

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 747 794**

51 Int. Cl.:

**C07D 401/14** (2006.01)

**C07D 401/04** (2006.01)

**A01N 43/56** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **01.12.2015 PCT/EP2015/078164**

87 Fecha y número de publicación internacional: **09.06.2016 WO16087421**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **01.12.2015 E 15801880 (4)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **03.07.2019 EP 3227274**

54 Título: **Compuestos bicíclicos como pesticidas**

30 Prioridad:

**02.12.2014 EP 14195937**

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

**11.03.2020**

73 Titular/es:

**BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT  
(100.0%)  
Alfred-Nobel-Strasse 50  
40789 Monheim am Rhein, DE**

72 Inventor/es:

**JESCHKE, PETER;  
ARLT, ALEXANDER;  
CEREZO-GALVEZ, SILVIA;  
VOERSTE, ARND;  
FÜSSLEIN, MARTIN;  
FISCHER, REINER;  
BRETSCHNEIDER, THOMAS;  
ILG, KERSTIN;  
MALSAM, OLGA y  
LÖSEL, PETER**

74 Agente/Representante:

**CARPINTERO LÓPEZ, Mario**

**ES 2 747 794 T3**

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

**DESCRIPCIÓN**

Compuestos bicíclicos como pesticidas

La presente solicitud se refiere a nuevos compuestos bicíclicos, a agentes que contienen estos compuestos, a su uso para combatir plagas animales así como a procedimientos y productos intermedios para su preparación.

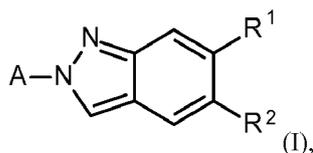
5 Recientemente se han conocido compuestos bicíclicos que tienen propiedades insecticidas (documento WO 2015/038503 A1).

En el documento WO 2003/090751 A1 se describe la preparación y el uso farmacéutico de inhibidores de metaloproteinasas selectivos de MMP-13, que contienen, entre otros, un fragmento de 4-[[2-(piridin-3-il)-2*H*-indazolil-5-il]-oxi].

10 Los agentes fitoprotectores modernos tienen que satisfacer muchos requisitos, por ejemplo con respecto a la altura, duración y amplitud de su acción y uso posible. Son cuestiones importantes la toxicidad, la combinabilidad con otros principios activos o adyuvantes de formulación, así como la cuestión del coste que tiene que dedicarse para la síntesis de un principio activo. Asimismo pueden aparecer resistencias. Ya por todos estos motivos no puede darse por concluida la búsqueda de nuevos agentes fitoprotectores y existe una necesidad constante de nuevos compuestos con propiedades mejoradas con respecto a los compuestos conocidos al menos con respecto a aspectos individuales.

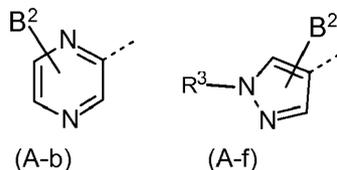
15 Era objetivo de la presente invención proporcionar compuestos mediante los que se amplíe el espectro de los pesticidas bajo distintos aspectos.

Se consigue el objetivo, así como objetivos adicionales no mencionados explícitamente, que pueden derivarse o deducirse a partir de los contextos discutidos en el presente documento, mediante compuestos de fórmula (I)



en la que

A representa un resto A de la serie (A-b) y (A-f)

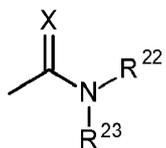


donde la línea discontinua significa el enlace con el átomo de nitrógeno del biciclo de fórmula (I),

25 B<sup>2</sup> representa hidrógeno,

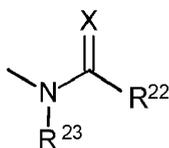
R<sup>1</sup> representa hidrógeno,

R<sup>2</sup> c) representa un resto de fórmula



o

30 R<sup>2</sup> d) representa un resto de fórmula



X representa oxígeno

R<sup>3</sup> representa alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>,

5 R<sup>22</sup> cuando R<sup>2</sup> representa el resto c), representa un resto de la serie alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> dado el caso sustituido con ciano, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfonilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, di-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-aminosulfonilo,

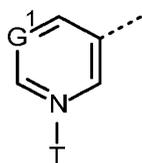
R<sup>23</sup> cuando R<sup>2</sup> representa el resto c), representa un resto de la serie hidrógeno y alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>,

R<sup>22</sup> cuando R<sup>2</sup> representa el resto d), representa un resto de la serie haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfinil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfonil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>,

10 R<sup>23</sup> cuando R<sup>2</sup> representa el resto d), representa un resto de la serie hidrógeno y alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, y en el caso de R<sup>2</sup> = d)

R<sup>22</sup> también representa fenilo dado el caso sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> y haloalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfinilo y compuestos de fórmula (I), donde

A representa el resto A



(A-a)

15 donde la línea discontinua significa el enlace con el átomo de nitrógeno del biciclo de fórmula (I),

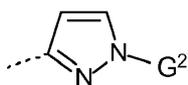
G<sup>1</sup> representa N o C-B<sup>1</sup>,

B<sup>1</sup> representa un resto de la serie hidrógeno y flúor,

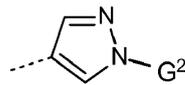
T representa un par de electrones,

R<sup>1</sup> representa hidrógeno,

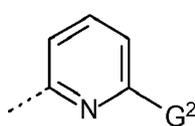
20 R<sup>2</sup> aa) representa un resto de la serie



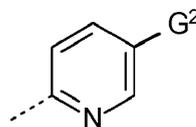
(B-3)



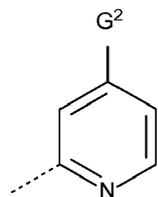
(B-4)



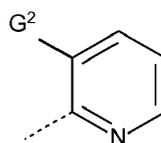
(B-21)



(B-22)



(B-35)

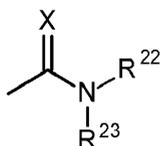


(B-36)

, donde

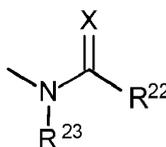
G<sup>2</sup> representa un resto de la serie halógeno, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfinilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfonilo, haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfinilo, haloalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfonilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfinil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfonil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, o

5 R<sup>2</sup> c) representa un resto de fórmula



, o

R<sup>2</sup> d) representa un resto de fórmula

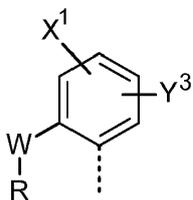


10 , o

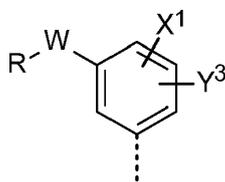
R<sup>2</sup> f) representa haloalquilo,

X representa oxígeno

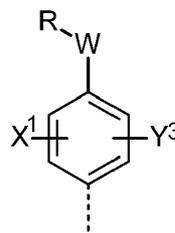
R<sup>22</sup> representa un resto de la serie (D-1) a (D-3)



(D-1)



(D-2)



(D-3)

15 donde la línea discontinua significa el enlace con el átomo de nitrógeno en el resto c) o con el átomo de carbono en el resto d),

R representa en cada caso alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> dado el caso sustituido una, dos, tres, cuatro o cinco veces con flúor, cloro,

X<sup>1</sup> representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo,

20 W representa un resto de la serie S, SO y SO<sub>2</sub>, Y<sup>3</sup> representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo y etilo.

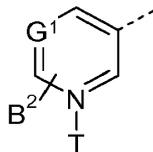
Además se descubrió que los compuestos de fórmula (I) presentan una eficacia adecuada como pesticidas, por ejemplo contra artrópodos y en particular insectos, y además, por regla general, en particular son muy compatibles con las plantas con respecto a las plantas de cultivo y/o disponen de propiedades toxicológicas y/o relevantes para el medio ambiente favorables.

25 Restos sustituidos con halógeno, por ejemplo haloalquilo (= haloalquil), están mono- o polihalogenados hasta el número de sustituyentes máximo posible. En el caso de la halogenación múltiple, los átomos de halógeno pueden ser iguales o distintos. Halógeno a este respecto representa flúor, cloro, bromo o yodo, en particular representa flúor, cloro o bromo.

30 Restos hidrocarburo saturados o insaturados tales como alquilo o alqueno, también junto con heteroátomos, tal como por ejemplo en alcoxi, siempre que sea posible, pueden ser en cada caso de cadena lineal o ramificados.

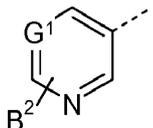
Los restos dado el caso sustituidos pueden, siempre que no se indique lo contrario, estar mono- o polisustituidos, pudiendo ser en el caso de sustituciones múltiples los sustituyentes iguales o distintos.

Cuando T en el resto A de fórmula (A-a)



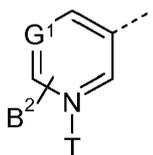
(A-a)

representa un par de electrones, el resto se encuentra como derivado de piridina de fórmula



- 5 Las definiciones de restos o explicaciones expuestas anteriormente son válidas de manera correspondiente para los productos finales y para los productos de partida y productos intermedios.

Una forma de realización preferida de la invención se refiere a compuestos de fórmula (I), en los que A representa el resto de fórmula (A-a).



(A-a)

- 10 Una forma de realización preferida adicional de la invención se refiere a compuestos de fórmula (I), en los que A representa piridin-3-ilo.

Una forma de realización preferida adicional de la invención se refiere a compuestos de fórmula (I), en los que A representa 5-fluoro-piridin-3-ilo.

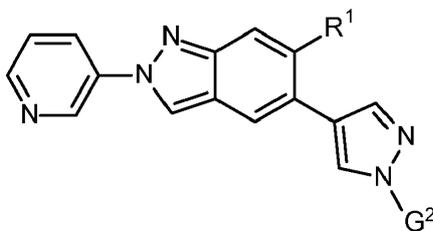
- 15 Una forma de realización preferida adicional de la invención se refiere a compuestos de fórmula (I), en los que A representa pirimidin-5-ilo.

Una forma de realización preferida adicional de la invención se refiere a compuestos de fórmula (I), en los que R<sup>2</sup> tiene los significados expuestos en c).

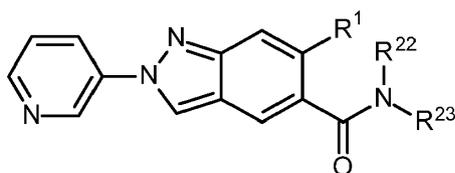
Una forma de realización preferida adicional de la invención se refiere a compuestos de fórmula (I), en los que R<sup>2</sup> tiene los significados expuestos en d).

- 20 Una forma de realización preferida adicional de la invención se refiere a compuestos de fórmula (I), en los que R<sup>2</sup> tiene los significados expuestos en f).

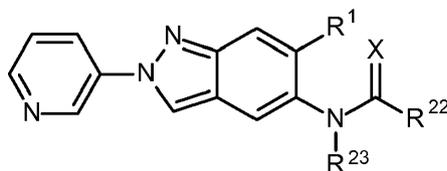
En una forma de realización preferida adicional la invención se refiere a compuestos de fórmula (I-B)



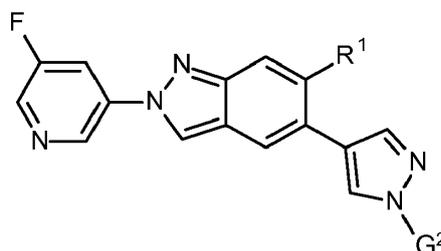
En una forma de realización preferida adicional la invención se refiere a compuestos de fórmula (I-E)



En una forma de realización preferida adicional la invención se refiere a compuestos de fórmula (I-F)

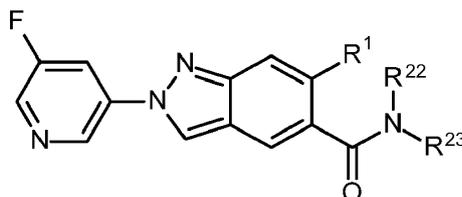


En una forma de realización preferida adicional la invención se refiere a compuestos de fórmula (I-I)

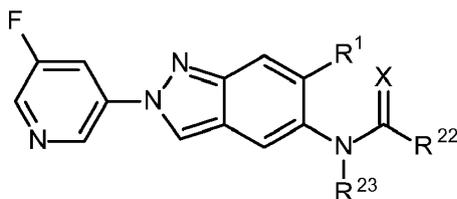


5

En una forma de realización preferida adicional la invención se refiere a compuestos de fórmula (I-L)



En una forma de realización preferida adicional la invención se refiere a compuestos de fórmula (I-M)



10 En

En las fórmulas (I-B), (I-E), (I-F), (I-I), (I-L), y (I-M), las variables tienen los significados mencionados más arriba.

