirounka (*Numata muiri*), Sanhozekaigaramushi (*Comstockaspis perniciosus*), piojo harinoso de los cítricos (*Unaspis citri*), áfido de la patata (*Aulacorthum solani*), Shirahoshi stink bug (*Eysarcoris ventralis*), Silverleaf whitefly (*Bemisia argentifolii*), Shiroooyokobai (*Cicadella spectra*), Shiromarukaigaramushi (*Aspidiotus hederæ*), Sukashihimeherikamemushi (*Liorhyssus hyalinus*), Segurohimekijirami (*Calophya nigridorsalis*), Sejirounka (*Sogatella furcifera*), áfido de la judía ancha (*Megoura crassicauda*), pulgón del repollo (*Brevicoryne brassicae*), áfido de la soja (*Aphis glycines*), Taiwankumoharikamemushi (*Leptocoris oratorius*), Taiwantsumaguroyokobai (*Nephotettix virescens*), Taiwanhigenagaaburamushi (*Uroeucon formosanum*), Tabakokasumikame (*Cyrtopeltis tenuis*), Tabakokonajirami (*Bemisia tabaci*), Chanokatakaigaramushi (*Lecanium persicae*), Chanokurohoshikaigaramushi (*Parlatoria theae*), Chanomarukaigaramushi (*Pseudaonidia paeoniae*),  
20 Chanomidorihimeyokobai (*Empoasca onukii*), Chabaneaokamemushi (*Plautia stali*), Churippuneaburamushi (*Dysaphis tulipae*), Churippuhigenagaaburamushi (*Macrosiphum euphorbiae*), Tsutsujigunbai (*Stephanitis pyrioides*), Tsumonouramushi (*Ceroplastes ceriferus*), Tsub-akikurohoshikaigaramushi (*Parlatoria camelliae*), Tsumaguroaokasumikame (*Apolygus spinolai*), saltamontes verde del arroz (*Nephotettix cincticeps*), Tsuyaaokamemushi (*Glaucias subpunctatus*), Tensaikasumikame (*Orthotylus flavosparvus*), áfido del maíz (*Rhopalosiphum maidis*), salta hoja del maíz (*Peregrinus maidis*), Togeshirahoshikamemushi (*Eysarcoris parvus*), chinche común de las camas (*Cimex lectularius*), Todokijirami (*Psylla abieti*), salta hoja marrón (*Nilaparvata lugens*), Toberakijirami (*Psylla tobiae*), Nagame (*Eurydema rugosum*), áfido de las peras (*Schizaphis piricola*), Nashikijirami (*Psylla pyricola*), Nashikurohoshikaigaramushi (*Parlatoreopsis pyri*), Nashigunbai (*Stephanitis nashi*),  
30 Nashikonakaigaramushi (*Dysmicoccus wistariae*), Nashishironagakaigaramushi (*Lepholeucaspis japonica*), Nashimaruaburamushi (*Sappaphis piri*), áfido del nabo (*Lipaphis erysimi*), áfido de la cebolla verde (*Neotoxoptera formosana*), Hasukubireaburamushi (*Rhopalosiphum nymphaeae*), saltamontes rosa (*Edwardsianarosa*), Harannagakaigaramushi (*Pinnaspisaspisidistrae*), Hannokijirami (*Psylla alni*), Hannonagayokobai (*Speusotettix subfuscus*), Hannohimeyokobai (*Alnetoidia alneti*), Hieunka (*Sogatella panicola*), Higenagakasumikame (*Adelphocoris lineolatus*), Himeakahoshikamemushi (*Dysdercus poecilus*), Himekurokaigaramushi (*Parlatoria ziziphi*),  
35 Himegunbai (*Uhlerites debile*), salta hoja marrón pequeño (*Laodelphax striatella*), Himenagame (*Eurydema pulchrum*), Himeharikamemushi (*Cletus trigonus*), Himefutatenagawafuki (*Clovia punctata*), Himeyokobai (especie de *Empoasca*), Hiratakataigaramushi (*Coccus hesperidum*), Hiratahyotannagakamemushi (*Pachybrachius luridus*), Fujikonakaigaramushi (*Planococcus kraunhiae*), Futasujikasumikame (*Stenotus binotatus*), Futatenhimeyokobai (*Arboridia apicalis*), Futatenyokobai (*Macrostelus fascifrons*), Buchihigekamemushi (*Dolycoris baccarum*),  
40 Buchihigekurokasumikame (*Adelphocoris triannulatus*), Filoxera (*Viteus vitifolii*), chince de la cereza (*Acanthocoris sordidus*), Hosokumoharikamemushi (*Leptocoris acuta*), Hosokobanagakamemushi (*Macropes obnubilus*), Hosoharikamemushi (*Cletus punctiger*), Hosoharikamemushi (*Riptortus clavatus*), Potetopishirido (*Paratrioza cockerelli*), Maekiwafuki (*Aphrophora costalis*), Makibakasumikame (*Lygus disponsi*), Madarakasumikame (*Lygus saundersi*), Matsukonakaigaramushi (*Crisicoccus pini*), salta hoja del pino (*Empoasca abietis*),  
45 Matsumotokonakaigaramushi (*Crisicoccus matsumotoi*), áfido del frijol (*Aphis craccivora*), platáspido (*Megacopta punctatissimum*), Marushirahoshikamemushi (*Eysarcoris guttiger*), coma de los agrios (*Lepidosaphes beckii*), Mikankijirami (*Diaphorina citri*), Mikankuroaburamushi (*Toxoptera citricidus*), Mikankonakaigaramushi (*Planococcus citri*), mosca blanca del cítrico (*Dialeurodes citri*), mosca blancaespinosa naranja (*Aleurocanthus spiniferus*), Mikanhimekonakaigaramushi (*Pseudococcus citriculus*), Mikanhimeyokobai (*Zyginella citri*),  
50 Mikanhimewatakaigaramushi (*Pulvinaria citricola*), Mikanhiratakagaigaramushi (*Coccus discrepans*), Mikanmarukaigaramushi (*Pseudaonidia duplex*), Mikanwatakaigaramushi (*Pulvinaria aurantii*), Mizukikatakaigaramushi (*Lecanium corni*), chince azul del sur (*Nezara viridula*), Mugikasumikame (*Stenodema calcaratum*), Mugikubireaburamushi (*Rhopalosiphum padi*), Mugihigenagaaburamushi (*Sitobion akebiae*), pulgón de las gramíneas (*Schizaphis graminum*), Mugiyokobai (*Sorhoanus tritici*), Mugiwaragikuomaruaburamushi  
55 (*Brachycaudus helichrysi*), chinche violeta (*Carpocoris purpureipennis*), pulgón verde del duraznero (*Myzus persicae*), Momokofukiaburamushi (*Hyalopterus pruni*), Yanagiaburamushi (*Aphis farinose yanagicola*), Yanagigunbai (*Metasalis populi*), Yanonekaigaramushi (*Unaspis yanonensis*), Yamaasakijirami (*Mesohomotoma camphorae*), Yukiyangiaburamushi (*Aphis spiraeicola*), áfido de la manzana (*Aphis pomi*), serpeta del olmo (*Lepidosaphes ulmi*), Ringokijirami (*Psylla mali*), Ringokurokasumikame (*Heterocordylus flavipes*), Ringokobuaburamushi (*Myzus malisuctus*), Ringoneaburamushi (*Aphidonuguis mali*), Ringomadarayokobai (*Orientus ishidae*), áfido de la manzana verde (*Ovatus malicolens*), áfido de sangre (*Eriosoma lanigerum*), Rubiouramushi (*Ceroplastes rubens*), áfido del algodón (*Aphis gossypii*) y similares.

Insectos plaga coleópteros incluyen, por ejemplo, Aosujikamikiri (*Xystrocera globosa*), Aobaarigatahanekakushi  
65 (*Paederus fuscipes*), Aohanamuguri (*Eucetonia roelofsi*), picudo (*Callosobruchus chinensis*), gorgojo de la batata (*Cylas formicarius*), gorgojo de la alfalfa (*Hypera postica*), gorgojo de la planta del arroz (*Echinocnemus squameus*),

Inedorooimushi (*Oulema oryzae*), Inenekuihamushi (*Donacia provosti*), gorgojo acuático del arroz (*Lissorhoptrus oryzophilus*), Imosaruhamushi (*Colasposoma dauricum*), Imozoumushi (*Euscepes postfasciatus*), escarabajo mejicano del frijol (*Epilachna varivestis*), gorgojo del frijol común (*Acanthoscelides obtectus*), diabrótica del maíz (*Diabrotica virgifera virgifera*), Umechokkirizoumushi (*Involvulus cupreus*), escarabajo de las hojas de las cucurbitáceas (*Aulacophora femoralis*), gorgojo del guisante (*Bruchus pisorum*), Oonijuyahoshitentou (*Epilachna vigintioctomaculata*), gorgojo de los granos del mani (*Carpophilus dimidiatus*), chinche nebulosa (*Cassida nebulosa*), Kiashinomihamushi (*Luperomorpha tenebrosa*), escarabajo saltador (*Phyllotreta striolata*), Kiboshikamikiri (*Psacotheta hilaris*), Kimadarakamikiri (*Aeolesthes chrysothrix*), gorgojo del castaño (*Curculio sikkimensis*), escarabajos de frutos secos (*Carpophilus hemipterus*), Koachanamuguri (*Oxycetonia jucunda*), gusano del maíz (*Diabrotica* spp.), escarabajos dorados (*Mimela splendens*), gorgojo del maíz (*Sitophilus zeamais*), escarabajo rojo de la harina (*Tribolium castaneum*), gorgojo del arroz (*Sitophilus oryzae*), Kohimekokunusutomodoki (*Palorus subdepressus*), melolontide (*Melolontha japonica*), Gomadarakamikiri (*Anoplophora malasiaca*), Tenebrio molitor (*Neatus picipes*), escarabajo de las hojas de patata (*Leptinotarsa decemlineata*), diabrótica del cacahuate (*Diabrotica undecimpunctata howardi*), Shibaosazoumushi (*Sphenophorus venatus*), Jyushihoshikubinagahamushi (*Crioceris quatuordecimpunctata*), gorgojo de las ciruelas (*Conotrachelus nenuphar*), Daikonsaruzoumushi (*Ceuthorrhynchidius albosuturalis*), escarabajos de las hojas del rábano (*Phaedon brassicae*), Tabakoshibanmushi (*Lasioderma serricorne*), Chibikofukizoumushi (*Sitona japonicus*), Chairokogane (*Adoretus tenuimaculatus*), Chirokomenogomumushidamashi (*Tenebrio molitor*), Chirosaruhamushi (*Basilepta balyi*), Tsumekusatakozoumushi (*Hypera nigrirostris*), Tensaitobihamushi (*Chaetocnema concinna*), Cupreous chafer (*Anomala cuprea*), Nagachakogane (*Heptophylla picea*), Nijuuyahoshi beetle (*Epilachna vigintioctopunctata*), diabrótica de antenasargas (*Diabrotica longicornis*), escarabajo de las flores (*Eucetonia pilifera*), gusano de alambre (*Agriotes* spp.), Himekatsubushimushi (*Attagenus unicolor japonicus*), Himekibanesaruhamushi (*Pagria signata*), Rufocuprea (*Anomala rufocuprea*), Himekokunusutomodoki (*Palorus ratzeburgii*), Himegomimushidamashi (*Alphitobius laevigatus*), Himemaru carpet beetle (*Anthrenus verbasci*), Hiratakikumushi (*Lyctus brunneus*), gorgojo de la harina (*Tribolium confusum*), Futasujihimehamushi (*Medythia nigrobilineata*), Budoutorakamikiri (*Xylotrechus pyrrhoderus*), pulguilla del pepino (*Epitrix cucumeris*), jardinero del monte (*Tomicus piniperda*), aserrador del pino japonés (*Monochamus alternatus*), escarabajo japonés (*Popillia japonica*), escarabajo tigre del frijol (*Epicauta gorhami*), gorgojo del maíz (*Sitophilus zeamais*), Momochockirizoumushi (*Rhynchites heros*), gorgojo de las verduras (*Listroderes costirostris*), gorgojo del sorgo (*Callosobruchus maculatus*), Ringokofukizoumushi (*Phyllobius armatus*), Ringohanazoumushi (*Anthonomus pomorum*), Rurihamushi (*Linaeidea aenea*), picudo del algodón ( *Anthonomus grandis*) y similares.

Insectos plaga dípteros incluyen, por ejemplo, mosquito común (*Culex pipiens pallens*), mosca de la espinaca (*Pegomya hyoscyami*), Ashigurohamoguribae (*Liriomyza huidobrensis*), moscas domésticas (*Musca domestica*), Inekimoguribae (*Chlorops oryzae*), Inekukimigiwabae (*Hydrellia sasakii*), minador de las hojas del arroz (*Agromyza oryzae*), minador del follaje del arroz (*Hydrellia griseola*), Inemigiwabae (*Hydrellia griseola*), Ingenmoguribae (*Ophiomyia phaseoli*), mosca de la sandía (*Dacus cucurbitae*), drosófila de ala manchada (*Drosophila suzukii*), Outouhamadaramibae (*Rhacochlaena japonica*), Ooiebae (*Muscina stabulans*), Nomibae tal como Okimonnomibae (*Megaselia spiracularis*), Oochobae (*Clogmia albipunctata*), Kiriujikagambo (*Tipula aino*), Kurokinbae (*Phormia regina*), Kogataakaieka (*Culex tritaeniorhynchus*), mosquito chino de la malaria (*Anopheles sinensis*), Daikonbae (*Hylemya brassicae*), mosquito de las agallas de la soja (*Asphondylia* sp.), mosca de la semilla del maíz (*Delia platura*), mosca de los bulbos (*Delia antiqua*), mosca de la cereza (*Rhagoletis cerasi*), mosquito doméstico autógeno (*Culex pipiens molestus* Forskal), mosca mediterránea (*Ceratitis capitata*), Chibikurobanekinokobae (*Bradysia agrestis*), Tensaimogurihanabae (*Pegomya cunicularia*), minador de la higuera (*Liriomyza sativae*), minador de la berenjena (*Liriomyza bryoniae*), Namoguribae (*Chromatomyia horticola*), minador de la cebolla verde (*Liriomyza chinensis*), mosquitos domésticos tropicales (*Culex quinquefasciatus*), mosquitos de la fiebre amarilla (*Aedes aegypti*), mosquito tigre (*Aedes albopictus*), minador de los frijoles (*Liriomyza trifolii*), minador de la higuera (*Liriomyza sativae*), mosca oriental de la fruta (*Dacus dorsalis*), Mikanbae (*Dacus tsuneonis*), mosquilla anaranjada del trigo (*Sitodiplosis mosellana*), Mugikimoguribae (*Meromuza nigriventris*), gusano de la naranja (*Anastrepha ludens*), mosca de las manzanas (*Rhagoletis pomonella*) y similares.

Insectos plaga himenópteros incluyen, por ejemplo, Amimeari (*Pristomyrmex pungens*), betílidos tal como, hormiga cosechadora (*Monomorium pharaonis*), Oozuari (*Pheidole noda*), Kaburahabachi (*Athalia rosae*), avispa del castaño (*Dryocosmus kuriphilus*), Hormiga negro (*Formica fusca japonica*), Avispas, sínfito del nabo de torso negro (*Athalia infumata infumata*), mosca arge pagana (*Arge pagana*), sínfito japonés (*Athalia japonica*), hormiga corta hojas (*Acromyrmex* spp.), hormiga de fuego (*Solenopsis* spp.), Ringohabachi (*Arge mali*), Ruriari (*Ochetellus glaber*) y similares.

Insectos plaga ortópteros incluyen, por ejemplo, Ruspolia lineosa (*Homorocoryphus lineosus*), grillo topo (*Gryllotalpa* sp.), Koinago (*Oxya hyla intricata*), Kobaneinago (*Oxya yezoensis*), langosta migratoria (*Locusta migratoria*), Hanenagainago (*Oxya japonica*), Himekusakiri (*Homorocoryphus jezoensis*), Emmakoorogi (*Teleogryllus emma*) y similiares.