Los compuestos de acuerdo con la invención de fórmula (I) y sus sales de adición de ácido y complejos de sal de metal tienen buena eficacia, en particular para combatir plagas animales, entre las que figuran artrópodos y en particular insectos.

15 Los compuestos de fórmula (I) pueden encontrarse dado el caso también, en función del tipo de sustituyentes, como estereoisómeros, es decir como isómeros geométricos y/o como isómeros ópticos o mezclas de isómeros en diferentes composiciones. Tanto los estereoisómeros puros como cualquier mezcla de estos isómeros son objeto de esta invención, incluso cuando en este caso se habla en general solamente de compuestos de fórmula (I).

20 La invención se refiere, por lo tanto, tanto a los enantiómeros y diastereómeros puros, como a sus mezclas para combatir plagas animales, entre las que figuran artrópodos y en particular insectos.

Preferentemente se usan sin embargo las formas estereoisoméricas, ópticamente activas, de los compuestos de fórmula (I) y sus sales de acuerdo con la invención.

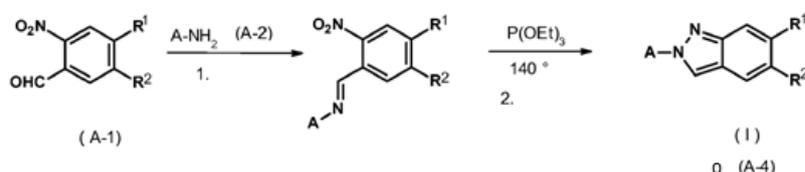
como sales adecuadas de los compuestos de fórmula (I) pueden mencionarse sales no tóxicas habituales, es decir

sales con bases correspondientes y sales con ácidos añadidos. Preferentemente se mencionan sales con bases inorgánicas, tales como sales de metal alcalino, por ejemplo sales de sodio, potasio o cesio, sales de metal alcalinotérreo, por ejemplo sales de calcio o magnesio, sales de amonio, sales con bases orgánicas así como con aminas inorgánicas, por ejemplo sales de trietilamonio, dicitlohexilamonio, *N,N*-dibenciletilendiamonio, piridinio, picolinio o etanolamonio, sales con ácidos inorgánicos, por ejemplo clorhidratos, bromhidratos, dihidrosulfatos, trihidrosulfatos, o fosfatos, sales con ácidos carboxílicos orgánicos o ácido sulfónico orgánico, por ejemplo formiatos, acetatos, trifluoroacetatos, maleatos, tartratos, metanosulfonatos, bencenosulfonatos o *para*-toluenosulfonatos, sales con aminoácidos básicos, por ejemplo arginatos, aspartatos o glutamatos y similares.

Se descubrió además que los compuestos de fórmula (I) pueden prepararse según los procedimientos que se describen a continuación.

Compuestos de fórmula (I), en los que el heterociclo A representa pirimidin-5-ilo dado el caso sustituido con un resto B<sup>2</sup> (A-a; G<sup>1</sup> = N), piridin-3-ilo (A-a; G<sup>1</sup> = C-B<sup>1</sup>), pirazin-2-ilo (A-b), y pirazol-4-il (A-f), pueden prepararse por ejemplo de acuerdo con el esquema de reacción I en dos etapas.

#### Esquema de reacción I



En el esquema de reacción I, A, R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> tienen los significados mencionados anteriormente, siempre que no se indique lo contrario.

Por ejemplo, los 2-nitro-benzaldehídos sustituidos de fórmula (A-1) pueden hacerse reaccionar con los heterociclos 3-aminosustituidos correspondientes de fórmula (A-2) en presencia de adyuvantes de reacción ácidos en una primera etapa de reacción para dar compuestos de fórmula (A-3), que entonces se ciclan en una segunda etapa de reacción en presencia de un reactivo de fósforo(III) adecuado, por ejemplo fosfito de trietilo, de manera reductora con la formación de los compuestos (A-4).

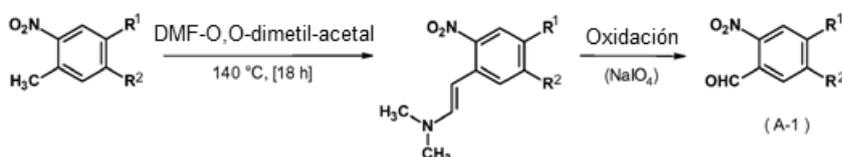
Si en el procedimiento de acuerdo con la invención, para la preparación de los compuestos de fórmula (I), como compuesto de fórmula (A-1) se emplea el 2-nitro-5-(trifluorometil)-benzaldehído (R<sup>1</sup> = H, R<sup>2</sup> = CF<sub>3</sub>) y como compuesto de fórmula (A-2) 3-piridinamina (A = piridin-3-ilo), entonces se genera en primer lugar la N-[(2-nitro-5-trifluorometil-fenil)metil]-3-piridinamina (A = piridin-3-ilo, R<sup>1</sup> = H, R<sup>2</sup> = CF<sub>3</sub>). La posterior reducción y ciclación lleva entonces al 5-trifluorometil-2-(piridin-3-il)-2*H*-indazol (A-4, A = piridin-3-ilo, R<sup>1</sup> = H, R<sup>2</sup> = CF<sub>3</sub>) (véase ejemplos de preparación 6 y 16).

Los derivados de azometina o las denominadas "*bases de Schiff*" de heterociclos aminosustituidos tienen aplicaciones de diversos tipos (forman por ejemplo complejos de metal o son biológicamente activos) y pueden obtenerse según procedimientos habituales, (véase también V. Shama, et al., Intern. J. Univ. Pharm. Bio Science 2013, 2, 241-57 y bibliografía ahí citada).

Los compuestos de fórmula (A-1) son conocidos en parte y se encuentran comercialmente disponibles o pueden obtenerse según procedimientos de preparación conocidos en principio (para R<sup>1</sup> = H, R<sup>2</sup> = Br; 5-bromo-2-nitro-benzaldehído (documento WO 2014/121416 A1); para R<sup>1</sup> = OCH<sub>3</sub>, R<sup>2</sup> = Br; 5-bromo-4-metoxi-2-nitro-benzaldehído (documento WO 2008/079988 A2); para R<sup>1</sup> = H, R<sup>2</sup> = COOCH<sub>3</sub>; éster metílico de ácido 3-formil-4-nitro-benzoico (documento WO 2007/087129 A2); para R<sup>1</sup> = OCH<sub>3</sub>, R<sup>2</sup> = NH<sub>2</sub>; 5-amino-4-metoxi-2-nitro-benzaldehído (X. Han et al., Chem. Eur. J. 2007, 13(28), 7957-7964).

Por ejemplo, el 2-nitro-5-trifluorometil-benzaldehído (R<sup>1</sup> = H, R<sup>2</sup> = CF<sub>3</sub>) puede sintetizarse a partir de 2-metil-1-nitro-4-trifluorometil-benceno a través de reacción de *N,N*-dimetilformamida-*O,O*-dimetilacetal y posterior oxidación de peryodato de sodio de acuerdo con el esquema de reacción II (véase ejemplo de preparación).

#### Esquema de reacción II



Los compuestos de fórmula (A-2) son conocidos en parte y se encuentran comercialmente disponibles o pueden obtenerse según procedimientos de preparación conocidos en principio, véase por ejemplo para A = 5-fluoro-piridin-3-ilo (A-a; B<sup>2</sup> = H, G<sup>1</sup> = C-F; T = par de electrones) (documento WO 2011/ 123751 A2); pirazin-2-ilo (A-b; B<sup>2</sup> = H) (documento WO 2012/151567 A1); o 1-metil-1*H*-pirazol-4-ilo (A-f; B<sup>2</sup> = H, R<sup>3</sup> = CH<sub>3</sub>).

5 Los compuestos de fórmula (A-3) pueden obtenerse según la etapa 1 del procedimiento de preparación mencionado o según procedimientos de síntesis conocidos en principio, véase por ejemplo para A = piridin-3-ilo (A-a; B<sup>2</sup> = H, G<sup>1</sup> = CH; T = par de electrones; R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> = H) (S. Ostrowski, A. M. Wolniewicz, Chem. Het. Compd. (Nueva York) (Transl. Khim. Geterotsikl. Soedin.) 2000, 36(6), 705-713) o para A = pirimid-2-ilo (A-b; B<sup>2</sup>, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> = H) (A. L. El-Ansary et al., Egypt. J. Chem. 1991, 33(2), 129-145).

10 Por último, los compuestos de fórmula (I) pueden obtenerse de acuerdo con la etapa 2 del procedimiento de preparación mencionado por medio de una ciclación reductora de los *orto*-imino-nitrobenzenos de fórmula general (A-3), por ejemplo según la síntesis de indazol de Candogan en presencia de fosfito de trietilo, (véase J. I. G. Candogan et al., J. Chem. Soc. 1965, 4831).

15 Como alternativa pueden usarse también condiciones de reacción variadas de la ciclación reductora según Candogan et al. o condiciones de reacción alternativas correspondientes, tal como por ejemplo la ciclación reductora catalizada por metal de transición de compuestos imino-nitroaromáticos y la ciclación catalizada por metal de transición de 2-azido-iminas (véase N. E. Genung et al., Org. Lett. 2014, 16, 3114-3117 y bibliografía citada en el mismo).

20 Además, se ha conocido también una serie de procedimientos distintos, tales como por ejemplo ciclaciones reductoras de *orto*-nitrobencilaminas (F. Sun et al. Tetrahedron 2012, 68, 3851), reacciones de aminación intramoleculares (J. J. Song, N. K. Yee, Org. Lett. 2000, 2, 519) o ciclaciones de azobenceno aciladas (H. Li, et al., Chem. Commun. 2013, 49, 9170). No obstante, estos procedimientos pueden emplearse solo de manera limitada con respecto a la amplitud, el uso de catalizadores de metal de transición y los productos intermedios en partes altamente energéticos a temperaturas elevadas.

25 En presencia del reactivo de fósforo(III) tiene lugar en primer lugar la reducción del grupo nitro en el sustrato (A-3) con la formación de un grupo nitroso, a partir del que, a continuación, se forma un nitreno o un producto intermedio similar a nitreno, que provoca, a continuación, de manera intramolecular, una ciclación (véase N. E. Genung et al., Org. Lett. 2014, 16, 3114-3117). Otros estudios pudieron probar que junto al fosfito de trietilo también pueden emplearse triciclohexilfosfina, tri-(*n*-butil)-fosfina o tri-(*terc*-butil)-fosfina (M.-A. Armour et al., J. Chem. Soc., Perkin Trans. 2 1975, 1185-1189; N. E. Genung et al., Org. Lett. 2014, 16, 3114-3117) como reactivos de fósforo(III) alternativos.

30 Compuestos de fórmula (I), en los que A, R<sup>1</sup> tienen el significado mencionado más anteriormente y R<sup>2</sup> representa un resto de la serie (B-3), (B-4), (B-21), (B-22), (B-35) y (B-36), pueden obtenerse por ejemplo a partir de compuestos de fórmula (I), en los que R<sup>2</sup> preferentemente representa halógeno de la serie bromo y yodo, según procedimientos conocidos en general (procedimiento A: véase J. C. Antilla et al., J. Org. Chem., 2004, 69, 5578-5587 y procedimiento B: véase H. Dong et al., Org. Lett., 2011, 13, 2726 - 2729; Ch. O. Ndubaku et al., J. Med. Chem., 2013, 56, 4597 - 4610; T. Furuya et al., J. Am. Chem. Soc., 2010, 132, 3793-3807).

35 Compuestos de fórmula (I), en los que R<sup>2</sup> representa halógeno, por ejemplo bromo o yodo, , pueden obtenerse de acuerdo con el esquema de reacción I a partir de 2-nitro-benzaldehídos halogenados de manera correspondiente (A-1).

40 Por ejemplo los compuestos de fórmula (I), en los que R<sup>2</sup> representa el resto (B-21), de acuerdo con el esquema de reacción III.



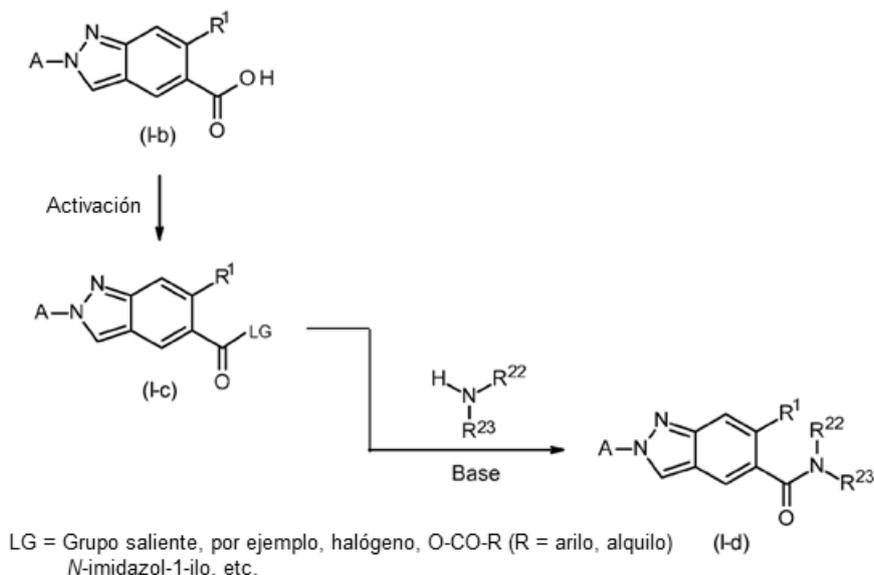
combinación con agua.

Compuestos de fórmula (I), en los que  $R^2$  representa un resto de la serie (C-1) a (C-9) o representa  $C(X)NR^{22}R^{23}$ , pueden obtenerse por ejemplo a partir de compuestos de fórmula (I), en los que  $R^2$  representa un grupo carboxilo, después de activación adecuada (es decir, LG representa un grupo saliente nucleófilo generado *in situ*) por medio de procedimientos conocidos.

5

Por ejemplo los compuestos de fórmula (I), en los que  $R^2$  representa  $C(X)NR^{22}R^{23}$ , de acuerdo con el esquema de reacción IV (para (I-d): A = piridin-3-il o pirimidin-5-il;  $R^1 = H$ ,  $R^{22}$ ,  $R^{23} = CH_3$ ).

#### Esquema de reacción IV



Compuestos de fórmula (I), en los que  $R^2$  representa carboxilo, pueden obtenerse de acuerdo con el esquema de reacción I a partir de ésteres alquílicos de ácido 3-formil-4-nitro-benzoico correspondientes (A-1;  $R^2 = COOR$ ). La siguiente escisión de éster según procedimientos habituales lleva entonces a los compuestos de fórmula (I-b).

10

Como agente de condensación para la activación de los ácidos carboxílicos de fórmula (I-b) se tienen en cuenta todos los agentes de condensación que pueden usarse habitualmente para reacciones de amidación de este tipo. A modo de ejemplo se mencionan agentes de formación de haluro de ácido tales como fosgeno, derivados de fosgeno tales como carbonildiimidazol (CDI), tricloruro de fósforo, cloruro de oxalilo o cloruro de tionilo; carbodiimidaz, tales como *N,N'*-diciclohexilcarbodiimida (DCC) y 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etil-carbodiimida (EDCI), u otros agentes de condensación habituales, tales como pentóxido de fósforo, poli(ácido fosfórico), *N,N'*-carbonildiimidazol, 1-metoyoduro de 2-cloropiridina (reactivo de Mukaiyama), 2-etoxi-N-etoxicarbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), trifetilfosfina/tetraclorocarbono, hexafluorofosfato de bromotripirrolidino-fosfonio (BROP), hexafluorofosfato de O-(1*H*-benzotriazol-1-iloxi)tris(dimetilamino)fosfonio (BOP), cloruro de ácido de bis(2-oxo-3-oxazolidinil)-fosfonio (BOP-Cl), tetrafluoroborato de *N,N,N',N'*-bis(tetrametilen)cloruronio, hexafluorofosfato de O-(1*H*-benzotriazol-1-il)-*N,N,N',N'*-tetrametiluronio (HBTU), hexafluorofosfato de O-(1*H*-benzotriazol-1-il)-*N,N,N',N'*-bis(tetrametilen)uronio, tetrafluoroborato de O-(1*H*-benzotriazol-1-il)-*N,N,N',N'*-tetrametiluronio (TBTU), tetrafluoroborato de O-(1*H*-benzotriazol-1-il)-*N,N,N',N'*-bis(tetrametilen)uronio, hexafluorofosfato de O-(7-azabenzotriazol-1-il)-*N,N,N',N'*-tetrametiluronio (HATU), 1-hidroxibenzotriazol (HOBt) y sal de 4-(4,6-dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il)-4-metilmorfolinio (DMT.MM), disponibles en la mayoría de los casos como cloruro. Estos reactivos pueden emplearse por separado o dado el caso en combinación.

15

20

25

Para la activación dirigida de los compuestos con la fórmula (I-b) pueden usarse en cambio también anhídridos mixtos (LG = COOR), que llevan a la preparación de compuestos de fórmula (I-c-1) y (I-d) (véase G. W. Anderson et al. J. Am. Chem. Soc. 1967, 89, 5012-5017). En este procedimiento pueden emplearse distintos ésteres de ácido clorofórmico, tales como por ejemplo éster isobutílico de ácido clorofórmico (LG = COOR con R = *iso*-butilo) y éster isopropílico de ácido clorofórmico (LG = COOR con R = *iso*-propilo). Asimismo, pueden usarse para ello cloruro de dietilacetilo, cloruro de trimetilacetilo y similares.

30

Las siguientes reacciones de los compuestos de fórmula (I-c) activados con los componentes de amina respectivos según el esquema de reacción IV se lleva a cabo dado el caso en presencia de un adyuvante de reacción adecuado y en presencia de un disolvente o diluyente adecuado.

35

Como adyuvantes de reacción adecuados se usan adyuvantes de reacción básicos para llevar a cabo el procedimiento de acuerdo con el esquema de reacción IV.

A modo de ejemplo se mencionan los hidróxidos, hidruros, óxidos y carbonatos de litio, sodio, potasio, magnesio, calcio y bario, asimismo otros compuestos básicos tales como bases de guanidina tales como 7-metil-1,5,7-triaza-biciclo(4.4.0)dec-5-eno (MTBD); diazabicyclo(4.3.0)noneno (DBN), diazabicyclo(2.2.2)octano (DABCO), 1,8-diazabicyclo(5.4.0)undeceno (DBU), ciclohexiltetrabutyl-guanidina (CyTBG), ciclohexiltetrametilguanidina (CyTMG), *N,N,N,N*-tetrametil-1,8-naftalindiamina, pentametilpiperidina, aminas terciarias tales como trietilamina, trimetilamina, tribencilamina, triisopropilamina, tributilamina, triciclohexilamina, triamilamina, trihexilamina, *N,N*-dimetilaniilina, *N,N*-dimetil-toluidina, *N,N*-dimetil-p-aminopiridina, *N*-metilpirrolidina, *N*-metilpiperidina, *N*-metil-imidazol, *N*-metil-pirazol, *N*-metil-morfolina, *N*-metilhexametilendiamina, piridina, 4-pirrolidinopiridina, 4-dimetilamino-piridina, quinolina,  $\alpha$ -picolina,  $\beta$ -picolina, isoquinolina, pirimidina, acridina, *N,N,N',N'*-tetrametilendiamina, *N,N,N',N'*-tetraetilendiamina, quinoxalina, *N*-propil-diisopropilamina, *N*-etil-diisopropilamina (base de Hünig), *N,N'*-dimetilciclohexilamina, 2,6-lutidina, 2,4-lutidina o trietildiamina.

Como adyuvantes de reacción básicos para llevar a cabo el procedimiento de acuerdo con el esquema de reacción IV pueden emplearse todos los agentes aceptores de ácido adecuados, por ejemplo aminas, en particular aminas terciarias, así como compuestos de metal alcalino y alcalinotérreo.

Para la preparación de compuestos de fórmula (I-d) se emplean preferentemente aminas terciarias tales como *N*-propil-diisopropilamina o *N*-etil-diisopropilamina (DIEA; base de Hünig).

Como disolventes o diluyentes adecuados se tienen en cuenta todos los disolventes orgánicos inertes, por ejemplo hidrocarburos alifáticos o aromáticos (tales como éter de petróleo, tolueno), hidrocarburos halogenados (tales como clorotolueno, diclorometano, cloroformo, 1,2-dicloroetano), éteres (tales como dietil éter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano), ésteres (tales como éster etílico o éster metílico de ácido acético), nitrohidrocarburos (tales como nitrometano, nitroetano, nitrobenzono), nitrilos (tales como acetonitrilo, benzonitrilo), amidas (tales como *N,N*-dimetilformamida, *N,N*-dimetilacetamidas, *N*-metilformanilida, *N*-metilpirrolidona, triamida de ácido hexametilfosfórico) así como dimetilsulfóxido o agua o mezclas de los disolventes mencionados.

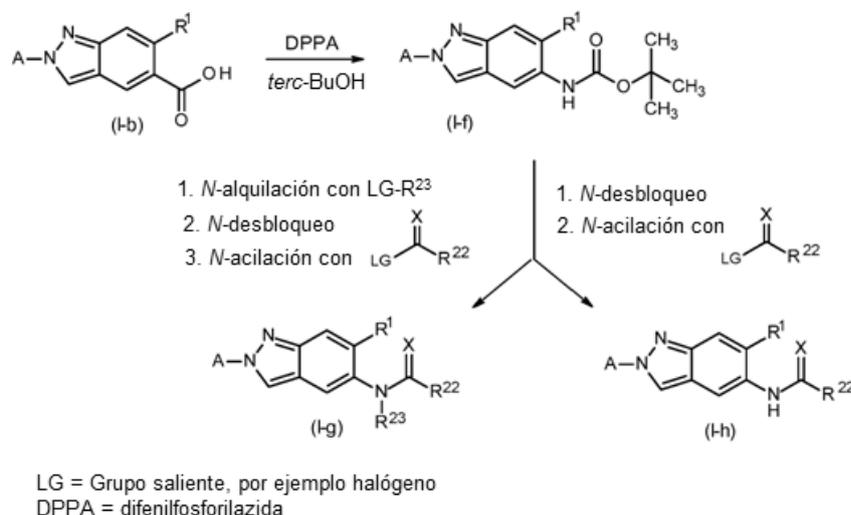
Preferentemente se emplean amidas como disolvente, tal como por ejemplo *N,N*-dimetilformamida.