Insectos plaga tisanópteros incluyen, por ejemplo, tripido de listas rojas (*Selenothrips rubrocinctus*), trips del arroz (*Stenchaetothrips biformis*), trips alargado del arroz (*Haplothrips aculeatus*), trips de Kakikuda (*Ponticulothrips diospyrosi*), trips de flores amarillas (*Thrips flavus*), trips de la hierba (*Anaphothrips obscurus*), trips del alcanfor

(Liothrips floridensis), trips del gladiolo (thrips simplex), tripido de Kurogehana (thrips nigropilosus), trips de los cítricos (Heliothrips haemorrhoidalis), trips de la morera (Pseudodendrothrips mori), trips de los compuestos (Microcephalothrips abdominalis), trips de Shiionagakuda (Leeuwenia pasanii), trips de Shiimarukuda (Litotetothrips pasaniae), trips de los cítricos (Scirtothrips citri), trips de Sinakuda (Haplothrips chinensis), trips de Daizu (Mycterothrips glycines), trips de Daizuuuiro (thrips setosus), trips de Chanokiuro (Scirtothrips dorsalis), trips de Chanokuro (Dendrothrips minowai), trips de Tsumekusakuda (Haplothrips niger), trips de la cebolla (Thrips tabaci), trips de Negikuro (Thrips alliorum), trips de Hana (Thrips hawaiiensis), trips de Hana Kuda (Haplothrips kurdjumovi), trips de Higebuto (Chirothrips manicatus), trips de Hirazuhanaazamiuma (Frankliniella intonsa), trips de Loquat Hana (Thrips coloratus), trips de flores occidentales (Frankliniella occidentalis), trips de Minamikiuro (Thrips palmi), trips de Yurikiuro (Frankliniella liliivora), trips de Yurinokuda (Liothrips vaneeckei) y similares.

Insectos plaga acari incluyen, por ejemplo, niguas azules (Leptotrombidium akamushi), Ashinowahadani (Tetranychus ludeni), garrapata americana del perro (Dermacentor variabilis), ácaro de la araña de Ishiunami (Tetranychus truncatus), ácaro del polvo del hogar (Ornithonyssus bacoti), Inunikibidani (Demodex canis), ácaros de la araña de la cereza (Tetranychus viennensis), ácaro araña de Kanzawa (Tetranychus kanzawai), garrapatas tales como la garrapata Kurirokita (Rhipicephalus sanguineus), Stag tsumedani (Cheyletus malaccensis), ácaro del moho (Tyrophagus putrescentiae), Konahyouhidani (Dermatophagoides farinae), araña de espalda roja (Latrodectus hasseltii), garrapatas Taiwankaku (Dermacentor taiwanicus), ácaro del óxido del té (Acaphylla theavagrans), Chanohokoridani (Polyphagotarsonemus latus), ácaro Tomatosabi (Aculops lycopersici), ácaro de las aves del norte (Ornithonyssus sylvaivum), ácaro araña de dos puntos (Tetranychus urticae), ácaro Nisenashisabi (Eriophyes chibaensis), ácaro de la sarna (Sarcoptes scabiei), garrapata cerambícida (Haemaphysalis longicornis), garrapata de patas negras (Ixodes scapularis), Tyrophagus dimidiatus (Tyrophagus similis), Hosotsumedani (Cheyletus eruditus), Citrus red mite (Panonychus citri), Minami tsumedani (Cheyletus moorei), ácaro de la leprosa de los cítricos (Brevipalpus phoenicis), ácaros Mimihizen (Octodectes cynotis), ácaro del polvo doméstico europeo (Dermatophagoides ptenyssnus), Yamatochimadani (Haemaphysalis flava), Ixodes ovatus (Ixodes ovatus), ácaro del óxido de Ryukyu tangerine (Phyllocoptruta citri), ácaro de las hojas de la manzana (Aculus schlechtendali), ácaro rojo europeo (Panonychus ulmi), garrapata estrella solitaria (Amblyomma americanum), garrapatas de gallina (Dermanyssus gallinae), Robinnedani (Rhyzoglyphus robini), un tipo de Nedanimodoki (Sancassania sp.) y similares.

Insectos plaga isópteros incluyen, por ejemplo, termita Amami (Reticulitermes miyatakei), termitas de la madera seca de los EE.UU. (Incisitermes minor), termita subterránea de Japón del sur (Coptotermes formosanus), termita gigante (Hodotermopsis japonica), termita Kanmon (Reticulitermes sp.), Kiashishiroari (Reticulitermes flaviceps amamianus), termita Kushimoto (Glyptotermes kushimensis), termita subterránea Koushu formosan (Coptotermes guangzhoensis), termita Koushun (Neotermes koshunensis), termita Kodama (Glyptotermes kodamai), termita Satsuma (Glyptotermes satsumensis), termita Daikoku (Cryptotermes domesticus), termita de Taiwan (Odontotermes formosanus), termita Nakajima (Glyptotermes nakajimai), termita Nitobe (Pericaprithermes nitobei), termita Yamato (Reticulitermes speratus) y similares.

Insectos plaga blatodeos incluyen, por ejemplo, cucaracha (Periplaneta fuliginosa), cucaracha alemana (Blattella germanica), cucaracha oriental (Blatta orientalis), cucaracha marrón (Periplaneta brunnea), cucaracha alemana (Blattella lituricollis), cucaracha japonesa (Periplaneta japonica), American cockroach (Periplaneta americana) y similares.

Insectos plaga sifonápteros incluyen, por ejemplo, piojo humano (Pulex irritans), piojo del gato (Ctenocephalides felis), piojo de pollo (Ceratophyllus gallinae) y similares.

Nematodos incluyen, por ejemplo, nematodo de la fresa (Nothotylenchus acris), nematodo de Ineshingare (Aphelenchoides besseyi), nematodo de la pradera del norte (Pratylenchus penetrans), nematodo norteno de quiste (Meloidogyne hapla), nematodo sureño de quiste (Meloidogyne incognita), nematodo dorado de la patata (Globodera rostochiensis), nematodo javanés de quiste (Meloidogyne javanica), heterodera de la soja (Heterodera glycines), nematodo lesionador del café (Pratylenchus coffeae), nematodo de la pradera de trigo (Pratylenchus neglectus), Mandarin orange root nematodes (Tylenchus semipenetrans), y simialres.

Moluscos incluyen, por ejemplo, caracol de la manzana (Pomacea canaliculata), caracol gigante africano (Achatina fulica), Babosas (Meghimatium bilineatum), babosa chaco (Lehmannina valentiana), Kouranamekuji (Limax flavus), caracol globular de Siebold (Acusta despecta sieboldiana) y similares.

Además, el insecticida agrícola/hortícola propuesto por la presente invención tiene fuertes efectos insecticidas sobre otros insectos plaga tales como gusano minador del tomate (Tuta absoluta).

Además, ácaros zoobióticos, que también se pueden controlar, incluyen, por ejemplo, garrapatas tales como garrapata de ganado (Boophilus microplus), Kuriuro koitamadani (Rhipicephalus sanguineus), Futatogechimadani (Haemaphysalis longicornis), Kichimadani (Haemaphysalis flava), Adenophora chimadani (Haemaphysalis campanulata), Isukachimadani (Haemaphysalis concinna), Yamatochimadani (Haemaphysalis japonica), Higenagachimadani (Haemaphysalis kitaokai), garrapata Iyasuchi (Haemaphysalis ias), garrapata Yamato (Ixodes ovatus), garrapata Tanegata (Ixodes nipponensis), garrapata Schulze (Ixodes persulcatus), garrapata Takasago

Kirara (*Amblyomma testudinarium*), Ootogechimadani (*Haemaphysalis megaspinosa*), garrapatas Aminokaku (*Dermacentor reticulatus*) y garrapatas Taiwan Kaku (*Dermacentor taiwanesis*), Torisashidani tales como ácaros de gallinas (*Dermanyssus gallinae*), ácaro de aves del norte (*Ornithonyssus sylviarum*) y ácaro de aves del sur (*Ornithonyssus bursa*), niguas, tales como niguas Nanyo (*Eutrombicula wichmanni*), ácaro Scrub typhus (*Leptotrombidium akamushi*), niguas de espinas (*Leptotrombidium pallidum*), niguas Fuji (*Leptotrombidium fuji*), niguas Tosa (*Leptotrombidium tosa*), ácaro Aki de Europa (*Neotrombicula autumnalis*), niguas de América (*Eutrombicula alfreddugesi*) y niguas de Miyagawa Tama (*Helenicula miyagawai*), Tsumedani tales como Inutsumedani (*Cheyletiella yasguri*), tsumedani de conejo (*Cheyletiella parasitivorax*) y Nektsumedani (*Cheyletiella blakei*), Sarcoptes tales como ácaro de conejo (*Psoroptes cuniculi*), Ushishokuhidani (*Chorioptes bovis*), ácaros de orejas de perro (*Otodectes cynotis*), ácaro de comezón (*Sarcoptes scabiei*) y ácaros foraminosos del gato (*Notoedres cati*), Demodex tal como tipo Inunikibidani (*Demodex canis*) y similares.

Pulgas, que también se pueden controlar, incluyen, por ejemplo, insectos ápteros ectoparásitos en el orden de los sifonápteros o, específicamente, pulgas que pertenecen a la familia Pulicidae y a la familia Ceratophyllus, entre otros. Pulgas que pertenecen a la familia Pulicidae incluyen, por ejemplo, piojo del perro (*Ctenocephalides canis*), piojo del gato (*Ctenocephalides felis*), piojo humano (*Pulex irritans*), piojo de las gallinas (*Echidnophaga gallinacea*), pulga de rata (*Xenopsylla cheopis*), pulga de ratón (*Leptopsylla segnis*), pulga de rata europea (*Nosopsyllus fasciatus*), pulga de rata de Yamato (*Monopsyllus anisus*) y similares.

Además, otros parásitos externos que pueden controlarse incluyen, por ejemplo, piojos tales como piojo de la trompa corta del ganado (*Haematopinus eurysternus*), Umajirami (*Haematopinus asini*), Hitsujirami (*Dalmalinia ovis*), Ushihosojirami (*Linognathus vituli*), piojo del cerdo (*Haematopinus suis*), piojo púbico (*Phthirus pubis*) y piojo de la cabeza (*Pediculus capitis*), piojo corporal tal como Inuhajirami (*Trichodectes canis*) y otros insectos plaga dípteros chupadores de sangre, tal como tábano (*Tabanus trigonus*), Uainukaka (*Culicoides schultzei*), Tsumetogebuyu (*Simulium ornatum*) y similares. Asimismo, parásitos internos incluyen, por ejemplo, gusanos pulmonares, tricocéfalos, gusanos nodulares, parásitos gástricos, ascárides, insectos filiformes y otros nematodos; *Diphyllobothrium mansonii*, *Diphyllobothrium latum*, *Dipylidium caninum*, *Taenia multiceps*, *Echinococcus granulosus*, *Echinococcus multilocularis* y otros cestodos; *Schistosomiasis japonica*, *Fasciola hepatica* y otros trematodos; *coccidium*, parásito de la malaria, *chounainikuhoushichu*, *Toxoplasma gondii*, *Cryptosporidium* y otros protozoos, etc.

Puesto que un insecticida agrícola/hortícola que contiene, como su principio activo, un compuesto de oxazepina o sal del mismo expresado por la Fórmula General (I) según la presente invención tiene un efecto notable en el control de los insectos plaga anteriormente mencionados que dañan cultivos de arroz, cultivos de campo, árboles frutales, verduras y otros cultivos así como flores, se puede aplicar en o sobre viveros, arrozales, campos de cultivo, árboles frutales, verduras y otros cultivos, flores, etc. y sus semillas, agua en arrozales, tallos y hojas, suelo y otros vehículos de cultivo, etc., cuando se espera la generación de insectos plaga, antes de que se generen los insectos plaga o cuando su generación está confirmada, y el insecticida agrícola/hortícola propuesto por la presente invención conseguirá los efectos especificados. En particular, un modo de uso preferente es el que utiliza las denominadas "características de migración por penetración", que implica la aplicación al suelo en viveros para cultivos, flores, etc., tierra alrededor de hoyos de siembra usados para el trasplante, raíces de plantas, agua de irrigación, agua usada para cultivo hidropónico, etc., de modo que el compuesto propuesto por la presente invención se absorberá a través del suelo o desde las raíces sin ir a través del suelo.

Plantas útiles sobre las que se puede usar el insecticida agrícola/hortícola de la presente invención no están limitadas de ningún modo y ejemplos incluyen, cereales (como arroz, cebada, trigo, centeno, avena, maíz, etc.), legumbres (soja, judías azuki, habas forrajeras, guisantes, alubias rojas, cacahuets, etc.), huertos/frutas (manzanas, cítrico, pera, uvas, melocotón, ciruela, melocotones amarillos, nueces, castañas, almendras, plátanos, etc.), verduras de hojas/frutos (col, tomates, espinaca, brécol, lechuga, cebollas, cebollas verdes (cebolletas, wakegi), pimentón berenjena, fresas, pimienta, okra, puerros, etc.), verduras de raíces (zanahorias, patatas, batatas, malanga, rábano daikon, nabos, raíz de loto, bardana, ajo, ascalonias, etc.), cultivos para procesar (algodón, cáñamo, remolacha, lúpulo, caña de azúcar, remolacha azucarera, aceitunas, goma, café, tabaco, té, etc.), cucurbitáceas (calabaza, pepinos, sandía, melones dulces orientales, melones, etc.), pasto (pasto de huerto, sorgo, heno, trébol, alfalfa, etc.), césped (césped de Corea, césped Bentgrass, etc.), cultivos de especias y otros cultivos ornamentales (lavanda, romero, tomillo, perejil, pimienta, jengibre, etc.), flores (crisantemo, rosas, claveles, orquídeas, tulipanes, lirios, etc.), árboles de jardín (ginkgo, cerezos, aucuba japonés, etc.), árboles forestales (abeto, abeto japonés, pino, cedro amarillo, cedro japonés, ciprés hinoki, eucalipto, etc.) y otras plantas.

Las "plantas" mencionadas anteriormente también incluyen plantas provistas de resistencia a isoxaflutol y otros inhibidores de HPPD, imazetapir, tifensulfurón-metilo y otros inhibidores de ALS, glifosato y otros inhibidores enzimáticos sintéticos de EPSP, glufosinato y otros inhibidores enzimáticos sintéticos de glutamina, setoxidim y otros inhibidores de acetil-CoA carboxilasa y bromoxinilo, dicamba, 2,4-D y otros herbicidas, se ha proporcionado mediante métodos de clásicos de reproducción o de ingeniería de modificación genética.

Ejemplos de "plantas" a las que se les ha proporcionado resistencia mediante métodos de reproducción clásicos incluyen colza, trigo, girasol y arroz resistentes a imazetapir y otra imidazolinona de herbicidas de tipo inhibidores de

ALS, tales plantas tales como los comercializados con el nombre comercial de Clearfield (marca comercial registrada). Asimismo, una soja provista de resistencia a tífensulfurón-metilo y otros de sulfonil urea de herbicidas inhibidores de ALS tales usando un método de reproducción clásico ya está disponible en el mercado con el nombre de producto STS Soybean. Asimismo, Maíz SR es un ejemplo de plantas provistas de resistencia a inhibidores de acetil-CoA carboxilasa, tales como triona oxima, aliloxi fenoxi propionato y otros herbicidas, se ha añadido usando un método de reproducción clásico.

Asimismo, Las plantas provistas de resistencia a los inhibidores de la acetil-CoA carboxilasa se describen en Proceedings of the National Academy of Sciences of the United States of America (Proc. Natl. Acad. Sci. USA), vol. 87, págs. 7175-7179 (1990), etc. Asimismo, se informa sobre mutantes de acetil-CoA carboxilasa resistentes a inhibidores de la acetil-CoA carboxilasa en Weed Science, vol. 53, págs. 728-746 (2005), etc. Mediante la introducción de estos genes mutantes de acetil-CoA carboxilasa en las plantas mediante una técnica de ingeniería de modificación genética, o mediante la introducción de la mutación que confiere resistencia a acetil-CoA carboxilasa de plantas, se pueden crear plantas resistentes a los inhibidores de la acetil-CoA carboxilasa; adicionalmente, al introducir una mutación de sustitución de aminoácidos de sitio específico a genes de acetil-CoA carboxilasa vegetales, genes ALS, etc., que se realiza introduciendo en células vegetales un ácido nucleico al que se ha introducido una mutación de sustitución de bases usando quimeroplastia (Gurta T. 1999. Repairing the Genome's Spelling Mistakes. Science 285: 316-318), plantas resistentes a inhibidores de acetil-CoA carboxilasa, inhibidores de ALS, etc., se pueden crear y el insecticida agrícola/hortícola propuesto por la presente invención también se puede usar en estas plantas.