Compuestos de fórmula (I), en los que W representa SO (sulfóxidos) o W representa SO<sub>2</sub> (sulfonas) pueden prepararse mediante oxidación según procedimientos conocidos de la bibliografía a partir de compuestos de fórmula (I), en los que W representa S (tioéteres), por ejemplo mediante un agente oxidante en un disolvente o diluyente adecuado. Como agente oxidante son adecuados por ejemplo ácido nítrico diluido, peróxido de hidrógeno, Oxone® y ácidos peroxiacetálicos, tales como por ejemplo ácido *meta*-cloroperbenzoico. Como disolvente o diluyente son adecuados disolventes orgánicos inertes, normalmente acetonitrilo y disolventes halogenados tales como diclorometano, cloroformo o dicloroetano, así como agua y alcoholes tales como metanol para la reacción con Oxone®.

Para la generación de sulfóxidos enantioméricamente enriquecidos son adecuados una pluralidad de procedimientos, tal como se describen por G. E. O'Mahony et al., en ARKIVOC (Gainesville, FL, Estados Unidos), 2011, 1, 1-110: oxidaciones asimétricas catalizadas por metal de tioéteres, por ejemplo con titanio o vanadio como fuentes de catalizador usadas principalmente, en forma de Ti(O<sup>i</sup>Pr)<sub>4</sub> o VO(acac)<sub>2</sub>, junto con un ligando quiral y un agente oxidante tal como peróxido de *tert*-butil-hidrógeno (TBHP), hidroperóxido de 2-fenilpropan-2-ilo (CHP) o peróxido de hidrógeno; oxidaciones asimétricas catalizadas por no metal mediante el uso de agentes oxidantes quirales o catalizadores quirales; oxidaciones asimétricas electroquímicas o biológicas así como resolución cinética de sulfóxidos y desplazamiento nucleofílico (según el procedimiento de Andersen).

Compuestos de fórmula (I), en los que A, R<sup>1</sup> tienen el significado mencionado más anteriormente y R<sup>2</sup> representa -NR<sup>23</sup>-C(X)-R<sup>22</sup>, pueden obtenerse por ejemplo a partir de compuestos de fórmula (I), en los que R<sup>2</sup> representa -NHR<sup>23</sup>, por medio de reacción de *N*-acilación con el uso de compuestos activados de fórmula LG-CX-R<sup>22</sup>, donde LG representa un grupo saliente nucleofugo generado dado el caso *in-situ*.

Estos compuestos de fórmula (I), en los que R<sup>2</sup> representa -NHR<sup>23</sup>, pueden prepararse a partir de compuestos de fórmula (I), en los que R<sup>2</sup> representa un grupo carboxilo, de acuerdo con el esquema de reacción VI según procedimientos conocidos.

**Esquema de reacción VI**

Por ejemplo, pueden obtenerse compuestos de fórmula (I-f) por medio de degradación de Curtius, tal como se describe por ejemplo en Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, volumen XI/1 (Georg Thieme Verlag Stuttgart), página 865.

- 5 En este sentido, los compuestos de fórmula (I-b) pueden reaccionar por ejemplo con difenilfosforilazida (DPPA) en presencia de *tert*-butanol directamente para dar compuestos de fórmula (I-f).

A partir de los compuestos de fórmula (I-f) pueden obtenerse los compuestos de fórmula (I-g) mediante N-alkilación en una primera etapa de reacción, N-desbloqueo (es decir, escisión del grupo Boc) en una segunda etapa de reacción y posterior N-acilación en una tercera etapa de reacción.

- 10 Los compuestos de fórmula (I-h) pueden prepararse por medio de N-desbloqueo (es decir, escisión del grupo Boc) en una primera etapa de reacción y posterior N-acilación en una segunda etapa de reacción (véanse Ejemplos 105 a 107, 114 a 120, 125 a 127).

- 15 En general, para la eliminación del grupo protector, pueden usarse adyuvantes de reacción ácidos o básicos según el modo de proceder conocido de la bibliografía. En el caso del uso de grupos protectores de tipo carbamato se usan preferentemente adyuvantes de reacción ácidos. En el caso del uso del grupo protector carbamato de *tert*-butilo (grupo Boc) se usan por ejemplo mezclas de ácidos minerales tales como ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido nítrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico o de ácidos orgánicos tales como ácido benzoico, ácido fórmico, ácido acético, ácido trifluoroacético, ácido metanosulfónico, ácido bencenosulfónico o ácido toluenosulfónico en un diluyente adecuado tal como agua y/o un disolvente orgánico tal como tetrahidrofurano, dioxano, diclorometano, cloroformo, éster acético, etanol o metanol. Se prefieren mezclas de ácido clorhídrico o ácido acético con agua y/o un disolvente orgánico tal como éster acético.

**Isómeros**

- 25 Los compuestos de fórmula (I) pueden encontrarse, en función del tipo de sustituyentes como isómeros geométricos y/o como isómeros ópticamente activos o mezclas de isómeros correspondientes en diferente composición. Estos estereoisómeros son por ejemplo enantiómeros, diastereómeros, atropisómeros o isómeros geométricos. La invención comprende por lo tanto estereoisómeros puros como también cualquier mezcla de estos isómeros.

**Procedimientos y usos**

- 30 La invención se refiere también a un procedimiento para combatir plagas animales, en el que se dejan actuar compuestos de fórmula (I) sobre plagas animales y/o su hábitat. Preferentemente el control de las plagas animales se lleva a cabo en la agricultura y silvicultura y en la protección de materiales. Entre estos están excluidos procedimientos para el tratamiento quirúrgico o terapéutico del cuerpo humano o animal y procedimientos de diagnóstico que se efectúan en el cuerpo humano o animal.

La invención se refiere asimismo al uso de los compuestos de fórmula (I) como pesticidas, en particular agentes fitoprotectores.

- 35 En el contexto de la presente solicitud, el término pesticidas abarca siempre el término agentes fitoprotectores.

Los compuestos de fórmula (I) son adecuados en el caso de una buena compatibilidad con las plantas, toxicidad para animales de sangre caliente favorable y buena compatibilidad ambiental para la protección de plantas y órganos de plantas frente a factores de estrés biótico y abiótico, para aumentar los rendimientos de las cosechas, mejorar la calidad del producto cosechado y para combatir plagas animales, en particular insectos, arácnidos, helmintos, nematodos y moluscos, que aparecen en la agricultura, en horticultura, en la cría de animales, en acuicultura, en bosques, en jardines y instalaciones de ocio, en la protección de reservas y materiales así como en el sector de la higiene. Pueden emplearse preferentemente como pesticidas. Son activos contra especies generalmente sensibles y resistentes así como contra todos los estadios de desarrollo o estadios de desarrollo individuales. Entre las plagas mencionadas anteriormente figuran:

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

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

del orden o de la clase de los colémbolos por ejemplo *Onychiurus armatus*; *Sminthurus viridis*;

de la clase de los diplópodos por ejemplo *Bianiulus guttulatus*;

30 de la clase de los insectos, por ejemplo del orden de los blatodeos por ejemplo *Blatta orientalis*, *Blattella asahinai*, *Blattella germanica*, *Leucophaea maderae*, *Loboptera decipiens*, *Neostilopyga rhombifolia*, *Panchlora* spp., *Parcoblatta* spp., *Periplaneta* spp., por ejemplo *Periplaneta americana*, *Periplaneta australasiae*, *Pycnoscelus surinamensis*, *Supella longipalpa*;

del orden de los coleópteros por ejemplo *Acalymma vittatum*, *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus* spp., *Aethina tumida*, *Agelastica alni*, *Agriotes* spp., por ejemplo *Agriotes linneatus*, *Agriotes mancus*, *Alphitobius diaperinus*, *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora* spp., *Anthonomus* spp., por ejemplo *Anthonomus grandis*, *Anthrenus* spp., *Apion* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp., por ejemplo *Atomaria linearis*, *Attagenus* spp., *Baris caerulescens*, *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., por ejemplo *Bruchus pisorum*, *Bruchus rufimanus*, *Cassida* spp., *Ceratomyza trifurcata*, *Ceutorrhynchus* spp., por ejemplo *Ceutorrhynchus assimilis*, *Ceutorrhynchus quadridens*,  
 40 *Ceutorrhynchus rapae*, *Chaetocnema* spp., por ejemplo *Chaetocnema confinis*, *Chaetocnema denticulata*, *Chaetocnema ectypa*, *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp., por ejemplo *Cosmopolites sordidus*, *Costelytra zealandica*, *Ctenicera* spp., *Curculio* spp., por ejemplo *Curculio caryae*, *Curculio caryatipes*, *Curculio obtusus*, *Curculio sayi*, *Cryptolestes ferrugineus*, *Cryptolestes pusillus*, *Cryptorhynchus lapathi*, *Cryptorhynchus mangiferae*, *Cylindrocopturus* spp., *Cylindrocopturus adpersus*, *Cylindrocopturus furnissi*, *Dermestes* spp.,  
 45 *Diabrotica* spp., por ejemplo *Diabrotica balteata*, *Diabrotica barberi*, *Diabrotica undecimpunctata howardi*, *Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata*, *Diabrotica virgifera virgifera*, *Diabrotica virgifera zea*, *Dichocrocis* spp., *Dicladispa armigera*, *Diloboderus* spp., *Epicaerus* spp., *Epilachna* spp., por ejemplo *Epilachna borealis*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix* spp., por ejemplo *Epitrix cucumeris*, *Epitrix fuscata*, *Epitrix hirtipennis*, *Epitrix subcrinita*, *Epitrix tuberis*, *Faustinus* spp., *Gibbium psyllioides*, *Gnathocerus cornutus*, *Hellula undalis*, *Heteronychus arator*,  
 50 *Heteronyx* spp., *Hylamorpha elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypomeces squamosus*, *Hypothenemus* spp., por ejemplo *Hypothenemus hampei*, *Hypothenemus obscurus*, *Hypothenemus pubescens*, *Lachnosterna consanguinea*, *Lasioderma serricornis*, *Latheticus oryzae*, *Lathridius* spp., *Lema* spp., *Leptinotarsa decemlineata*, *Leucoptera* spp., por ejemplo *Leucoptera coffeella*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Listronotus* (= *Hyperodes*) spp.,  
 55 *Lixus* spp., *Luperomorpha xanthodera*, *Luperodes* spp., *Lyctus* spp., *Megascelis* spp., *Melanotus* spp., por ejemplo *Melanotus longulus oregonensis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha* spp., por ejemplo *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp., *Naupactus xanthographus*, *Necrobia* spp., *Neogalerucella* spp., *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Oryzaphagus oryzae*, *Otiorynchus* spp., por ejemplo *Otiorynchus cribricollis*, *Otiorynchus ligustici*, *Otiorynchus ovatus*, *Otiorynchus rugosostriatus*, *Otiorynchus sulcatus*, *Oulema* spp., por ejemplo *Oulema melanopus*, *Oulema oryzae*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*,  
 60 *Phyllophaga* spp., *Phyllophaga helleri*, *Phyllotreta* spp., por ejemplo *Phyllotreta armoraciae*, *Phyllotreta pusilla*, *Phyllotreta ramosa*, *Phyllotreta striolata*, *Popillia japonica*, *Premnotrypes* spp., *Prostephanus truncatus*, *Psylliodes*