Además, las toxinas que se expresan en plantas modificadas genéticamente incluyen, por ejemplo, proteínas insecticidas derivadas de *Bacillus cereus* o *Bacillus popilliae*; Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, CryIFa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1, Cry9C y otras  $\delta$ -endotoxinas, VIP1, VIP2, VIP3, VIP3A y otras proteínas insecticidas derivadas de *Bacillus thuringiensis*; proteínas insecticidas derivadas de nematodos; toxinas de escorpiones, toxinas de arañas, toxinas de abeja, toxinas de nervios específicos de insectos y otras toxinas producidas en animales; toxinas filiformes; lectina vegetal; aglutininas; inhibidores de tripsina, inhibidores de serina proteasa, inhibidores de patatina, cistatina, inhibidores de papaína y otros inhibidores de proteasa; ricina, RIP de maíz, abrina, lufina, saporina, briodina y otras proteínas inactivadoras de ribosoma (RIP); 3-hidroxi-esteroide oxidasa, ecdiesterioide-UDP-glucosil transferasa, colesterol oxidasa y otra enzima metabólica de esteroides; inhibidores de ecdisona; HMG-CoA reductasa; inhibidores del canal de sodio o del canal de calcio y otros inhibidores de canales iónicos; esterasa de hormona juvenil; receptores de la hormona diurética; estilbena sintasa; bi-bencil sintasa; quitinasa; glucanasa. etc.

Asimismo, toxinas que manifiestan estas plantas genéticamente modificadas incluyen toxinas híbridas a base de Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1, Cry9C, Cry34Ab, Cry35Ab y otras proteínas de  $\delta$ -endotoxinas, VIP1, VIP2, VIP3, VIP3A y otras proteínas insecticidas, así como toxinas parcialmente defectuosas y toxinas modificadas. Las toxinas híbridas se crean mediante ingeniería de modificación, basada en nuevas combinaciones de distintos dominios de estas proteínas. Entre toxinas parcialmente defectuosas, se conoce Cry1Ab cuya secuencia de aminoácidos es parcialmente defectuosa. Las toxinas modificadas son toxinas naturales cuyo amino ácido o aminoácidos está/(n) sustituido(s).

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

Las toxinas contenidas en estas plantas modificadas añaden resistencia a las plantas, especialmente, resistencia a insectos plaga coleópteros, insectos plaga hemípteros, insectos plaga dípteros, insectos plaga lepidópteros y nematodos. El insecticida agrícola/hortícola propuesto por la presente invención puede combinarse o sistematizarse con tal tecnología.

El insecticida agrícola/hortícola propuesto por la presente invención puede usarse directamente o en un estado diluido o suspendido en agua, etc., según sea apropiado, en plantas en las que se espera que se generen insectos o nematodos, mediante una cantidad eficaz para controlar tales insectos plaga y nematodos; para controlar insectos plaga y nematodos que se generan en árboles frutales, cereales, hortalizas, etc., por ejemplo, se puede pulverizar sobre tallos y hojas, producirse en un agente de solución en el que se empapan las semillas, prepararse como un polvo para recubrir o, de otro modo, tratar semillas usando Calper, etc., mezclarse en las capas completas del suelo, aplicarse en filas de plantación, mezclarse en el lecho de siembra, aplicarse en plantines, hoyos de plantación, alrededor de las raíces de las plantas, en abonado de cobertera, en cajas para arroz, sobre superficies de agua, etc. o aplicarse en el suelo, etc., para que se absorba mediante las raíces. También puede aplicarse en solución de nutrientes en cultivo de solución de nutriente (hidroponía) o usarse mediante tratamiento por humo, inyección de tronco, etc.

Además, el insecticida agrícola/hortícola propuesto por la presente invención puede usarse directamente o en un estado diluido o suspendido en agua, etc., según sea apropiado, en ubicaciones en las que se espera que se generen insectos plaga, mediante una cantidad eficaz para controlar tales insectos plaga; por ejemplo, se puede pulverizar sobre insectos plaga de cereales almacenados, insectos plaga domésticos, insectos plaga de higiene, insectos plaga forestales, etc. y también puede aplicarse en materiales de construcción residenciales, con



tratamiento de humo, usado como cebo, etc.

5 Métodos para tratar semillas incluyen, por ejemplo, un método para sumergir las semillas en el producto en forma líquida o en un líquido preparado a partir del producto en forma sólida, con o sin dilución y dejar el reactivo permearse en las semillas; un método de mezclar y revestir con polvo el producto en forma sólida o forma líquida con/sobre las semillas para hacer que el reactivo se una a la superficie de las semillas; un método de mezclar el reactivo con resina, polímero u otro vehículo adhesivo y, a continuación, revestir la mezcla sobre las semillas; y un método de pulverizar un reactivo cerca de las semillas cuando se plantan.

10 "Semillas" tratadas por estos métodos se refiere a las formas iniciales de planta a cultivar para la propagación de plantas, en los que ejemplos, distintos a semillas, incluyen, tubérculos, patata de siembra, bulbiles, propágulos, bulbos escamosos y formas vegetales usadas para la propagación vegetal con los fines de injertar.

15 Cuando se aplica un método de uso de la presente invención, "suelo" o "vehículo de cultivo" se refiere a un medio de soporte para cultivar una cosecha o, específicamente, un soporte en el cual cultivar raíces y su material, que no está limitado de ningún modo siempre y cuando pueda crecer una planta en el mismo, puede ser un denominado suelo, esteras de plantas, agua, o, específicamente, puede ser arena, piedra pómez, vermiculita, tierra de diatomeas, agar, sustancias gelatinosas, sustancias poliméricas, lana de roca, lana de vidrio, virutas de madera, corteza, etc.

20 Métodos para pulverizar sobre tallos y hojas de cultivos o sobre insectos plaga de cereales almacenados, insectos plaga domésticos, insectos plaga de higiene, insectos plaga forestales, etc., incluyen un método para pulverizar el producto en forma de emulsión, una forma fluida u otra forma líquida o en forma de polvo humectable, forma granular dispersable en agua u otra forma sólida que se ha diluido en agua según se considere adecuado; un método para pulverizar el producto en forma de polvo; tratamiento con humo o similares

25 Método para su aplicación a suelo incluyen, por ejemplo, un método para aplicar el producto en forma líquida con o sin dilución en agua, a raíces de formas vegetales, lechos de semilleros, etc.; un método para pulverizar el producto en forma granular sobre raíces y formas vegetales, lechos de semilleros, etc.; un método para pulverizar el producto en forma de polvo, forma en polvo humectable, forma granular dispersable en agua, forma granular, etc., antes de sembrar o trasplantar y mezclándolo con el suelo completo; y un método para pulverizar el producto en forma de polvo, forma en polvo humectable, forma granular dispersable en agua, forma granular, etc., a hoyos de plantación, filas de plantación, etc., antes de sembrar o antes de plantar formas vegetales, etc.

30 Con respecto a los métodos de aplicación a lechos de semilleros de arroz, el producto puede encontrarse en distintas formas dependiendo del tiempo de aplicación, tal como la etapa de siembra, etapa de vegetación, etapa de trasplante, etc., en la que se puede aplicar en tales formas como polvo, gránulos dispersables en agua, gránulos, etc. El producto también puede mezclarse con suelo de cultivo, en forma de mezcla de suelo de cultivo con polvo, gránulos dispersables en agua, gránulos, etc., tal como mezcla con suelo de lecho, mezcla con suelo de cobertura, mezcla con la totalidad del suelo de cultivo, etc. El suelo de cultivo puede estratificarse simplemente con diversas formas del producto.

35 En los métodos para su aplicación en arrozales, el producto en forma de envase gigante, un paquete, forma granular, forma de gránulos dispersable en agua u otra forma sólida o en forma fluida, forma de emulsión u otra forma líquida, se pulveriza normalmente sobre arrozales que están inundados con agua. Además, cuando se plantas plántulas de arroz, el producto en una forma adecuada puede directamente, o mezclarse con un fertilizante primero, pulverizarse sobre o inyectarse en el suelo. Asimismo, el reactivo en forma de emulsión, forma fluida, etc., puede usarse en compuertas de agua, sistemas de irrigación u otras fuentes de agua, etc., que fluyen hacia los arrozales, de modo que se aplica con el suministro de agua y se puede ahorrar trabajo.

40 Con cultivos de campo, vehículos de cultivo, etc., en las cercanías de semillas y formas vegetales se pueden tratar en la etapa de siembra mediante la etapa de semilleros. Con plantas cuyas semillas se siembra directamente sobre los campos, el producto se aplica idealmente a las semillas o a las raíces de las plantas durante su cultivo. El producto puede pulverizarse en forma granular o el producto en forma líquida con o sin dilución en agua puede aplicarse mediante irrigación, etc. También es deseable mezclar el producto en forma granular con un vehículo de cultivo antes de su siembra y, a continuación, realizar la siembra.

45 Para el tratamiento en etapas de siembra y de semilleros de plantas a cultivar para su trasplante, es deseable que las semillas se traten directamente o el producto en forma líquida se aplica mediante irrigación a, o el producto en forma granular se pulveriza sobre, lechos de semilleros. También es deseable aplicar el producto en forma granular a hoyos de plantación en el momento de la plantación final o mezclarlo con el vehículo de cultivo en las proximidades del destino de trasplante.

50 El insecticida agrícola/hortícola propuesto por la presente invención está conformado, en general, en formas convenientes para su uso, según los métodos normales de formulación de químicos agrícolas.

55 Para ser específicos, un compuesto de óxido de oxazepina o sal del mismo expresado por la Fórmula General (I)

según la presente invención puede mezclarse en un vehículo inerte adecuado, mediante una relación adecuada, junto con agente(s) auxiliar(es), si es necesario, y disolverse, separarse, suspenderse, mezclarse, impregnarse, adsorberse o unirse y formularse en una forma adecuada tal como una suspensión, emulsión, líquido, polvo humectable, gránulos dispersables en agua, gránulos, polvo, comprimidos, paquete, etc., para su uso.

5 La composición propuesta por la presente invención (insecticida agrícola/hortícola o agente de control de parásitos zoobióticos) puede contener, además de su principio activo, aquellos ingredientes de aditivo usados normalmente en insecticidas agrícolas/hortícolas o agentes de control de parásitos zoobióticos. Estos ingredientes de aditivo incluyen vehículos sólidos, vehículos líquidos y otros vehículos, agentes tensioactivos, dispersantes, agentes humectantes, aglutinantes, adherentes, agentes espesantes, agentes colorantes, agentes de liberación prolongada, agentes de propagación, agentes anticongelantes, agentes antitorta, agentes disgregantes, agentes estabilizantes, etc. Además de lo anterior, conservantes, trozos vegetales, etc., también se pueden usar como ingredientes de aditivo, si es necesario. Cualquiera de estos ingredientes de aditivo se puede usar solo o se pueden combinar dos o más tipos.

15 Vehículos sólidos incluyen, por ejemplo, cuarzo, arcilla, caolinita, pirofilita, sericita, talco, bentonita, arcilla ácida, atapulgita, zeolita, tierra de diatomeas y otros minerales naturales, carbonato de calcio, sulfato de amonio, sulfato de sodio, cloruro de potasio y otras sales inorgánicas, ácido silícico sintético, silicato sintético, almidón, celulosa, polvos de plantas (serrín, cáscara de coco, mazorca de maíz, tallo de tabaco, etc.) y otros vehículos sólidos orgánicos, polietileno, polipropileno, poli(cloruro de vinilideno) y otros vehículos plásticos, urea, materiales inorgánicos huecos, materiales plásticos huecos, sílice pirógena (hulla blanca), etc. Cualquiera de estos puede usarse solo o pueden combinarse dos o más tipos.

25 Vehículos líquidos incluyen, por ejemplo, metanol, etanol, propanol, isopropanol, butanol y otros alcoholes monohídricos, etilenglicol, dietilenglicol, propilenglicol, hexilenglicol, polietilenglicol, polipropilenglicol, glicerina y otros alcoholes polihídricos, propilenglicol éter y otros compuestos de alcohol polihídrico, acetona, metilacetona, metil isobutil cetona, diisobutil cetona, ciclohexanona y otras cetonas, éter etílico, dioxano, etilenglicol monoetil éter, éter dipropílico, THF y otros éteres, parafina normal, nafteno, isoparafina, queroseno, aceite mineral y otros hidrocarburos de ácidos grasos, benceno, tolueno, xileno, nafta de disolvente, alquilnaftaleno y otros hidrocarburos aromáticos, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono y otros hidrocarburos halogenado, acetato de etilo, ftalato de diisopropilo, ftalato de dibutilo, ftalato de dioctilo, adipato de dimetilo y otros ésteres,  $\gamma$ -butirolactona y otras lactonas, dimetilformamida, dietilformamida, dimetilacetamida, N-alquil pirrolidinona y otras amidas, acetonitrilo y otros nitrilos, dimetilsulfóxido y otros compuestos de azufre, aceite de soja, aceite de colza, aceite de semilla de algodón, aceite de ricino y otros aceites vegetales, agua, etc. Cualquiera de estos puede usarse solo o pueden combinarse dos o más tipos.

35 Agentes tensioactivos usados como dispersantes y agentes humectantes incluyen, por ejemplo, éster de ácido graso de sorbitano, éster de ácido graso de polioxietilensorbitano, éster de ácido graso de sacarosa, éster de ácido graso de polioxietileno, éster de ácido de resina de polioxietileno, diéster de ácido graso de polioxietileno, polioxietileno alquil éter, polioxietileno alquil alil éter, polioxietileno alquil fenil éter, polioxietileno dialquil fenil éter, productos condensados de polioxietileno alquil fenil éter-formalina, copolímeros en bloque de polioxietileno-polioxipropileno, polímeros en bloque de poliestireno-polioxietileno, copolímero en bloque de alquil éter de polioxietileno-polipropileno, polioxietileno alquilamina, amida de ácido graso de polioxietileno, bis(fenil éter) de ácido graso de polioxietileno, polialquil bencil fenil éter, polioxialquilen estiril fenil éter, diol de acetileno con polioxialquilen añadido, silicona de tipo éter de polioxietileno, silicona de tipo éster, tensioactivos fluorados, aceite de ricino polioxietilenado, aceite de ricino hidrogenado polioxietilenado y otros agentes tensioactivos no iónicos, alquilsulfato, polioxietileno alquil éter sulfato, polioxietileno alquil fenil éter sulfato, polioxietileno estiril fenil éter sulfato, alquilbencenosulfonato, alquil alil sulfonato, lignosulfonato, alquilsulfosuccinato, naftalenosulfonato, alquilnaftalenosulfonato, sal de productos condensados de formalina de sulfonato de naftaleno, sal de productos condensados de formalina de alquilnaftalenosulfonato, sal de ácidos grasos, policarbonato, poliacrilato, N-metilsarcosinato de ácido graso, sal de ácido de reina, polioxietileno alquil éter fosfato, polioxietileno alquilfenil éter fosfato y otros agentes tensioactivos aniónicos, hidrocioruro de laurilamina, hidrocioruro de estearil amina, hidrocioruro de oleil amina, acetato de estearil amina, acetato de estearil aminopropilamina, cloruro de alquil trimetilamonio, cloruro de alquil dimetil benzalconio y otras sales de alquilaminas y otros agentes tensioactivos catiónicos, agentes tensioactivos anfóteros tipo aminoácido o tipo betaína, etc. Cualquiera de estos agentes tensioactivos puede usarse solo o pueden combinarse dos o más tipos.

60 Aglutinantes y pegamentos incluyen, por ejemplo, carboximetilcelulosa y sus sales, dextrina, almidón soluble en agua, goma de xantano, goma guar, sacarosa, polivinilpirrolidona, goma arábiga, alcohol polivinílico, poli(acetato de vinilo), poliacrilato de sodio, polietilenglicol con un peso molecular promedio de 6.000 a 20.000, poli(óxidos de etileno) con un peso molecular promedio de 100.000 a 5.000.000, fosfolípidos (tales como cefalina, lecitina, etc.), polvo de celulosa, dextrina, almidón procesado, compuesto quelante de ácido poliaminocarboxílico, polivinilpirrolidona reticulada, copolímero de maleato y estireno, copolímero de ácido (met)acrílico, semiéster de polímero de alcohol polihidroxilado y anhídrido dicarboxílico, sal soluble en agua de poliestireno sulfonato, parafina, terpeno, resina de poliamida, poliacrilato, polioxietileno, cera, polivinilalquiléter, productos condensados de alquilfenol-formalina, emulsión de resinas sintéticas, etc.

Agentes espesantes incluyen, por ejemplo, goma de xantano, goma guar, goma de diután, carboximetil celulosa, polivinilpirrolidona, polímero de carboxivinilo, polímeros acrílicos, compuestos de almidón, polisacáridos y otros polímeros solubles en agua, bentonita de alto grado, sílice ahumada (hulla blanca) y otros polvos finos inorgánicos, etc.

5 Los agentes colorantes incluyen, por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, azul de prusia y otros pigmentos inorgánicos, tintes de alizarina, tintes azoicos, tintes metálicos de ftalocianina y otros tintes orgánicos, etc.

10 Agentes anticongelantes incluyen, por ejemplo, etilenglicol, dietilenglicol, propilenglicol, glicerina y otros alcoholes polihídricos, etc.

15 Agentes auxiliares para evitar formación de torta o promover la desintegración incluyen, por ejemplo, almidón, ácido algínico, manosa, galactosa y otros polisacáridos, polivinilpirrolidona, sílice pirógena (hulla blanca), goma éster, resina de petróleo, tripolifosfato de sodio, hexametáfosfato de sodio, sal de estearato de metal, polvo de celulosa, dextrina, copolímero de éster de metacrilato, polivinilpirrolidona, compuesto quelante de ácido poliaminocarboxílico, copolímero de estireno-isobutileno-maleato anhídrido sulfonado, copolímero de injerto de almidón-poliacrilonitrilo, etc.

20 Agentes estabilizantes incluyen, por ejemplo, zeolita, cal viva, óxido de magnesio y otros agentes secantes, compuestos fenólicos, compuestos de amina, compuestos de azufre, compuestos de fosfato y otros antioxidantes, compuestos de salicilato, compuestos de benzofenona y otros absorbentes de UV, etc.

Conservantes incluyen, por ejemplo, sorbato de potasio, 1,2-benzotiazolin-3-ona, etc.

25 Además, agentes dispersantes funcionales, butóxido de piperonilo y otros inhibidores de descomposición metabólica y otros agentes potenciadores de la actividad, propilenglicol y otros agentes anticongelantes, BHT y otros antioxidantes, absorbentes UV y otros agentes auxiliares también se pueden usar, según sea necesario.

30 La relación de mezcla del compuesto de ingrediente activo puede aumentarse o disminuirse según sea necesario, a un nivel seleccionado según se considere adecuado en un intervalo de 0,01 a 90 partes en peso con respecto a 100 partes en peso del insecticida agrícola/hortícola propuesto por la presente invención. En el caso de polvo, gránulos, emulsión o polvo humectable, por ejemplo, de 0,01 a 50 partes en peso (0,01 a 50 por ciento en peso con respecto al peso total del insecticida agrícola/hortícola) son adecuadas.

35 La frecuencia en la que se usa el insecticida agrícola/hortícola propuesto por la presente invención varía dependiendo de diversos factores, tal como el fin, insecto plaga a controlar, condición del crecimiento del cultivo, tendencia de generación de insectos plaga, el clima, condiciones medioambientales, forma del producto, método de aplicación, ubicación de aplicación, tiempo de aplicación, etc.; sin embargo, la cantidad deseada del compuesto de principio activo puede seleccionarse según se considere adecuado en un intervalo de 0,001 g a 10 kg o preferentemente de 0,01 g a 1 kg, por 10 aras.

45 El insecticida agrícola/hortícola propuesto por la presente invención puede mezclarse con otros insecticidas agrícolas/hortícolas, miticidas, nematocidas, bactericidas, agroquímicos biológicos, etc., con el fin de expandir el alcance de los insectos plaga a controlar y tiempos en los que se pueden controlar o para reducir la cantidad de químicos, o se puede mezclar con herbicidas, agentes controladores del crecimiento vegetal, fertilizantes, etc., dependiendo de la ubicación de aplicación.

50 Ejemplos de otros insecticidas, acaricidas y nematocidas agrícolas/hortícolas usados para los fines anteriormente mencionados incluyen, entre otros, metilcarbamato de 3,5-xililo (XMC), toxinas de proteínas cristalinas producidas por *Bacillus thuringiensis*, *Bacillus thuringiensis aizawai*, *Bacillus thuringiensis israelensis*, *Bacillus thuringiensis japonensis*, *Bacillus thuringiensis kurstaki*, *Bacillus thuringiensis tenebrionis*, BPMC, compuestos insecticidas derivados de toxina Bt, CPCBS (clorfenson), DCIP (diclorodiisopropil éter), D-D (1, 3-dicloropropeno), DDT, NAC, fosforotioato de O-4-dimetilsulfamoilfenilo y O, O-dietilo (DSP), fenilfosfonotioato de O-etilo y O-4- nitrofenilo (EPN), cianurato de tripropiliso (TPIC), acrinatrina, azadiractina, azinfos-metilo, acequinocilo, acetamiprid, acetoprol, acefato, abamectina, avermectina-B, amidoflumet, amitraz, alanycarb, aldcarb, aldoxicarb, aldrina, alfa-endosulfán, alfa-cipermetrina, albendazol, aletrina, isazofos, isamidofos, isoamidofos, isoxatién, isofenfos, isoprocab (MIPC), ivermectina, imiciafos, imidacloprid, imiprotrina, indoxacarb, esfenvalerato, etiofencarb, etién, etiprol, etoxazol, etofenprox, etopofos, etrimfos, emamectina, emamectina-benzoato, endosulfano, empentrina, oxamilo, oxidemetón-metilo, oxideprofos (ESP), oxibendazol, oxfendazol, oleato de potasio, oleato de sodio, cadusafos, cartap, carbarilo, carbosulfán, carbofurilo, gamma-cihalotrina, xililcarb, quinalfos, kinopreno, cinometionat, cloetocarb, clotianidina, clofentezina, cromafenozida, clorantraniliprol, cloretoxifos, clordimeform, clordano, clorpirifos, clorpirifos-metilo, clorfenapir, clorfenson, clorfenvinfos, clorfluazurón, clorobencilato, clorobenzoato, dicofol, salitién, cianofos (CYAP), diafentiurón, diamidafos, ciantraniliprol, tetra-cipermetrina, dienoclor, cienopirafen, dioxabenzofos, diofenolan, sigma-cipermetrina, diclofentién (ECP), cicloprotrina, diclorvos (DDVP), disulfotón, dimetofurilo, cihalotrina, cifenotrina, ciflutrina, diflubenzurón, ciflumetofeno, diflovidazina, cihexatina, cipermetrina, dimetilvinfos, dimetoato, dimeflutrina, silafluofeno, ciromazina, espinetoram, espinosad, espirodiclofeno, espirotetramat, espiromesifen, sulfluramid,

5 sulprofos, sulfoxaflor, zeta-cipermetrina, diazinón, tau-fluvalinato, dazomet, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiociclam, tiosultap, tiosultap-sodio, tionazina, tiometón, deet, dieldrina, tetraclorvinfos, tetradifon, tetrametilflutrina, tetrametrina, tebupirimfos, tebufenozida, tebufenpirad, teflutrina, teflubenzurón, demeton-S-metilo, temefos, deltametrina, terbufos, tralopiril, tralometrino, transflutrina, triazamato, triazurón, triclamida, triclorfón (DEP),  
 10 triflumurón, tolfenpirad, naled (BRP), nitiazina, nitenpiram, novalurón, noviflumurón, hidropreno, vaniliprol, vamidotión, paratión, paratión-metilo, halfenprox, halofenozida, bistriflurón, bisultap, hidrametilnon, almidón de hidroxipropilo, binapacril, bifenazato, bifentrina, pimetozina, piraclofos, pirafluprol, piridafentión, piridaben, piridalilo, pirifluquinazon, piriprol, piriproxifeno, pirimicarb, pirimidifen, pirimifos-metilo, piretrinas, fipronilo, fenazaquina, fenamifos, bromopropilato, fenitrotión (MEP), fenoxicarb, fenotiocarb, fenotrina, fenobucarb, fensulfotión, fentión (MPP), fentoato (PAP), fenvalerato, fenpiroximato, fenpropatrino, fenbendazol, fostiazato, formetanato, butatíofos, buprofezina, furatiocarb, praletrina, fluacipirim, fluazinam, fluazurón, fluensulfona, fluciclozurón, flucirinato, fluvalinato, flupirazofos, flufenimer, flufenoxurón, flufenzina, flufenprox, fluproxifeno, flubrocitrinato, flubendiamida, flumetrina, flurimfeno, protíofos, protrifenbuto, flonicamid, propafos, propargita (BPPS), profenofos, proflutrina, propoxur (PHC), bromopropilato, beta-ciflutrina, hexaflumurón, hexitiazox, heptenofos, permetrina, bencloctiaz,  
 15 bencloctiaz, bentsultap, benzoximato, benfuricarb, foxim, fosalona, fostiazato, fostietano, fosfamidón, fosfocarb, fosmet (PMP), polinactinas, formetanato, formotión, forato, aceite para máquinas, malatión, milbemicina, milbemicina-A, milbemectina, mecarbam, mesulfenfos, metomilo, metaldehído, metaflumizona, metamidofos, metamonio, metam-sodio, metiocarb, metidatión (DMTP), metilisotiocianato, metilneodecanamida, metilparatión, metoxadiazona, metoxiclor, metoxifenozida, metoflutrina, metopreno, metolcarb, meperflutrina, mevinfos, monocrotófos, monosultap, lambda-cihalotrina, rianodina, lufenurón, resmetrina, lepimectina, rotenona, clorhidrato de levamisol, óxido de fenbutatina, tartarato de morantel, bromuro de metilo, cihexatina, cianamida de calcio, polisulfuro de calcio, azufre, sulfato de nicotina, etc.

25 Entre los ejemplos de bactericidas agrícolas/hortícolas utilizados con fines similares se incluyen, entre otros, aureofungina, azaconazol, azitiram, acipetacs, acibenzolar, acibenzolar-S-metilo, azoxistrobina, anilazina, amisulbrom, ampropilfos, ametoctradina, alcohol de alilo, aldimorf, amobam, isotianilo, isovalediona, isopirazam, isoprotilana, ipconazol, iprodiona, iprovalicarb, iprobenfos, imazalilo, iminocadina, iminocadina-albesilato, iminocadina-triacetato, imibenconazol, uniconazol, uniconazol-P, eclomezol, edifenfos, etaconazol, etaboxam, etirimol, etem, etoxiquin, etridiazol, enestrobirina, epoxiconazol, oxadixilo, oxicarboxina, 8-quinolinolato de cobre  
 30 oxitetraciclina, cobre-oxinato, oxpoconazol, oxpoconazol-fumarato, ácido oxolínico, octilina, ofurace, orisastrobina, metam-sódico y otros esterilizantes del suelo, kasugamicina, carbamorf, carpropamid, carbendazima, carboxina, carvona, quinazamida, quinacetol, quinoxifen, quinometionato, captafol, captano, kiralaxilo, quinconazol, quintoceno, guazatina, cufraneb, cuprobam, gliodina, griseofulvina, climbazol, cresol, kresoxim-metilo, clozolinato, clotrimazol, clobentiazona, cloraniformetano, cloranilo, clorquinox, cloropicrina, clorfenazol, clorodinitronaftaleno, clorotalonilo, cloroneb, zarilamid, salicilanilida, ciazofamid, pirocarbonato de dietilo, dietofencarb, ciclafuramida, diclocimfet, diclozolina, diclobutrazol, diclofluanida, cicloheximida, diclomezina, diclorano, diclorofeno, diclona, disulfiram, ditalimfos, ditianona, diniconazol, diniconazol-M, zineb, dinocap, dinocetona, dinosulfón, dinoterbona, dinobutona, dinopentona, dipiritiona, difenilamina, difenoconazol, ciflufenamid, diflumetorim, ciproconazol, ciprodinilo, ciprofuram, cipendazol, simeconazol, dimetirimol, dimetomorf, cimoxanilo, dimoxistrobina, bromuro de metilo, ziram, siltiofam,  
 40 estreptomycin, espiroxamina, sultropen, sedaxano, zoxamida, dazomet, tiadiazina, tiadinilo, tiadifluor, tiabendazol, tioximida, tioclorfenfima, tiofanato, tiofanato-metilo, ticiofeno, tioquinol, cinometionat, tifluzamida, tiram, decafentina, tecnazeno, tecloftalam, tecoram, tetraconazol, debacarb, ácido deshidroacético, tebuconazol, tebufloquina, dodicina, dodina, sal de ácido dodecylbencenosulfónico de bis-etilendiamina cobre [II] (DBEDC), dodomorfo, drazoxolona, triadimenol, triadimefón, triazbutilo, triazóxido, triamifos, triarimol, triclamida, triciclazol, triticonazol, tridemorf, óxido de tributiltina, triflumizol, trifloxistrobina, triforina, tolifluanida, tolclofos-metilo, natamicina, nabam, nitrothal-isopropilo, nitroestireno, nuarimol, nonilfenol sulfonato de cobre, halacrinato, validamicina, valifenalato, proetina harpin, bixafen, picoxistrobina, picobenzamida, bitionol, bitertanol, hidroxiisoxazol, hidroxiisoxazol-potasio, binapacril, bifenilo, piperalina, himexazol, piraoxistrobina, piracarbolid, piraclostrobina, pirazofos, pirametostrobina, pirofenona, piridinitril, pirifenox, piribencarb, pirimetanilo, piroxiclor, piroxifur, piroquilón, vinclozólín, famoxadona, fenapanilo, fenamidona, fenaminosulf, fenarimol, fenitropan, fenoxanilo, ferimzona, ferbam, fentina, fenciclonilo, fenciprazamina, fenbuconazol, fenfuram, fenpropidina, fenpropimorfo, fenhexamid, ftalida, butiobato, butilamina, bupirimato, fuberidazol, blasticidina-S, furametpir, furalaxilo, fluacipirim, fluazinam, fluoxastrobina, fluotrimazol, fluopicolida, fluopiram, fluoroimida, furcarbanilo, fluxaproxad, fluquinconazol, furconazol, furconazol-cis, fludioxonilo, flusilazol, flusulfamida, flutianilo, flutolanilo, flutriafol, furfural, furmeciclox, flumetover, flumorf, proquinazid, procloraz,  
 55 procimidona, protiocarb, protioconazol, propamocarb, propiconazol, propineb, furofanato, probenazol, bromuconazol, hexaclorobutadieno, hexaconazol, hexiltiofos, betoxazina, benalaxilo, benalaxil-M, benodanilo, benomilo, pefurazato, benquinox, penconazol, benzamorf, pencicurón, ácido benzohidroxámico, bentalarón, bentiazol, bentiavalicarb-isopropilo, pentioprof, penflufeno, boscalida, fosdifeno, fosetilo-AL, polioxinon, polioxirim, policarbamato, folpet, formaldehído, aceite para máquinas, maneb, mancozeb, mandipropamid, miclozolina, miclobutanilo, mildiomicina, milneb, mecarbinzida, metasulfocarb, metazoxolona, metam, metam-sódico, metalaxilo, metalaxil-M, metiram, isotiocianato de metilo, mepildinocap, metconazol, metsulfovax, metfuroxam, metominostrobina, metrafenona, mepanipirim, mefenoxam, mepildinocap, mepronilo, mebenilo, iodometano, rabenzazol, cloruro de benzalconio, cloruro básico de cobre, sulfato de cobre básico, plata y otros bactericidas inorgánicos, hipoclorito de sodio, hidróxido cúprico, azufre humectable, polisulfuro de calcio, hidrogenocarbonato de  
 65 potasio, hidrogenocarbonato sódico, azufre, sulfato de cobre anhídrido, dimetilditiocarbamato de níquel, compuestos de 8-quinolinolato de cobre (oxina de cobre) y otros compuestos de cobre, sulfato de zinc, sulfato de cobre

pentahidratado, etc.