- spp., por ejemplo *Psylliodes affinis*, *Psylliodes chrysocephala*, *Psylliodes punctulata*, *Ptinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizopertha dominica*, *Rhynchophorus* spp., *Rhynchophorus ferrugineus*, *Rhynchophorus palmarum*, *Sinoxylon perforans*, *Sitophilus* spp., por ejemplo *Sitophilus granarius*, *Sitophilus linearis*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Sphenophorus* spp., *Stegobium paniceum*, *Sternechus* spp., por ejemplo *Sternechus paludatus*, *Symphyletes* spp., *Tanymecus* spp., por ejemplo *Tanymecus dilaticollis*, *Tanymecus indicus*, *Tanymecus palliatus*, *Tenebrio molitor*, *Tenebrioides mauretanicus*, *Tribolium* spp., por ejemplo *Tribolium audax*, *Tribolium castaneum*, *Tribolium confusum*, *Trogoderma* spp., *Tychius* spp., *Xylotrechus* spp., *Zabrus* spp., por ejemplo *Zabrus tenebrioides*;
- del orden de los dermápteros por ejemplo *Anisolabis maritime*, *Forficula auricularia*, *Labidura riparia*;
- del orden de los dípteros por ejemplo *Aedes* spp., por ejemplo *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes sticticus*, *Aedes vexans*, *Agromyza* spp., por ejemplo *Agromyza frontella*, *Agromyza parvicornis*, *Anastrepha* spp., *Anopheles* spp., por ejemplo *Anopheles quadrimaculatus*, *Anopheles gambiae*, *Asphondylia* spp., *Bactrocera* spp., por ejemplo *Bactrocera cucurbitae*, *Bactrocera dorsalis*, *Bactrocera oleae*, *Bibio hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*, *Calliphora vicina*, *Ceratitis capitata*, *Chironomus* spp., *Chrysomya* spp., *Chrysops* spp., *Chrysozona pluvialis*, *Cochliomya* spp., *Contarinia* spp., por ejemplo *Contarinia johnsoni*, *Contarinia nasturtii*, *Contarinia pivivora*, *Contarinia schulzi*, *Contarinia sorghicola*, *Contarinia tritici*, *Cordilobia anthropophaga*, *Cricotopus silvestris*, *Culex* spp., por ejemplo *Culex pipiens*, *Culex quinquefasciatus*, *Culicoides* spp., *Culiseta* spp., *Cuterebra* spp., *Dacus oleae*, *Dasineura* spp., por ejemplo *Dasineura brassicae*, *Delia* spp., por ejemplo *Delia antiqua*, *Delia coarctata*, *Delia florilega*, *Delia platura*, *Delia radicum*, *Dermatobia hominis*, *Drosophila* spp., por ejemplo *Drosophila melanogaster*, *Drosophila suzukii*, *Echinocnemus* spp., *Euleia heraclei*, *Fannia* spp., *Gasterophilus* spp., *Glossina* spp., *Haematopota* spp., *Hydrellia* spp., *Hydrellia griseola*, *Hilemya* spp., *Hippobosca* spp., *Hypoderma* spp., *Liriomyza* spp., por ejemplo *Liriomyza brassicae*, *Liriomyza huidobrensis*, *Liriomyza sativae*, *Lucilia* spp., por ejemplo *Lucilia cuprina*, *Lutzomyia* spp., *Mansonina* spp., *Musca* spp., por ejemplo *Musca domestica*, *Musca domestica vicina*, *Oestrus* spp., *Oscinella frit*, *Paratanytarsus* spp., *Paralauterborniella subcincta*, *Pegomya* spp., por ejemplo *Pegomya betae*, *Pegomya hyoscyami*, *Pegomya rubivora*, *Phlebotomus* spp., *Phorbia* spp., *Phormia* spp., *Piophilina casei*, *Platyparea poeciloptera*, *Prodiplosis* spp., *Psila rosae*, *Rhagoletis* spp., por ejemplo *Rhagoletis cingulata*, *Rhagoletis completa*, *Rhagoletis fausta*, *Rhagoletis indifferens*, *Rhagoletis mendax*, *Rhagoletis pomonella*, *Sarcophaga* spp., *Simulium* spp., por ejemplo *Simulium meridionale*, *Stomoxys* spp., *Tabanus* spp., *Tetanops* spp., *Tipula* spp., por ejemplo *Tipula paludosa*, *Tipula simplex*, *Toxotrypana curvicauda*;
- del orden de los hemípteros por ejemplo *Acizzia acaciaebaileyanae*, *Acizzia dodonaeae*, *Acizzia uncatoides*, *Acrida turrita*, *Acyrtosiphon* spp., por ejemplo *Acyrtosiphon pisum*, *Acrogonia* spp., *Aeneolamia* spp., *Agonosцена* spp., *Aleurocanthus* spp., *Aleyrodes proletella*, *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrix floccosus*, *Allocaridara malayensis*, *Amrasca* spp., por ejemplo *Amrasca bigutulla*, *Amrasca devastans*, *Anuraphis cardui*, *Aonidiella* spp., por ejemplo *Aonidiella aurantii*, *Aonidiella citrina*, *Aonidiella inornata*, *Aphanostigma piri*, *Aphis* spp., por ejemplo *Aphis citricola*, *Aphis craccivora*, *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis glycines*, *Aphis gossypii*, *Aphis hederiae*, *Aphis illinoisensis*, *Aphis middletoni*, *Aphis nasturtii*, *Aphis nerii*, *Aphis pomi*, *Aphis spiraeicola*, *Aphis viburniphila*, *Arboridia apicalis*, *Arytainilla* spp., *Aspidiella* spp., *Aspidiotus* spp., por ejemplo *Aspidiotus nerii*, *Atanus* spp., *Aulacorthum solani*, *Bemisia tabaci*, *Blastosylla occidentalis*, *Boreioglycaspis melaleucaae*, *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycolus* spp., *Brevicoryne brassicae*, *Cacopsylla* spp., por ejemplo *Cacopsylla piricola*, *Calligypona marginata*, *Capulinia* spp., *Carneiocephala fulgida*, *Ceratovacuna lanigera*, *Cercopidae*, *Ceroplastes* spp., *Chaetosiphon fragaefolii*, *Chionaspis tegalensis*, *Chlorita onukii*, *Chondracris rosea*, *Chromaphis juglandicola*, *Chrysomphalus aonidum*, *Chrysomphalus ficus*, *Cicadulina mbila*, *Coccoxymylus halli*, *Coccus* spp., por ejemplo *Coccus hesperidum*, *Coccus longulus*, *Coccus pseudomagnoliarum*, *Coccus viridis*, *Cryptomyzus ribis*, *Cryptoneossa* spp., *Ctenarytaina* spp., *Dalbulus* spp., *Dialeurodes chittendeni*, *Dialeurodes citri*, *Diaphorina citri*, *Diaspis* spp., *Diuraphis* spp., *Doralis* spp., *Drosicha* spp., *Dysaphis* spp., por ejemplo *Dysaphis apiifolia*, *Dysaphis plantaginea*, *Dysaphis tulipae*, *Dysmicoccus* spp., *Empoasca* spp., por ejemplo *Empoasca abrupta*, *Empoasca fabae*, *Empoasca maligna*, *Empoasca solana*, *Empoasca stevensi*, *Eriosoma* spp., por ejemplo *Eriosoma americanum*, *Eriosoma lanigerum*, *Eriosoma piricola*, *Erythroneura* spp., *Eucalyptolyma* spp., *Euphyllura* spp., *Euscelis bilobatus*, *Ferrisia* spp., *Fiorinia* spp., *Furcaspis oceanica*, *Geococcus coffeae*, *Glycaspis* spp., *Heteropsylla cubana*, *Heteropsylla spinulosa*, *Homalodisca coagulata*, *Hyalopterus arundinis*, *Hyalopterus pruni*, *Icerya* spp., por ejemplo *Icerya purchasi*, *Idiocerus* spp., *Idioscopus* spp., *Laodelphax striatellus*, *Lecanium* spp., por ejemplo *Lecanium corni* (= *Parthenolecanium corni*), *Lepidosaphes* spp., por ejemplo *Lepidosaphes ulmi*, *Lipaphis erysimi*, *Lopholeucaspis japonica*, *Lycorma delicatula*, *Macrosiphum* spp., por ejemplo *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphum lillii*, *Macrosiphum rosae*, *Macrosteles facifrons*, *Mahanarva* spp., *Melanaphis sacchari*, *Metcalfiella* spp., *Metcalfa pruinosus*, *Metopolophium dirhodum*, *Monellia costalis*, *Monelliopsis pecanis*, *Myzus* spp., por ejemplo *Myzus ascalonicus*, *Myzus cerasi*, *Myzus ligustri*, *Myzus ornatus*, *Myzus persicae*, *Myzus nicotianae*, *Nasonovia ribisnigri*, *Neomaskellia* spp., *Nephotettix* spp., por ejemplo *Nephotettix cincticeps*, *Nephotettix nigropictus*, *Nettigoniclla spectra*, *Nilaparvata lugens*, *Oncometopia* spp., *Orthezia praelonga*, *Oxia chinensis*, *Pachypsylla* spp., *Parabemisia myricae*, *Paratrioza* spp., por ejemplo *Paratrioza cockerelli*, *Parlatoria* spp., *Pemphigus* spp., por ejemplo *Pemphigus bursarius*, *Pemphigus populivivae*, *Peregrinus maidis*, *Perkinsiella* spp., *Phenacoccus* spp., por ejemplo *Phenacoccus madeirensis*, *Phloeomyzus passerinii*, *Phorodon humuli*, *Phylloxera* spp., por ejemplo *Phylloxera devastatrix*, *Phylloxera notabilis*, *Pinnaspis aspidistrae*, *Planococcus* spp., por ejemplo *Planococcus citri*, *Prosopidopsylla flava*, *Protopulvinaria piriformis*, *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pseudococcus* spp., por ejemplo

5 Pseudococcus calceolariae, Pseudococcus comstocki, Pseudococcus longispinus, Pseudococcus maritimus, Pseudococcus viburni, Psyllopsis spp., Psylla spp., por ejemplo Psylla buxi, Psylla mali, Psylla pyri, Pteromalus spp., Pulvinaria spp., Pyrilla spp., Quadraspidiotus spp., por ejemplo Quadraspidiotus juglansregiae, Quadraspidiotus ostreaeformis, Quadraspidiotus perniciosus, Quesada gigas, Rastrococcus spp., Rhopalosiphum spp., por ejemplo Rhopalosiphum maidis, Rhopalosiphum oxyacanthae, Rhopalosiphum padi, Rhopalosiphum rufiabdominale, Saissetia spp., por ejemplo Saissetia coffeae, Saissetia miranda, Saissetia neglecta, Saissetia oleae, Scaphoideus titanus, Schizaphis graminum, Selenaspidus articulatus, Siphia flava, Sitobion avenae, Sogata spp., Sogatella furcifera, Sogatodes spp., Stictocephala festina, Siphoninus phillyreae, Tenalaphara malayensis, Tetragonocephala spp., Tinocallis caryaefoliae, Tomaspis spp., Toxoptera spp., por ejemplo Toxoptera aurantii, Toxoptera citricidus, Trialeurodes vaporariorum, Trioza spp., por ejemplo Trioza diospiri, Typhlocyba spp., Unaspis spp., Viteus vitifolii, Zyginia spp.;

15 del suborden de los Heteroptera por ejemplo Aelia spp., Anasa tristis, Antestiopsis spp., Boisea spp., Blissus spp., Calocoris spp., Campylomma livida, Cavelerius spp., Cimex spp., por ejemplo Cimex adjunctus, Cimex hemipterus, Cimex lectularius, Cimex pilosellus, Collaria spp., Creontiades dilutus, Dasyneus piperis, Dichelops furcatus, Diconocoris hewetti, Dysdercus spp., Euschistus spp., por ejemplo Euschistus heros, Euschistus servus, Euschistus tristigmus, Euschistus variolarius, Eurydema spp., Eurygaster spp., Halyomorpha halys, Heliopeltis spp., Horcias nobillellus, Leptocorisa spp., Leptocorisa varicornis, Leptoglossus occidentalis, Leptoglossus phyllopus, Lygocoris spp., por ejemplo Lygocoris pabulinus, Lygus spp., por ejemplo Lygus elisus, Lygus hesperus, Lygus lineolaris, Macropes excavatus, Megacopta cribraria, Miridae, Monalonia atratum, Nezara spp., por ejemplo  
20 Nezara viridula, Nysius spp., Oebalus spp., Pentomidae, Piesma quadrata, Piezodorus spp., por ejemplo Piezodorus guildinii, Psallus spp., Pseudacysta perseae, Rhodnius spp., Sahlbergella singularis, Scaptocoris castanea, Scotinophora spp., Stephanitis nashi, Tibraca spp., Triatoma spp.;