Asimismo, entre los ejemplos de herbicidas se incluyen, entre otros, 1-naftilacetamida, 2, 4-PA, 2,3,6-TBA, 2,4,5-T, 2,4,5-TB, 2,4-D, 2,4-DB, 2,4-DEB, 2,4-DEP, 3,4-DA, 3,4-DB, 3,4-DP, 4-CPA, 4-CPB, 4-CPP, MCP, MCPA, MCPA-tioetilo, MCPB, ioxinilo, aclonifeno, azafenidina, acifluorfenol, aziprotrina, azimsulfurón, asulam, acetocloro, atracina, atratón, anisurón, anilofos, aviglicinaa, ácido abscísico, amicarbazona, amidosulfurón, amitrol, aminociclopiraclor, aminopirialid, amibuzina, amiprofos-metilo, ametridiona, ametrina, alaclor, allidoclor, aloxidima, alorac, isourón, isocarbamida, isoxaclorol, isoxapirifop, isoxaflutol, isoxabeno, isocil, isonorurón, isoproturón, isopropalina, isopolinato, isometiozina, inabenfida, ipazina, ipfencarbazona, iprimidama, imazaquín, imazapic, imazapir, imazametapir, imazametabenz, imazametabenz-metilo, imazamox, imazetapir, imazosulfurón, indaziflam, indanofano, ácido indolbutírico, uniconazol-P, eglinazina, esprocarb, etametsulfurón, etametsulfuron-metilo, etalfluralina, etiolato, eticlozato-etilo, etidimurón, etinaofeno, etefon, etoxisulfurón, etoxifen, etnipromida, etofumesato, etobenzanida, epronaz, erbon, endothal, oxadiazón, oxadiargilo, oxaziclomefona, oxasulfurón, oxapirazona, oxifluorfenol, orizalina, ortosulfamuron, orbencarb, cafenstrol, cambendiclor, carbasulam, carfentrazona, carfentrazona-etilo, karbutilato, carbetamida, carboxazol, quizalofop, quizalofop-P, quizalofop-etilo, xilaclor, quinoclamina, quinonamida, quinclorac, quinmerac, cumilurón, clodinato, glifosato, glufosinato, glufosinato-P, credazina, cletodim, cloxifonac, clodinafop, clodinafop-propargilo, clorotolurón, clopiralid, cloproxidim, cloprop, clorbromurón, clofop, clomazona, clometoxinilo, clometoxifeno, clomeprop, clorazifop, clorazina, cloransulam, cloranocrilo, clorambeno, cloransulam-metilo, cloridazon, clorimuron, clorimurón-etilo, clorsulfurón, clorthal, clortiamida, clortolurón, clornitrofenol, clorfenaco, clorfenprop, clorbufam, clorflurazol, clorflurenol, clorprocarb, clorprofam, clorquet, cloreturón, cloroxinilo, cloroxurón, cloropón, saflufenacilo, cianazina, cianatrina, di-alato, diuron, dietamquat, dicamba, ciclurón, cicloato, cicloxidim, diclosulam, ciclosulfamuron, diclorprop, diclorprop-P, diclobenilo, diclofop, diclofop-metilo, diclormato, dicloralurea, diquat, cisanilida, disul, sidurón, ditiopir, dinitramina, cinidon-etilo, dinosam, cinosulfuron, dinoseb, dinoterb, dinofenato, dinoprop, cihalofop-butilo, difenamida, difenoxurón, difenopenteno, difenzoquat, ciburtrina, ciprazina, ciprazol, diflufenican, diflufenzopir, dipropetrina, cipromid, ciperquat, giberelina, simazina, dimexano, dimetaclor, dimidazona, dimetametetrín, dimetenamida, simetrina, simetón, dimepiperato, dimefurón, cinmetilina, swep, sulglicapina, sulcotriona, sulfalato, sulfentrazona, sulfosulfurón, sulfometuron, sulfometuron-metilo, sebumeton, setoxidim, sebutilazina, terbacilo, daimuron, dazomet, dalapón, tiazaflurón, tiazopir, tiencarbazona, tiencarbazona-metilo, tiocarbazil, tioclorim, tiobencarb, tidiazimin, tidiazuron, tifensulfuron, thifensulfuron-metilo, desmedifam, desmetrina, tetraflurón, thenilclor, tebutam, tebutiurón, terbumeton, tepraloxidim, tefuriltriona, tembotriona, delaclor, terbacilo, terbucarb, terbuclor, terbutilazina, terbutrina, topramezona, tralkoxidim, triaziflam, triasulfuron, tri-alato, trietazina, tricamba, triclopir, tridifano, tritac, tritosulfurón, triflusulfuron, triflusulfuron-metilo, trifluralina, trifloxisulfuron, tripropindano, tribenuron-metilo, tribenuron, trifop, trifopsima, trimeturón, naptalam, naproanilida, napropamida, nicosulfuron, nitalina, nitrofenol, nitrofluorfenol, nipiraclorfenol, neburón, norflurazón, norurón, barban, paclobutrazol, paraquat, paraflurón, haloxidina, haloxifop, haloxifop-P, haloxifop-metilo, halosulfuron, halosulfuron-metilo, picloram, picolinaféeno, biciclopirona, bispiribac, bispiribac-sodio, pidanona, pinoxaden, bifenox, piperofos, himexazol, piraclonilo, pirasulfotol, pirazoxifen, pirazosulfuron, pirazosulfuron-etilo, pirazolato, bilanafos, piraflufen-etilo, pirioclor, piridafol, piritiobac, piritiobac-sódico, piridato, pirifitalid, piributicarb, piribenzoxim, pirimisulfano, primisulfurón, piriminobac-metil, piroxasulfona, piroxsulam, fenasulam, fenisofam, fenurón, fenoxasulfona, fenoxaprop, fenoxaprop-P, fenoxaprop-etilo, fenotirol, fenoprop, fenobenzurón, fentiafop, fenteracol, fentrazamida, fenmedifam, fenmedifam-etilo, butacloro, butafenacilo, butamifos, butiurón, butidazol, butilato, buturón, butenaclor, butoxidim, butralina, flazasulfurón, flamprop, furiloxifeno, prinaclor, primisulfuron-metilo, fluzafop, fluzafop-P, fluzafop-butilo, fluzolato, fluroxipir, fluotiurón, fluometuron, fluoroglicofeno, fluorocloridona, fluorodifeno, fluoronitrofenol, fluoromidina, flucarbazona, flucarbazona de sodio, flucloralina, flucetosulfurón, flutiacet, flutiacet-metilo, flupirsulfuron, flufenacet, flufenican, flufenpir, flupropacilo, flupropanato, flupoxam, flumioxazina, flumiclorac, flumiclorac-pentilo, flumipropina, flumezina, fluometuron, flumetsulam, fluridona, flurtamona, fluroxipir, pretilacloro, proxan, proglinazina, proclazina, prodiamina, prosulfalina, prosulfurón, prosulfocarb, propaquizafop, propacloro, propazina, propanilo, propizamida, propisoclor, prohidrojasmona, propirisulfurón, profam, profluzol, profluralina, prohexadiona-calcio, propoxicarbazona, propoxicarbazona de sodio, profoxidim, bromacilo, brompirazona, prometrina, prometona, bromoxinilo, bromofenoxim, bromobutida, bromobonilo, florasulam, hexacloroacetona, hexazinona, petoxamid, benazolin, penoxsulam, pebulato, beflubutamida, vernolato, perfluidona, bencarbazona, benzadox, benzipram, bencilaminopurina, benztiaturón, benzfendazona, bensulida, bensulfurón-metilo, benzoilprop, benzobiciclón, benzofenap, benzofluor, bentazona, pentanoclor, bentiocarb, pendimetalina, pentoxazona, benfluralina, benfuresato, fosamina, fomesafen, foramsulfuron, forclorfenuron, hidrazida maleica, mecoprop, mecoprop-P, medinoterb, mesosulfuron, mesosulfuron-metilo, mesotriona, mesoprazina, metoprotina, metazacloro, metazol, metazosulfurón, metabenztiaturón, metamitrón, metamifop, metam, metalpropalina, metiurón, metiozolina, metiobencarb, metildimrona, metoxurón, metosulam, metsulfuron, metsulfurón-metilo, metflurazona, metobromurón, metobenzurón, metometona, metolacloro, metribuzina, cloruro de mepiquat, mafenacet, mefluidida, monalida, monisourón, monurón, ácido monocloroacético, monolinurón, molinato, morfamquat, iodosulfuron, yodosulfurón metil sodio, iodobonilo, iodometano, lactofen, linurón, rimsulfurón, lenacilo, rodetanilo, peróxido de calcio, bromuro de metilo, etc.

Asimismo, se pueden esperar efectos similares mezclándose con agroquímicos biológicos, tales como virus de la polihedrosis nuclear (NPV), virus de la granulosis (GV), virus de la polihedrosis citoplásmica (CPV), virus entomopoxi (EPV) y otros agentes víricos, *Monacrosporium phymatophagum*, *Steinernema carpocapsae*, *Steinernema kushidai*, *Pasteuria penetrans* y otros agroquímicos microbianos usadas como insecticidas o nematocidas, *Trichoderma*

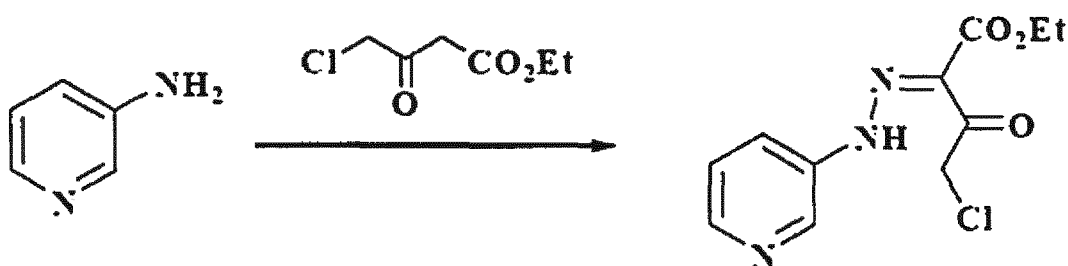
lignorum, Agrobacterium radiobacter, Erwinia carotovora apatogénica, Bacillus subtilis y otros agroquímicos microbianos usados como bactericidas, Xanthomonas campestris y otros agroquímicos biológicos usados como herbicidas, y similares.

- 5 Además, es posible mezclarse con tales agroquímicos biológicos como Onshitsutsuyakobachi (*Encarsia formosa*), Koremanaburabachi (*Aphidius colemani*), Shokugatamabae (*Aphidoletes aphidimyza*), Isaeahimekobachi (*Diglyphus isaea*), Hamogurikomayubachi (*Dacnusa sibirica*), Chirikaburidani (*Phytoseiulus persimilis*), Kukumerisukaburidani (*Amblyseius cucumeris*), Namihimehanakamemushi (*Orius sauteri*) y otros depredadores naturales, Beauveria brongniartii y otros agroquímicos microbianos, (Z)-10-tetradecenil=acetato, (E,Z)-4,10-tetradecadienil=acetato, (Z)-8-dodecenil=acetato, (Z)-11-tetradecenil=acetato, (Z)-13-icosen-10-ona, 14-metil-1-octadeceno y otros agentes de feromonas.

A continuación, se muestran ejemplos representativos de la presente invención; debe destacarse, sin embargo, que la presente invención no se limita a estos ejemplos.

15

Ejemplo de referencia 1. Producción de Butanoato de Etil (E)-4-cloro-3-oxo-2-(2-piridina-3-il)hidrazono



- 20 Se añadió 3-amino piridina (7,52 g, 80,0 mmol) a ácido 6N-clorhídrico (27 ml, 160 mmol). En esta solución, se agregó a gotas solución acuosa (40 ml) de nitrito de sodio (5,52 g, 80,0 mmol) manteniendo a temperatura a 3 °C o inferior, para provocar y mantener la reacción durante 20 minutos. Después de ello, se agregó acetato de etil 4-cloroaceto (13,2 g, 80,0 mmol), acetato de etilo (30 ml) y acetato de sodio (15,0 g, 183 mmol), para provocar y mantener la reacción durante 1 hora a 0 °C. Se agregaron acetato de etilo y agua a la solución de reacción y se extrajo una capa orgánica con acetato de etilo, después de lo cual, se lavó la capa orgánica con agua con sal saturada, se secó usando sulfato de magnesio anhidrido y, a continuación, se concentró al vacío. El residuo se refinó por cromatografía en columna sobre gel de sílice, para obtener butanoato de etil (E)-4-cloro-3-oxo-2-(2-piridina-3-il)hidrazono (17,8 g, 66,0 mmol, 82 %). RMN-1H δ: 13,02 (1H, s), 8,67-8,63 (1H, m), 8,47-8,44 (1H, m), 7,75-7,69 (1H, m), 7,41-7,35 (1H, m), 4,69 (2H, m), 4,41 (2H, c), 1,42 (3H, t)

30

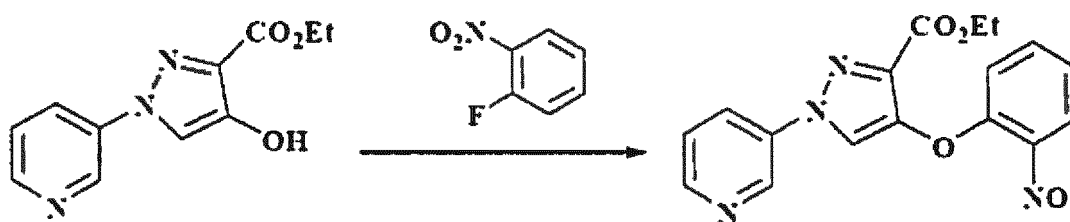
Ejemplo de referencia 2. Producción de Etil 4-hidroxi-1-(piridina-3-il)-1H-pirazol-3-carboxilato



- 35 Se agregó *tert*-butoxi potasio (7,84, 70,0 mmol) a solución de THF (70 ml) de butanoato de etil (E) 4-cloro-3-oxo-2-(2-piridina-3-il)hidrazono (17,0 g, 63,0 mmol) a 0 °C, para provocar y mantener la reacción durante 1 hora a temperatura ambiente. Se agregó una solución acuosa de cloruro de amonio saturado a la solución de reacción y se extrajo una capa orgánica con acetato de etilo, después de lo cual, se lavó la capa orgánica con agua con sal saturada, se secó usando sulfato de magnesio anhidrido y, a continuación, se concentró al vacío. El cristal obtenido se lavó con acetato de hexano/etilo y, a continuación, se filtró, para obtener etil 4-hidroxi-1-(piridina-3-il)-1H-pirazol-3-carboxilato (12,0 g, 51,4 mmol, 82 %). Punto de fusión: 135-137 °C.

40

Ejemplo 1. Producción de Etil 4-(2-nitrofenoxi)-1-(piridina-3-il)-1H-pirazol-3-carboxilato

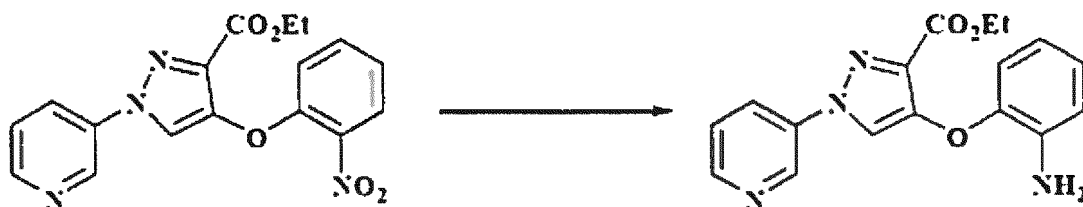


- 5 Se agregó 2-fluoronitrobenzono (1,48 g, 10,3 mmol) y carbonato de potasio (1,55 g, 11,2 mmol) a solución de acetonitrilo (40 ml) de etil 4-hidroxi-1-(piridina-3-il)-1H-pirazol-3-carboxilato (2,00 g, 8,58 mmol) para provocar y mantener la reacción durante 1 hora con calentamiento hasta reflujo. La solución de reacción se devolvió a temperatura ambiente y, a continuación, se filtró usando Celite y, el filtrado se concentró al vacío. El cristal obtenido se lavó con acetato de hexano/MTBE y, a continuación, se filtró, para obtener etil 4-(2-nitrofenoxi)-1-(piridina-3-il)-1H-pirazol-3-carboxilato (2,81 g, 7,92 mmol, 92 %). Punto de fusión: 136-138 °C.

Ejemplo 2.

Producción de Etil 4-(2-aminofenoxi)-1-(piridina-3-il)-1H-pirazol-3-carboxilato

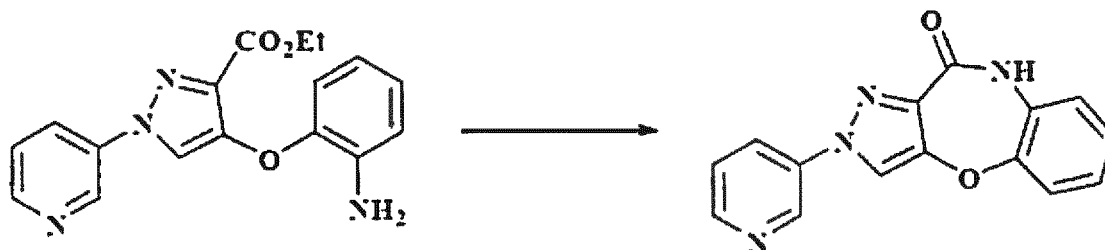
15



- 20 Se agregó cloruro de amonio (0,21 g, 3,95 mmol) y polvo de hierro electrolítico (1,32 g, 23,7 mmol) a solución de etanol/agua (20 ml/10 ml) de etil 4-(2-nitrofenoxi)-1-(piridina-3-il)-1H-pirazol-3-carboxilato (2,80 g, 7,90 mmol) para provocar y mantener la reacción durante 1 hora con calentamiento hasta reflujo. La solución de reacción se devolvió a temperatura ambiente y, a continuación, se filtró usando Celite y, el filtrado se concentró al vacío. Se agregó acetato de etilo y agua a esta solución y se extrajo una capa orgánica con acetato de etilo, después de lo cual, se lavó la capa orgánica con agua con sal saturada, se secó usando sulfato de magnesio anhidrido y, a continuación, se concentró al vacío. El cristal obtenido se lavó con acetato de hexano/MTBE y, a continuación, se filtró, para obtener etil 4-(2-aminofenoxi)-1-(piridina-3-il)-1H-pirazol-3-carboxilato (1,88 g, 5,80 mmol, 73 %). Punto de fusión: 120-122 °C.