25 del orden de los himenópteros por ejemplo Acromyrmex spp., Athalia spp., por ejemplo Athalia rosae, Atta spp., Camponotus spp., Dolichovespula spp., Diprion spp., por ejemplo Diprion similis, Hoplocampa spp., por ejemplo Hoplocampa cookei, Hoplocampa testudinea, Lasius spp., Linepithema (Iridomyrmex) humile, Monomorium pharaonis, Paratrechina spp., Paravespula spp., Plagiolepis spp., Sirex spp., Solenopsis invicta, Tapinoma spp., Technomyrmex albipes, Urocerus spp., Vespa spp., por ejemplo Vespa crabro, Wasmannia auropunctata, Xeris spp.;

del orden de los isópodos por ejemplo Armadillidium vulgare, Oniscus asellus, Porcellio scaber;

30 del orden de los isópteros por ejemplo Coptotermes spp., por ejemplo Coptotermes formosanus, Cornitermes cumulans, Cryptotermes spp., Incisitermes spp., Kalotermes spp., Microtermes obesi, Nasutitermes spp., Odontotermes spp., Reticulitermes spp., por ejemplo Reticulitermes flavipes, Reticulitermes hesperus;

35 del orden de los lepidópteros por ejemplo Achroia grisella, Acronicta major, Adoxophyes spp., por ejemplo Adoxophyes orana, Aedia leucomelas, Agrotis spp., por ejemplo Agrotis segetum, Agrotis ipsilon, Alabama spp., por ejemplo Alabama argillacea, Amyelois transitella, Anarsia spp., Anticarsia spp., por ejemplo Anticarsia gemmatalis, Argyroploce spp., Autographa spp., Barathra brassicae, Blastodacna atra, Borbo cinnara, Bucculatrix thurberiella, Bupalus piniarius, Busseola spp., Cacoecia spp., Caloptilia theivora, Capua reticulana, Carposapsa pomonella, Carposina niponensis, Cheimantobia brumata, Chilo spp., por ejemplo Chilo plejadellus, Chilo suppressalis, Choreutis pariana, Choristoneura spp., Chrysodeixis chalcites, Clysia ambiguella, Cnaphalocerus spp., Cnaphalocrocis medinalis, Cnephassa spp., Conopomorpha spp., Conotrachelus spp., Copitarsia spp., Cydia spp., por ejemplo Cydia nigricana, Cydia pomonella, Dalaca noctuides, Diaphania spp., Diparopsis spp., Diatraea saccharalis, Earias spp., Ecdytoplopha aurantium, Elasmopalpus lignosellus, Eldana saccharina, Ephestia spp., por ejemplo Ephestia elutella, Ephestia kuehniella, Epinotia spp., Epiphyas postvittana, Erannis spp., Erschoviella musculana, Etiella spp., Eudocima spp., Eulia spp., Eupoecilia ambiguella, Euproctis spp., por ejemplo Euproctis chrysoorrhoea, Euxoa spp., Feltia spp., Galleria mellonella, Gracillaria spp., Grapholitha spp., por ejemplo Grapholitha molesta, Grapholitha prunivora, Hedilepta spp., Helicoverpa spp., por ejemplo Helicoverpa armigera, Helicoverpa zea, Heliothis spp., por ejemplo Heliothis virescens, Hofmannophila pseudopretella, Homoeosoma spp., Homona spp., Hyponomeuta padella, Kakivoria flavofasciata, Lampides spp., Laphygma spp., Laspeyresia molesta, Leucinodes orbonalis, Leucoptera spp., por ejemplo Leucoptera coffeella, Lithocolletis spp., por ejemplo  
45 Lithocolletis blancardella, Lithophane antennata, Lobesia spp., por ejemplo Lobesia botrana, Loxagrotis albicosta, Lymantria spp., por ejemplo Lymantria dispar, Lyonetia spp., por ejemplo Lyonetia clerkella, Malacosoma neustria, Maruca testulalis, Mamestra brassicae, Melanitis leda, Mocis spp., Monopis obviella, Mythimna separata, Nemapogon cloacellus, Nymphula spp., Oiketicus spp., Omphisa spp., Operophtera spp., Oria spp., Orthaga spp., Ostrinia spp., por ejemplo Ostrinia nubilalis, Panolis flammea, Parnara spp., Pectinophora spp., por ejemplo Pectinophora gossypiella, Perileucoptera spp., Phthorimaea spp., por ejemplo Phthorimaea operculella, Phyllocnistis citrella, Phyllonorycter spp., por ejemplo Phyllonorycter blancardella, Phyllonorycter crataegella, Pieris spp., por ejemplo Pieris rapae, Platynota stultana, Plodia interpunctella, Plusia spp., Plutella xylostella (=Plutella maculipennis), Prays spp., Prodenia spp., Protoperce spp., Pseudaletia spp., por ejemplo Pseudaletia unipuncta, Pseudoplusia includens, Pyrausta nubilalis, Rachiplusia nu, Schoenobius spp., por ejemplo Schoenobius bipunctifer, Scirpophaga spp., por ejemplo Scirpophaga innotata, Scotia segetum, Sesamia spp., por ejemplo Sesamia inferens, Sparganothis spp., Spodoptera spp., por ejemplo Spodoptera eradiana, Spodoptera exigua, Spodoptera frugiperda, Spodoptera praefica, Stathmopoda spp., Stenoma spp., Stomopteryx subsecivella,

Synanthedon spp., Tecia solanivora, Thaumetopoea spp., Thermesia gemmatilis, Tinea cloacella, Tinea pellionella, Tineola bisselliella, Tortrix spp., Trichophaga tapetzella, Trichoplusia spp., por ejemplo Trichoplusia ni, Tryporyza incertulas, Tuta absoluta, Virachola spp.;

5 del orden de los ortópteros o Saltatoria por ejemplo Acheta domesticus, Dichroplus spp., Gryllotalpa spp., por ejemplo Gryllotalpa gryllotalpa, Hieroglyphus spp., Locusta spp., por ejemplo Locusta migratoria, Melanoplus spp., por ejemplo Melanoplus devastator, Paratlanticus ussuriensis, Schistocerca gregaria;

del orden de los fitópteros por ejemplo Damalinia spp., Haematopinus spp., Linognathus spp., Pediculus spp., Phylloxera vastatrix, Phthirus pubis, Trichodectes spp.;

del orden de los psocópteros por ejemplo Lepinotus spp., Liposcelis spp.;

10 del orden de los sifonápteros por ejemplo Ceratophyllus spp., Ctenocephalides spp., por ejemplo Ctenocephalides canis, Ctenocephalides felis, Pulex irritans, Tunga penetrans, Xenopsylla cheopis;

15 del orden de los tisanópteros por ejemplo Anaphothrips obscurus, Baliothrips biformis, Chaetanaphothrips leeuweni, Drepanothrips reuteri, Enneothrips flavens, Frankliniella spp., por ejemplo Frankliniella fusca, Frankliniella occidentalis, Frankliniella schultzei, Frankliniella tritici, Frankliniella vaccinii, Frankliniella williamsi, Haplothrips spp., Heliothrips spp., Hercinothrips femoralis, Kakothrips spp., Rhipiphorotheus cruentatus, Scirtothrips spp., Taeniothrips cardamomi, Thrips spp., por ejemplo Thrips palmi, Thrips tabaci;

del orden de los zigentomos (= tisanuros), por ejemplo Ctenolepisma spp., Lepisma saccharina, Lepismodes inquilinus, Thermobia domestica;

de la clase de los sínfilos por ejemplo Scutigera spp., por ejemplo Scutigera immaculata;

20 plagas del filo de los moluscos, en particular de la clase de los bivalvos, por ejemplo Dreissena spp.;

así como de la clase de los gastrópodos por ejemplo Arion spp., por ejemplo Arion ater rufus, Biomphalaria spp., Bulinus spp., Deroceras spp., por ejemplo Deroceras laeve, Galba spp., Lymnaea spp., Oncomelania spp., Pomacea spp., Succinea spp.;

25 Parásitos de animales y de humanos de los filos de los platelmintos y nematodos, por ejemplo z.B. Aelurostrongylus spp., Amidostomum spp., Ancylostoma spp., por ejemplo Ancylostoma duodenale, Ancylostoma ceylanicum, Ancylostoma braziliense, Angiostrongylus spp., Anisakis spp., Anoplocephala spp., Ascaris spp., Ascaridia spp., Baylisascaris spp., Brugia spp., por ejemplo Brugia malayi, Brugia timori, Bunostomum spp., Capillaria spp., Chabertia spp., Clonorchis spp., Cooperia spp., Crenosoma spp., Cyathostoma spp., Dicrocoelium spp., Dictyocaulus spp., por ejemplo Dictyocaulus filaria, Diphyllbothrium spp., por ejemplo Diphyllbothrium latum, Dipylidium spp., Diofilaria spp., Dracunculus spp., por ejemplo Dracunculus medinensis, Echinococcus spp., por ejemplo Echinococcus granulosus, Echinococcus multilocularis, Echinostoma spp., Enterobius spp., por ejemplo Enterobius vermicularis, Eucoleus spp., Fasciola spp., Fascioloides spp., Fasciolopsis spp., Filaroides spp., Gongylonema spp., Gyrodactylus spp., Habronema spp., Haemonchus spp., Heligmosomoides spp., Heterakis spp., Hymenolepis spp., por ejemplo Hymenolepis nana, Hyostrongylus spp., Litomosoides spp., Loa spp., por ejemplo Loa Loa, Metastrongylus spp., Metorchis spp., Mesocostoides spp., Moniezia spp., Muellerius spp., Necator spp., Nematodirus spp., Nippostrongylus spp., Oesophagostomum spp., Ollulanus spp., Onchocerca spp., por ejemplo Onchocerca volvulus, Opisthorchis spp., Oslerus spp., Ostertagia spp., Oxyuris spp., Paracapillaria spp., Parafilaria spp., Paragonimus spp., Paramphistomum spp., Paranoplocephala spp., Parascaris spp., Passalurus spp., Protostrongylus spp., Schistosoma spp., Setaria spp., Spirocerca spp., Stephanofilaria spp., Stephanurus spp., Strongyloides spp., por ejemplo Strongyloides fuelleborni, Strongyloides stercoralis, Strongylus spp., Syngamus spp., Taenia spp., por ejemplo Taenia saginata, Taenia solium, Teladorsagia spp., Thelazia spp., Toxascaris spp., Toxocara spp., Trichinella spp., por ejemplo Trichinella spiralis, Trichinella nativa, Trichinella britovi, Trichinella nelsoni, Trichinella pseudospiralis, Trichobilharzia spp., Trichostrongylus spp., Trichuris spp., por ejemplo Trichuris trichuria, Uncinaria spp., Wuchereria spp., por ejemplo Wuchereria bancrofti;