Ejemplo 3.

30 Producción de 2-(Piridina-3-il)-2H-Benzo[B]Pirazolo[3,4-f][1,4]Oxazepina-10 (9H)-ona (compuesto n.º 1-1)



- 35 Se agregó terc-butoxi potasio (1,44, 12,8 mmol) a solución de THF (40 ml) de etil 4-(2-aminofenoxi)-1-(piridina-3-il)-1H-pirazol-3-carboxilato (1,88 g, 5,80 mmol) a 0 °C, para provocar y mantener la reacción durante 1 hora a temperatura ambiente. Se agregó una solución acuosa de cloruro de amonio saturado a la solución de reacción y se extrajo una capa orgánica con acetato de etilo, después de lo cual, se lavó la capa orgánica con agua con sal saturada, se secó usando sulfato de magnesio anhidrido y, a continuación, se concentró al vacío. El cristal obtenido se lavó con acetato de hexano/MTBE y, a continuación, se filtró, para obtener 2-(piridina-3-il)-2H-benzo[b]pirazolo[3,4-f][1,4]oxazepina-10 (9H)-ona (1,39 g, 4,99 mmol, 86 %). Punto de fusión: 259-262 °C.

40

## Ejemplo 4.

Producción de 9-Metil-2-(Piridina-3-il)-2H-Benzo[B]Pirazolo[3,4-F][1,4]Oxazepina-10 (9H)-Ona (compuesto n.º 1-2)



5

Se agregó hidruro de sodio (60%, 0,036 g, 0,91 mmol) a solución de DMF (8 ml) de 2-(piridina-3-il)-2H-benzo[b]pirazolo[3,4-f][1,4]oxazepina-10 (9H)-ona (0,18 g, 0,65 mmol) a 0 °C, para provocar y mantener la reacción durante 10 minutos. Se agregó yoduro de metilo (0,13 g, 0,91 mmol), para provocar y mantener la reacción durante 1 hora a temperatura ambiente. Se agregó una solución acuosa de cloruro de amonio saturado a la solución de reacción y se extrajo una capa orgánica con acetato de etilo, después de lo cual, se lavó la capa orgánica con agua con sal saturada, se secó usando sulfato de magnesio anhidrido y, a continuación, se concentró al vacío. El residuo se refinó por cromatografía en columna sobre gel de sílice y el cristal obtenido se lavó con acetato de hexano/MTBE y, a continuación, se filtró, para obtener 9-metil-2-(piridina-3-il)-2H-benzo[b]pirazolo[3,4-f][1,4]oxazepina-10 (9H)-ona (0,13 g, 0,46 mmol, 71 %). Punto de fusión: 195-196 °C.

10

15

## Ejemplo 5.

Producción de 4-Hidroxi-N-Metil-1-(Piridina-3-il)-1H-Pirazol-3-Carboxamida

20

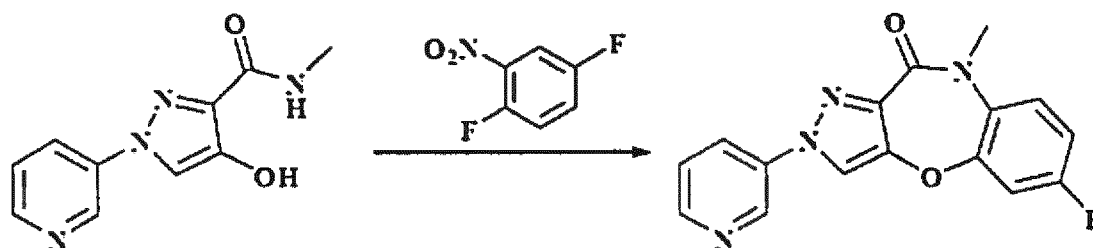


25

Se agregó solución de metilamina 40 % de metanol (10 ml) a la solución de metanol (10 ml) de etil 4-hidroxi-1-(piridina-3-il)-1H-pirazol-3-carboxilato (1,00 g, 4,29 mmol) para provocar y mantener la reacción durante 8 horas. La solución de reacción se concentró al vacío y el cristal obtenido se lavó con hexano/acetona y, a continuación, se filtró, para obtener 4-hidroxi-N-metil-1-(piridina-3-il)-1H-pirazol-3-carboxamida (0,94 g, 4,29 mmol, 100 %). Punto de fusión: 200-201 °C.

30

Ejemplo 6. Producción de 6-Fluoro-9-Metil-2-(Piridina-3-il)-2H-Benzo[B]Pirazolo[3,4-F][1,4]Oxazepina-10 (9H)-Ona (compuesto n.º 1-11)



35

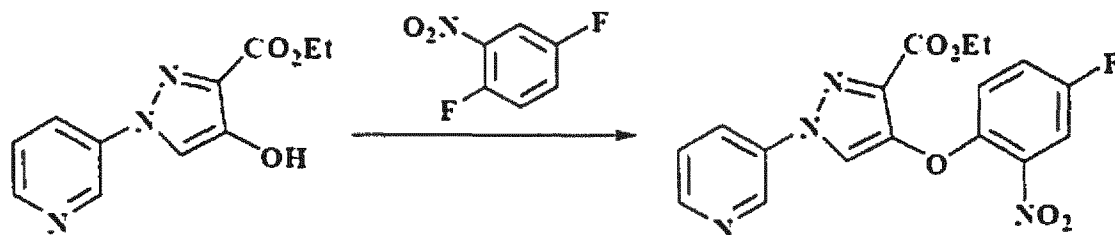
Se agregó carbonato de potasio (0,21 g, 1,52 mmol) y 2,5-difluoronitrobenzene (0,15 g, 0,96 mmol) a solución de acetonitrilo (20 ml) de 4-hidroxi-N-metil-1-(piridina-3-il)-1H-pirazol-3-carboxamida (0,15 g, 0,69 mmol) para provocar y mantener la reacción durante 7 horas con calentamiento hasta reflujo. La solución de reacción se devolvió a temperatura ambiente, después de lo cual los sólidos depositados se disolvieron con THF/metanol y, a continuación, se filtraron usando Celite y el filtrado se concentró al vacío. El residuo se refinó por cromatografía en columna sobre gel de sílice, para obtener 6-fluoro-9-metil-2-(piridina-3-il)-2H-benzo[b]pirazolo[3,4-f][1,4]oxazepina-10 (9H)-ona (0,14 g, 0,44 mmol, 64 %). Punto de fusión: 225-226 °C.

40



## Ejemplo 7.

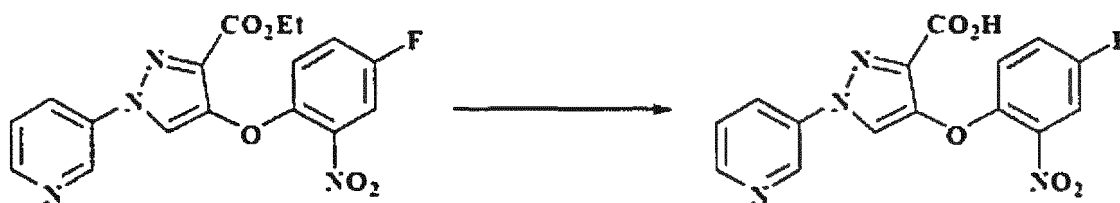
Producción de Etil 4-(4-fluoro-2-nitrofenoxi)-1-(piridina-3-il)-1H-pirazol-3-carboxilato



10 Se agregó 2,5-difluoronitrobenzene (2,70 g, 17,0 mmol) y carbonato de potasio (2,35 g, 17,0 mmol) a solución de acetonitrilo (100 ml) de etil 4-hidroxi-1-(piridina-3-il)-1H-pirazol-3-carboxilato (3,05 g, 13,1 mmol) para provocar y mantener la reacción durante 2 horas con calentamiento hasta reflujo. La solución de reacción se devolvió a temperatura ambiente y, a continuación, se filtró usando Celite y, el filtrado se concentró al vacío. El cristal obtenido se lavó con acetato de hexano/MTBE y, a continuación, se filtró, para obtener etil 4-(4-fluoro-2-nitrofenoxi)-1-(piridina-3-il)-1H-pirazol-3-carboxilato (4,78 g, 12,8 mmol, 98 %). Punto de fusión: 133-135 °C.

## Ejemplo 8.

Producción de 4-(4-fluoro-2-nitrofenoxi)-1-(piridina-3-il)-1H-pirazol-3-carboxilato

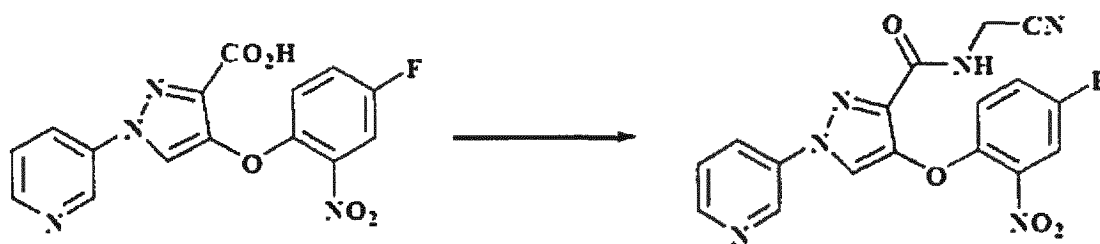


20 Se agregó monohidrato de hidróxido de litio (1,07 g, 25,6 mmol) a solución de metanol/agua (50 ml/10 ml) de etil 4-(4-fluoro-2-nitrofenoxi)-1-(piridina-3-il)-1 H-pirazol-3-carboxilato (4,77 g, 12,8 mmol) para provocar y mantener la reacción durante 16 horas. Se agregó ácido 6N-clorhídrico a la solución de reacción para producir un ácido medio, después de lo cual, la solución de reacción se concentró al vacío. El cristal obtenido se lavó con agua, se filtró y se secó usando un secador de especies, para obtener 4-(4-fluoro-2-nitrofenoxi)-1-(piridina-3-il)-1H-pirazol-3-carboxilato. Esto se usó directamente para la reacción en el Ejemplo 9. RMN-1H(d6-DMSO)  $\delta$ : 9,15-9,12 (1H, m), 8,94 (1H, s), 8,66-8,62 (1H, m), 8,32-8,26 (1H, m), 8,05 (1H, dd), 7,66-7,60 (1H, m), 7,56 (1H, ddd), 7,34 (1H, dd)

25

## Ejemplo 9.

30 Producción de N-(Cianometil)-4-(4-Fluoro-2-Nitrofenoxi)-1-(Piridina-3-il)-1 H-Pirazol-3-Carboxamida



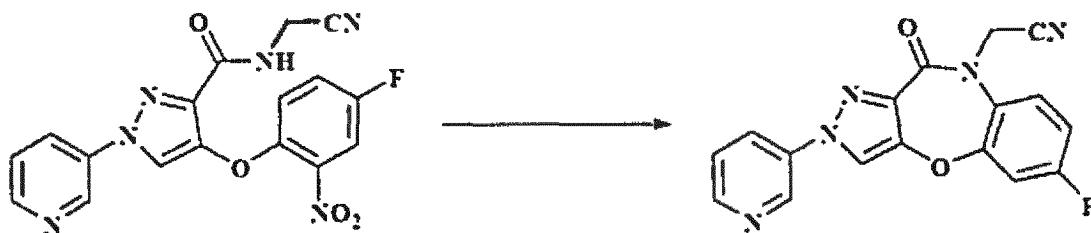
35 Se agregó trietil amina (5,38 g, 53,2 mmol), amino clorhidrato de acetonitrilo (1,80 g, 19,5 mmol) y yoduro de 2-cloro-1-metil-piridinio (5,08 g, 19,5 mmol) a solución de THF/DMF (40 ml/40 ml) del 4-(4-Fluoro-2-Nitrofenoxi)-1-(Piridina-3-il)-1H-Pirazol-3-Carboxilato obtenido en el Ejemplo 8, para provocar y mantener la reacción durante 18 horas. A la solución de reacción, se le añadió agua, y se extrajo una capa orgánica con acetato de etilo, después de lo cual, se lavó la capa orgánica con agua con sal saturada, se secó usando sulfato de magnesio anhidrido y, a continuación, se concentró al vacío. El residuo se refinó gruesamente por cromatografía en columna sobre gel de sílice, para obtener N-(cianometil)-4-(4-fluoro-2-nitrofenoxi)-1-(piridina-3-il)-1H-pirazol-3-carboxamida. Esto se usó directamente para la reacción en el Ejemplo 10. RMN- 1 H  $\delta$ : 8,99-8,95 (1H, m), 8,70-8,65 (1H, m), 8,08-8,03 (1H, m), 7,94 (1H, s), 7,76 (1H, dd), 7,51-7,46 (1H, m), 7,33-7,23 (2H, m), 7,19 (1H, dd), 4,36 (2H, d)

40

## Ejemplo 10.

Producción de acetonitrilo de 2-(6-Fluoro-10-Oxo-2-(Piridina-3-il)-2H-Benzo[B]Pirazolo[3,4-F][1,4]Oxazepina-9 (10H)-il (compuesto n.º 1-13)

5

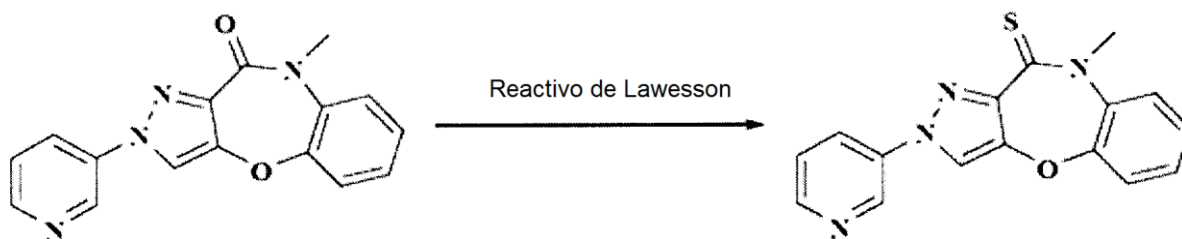


Se agregó carbonato de potasio (5,06 g, 36,6 mmol) a la solución de acetonitrilo (100 ml) del N-(cianometil)-4-(4-fluoro-2-nitrofenoxi)-1-(piridina-3-il)-1H-pirazol-3-carboxamida obtenido en el Ejemplo 9, para provocar y mantener la reacción durante 2 horas con calentamiento hasta reflujo. La solución de reacción se devolvió a temperatura ambiente, después de lo cual los sólidos depositados se disolvieron con THF y, a continuación, se filtraron usando Celite y el filtrado se concentró al vacío. El cristal obtenido se lavó con acetato de hexano/MTBE y, a continuación, se filtró, para obtener acetonitrilo de 2-(6-fluoro-10-oxo-2-(piridina-3-il)-2H-benzo[b]pirazolo[3,4-f][1,4]oxazepina-9 (10H)-il (3,67 g, 10,9 mmol, 85 % (3 etapas)). Punto de fusión: 212-214 °C.

10

15

Ejemplo 11. Producción de 9-Metil-2-(Piridina-3-il)-2H-Benzo[B]Pirazolo[3,4-F][1,4]Oxazepina-10 (9H)-Tiona (compuesto n.º 2-2)



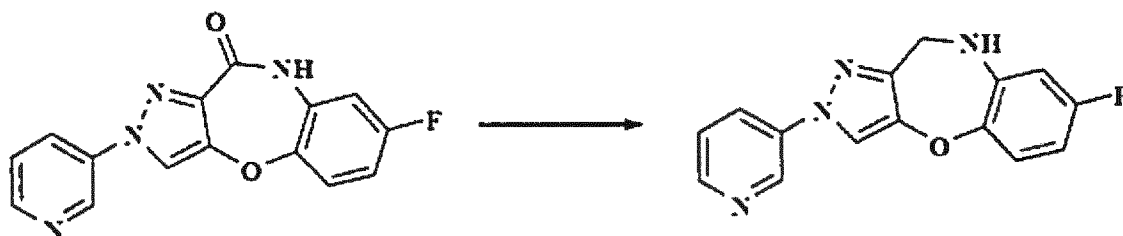
20

Se agregó reactivo de Lawesson (0,15, 0,37 mmol) a solución de tolueno (10 ml) de 9-metil-2-(piridina-3-il)-2H-benzo[b]pirazolo[3,4-f][1,4]oxazepina-10(9H)-ona (0,091 g, 0,31 mmol) y la mezcla se agitó durante 4 horas con calentamiento hasta reflujo. La solución de reacción se devolvió a temperatura ambiente y, a continuación, se filtró usando Celite y, el filtrado se concentró al vacío. El residuo se refinó por cromatografía en columna sobre gel de sílice, para obtener 9-metil-2-(piridina-3-il)-2H-benzo[b]pirazolo[3,4-f][1,4]oxazepina-10 (9H)-tiona (0,064 g, 0,21 mmol, 66 %). Punto de fusión: 206-210 °C.

25

Ejemplo 12. Producción de 7-Fluoro-2-(Piridina-3-il)-9,10-Dihidro-2H-Benzo[B] Pirazolo[3,4-F][1,4]Oxazepina (compuesto n.º 3-6)

30



Se agregó  $\text{LiAlH}_4$  (0,046 g, 1,01 mmol) a solución de THF (10 ml) de 7-fluoro-2-(piridina-3-il)-2H-benzo[b]pirazolo[3,4-f][1,4]oxazepina-10 (9H)-ona (0,15 g, 0,51 mmol) a 0 °C y la mezcla se agitó durante 20 horas a temperatura ambiente. La solución de reacción se enfrió a 0 °C, después de lo cual se agregó agua (0,1 ml), 15 % de solución acuosa de NaOH (0,1 ml) y agua (0,1 ml) uno por uno y la mezcla se agitó durante 1,5 horas a temperatura ambiente. La solución resultante se filtró usando Celite y el filtrado se concentró al vacío. El residuo se refinó por cromatografía en columna sobre gel de sílice, para obtener 7-fluoro-2-(piridina-3-il)-9,10-dihidro-2H-benzo[b]pirazolo[3,4-f][1,4]oxazepina (0,072 g, 0,25 mmol, 50 %). Punto de fusión: 186-188 °C.

35

40

De igual modo, los compuestos n.º 14-1 a 14-5 y 15-1 a 15-8 se produjeron según las condiciones descritas en los

Ejemplos 1 a 4.

Los ejemplos de productos se muestran a continuación; debe destacarse, sin embargo, que los productos no quedan limitados estos ejemplos. En los Ejemplos de Producto, "partes" se refiere a "partes en peso".

5 Ejemplo de Producto 1.

Compuesto según la presente invención	10 partes
Xileno	70 partes
N-metil-pirrolidona	10 partes
Mezcla de polioxietilen nonil fenil éter y alquilbencenosulfonato de calcio	10 partes

10 Los anteriores ingredientes se mezclaron homogéneamente y se disolvieron y se realizaron en una emulsión.

Ejemplo de Producto 2.

Compuesto según la presente invención	3 partes
Polvo de arcilla	82 partes
Polvo de tierra de diatomeas	15 partes

15 Los anteriores ingredientes se mezclaron homogéneamente y se trituraron, y se realizaron en una emulsión.

Ejemplo de Producto 3.

Compuesto según la presente invención	5 partes
Polvo mezclado de bentonita y arcilla	90 partes
Lignosulfonato de calcio	5 partes

20 Los anteriores ingredientes se mezclaron homogéneamente y se amasaron, con una cantidad adecuada de agua añadiéndose a estos, después de lo cual, la mezcla amasada se granuló y seco y se produjo en gránulos.

Ejemplo de Producto 4.

Compuesto según la presente invención	20 partes
Caolina y ácido silícico de alta dispersión sintético	75 partes
Mezcla de polioxietilen nonil fenil éter y alquilbencenosulfonato de calcio	5 partes

25 Los anteriores ingredientes se mezclaron homogéneamente y se trituraron, y se realizaron en un polvo humectable.

Ejemplo de prueba 1.

30 Ejemplo de valor preventivo contra áfido verde del melocotón (*Myzus persicae*)

35 Se plantaron coles chinas en macetas de plástico, cada una con un tamaño de 8 cm de diámetro y 8 cm de altura, después de lo cual se propagaron áfidos verdes del melocotón y se examinó el número de insectos parasíticos en cada macetero. Un compuesto de oxazepina o sal del mismo expresado por la Fórmula General (I) según la presente invención se dispersó en agua y la dispersión se diluyó a 500 ppm en forma de un reactivo, después de lo cual, el reactivo se pulverizó sobre los tallos y hojas de las coles chinas en los maceteros y se dejó secar al viento y los maceteros se mantuvieron en un invernadero y el sexto día después de pulverizar el reactivo, se examinó el número de áfidos verdes del melocotón vivos parasíticamente en cada col china y se calculó el valor preventivo basándose en la fórmula a continuación y se realizó un criterio según los criterios a continuación.

40 Valor preventivo =  $100 - \left\{ \frac{T \times Ca}{Ta \times C} \right\} \times 100$

Ta: Número de insectos parasíticos dentro de la zona de tratamiento antes de la pulverización  
 T: Número de insectos parasíticos dentro de la zona de tratamiento después de la pulverización  
 Ca: Número de insectos parasíticos dentro de la zona sin tratamiento antes de la pulverización  
 45 C: Número de insectos parasíticos dentro de la zona sin tratamiento después de la pulverización

Criterios de valoración

A---Valor preventivo: 100 %

B---Valor preventivo: 99 % ~ 90 %

5 C---Valor preventivo: 89 % ~ 80 %

D---Valor preventivo: 79 % ~ 50 %

Ejemplo de prueba 2. Prueba de eficacia insecticida contra salta hoja marrón pequeño (*Laodelphax striatella*)

10 Un compuesto de oxazepina o sal del mismo expresado por la Fórmula General (I) según la presente invención se dispersó en agua y la dispersión se diluyó a 500 ppm en forma de un reactivo, después de lo cual, las plantas de  
15 arroz cultivadas a partir de semillas (variedad: Nipponbare) se empaparon en el reactivo durante 30 segundos y se secaron al viento y, a continuación, se colocaron en tubos de ensayo de vidrio, cada uno de los cuales se inoculó con larvas de 10 (tercer) estadio de salta hojas marrones pequeños y se sellaron con algodón y ocho días después de la inoculación, se examinó el número de insectos vivos y el de los insectos muertos y la mortalidad de insectos corregida se calculó basándose en la fórmula a continuación y se realizó el criterio según los criterios a continuación.

Mortalidad de insectos corregida (%) = (tasa de supervivencia en zona sin tratamiento - tasa de supervivencia en zona de tratamiento) / (tasa de supervivencia en zona sin tratamiento) x 100

20 Criterios de valoración---Mismos que en el Ejemplo 1.

25 Los resultados muestran que, en el ejemplo de prueba 1, los compuestos n.º 1-1, 1-2, 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-19, 1-22, 1-23, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-37, 1-38, 1-39, 1-40, 1-41, 1-42, 1-44, 1-45, 1-46, 1-47, 1-48, 1-50, 1-51, 1-52, 1-53, 1-55, 1-56, 1-57, 1-58, 1-62, 1-67, 1-68, 1-70, 1-71, 1-73, 1-74, 1-75, 1-76, 1-77, 1-79, 1-80, 1-81, 1-83, 1-85, 1-86, 2-1, 2-2, 2-5, 3-1, 3-2, 3-5, 3-6, 3-9, 4-10, 5-2, 6-2, 6-3, 6-5, 6-6, 6-7, 6-18, 7-1, 7-2, 8-2, 8-3, 8-4, 8-5, 8-6, 8-7, 8-8, 8-9, 8-10, 8-11, 8-12, 8-13, 8-14, 8-15, 8-16, 8-17, 8-18, 8-19, 8-20, 8-22, 8-24, 8-25, 8-26, 8-27, 8-28, 8-29, 8-30, 8-31, 8-32, 8-33, 8-34, 8-35, 8-36, 8-37, 8-38, 8-39, 8-40, 8-41, 8-42, 8-43, 8-44, 8-45, 8-46, 8-47, 8-48, 8-49, 8-50, 8-51, 8-52, 8-53, 8-54, 8-55, 8-56, 30 8-59, 8-60, 8-61, 8-62, 8-63, 8-65, 8-67, 8-68, 8-69, 8-70, 8-71, 8-72, 8-73, 8-74, 8-75, 8-77, 8-78, 8-79, 8-80, 8-83, 8-84, 8-85, 8-86, 8-87, 8-88, 8-89, 8-90, 8-91, 8-92, 8-93, 8-94, 8-95, 8-96, 8-97, 8-98, 8-99, 8-100, 8-101, 8-102, 8-109, 8-110, 8-112, 8-113, 8-114, 8-115, 8-118, 8-119, 8-120, 8-121, 8-122, 8-123, 8-124, 8-125, 8-126, 8-127, 8-130, 8-131, 8-132, 8-133, 8-134, 8-136, 8-137, 8-138, 8-140, 8-141, 8-142, 8-143, 8-145, 8-147, 8-148, 8-152, 8-153, 8-160, 8-161, 9-1, 9-3, 9-4, 9-5, 9-7, 10-1, 11-1, 11-2, 11-3, 11-4, 11-5, 11-6, 11-7, 11-8, 11-9, 11-10, 11-11, 11-12, 11-13, 11-14, 11-17, 11-18, 11-19, 12-1, 13-1, 14-2, 14-4, 14-5, 15-1, 15-2, 15-3, 15-4, 15-5, 15-6, 15-7 y 15-8 entre los compuestos de oxazepina expresados por la Fórmula General (I) según la presente invención tuvieron efectos insecticidas excelentes de criterios A a D contra pulgones del melocotonero.

40 Adicionalmente, en el ejemplo de prueba 2, los compuestos n.º 1-1, 1-2, 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-19, 1-23, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-37, 1-38, 1-39, 1-40, 1-41, 1-42, 1-44, 1-45, 1-46, 1-47, 1-48, 1-50, 1-51, 1-52, 1-53, 1-55, 1-56, 1-57, 1-58, 1-62, 1-67, 1-68, 1-69, 1-70, 1-71, 1-73, 1-74, 1-75, 1-76, 1-77, 1-79, 1-80, 1-81, 1-84, 1-85, 1-86, 2-1, 2-2, 2-5, 3-1, 3-3, 3-6, 4-10, 5-2, 6-2, 6-3, 6-6, 6-7, 7-1, 7-2, 8-2, 8-4, 8-10, 8-12, 8-13, 8-20, 8-21, 8-23, 8-24, 8-25, 8-26, 8-31, 8-32, 8-34, 8-35, 8-37, 8-38, 8-40, 8-41, 8-42, 8-45, 8-46, 8-49, 8-54, 8-56, 8-57, 8-58, 8-62, 8-64, 8-66, 8-68, 8-71, 8-73, 8-77, 8-93, 8-94, 8-95, 8-96, 8-102, 8-106, 8-110, 8-112, 8-114, 8-115, 8-117, 8-121, 8-124, 8-125, 8-128, 8-129, 8-130, 8-131, 8-135, 8-137, 8-140, 8-141, 8-143, 8-145, 8-150, 8-154, 8-158, 8-159, 9-1, 9-3, 11-1, 11-2, 11-5, 11-6, 11-7, 11-9, 11-10, 11-11, 11-15, 11-16, 11-17, 11-18, 11-19, 12-1, 13-1, 14-3, 14-5, 15-6, 15-7 y 15-8 entre los compuestos de oxazepina expresados por la Fórmula General (I) según la presente invención tuvieron efectos insecticidas de criterios A a D contra cicadellas marrones pequeñas.

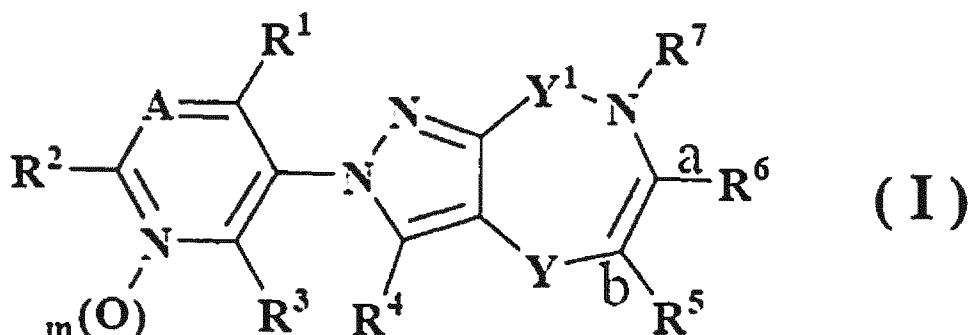
50 **Campo industrial de aplicación**

El compuesto de oxazepina o sal del mismo como se propone mediante la presente invención tiene efectos excelentes como insecticida agrícola/hortícola.

55

## REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de oxazepina o sal del mismo, expresado por la Fórmula General (I):



5

en donde, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> pueden ser iguales o diferentes, que representan:

(a1) un átomo de hidrógeno;

(a2) un átomo de halógeno;

10 (a3) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

(a4) un grupo cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>);

(a5) un grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

(a6) un grupo haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

(a7) un grupo alquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

15 (a8) un grupo alquilsulfinilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

(a9) un grupo alquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

(a10) un grupo fenilsulfonilo;

(a11) un grupo amino; o

(a12) un grupo alquilcarbonilamino (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

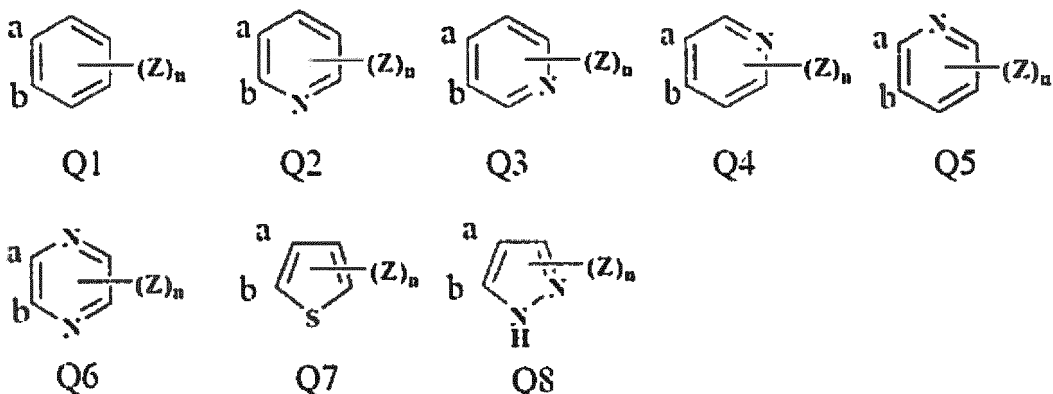
20 R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> pueden ser iguales o diferentes, que representan:

(b1) un átomo de hidrógeno;

(b3) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>); o

(b4) R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> que forman la Fórmula Estructural Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, Q<sup>3</sup>, Q<sup>4</sup>, Q<sup>5</sup>, Q<sup>6</sup>, Q<sup>7</sup> o Q<sup>8</sup> a continuación junto con átomos de carbono a los que se unen grupos de sustitución:

25



en donde, Z puede ser igual o diferente, que representa (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (d) un grupo amino, (e) un grupo dialquilamino (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) (alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) puede ser igual o diferente), (f) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (g) un grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (h) un grupo haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (i) un grupo haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (p) un grupo hidroxilo, (q) un grupo nitro, (r) un grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (s) un grupo dialcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), en donde el alquilo en el dialcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) puede ser igual o diferente y puede estar unido a un átomo de carbono igual o diferente), (t) un grupo fenilo, (u) un grupo monoalquilamino (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (v) un grupo monoformilamino, (w) un grupo monoalquilcarbonilamino (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (x) un grupo monoalquilsulfonilamino (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (y) un grupo bis alquilsulfonilamino (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), en donde el alquilo en el bis alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) puede ser igual o diferente, (z) un grupo alcocarbonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (aa) un grupo hidroxicarbonilo, (ab) un grupo alquilaminosulfonilcarbonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (ac) un grupo alquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (ad) un grupo haloalquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) o (ae) un grupo aminosulfonilo y n representa un número entero de 0 a 2; y a y b cada uno representa una posición de unión);

R<sup>7</sup> representa:

40 (c1) un átomo de hidrógeno;

(c2) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>);