45 plagas vegetales del filo de los nematodos, es decir nematodos parasitarios de plantas, en particular Aglenchus spp., por ejemplo Aglenchus agricola, Anguina spp., por ejemplo Anguina tritici, Aphelenchoides spp., por ejemplo Aphelenchoides arachidis, Aphelenchoides fragariae, Belonolaimus spp., por ejemplo Belonolaimus gracilis, Belonolaimus longicaudatus, Belonolaimus nortoni, Bursaphelenchus spp., por ejemplo Bursaphelenchus cocophilus, Bursaphelenchus eremus, Bursaphelenchus xylophilus, Cacopaurus spp., por ejemplo Cacopaurus pestis, Criconemella spp., por ejemplo Criconemella curvata, Criconemella onoensis, Criconemella ornata, Criconemella rusium, Criconemella xenoplax (= Mesocriconema xenoplax), Criconemoides spp., por ejemplo Criconemoides ferniae, Criconemoides onense, Criconemoides ornatum, Ditylenchus spp., por ejemplo Ditylenchus dipsaci, Dolichodorus spp., Globodera spp., por ejemplo Globodera pallida, Globodera rostochiensis, Helicotylenchus spp., por ejemplo Helicotylenchus dihystera, Hemicriconemoides spp., Hemicyclophora spp., Heterodera spp., por ejemplo Heterodera avenae, Heterodera glycines, Heterodera schachtii, Hirschmaniella spp., Hoplolaimus spp., Longidorus spp., por ejemplo Longidorus africanus, Meloidogyne spp., por ejemplo Meloidogyne chitwoodi, Meloidogyne fallax, Meloidogyne hapla, Meloidogyne incognita, Meloinema spp., Nacobbus spp.,

5 Neotylenchus spp., Paralongidorus spp., Paraphelenchus spp., Paratrichodorus spp., por ejemplo Paratrichodorus minor, Paratylenchus spp., Pratylenchus spp., por ejemplo Pratylenchus penetrans, Pseudohalenchus spp., Psilenchus spp., Punctodera spp., Quinisulcius spp., Radopholus spp., por ejemplo Radopholus citrophilus, Radopholus similis, Rotylenchulus spp., Rotylenchus spp., Scutellonema spp., Subanguina spp., Trichodorus spp., por ejemplo Trichodorus obtusus, Trichodorus primitivus, Tylenchorhynchus spp., por ejemplo Tylenchorhynchus annulatus, Tylenchulus spp., por ejemplo Tylenchulus semipenetrans, Xiphinema spp., por ejemplo Xiphinema index.

Además, del subreino de los protozoos puede combatirse el orden de los coccidios por ejemplo Eimeria spp.

10 Los compuestos de fórmula (I) pueden usarse dado el caso en determinadas concentraciones o cantidades de aplicación también como herbicidas, protectores, reguladores del crecimiento o agentes para mejorar las propiedades de las plantas, como microbicidas o gametocidas, por ejemplo como fungicidas, antimicóticos, bactericidas, viricidas (inclusive agentes contra viroides) o como agentes contra MLO (organismo de tipo micoplasma) y RLO (organismo de tipo Rickettsia). Pueden emplearse dado el caso también como productos intermedios o previos para la síntesis de otros principios activos.

#### 15 Formulaciones

La presente invención se refiere además a formulaciones y formas de aplicación preparadas a partir de las mismas como pesticidas tales como por ejemplo caldos para empapado, inmersión y pulverización, que comprenden al menos un compuesto de fórmula (I). Dado el caso las formas de aplicación contienen otros pesticidas y/o adyuvantes que mejoran el efecto tales como promotores de la penetración, por ejemplo aceites vegetales tales como por ejemplo 20 aceite de colza, aceite de girasol, aceites minerales tales como por ejemplo aceites de parafina, ésteres alquílicos de ácidos grasos vegetales tales como por ejemplo éster metílico de aceite de colza o aceite de soja o alcoxilatos de alcohol y/o agentes de esparcimiento tales como por ejemplo alquilsiloxanos y/o sales por ejemplo sales de amonio o fosfonio orgánicas o inorgánicas tales como por ejemplo sulfato de amonio o hidrogenofosfato de diamonio y/o agentes que promueven la retención tales como por ejemplo sulfosuccinato de dioctilo o polímeros de hidroxipropilguar y/o 25 humectantes tales como por ejemplo glicerol y/o fertilizantes tales como por ejemplo fertilizantes que contienen amonio, potasio o fósforo.

Formulaciones habituales son por ejemplo líquidos solubles en agua (SL), concentrados en emulsión (EC), emulsiones en agua (EW), concentrados en suspensión (SC, SE, FS, OD), granulados dispersables en agua (WG), granulados (GR) y concentrados encapsulados (CS); estos y otros posibles tipos de formulación se describen por ejemplo por 30 Crop Life International y en Pesticide Specifications, Manual on development and use of FAO and WHO specifications for pesticides, FAO Plant Production and Protection Papers - 173, preparado por la FAO/WHO Joint Meeting on Pesticide Specifications, 2004, ISBN: 9251048576. Dado el caso, las formulaciones contienen, junto a uno o varios compuestos de fórmula (I), otros principios activos agroquímicos.

Preferentemente se trata de formulaciones o formas de aplicación, que contienen agentes auxiliares tales como por 35 ejemplo extensores, disolventes, promotores de la espontaneidad, vehículos, emulsionantes, dispersantes, anticongelantes, biocidas, espesantes y/u otros agentes auxiliares tales como por ejemplo adyuvantes. Un adyuvante en este contexto es un componente que mejora la acción biológica de la formulación, sin que el componente en sí tenga una acción biológica. Ejemplos de adyuvantes son agentes que promueven la retención, el comportamiento de extensión, la adherencia a la superficie de las hojas o la penetración.

40 Estas formulaciones se preparan de manera conocida, por ejemplo mediante mezclado de los compuestos de fórmula (I) con agentes auxiliares tales como por ejemplo extensores, disolventes y/o vehículos sólidos y/u otros agentes auxiliares tales como por ejemplo sustancias tensioactivas. La preparación de las formulaciones tiene lugar o bien en instalaciones adecuadas o también antes o durante la aplicación.

45 Como agentes auxiliares pueden emplearse aquellas sustancias que son adecuadas para conferir a la formulación de los compuestos de fórmula (I) o a las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones (tal como por ejemplo pesticidas útiles tales como caldos de pulverización o productos de recubrimiento de semillas) propiedades especiales, tales como determinadas propiedades físicas, técnicas y/o biológicas.

50 Como extensores son adecuados por ejemplo agua, líquidos químicos orgánicos polares y no polares por ejemplo de las clases de los hidrocarburos aromáticos y no aromáticos (tales como parafinas, alquilbencenos, alquilnaftalenos, clorobencenos), de los alcoholes y polioles (que dado el caso también pueden estar sustituidos, eterificados y/o esterificados), de las cetonas (tales como acetona, ciclohexanona), ésteres (también grasas y aceites) y (poli-)éteres, de las aminas simples y sustituidas, amidas, lactamas (tales como N-alquilpirrolidonas) y lactonas, de las sulfonas y sulfóxidos (tales como dimetilsulfóxido).

55 En el caso del uso de agua como extensor pueden usarse por ejemplo también disolventes orgánicos como disolventes auxiliares. Como disolventes líquidos se tienen en cuenta esencialmente: compuestos aromáticos tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, compuestos aromáticos clorados o hidrocarburos alifáticos clorados tales como clorobencenos, cloroetileno o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano o parafinas, por ejemplo, fracciones de petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoholes tales como butanol o glicol así como sus

éteres y ésteres, cetonas tales como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, disolventes fuertemente polares tales como dimetilformamida y dimetilsulfóxido así como agua.

5 En principio pueden usarse todos los disolventes adecuados. Disolventes adecuados son por ejemplo hidrocarburos aromáticos tales como por ejemplo xileno, tolueno o alquilnaftalenos, hidrocarburos clorados aromáticos o alifáticos tales como por ejemplo clorobenceno, cloroetileno, o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos tales como por ejemplo ciclohexano, parafinas, fracciones de petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoholes tales como por ejemplo metanol, etanol, iso-propanol, butanol o glicol así como sus éteres y ésteres, cetonas tales como por ejemplo acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, disolventes fuertemente polares tales como dimetilsulfóxido así como agua.

10 En principio pueden emplearse todos los vehículos adecuados. como vehículos se tienen en cuenta en particular: por ejemplo sales de amonio y harinas de rocas naturales tales como caolines, arcillas, talco, creta, cuarzo, atapulgita, montmorillonita o tierra de diatomeas y harina de roca sintética, tales como ácido silícico altamente dispersado, óxido de aluminio y silicatos naturales o sintéticos, resinas, ceras y/o fertilizantes sólidos. Mezclas de vehículos de este tipo pueden usarse asimismo. como vehículos para granulados se tienen en cuenta: por ejemplo rocas naturales  
15 quebradas y fraccionadas tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita así como granulados sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas, así como granulados de material orgánico tales como serrín, papel, cáscaras de coco, mazorcas de maíz y tallos de tabaco.

20 Como extensores gaseosos licuados o disolventes pueden emplearse. En particular son adecuados aquellos extensores o vehículos, que son gaseosos a temperatura normal y a presión normal, por ejemplo gases propelentes de aerosol tales como hidrocarburos halogenados así como butano, propano, nitrógeno y dióxido de carbono.

25 Ejemplos de agentes que generan emulsión y/o espuma, dispersantes o humectantes con propiedades iónicas o no iónicas o mezclas de estas sustancias tensioactivas son sales de poli(ácido acrílico), sales de ácido lignosulfónico, sales de ácido fenolsulfónico o ácido naftalenosulfónico, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o con ácidos grasos o con aminas grasas, con fenoles sustituidos (preferentemente alquilfenoles o arilfenoles), sales de ésteres de ácido sulfosuccínico, derivados de taurina (preferentemente alquiltauratos), ésteres de ácido fosfórico de alcoholes o fenoles polietoxilados, ésteres de ácido graso de polioles y derivados de los compuestos que contienen sulfatos, sulfonatos y fosfatos, por ejemplo alquilarilpoliglicol éteres, alquilsulfonatos, arilsulfonatos, hidrolizados de proteína, lejías sulfíticas de lignina de desecho y metilcelulosa. La presencia de una sustancia  
30 tensioactiva es ventajosa cuando uno de los compuestos de fórmula (I) y/o uno de los vehículos inertes no es soluble en agua y cuando la aplicación tiene lugar en agua.

Como vehículos adicionales pueden estar presentes en las formulaciones y las formas de aplicación derivadas de las mismas colorantes tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, azul de ferrociano y colorantes orgánicos tales como colorantes de alizarina, azo y metaloftalocianinas y nutrientes y oligoelementos tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y zinc.

35 Además, pueden estar contenidos estabilizadores tales como estabilizadores frente al frío, agentes conservantes, antioxidantes, agentes fotoprotectores u otros agentes que mejoran la estabilidad química y/o física. Además, pueden estar contenidos agentes espumantes o antiespumantes. Asimismo, las formulaciones y formas de aplicación derivadas de las mismas pueden contener como adyuvantes adicionales también agentes adherentes tales como carboximetilcelulosa, polímeros en forma de polvo, de grano o de látex, naturales y sintéticos tales como goma arábiga,  
40 poli(alcohol vinílico), poli(acetato de vinilo) así como fosfolípidos naturales tales como cefalinas y lecitinas y fosfolípidos sintéticos. Otras sustancias auxiliares pueden ser aceites minerales y vegetales.

45 Dado el caso pueden estar contenidas aún otras sustancias auxiliares en las formulaciones y las formas de aplicación derivadas de las mismas. Tales aditivos son por ejemplo sustancias aromáticas, coloides protectores, aglutinantes, adhesivos, espesantes, sustancias tixotrópicas, promotores de la penetración, promotores de la retención, estabilizadores, secuestrantes, agentes complejantes, humectantes, agentes de esparcimiento. En general, los compuestos de fórmula (I) pueden combinarse con cualquier aditivo sólido o líquido, que se usa habitualmente para fines de formulación.

50 Como promotores de la retención se tienen en cuenta todas aquellas sustancias que reducen la tensión superficial dinámica tales como por ejemplo sulfosuccinato de dioctilo o aumentan la viscoelasticidad tales como por ejemplo polímeros de hidroxipropil-guar.