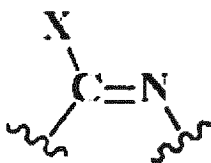
- (c3) un grupo alqueno ( $C_2-C_8$ );  
(c4) un grupo alquino ( $C_2-C_8$ );  
(c5) un grupo cianoalquilo ( $C_1-C_8$ );  
(c6) un grupo cicloalquilo ( $C_3-C_8$ );  
5 (c7) un grupo haloalquilo ( $C_1-C_8$ );  
(c8) un grupo haloalqueno ( $C_2-C_8$ );  
(c9) un grupo haloalquino ( $C_2-C_8$ );  
(c10) un grupo alcoxi ( $C_1-C_8$ ) alquilo ( $C_1-C_8$ );  
(c11) un grupo alquiltio ( $C_1-C_8$ ) alquilo ( $C_1-C_8$ );  
10 (c12) un grupo alquilsulfino ( $C_1-C_8$ ) alquilo ( $C_1-C_8$ );  
(c13) un grupo alquilsulfonilo ( $C_1-C_8$ ) alquilo ( $C_1-C_8$ );  
(c14) un grupo alquilcarbonilo ( $C_1-C_8$ );  
(c15) un grupo alcocarbonilo ( $C_1-C_8$ );  
(c16) un grupo alcocarbonilo ( $C_1-C_8$ ) alquilo ( $C_1-C_8$ );  
15 (c17) un grupo aminoalquilo ( $C_1-C_8$ );  
(c18) un grupo di(alquilamino ( $C_1-C_8$ )) alquilo ( $C_1-C_8$ ) (en la fórmula alquilo en dialquilo ( $C_1-C_8$ ) puede ser igual o diferente);  
(c19) un grupo alquilo ( $C_1-C_8$ ) heterocíclico no aromático;  
(c20) un grupo alquilo ( $C_1-C_8$ ) heterocíclico no aromático que tiene, en su anillo, de uno a cinco grupo(s) de  
20 sustitución que puede(n) ser igual(es) o diferente(s) y seleccionado(s) de (a) átomo de halógeno, (b) grupo ciano, (c) grupo nitro, (af) grupo formilo, (f) grupo alquilo ( $C_1-C_6$ ) y (g) grupo alcoxi ( $C_1-C_6$ );  
(c21) un grupo fenilo;  
(c22) un grupo fenilo que tiene, en su anillo, de uno a cinco grupo(s) de sustitución que puede(n) ser igual(es) o  
diferente(s) y seleccionado(s) de (a) átomo de halógeno, (b) grupo ciano, (c) grupo nitro, (af) grupo formilo, (f) grupo  
25 alquilo ( $C_1-C_6$ ), (h) grupo haloalquilo ( $C_1-C_6$ ), (g) grupo alcoxi ( $C_1-C_6$ ), (i) grupo haloalcoxi ( $C_1-C_6$ ), (ag) cicloalquilo ( $C_3-C_6$ ) alcoxi ( $C_1-C_6$ ), (j) grupo alquiltio ( $C_1-C_6$ ), (k) grupo haloalquiltio ( $C_1-C_6$ ), (l) grupo alquilsulfino ( $C_1-C_6$ ), (m) grupo haloalquilsulfino ( $C_1-C_6$ ), (n) grupo alquilsulfonilo ( $C_1-C_6$ ) y (o) grupo haloalquilsulfonilo ( $C_1-C_6$ );  
(c23) un grupo fenilalquilo ( $C_1-C_8$ );  
(c24) un grupo fenilalquilo ( $C_1-C_8$ ) que tiene, en su anillo, de uno a cinco grupo(s) de sustitución que puede(n) ser  
30 igual(es) o diferente(s) y seleccionado(s) de (a) átomo de halógeno, (b) grupo ciano, (c) grupo nitro, (af) grupo formilo, (f) grupo alquilo ( $C_1-C_6$ ), (h) grupo haloalquilo ( $C_1-C_6$ ), (g) grupo alcoxi ( $C_1-C_6$ ), (i) grupo haloalcoxi ( $C_1-C_6$ ), (ag) cicloalquilo ( $C_3-C_6$ ) alcoxi ( $C_1-C_6$ ), (j) grupo alquiltio ( $C_1-C_6$ ), (k) grupo haloalquiltio ( $C_1-C_6$ ), (l) grupo alquilsulfino ( $C_1-C_6$ ), (m) grupo haloalquilsulfino ( $C_1-C_6$ ), (n) grupo alquilsulfonilo ( $C_1-C_6$ ) y (o) grupo haloalquilsulfonilo ( $C_1-C_6$ );  
(c25) un grupo fenilcarbonilalquilo ( $C_1-C_6$ );  
35 (c26) un grupo fenilcarbonilalquilo ( $C_1-C_8$ ) que tiene, en su anillo, de uno a cinco grupo(s) de sustitución que puede(n) ser igual(es) o diferente(s) y seleccionado(s) de (a) átomo de halógeno, (b) grupo ciano, (c) grupo nitro, (af) grupo formilo, (f) grupo alquilo ( $C_1-C_6$ ), (h) grupo haloalquilo ( $C_1-C_6$ ), (g) grupo alcoxi ( $C_1-C_6$ ), (i) grupo haloalcoxi ( $C_1-C_6$ ), (ag) cicloalquilo ( $C_3-C_6$ ) alcoxi ( $C_1-C_6$ ), (j) grupo alquiltio ( $C_1-C_6$ ), (k) grupo haloalquiltio ( $C_1-C_6$ ), (l) grupo alquilsulfino ( $C_1-C_6$ ), (m) grupo haloalquilsulfino ( $C_1-C_6$ ), (n) grupo alquilsulfonilo ( $C_1-C_6$ ) y (o) grupo  
40 haloalquilsulfonilo ( $C_1-C_6$ );  
(c27) un grupo heterocíclico aromático;  
(c28) un grupo heterocíclico aromático que tiene, en su anillo, de uno a tres grupo(s) de sustitución que puede(n) ser  
igual(es) o diferente(s) y seleccionado(s) de (a) átomo de halógeno, (b) grupo ciano, (c) grupo nitro, (af) grupo  
45 formilo, (f) grupo alquilo ( $C_1-C_6$ ), (h) grupo haloalquilo ( $C_1-C_6$ ), (g) grupo alcoxi ( $C_1-C_6$ ), (i) grupo haloalcoxi ( $C_1-C_6$ ), (ag) cicloalquilo ( $C_3-C_6$ ) alcoxi ( $C_1-C_6$ ), (j) grupo alquiltio ( $C_1-C_6$ ), (k) grupo haloalquiltio ( $C_1-C_6$ ), (l) grupo alquilsulfino ( $C_1-C_6$ ), (m) grupo haloalquilsulfino ( $C_1-C_6$ ), (n) grupo alquilsulfonilo ( $C_1-C_6$ ) y (o) grupo haloalquilsulfonilo ( $C_1-C_6$ );  
(c29) un grupo alquilo ( $C_1-C_8$ ) heterocíclico aromático;  
(c30) un grupo alquilo ( $C_1-C_8$ ) heterocíclico aromático que tiene, en su anillo, de uno a tres grupo(s) de sustitución  
que puede(n) ser igual(es) o diferente(s) y seleccionado(s) de (a) átomo de halógeno, (b) grupo ciano, (c) grupo  
50 nitro, (af) grupo formilo, (f) grupo alquilo ( $C_1-C_6$ ), (h) grupo haloalquilo ( $C_1-C_6$ ), (g) grupo alcoxi ( $C_1-C_6$ ), (i) grupo haloalcoxi ( $C_1-C_6$ ), (ag) cicloalquilo ( $C_3-C_6$ ) alcoxi ( $C_1-C_6$ ), (j) grupo alquiltio ( $C_1-C_6$ ), (k) grupo haloalquiltio ( $C_1-C_6$ ), (l) grupo alquilsulfino ( $C_1-C_6$ ), (m) grupo haloalquilsulfino ( $C_1-C_6$ ), (n) grupo alquilsulfonilo ( $C_1-C_6$ ) y (o) grupo  
haloalquilsulfonilo ( $C_1-C_6$ );  
(c31) un grupo alquilsulfonilo ( $C_1-C_8$ );  
55 (c32) un grupo aminocarbonilalquilo ( $C_1-C_8$ );  
(c33) un grupo dialquilamino ( $C_1-C_8$ ) alquilo ( $C_1-C_8$ ), en donde el alquilo en el dialquilo ( $C_1-C_8$ ) puede ser igual o diferente);  
(c34) un grupo alquilo ( $C_1-C_8$ ) carbonilalquilo ( $C_1-C_8$ );  
(c35) un grupo dialcoxi ( $C_1-C_8$ ) alquilo ( $C_1-C_8$ ), en donde el alquilo en el dialquilo ( $C_1-C_8$ ) puede ser igual o diferente y  
60 puede estar unido a un carbono igual o diferente);  
(c36) un grupo formilo;  
(c37) un grupo di(alquil ( $C_1-C_8$ ) aminocarbonilo, en donde el alquilo en el dialquilo ( $C_1-C_8$ ) puede ser igual o diferente);  
(c38) un grupo formilalquilo ( $C_1-C_8$ );  
65 (c39) un grupo alcóximino ( $C_1-C_8$ ) alquilo ( $C_1-C_8$ );  
(c40) un grupo haloalquiltio ( $C_1-C_8$ ) alquilo ( $C_1-C_8$ );

- (c41) un grupo haloalquilsulfino (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);
- (c42) un grupo haloalquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);
- (c43) un grupo cicloquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>); o
- (c44) un grupo cianohaloalquil (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

5 A representa un CH, C-R<sup>8</sup> (en la fórmula, R<sup>8</sup> representa (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (af) un grupo formilo, (f) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (h) un grupo haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (g) un grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) o (i) un grupo haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) o átomo de nitrógeno;

10 Y representa un átomo de oxígeno, S o NH;

Y<sup>1</sup> representa un C=O, C=S o grupo CH<sub>2</sub> o un grupo químico expresado por la Fórmula que se muestra a continuación junto con un átomo de nitrógeno contiguo:



- 15 en donde, X representa:
- (d1) un átomo de halógeno;
  - (d2) un grupo ciano;
  - 20 (d3) un grupo trialquilsililo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) alquino (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), en donde el grupo alquilo en el grupo trialquilsililo(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) puede ser igual o diferente);
  - (d4) un NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup> (en donde R<sup>10</sup>R<sup>11</sup> puede ser igual o diferente, que representa un átomo de hidrógeno, un grupo hidroxilo, grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), grupo alqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), grupo cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), grupo haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) o grupo heterocíclico no aromático);
  - 25 (d5) un grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>);
  - (d6) un grupo alquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>);
  - (d7) un grupo alquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>);
  - (d8) un grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>); o
  - (d9) un grupo haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>); y
  - 30 m representa un número entero de 0 a 1.

2. Un compuesto de oxazepina o sal del mismo, según la reivindicación 1, en donde:

- R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> pueden ser iguales o diferentes, que representan:
- 35 (a1) un átomo de hidrógeno;
  - (a2) un átomo de halógeno;
  - (a3) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);
  - (a10) un grupo fenilsulfonilo;
  - (a11) un grupo amino; o
  - 40 (a12) un grupo alquilcarbonilamino (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);
- R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> pueden ser iguales o diferentes, que representan:
- (b1) un átomo de hidrógeno;
  - (b3) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>); o
  - (b4) R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> que forman la Fórmula Estructural Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, Q<sup>3</sup>, Q<sup>4</sup>, Q<sup>5</sup>, Q<sup>6</sup>, Q<sup>7</sup> o Q<sup>8</sup> junto con átomos de carbono a los
  - 45 que están unidos;
- R<sup>7</sup> es:
- (c1) un átomo de hidrógeno;
  - (c2) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>);
  - (c3) un grupo alqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>);
  - 50 (c4) un grupo alquino (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>);
  - (c5) un grupo cianoalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);
  - (c6) un grupo cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>);
  - (c7) un grupo haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);
  - (c10) un grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);
  - 55 (c11) un grupo alquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);
  - (c12) un grupo alquilsulfino (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);
  - (c13) un grupo alquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);
  - (c14) un grupo alquilcarbonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);
  - (c16) un grupo alcoxycarbonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);
  - 60 (c18) un grupo dialquilamino (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), en donde el alquilo en el dialquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) puede ser igual o diferente;

- (c19) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) heterocíclico no aromático;  
(c20) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) heterocíclico no aromático que tiene, en su anillo, de uno a cinco grupo(s) de sustitución que puede(n) ser igual(es) o diferente(s) y seleccionado(s) de (a) átomo de halógeno, (b) grupo ciano, (c) grupo nitro, (af) grupo formilo, (f) grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) y (g) grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>);
- 5 (c21) un grupo fenilo;  
(c23) un grupo fenilalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
(c24) un grupo fenilalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) que tiene, en su anillo, de uno a cinco grupo(s) de sustitución que puede(n) ser igual(es) o diferente(s) y seleccionado(s) de (a) átomo de halógeno, (b) grupo ciano, (c) grupo nitro, (af) grupo formilo, (f) grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (h) grupo haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (g) grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (i) grupo haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),
- 10 (ag) cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (j) grupo alquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (k) grupo haloalquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (l) grupo alquilsulfinilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (m) grupo haloalquilsulfinilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (n) grupo alquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) y (o) grupo haloalquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>);  
(c26) un grupo fenilcarbonilalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) que tiene, en su anillo, de uno a cinco grupo(s) de sustitución que puede(n) ser igual(es) o diferente(s) y seleccionado(s) de (a) átomo de halógeno, (b) grupo ciano, (c) grupo nitro, (af) grupo formilo, (f) grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (h) grupo haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (g) grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (i) grupo haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (ag) cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (j) grupo alquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (k) grupo haloalquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (l) grupo alquilsulfinilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (m) grupo haloalquilsulfinilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (n) grupo alquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) y (o) grupo haloalquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>);
- 15 (c27) un grupo heterocíclico aromático;  
(c29) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) heterocíclico aromático;  
(c30) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) heterocíclico aromático que tiene, en su anillo, de uno a tres grupo(s) de sustitución que puede(n) ser igual(es) o diferente(s) y seleccionado(s) de (a) átomo de halógeno, (b) grupo ciano, (c) grupo nitro, (af) grupo formilo, (f) grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (h) grupo haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (g) grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (i) grupo haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (ag) cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (j) grupo alquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (k) grupo haloalquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (l) grupo alquilsulfinilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (m) grupo haloalquilsulfinilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (n) grupo alquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) y (o) grupo haloalquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>);
- 20 (c31) un grupo alquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
(c32) un grupo aminocarbonilalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
(c33) un grupo dialquilamino (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), en donde el alquilo en el dialquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) puede ser igual o diferente);
- 25 (c34) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) carbonilalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
(c35) un grupo dialcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>), en donde el alquilo en el dialquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) puede ser igual o diferente);  
(c36) un grupo formilo;  
(c37) un grupo di(alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) aminocarbonilo, en donde el alquilo en el dialquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) puede ser igual o diferente);
- 30 (c38) un grupo formilalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
(c39) un grupo alcoxiimino (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
(c40) un grupo haloalquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
(c41) un grupo haloalquilsulfinilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);  
(c42) un grupo haloalquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);
- 35 (c43) un grupo cicloquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>); o  
(c44) un grupo cianohaloalquil (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

A es un CH, C-R<sup>8</sup> (en la fórmula, R<sup>8</sup> es (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (af) un grupo formilo, (f) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (h) un grupo haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (g) un grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) o (i) un grupo haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) o átomo de nitrógeno;

45

Y es un átomo de oxígeno, S o NH;

Y<sup>1</sup> es un C=O, C=S o grupo CH<sub>2</sub>; y  
m es 0 o 1.

50

3. Un compuesto de oxazepina o sal del mismo, según la reivindicación 1 o 2, en donde:

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> pueden ser iguales o diferentes, que representan:

55

(a1) un átomo de hidrógeno; o

(a2) un átomo de halógeno;

R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> forman la Fórmula Estructural Q<sup>1</sup> o Q<sup>7</sup> junto con átomos de carbono a los que están unidos;

R<sup>7</sup> es:

(c1) un átomo de hidrógeno;

60

(c2) un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>);

(c4) un grupo alquínilo (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>);

(c5) un grupo cianoalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>); o

(c10) un grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

65 A es un CH;



Y es un átomo de oxígeno;

Y<sup>1</sup> es un C=O; y

5 m es 0.

4. Un insecticida agrícola/hortícola caracterizado por que contiene, como principio activo, un compuesto o sal del mismo según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3.

10 5. Un método para el uso de un insecticida agrícola/hortícola, caracterizado por que un insecticida agrícola/hortícola según la reivindicación 4 se aplica a una planta o suelo mediante una cantidad eficaz.

6. Uso de un compuesto o sal del mismo según cualquiera una de las reivindicaciones 1 a 3, como un insecticida agrícola/hortícola.