55 Como promotores de la penetración se tienen en cuenta en el presente contexto todas aquellas sustancias que se emplean habitualmente para mejorar la introducción de principios activos agroquímicos en las plantas. Los promotores de la penetración se definen en este contexto porque pueden introducirse en la cutícula de las plantas a partir del caldo de aplicación (por regla general acuoso) y/o a partir del producto de recubrimiento de pulverización y con ello pueden aumentar la capacidad de movimiento de las sustancias (movilidad) de los principios activos en la cutícula. El procedimiento descrito en la bibliografía (Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152) puede emplearse para la determinación de esta propiedad. A modo de ejemplo se mencionan alcoxilatos de alcohol tales como por ejemplo etoxilato de grasa de coco (10) o etoxilato de isotridecilo (12), ésteres de ácido graso tales como por ejemplo éster

metílico de aceite de colza o de aceite de soja, alcoxilatos de amina grasa tales como por ejemplo etoxilato de seboamina (15) o sales de amonio y/o fosfonio tales como por ejemplo sulfato de amonio o hidrogenofosfato de diamonio.

5 Las formulaciones contienen preferentemente entre el 0,00000001 y el 98 % en peso del compuesto de fórmula (I), de manera especialmente preferente entre el 0,01 y el 95 % en peso del compuesto de fórmula (I), de manera muy especialmente preferente entre 0,5 y 90 % en peso del compuesto de fórmula (I), con respecto al peso de la formulación.

10 El contenido en el compuesto de fórmula (I) en las formas de aplicación preparadas a partir de las formulaciones (en particular pesticidas) puede variar en amplios intervalos. La concentración del compuesto de fórmula (I) en las formas de aplicación puede encontrarse habitualmente entre el 0,00000001 y el 95 % en peso del compuesto de fórmula (I), preferentemente entre el 0,00001 y el 1 % en peso, con respecto al peso de la forma de aplicación. La aplicación se efectúa de manera habitual adaptada a una de las formas de aplicación.

#### Mezclas

15 Los compuestos de fórmula (I) pueden usarse también en mezcla con uno o varios fungicidas adecuados, bactericidas, acaricidas, molusquicidas, nematocidas, insecticidas, agentes microbiológicos, insectos útiles, herbicidas, fertilizantes, repelentes de aves, fitotónicos, esterilizantes, protectores, semioquímicos y/o reguladores del crecimiento de plantas, para ampliar así por ejemplo el espectro de acción, prologar la duración efectiva, aumentar la velocidad activa, impedir la repelencia o prevenir desarrollos de resistencias. Además, tales combinaciones de principios activos pueden mejorar el crecimiento de las plantas y/o la tolerancia frente a factores abióticos tales como por ejemplo temperaturas altas o bajas, frente a la sequedad o frente a un contenido en sal elevado en el agua o la tierra. También puede mejorarse el comportamiento de floración y crecimiento del fruto, optimizar la capacidad de germinación y enraizamiento, facilitar la cosecha y aumentar los rendimientos de la cosecha, influir en la maduración, aumentar la calidad y/o el valor nutricional de los productos de la cosecha, prolongar la estabilidad en almacén y/o mejorar la procesabilidad de los productos de la cosecha.

25 Además, los compuestos de fórmula (I) pueden encontrarse en mezcla con otros principios activos o semioquímicos, tales como sustancias atrayentes y/o repelentes de aves y/o activadores vegetales y/o reguladores del crecimiento y/o fertilizantes. Igualmente, los compuestos de fórmula (I) pueden emplearse en mezclas con agentes para mejorar las propiedades de las plantas tales como por ejemplo crecimiento, rendimiento y calidad del material de cosecha.

30 En una forma de realización de acuerdo con la invención particular, los compuestos de fórmula (I) se encuentran en formulaciones o en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones en mezcla con otros compuestos, preferentemente aquellos que se describen anteriormente.

Cuando uno de los compuestos mencionados a continuación puede encontrarse en distintas formas tautoméricas, puede estar abarcadas también estas formas, aunque estas no se mencionen explícitamente en cada uno de los casos.

#### Insecticidas / acaricidas / nematocidas

35 Los principios activos denominados con su "nombre común" son conocidos y se describen por ejemplo en el manual de pesticidas ("The Pesticide Manual" 16ª Ed., British Crop Protection Council 2012) o pueden encontrarse en internet (por ejemplo <http://www.alanwood.net/pesticides>).

40 (1) Inhibidores de la acetilcolinesterasa (AChE), tales como por ejemplo carbamatos, por ejemplo alanicarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbaril, carbofurano, carbosulfan, etiofencarb, fenobucarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metiocarb, metomil, metolcarb, oxamil, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, triazamato, trimetacarb, xmc y xilicarb u organofosfatos, por ejemplo acefato, azametipós, azinfón-etilo, azinfón-metilo, cadusafós, cloretoxifós, clorofenvinfós, clormefós, clorpirifós, clorpirifós-metilo, cumafós, cianofós, demetón-S-metilo, diazinona, diclorvos/DDVP, dicrotofós, dimetoato, dimetilvinfós, disulfoton, EPN, etiona, etoprofós, Famphur, fenamifós, fenitrotona, fentiona, fostiazato, feptenofós, imiciafós, isofenfós, O-(metoxiaminotio-fosforil) salicilato de isopropilo, isoxationa, malatién, mecarbam, metamidofós, metidation, mevinfós, monocrotofós, naled, ometoato, oxidemeton-metilo, paration, paration-metilo, fentoato, forato, fosalona, fosmet, fosfamidona, foxim, pirimifós-metilo, profenofós, propetanfós, protiofós, piraclófós, piridafentiona, quinalfós, sulfotep, tebupirinfós, temefós, terbufós, tetraclorvinfós, tiometon, triazofós, triclofon y vamidotona.

50 (2) Antagonistas de los canales de cloruro controlados por GABA, tales como por ejemplo ciclodieno-organocloro, por ejemplo clordano y endosulfán o fenilpirazol (fiprol), por ejemplo etiprol y fipronil.

55 (3) Moduladores de los canales de sodio / bloqueantes de los canales de sodio dependientes del voltaje, tales como por ejemplo piretroides, por ejemplo acrinatrina, aletrina, d-cis-trans aletrina, d-trans aletrina, bifentrina, bioaletrina, bioaletrina isómero de S-ciclopentenilo, bioresmetrina, cicloprotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, gamma-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, beta-cipermetrina, theta-cipermetrina, zeta-cipermetrina, cifenotrina [isómeros (1R)-trans], deltametrina, empentrina [isómeros (EZ)-(1R)], esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flumetrina, tau-fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, cadetrina, momfluorotrina, permetrina, fenotrina [isómero (1R)-trans], praletrina, piretrina (piretro), resmetrina, silafluofeno, teflutrina, tetrametrina, tetrametrina [isómeros (1R)], tralometrina y transflutrina o DDT o metoxicloro.

- (4) Agonistas del receptor nicotínico de la acetilcolina (nAChR), tales como por ejemplo neonicotinoides, por ejemplo acetamiprid, clotianidina, dinotefurán, imidacloprid, nitenpiram, tiacloprid y tiametoxam o nicotina o sulfoxaflor o flupiradifurona.
- (5) Activadores alostéricos del receptor nicotínico de la acetilcolina (nAChR), tales como por ejemplo espinosinas, por ejemplo espinetoram y espinosad.
- (6) Activadores de los canales de cloruro, tales como por ejemplo avermectina/milbemicina, por ejemplo abamectina, emamectina-benzoato, lepimectina y milbemectina.
- (7) Imitadores de hormonas juveniles, tales como por ejemplo análogos de hormonas juveniles, por ejemplo hidropreno, quinopreno y metopreno o fenoxicarb o piriproxifeno.
- (8) Principios activos con mecanismos de acción desconocidos o no específicos, tales como por ejemplo haluros de alquilo, por ejemplo bromuro de metilo y otros haluros de alquilo; o cloropicrina o fluoruro de sulfurilo o bórax o tratrato emético.
- (9) Sustancias inhibitorias del apetito selectivas, por ejemplo pimetozina o flonicamida.
- (10) Inhibidores del crecimiento de ácaros, por ejemplo clofentezina, hexitiazox y diflovidazina o etoxazol.
- (11) Disruptores microbianos de la membrana intestinal de insecto, por ejemplo *Bacillus thuringiensis* Subespecies israelensis, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* Subespecies aizawai, *Bacillus thuringiensis* Subespecies kurstaki, *Bacillus thuringiensis* Subespecies tenebrionis y proteínas vegetales de BT: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry2Ab, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34/35Ab1.
- (12) Inhibidores de la fosforilación oxidativa, disruptores de ATP, tales como por ejemplo diafenturión o compuestos de organoestaño, por ejemplo azociclotina, cihexatina y fenbutatin-óxido o propargita o tetradifón.
- (13) Desacopladores de la fosforilación oxidativa mediante interrupción del gradiente de protones H, tales como por ejemplo clorfenapir, DNOC y sulfluramida.
- (14) Antagonistas del receptor nicotínico de la acetilcolina, tales como por ejemplo bensultap, cartap clorhidrato, tiociclam y tiosultap-sodio.
- (15) Inhibidores de la síntesis de quitina, tipo 0, tales como por ejemplo bistriflurón, clorfluazurón, diflubenzurón, flucicloxurón, flufenoxurón, hexaflumurón, lufenurón, novalurón, noviflumurón, teflubenzurón y triflumurón.
- (16) Inhibidores de la síntesis de quitina, tipo 1, tales como por ejemplo buprofezina.
- (17) Inhibidores de la ecdisis (en particular en dípteros, es decir Diptera), tales como por ejemplo ciromazina.
- (18) Agonistas del receptor de la ecdisona, tales como por ejemplo cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida y tebufenozida.
- (19) Agonistas octopaminérgicos, tales como por ejemplo amitraz.
- (20) Inhibidores del transporte de electrones del complejo III, tales como por ejemplo hidrametilnona o acequinocil o fluacripirim.
- (21) Inhibidores del transporte de electrones del complejo I, por ejemplo acaricidas METI, por ejemplo fenazaquin, fenpiroximato, pirimidifeno, piridaben, tebufenpirad y tolfenpirad o rotenona (Derris).
- (22) Bloqueadores de los canales de sodio dependientes del voltaje, por ejemplo indoxacarb o metaflumizona.
- (23) Inhibidores de la acetil-CoA-carboxilasa, tales como por ejemplo derivados del ácido tetrónico y tetrámico, por ejemplo espirodiclofeno, espiromesifeno y espirotetramato.
- (24) Inhibidores del transporte de electrones del complejo IV, tales como por ejemplo fosfinas, por ejemplo fosfuro de aluminio, fosfuro de calcio, fosfina y fosfuro de zinc o cianuro.
- (25) Inhibidores del transporte de electrones del complejo II, tales como por ejemplo cienopirafeno y ciflumetofeno.
- (28) Efectores del receptor de rianodina, tales como por ejemplo diamidas, por ejemplo clorantraniliprol, ciantraniliprol y flubendiamida.

Otros principios activos con mecanismo de acción desconocido o no unívoco, tales como por ejemplo afidopiropeno, afoxolaner, azadiractina, benclotiaz, benzoximato, bifenazato, bromopropilato, quinometionato, criolita, ciclaniliprol, cicloxaprid, cihalodiamida dicloromezotiaz, dicofol, diflovidazina, flometoquina, fluensulfona, flufenerim, flufenoxistrobina, flufiprol, fluhexafon, fluopiram, fluralaner, fufenozida, guadipir, heptaflutrina, imidacloprid, iprodiona, meperflutrina, paichongding, piflubumida, piridilil, pirifluquinazona, piriminostrobina, tetrametilflutrina, tetraniliprol, tetraclorantraniliprol, tioazafeno, triflumezopirim y yodometano; además preparaciones a base de *Bacillus firmus* (I-1582, BioNeem, Votivo), así como los siguientes compuestos activos conocidos: 1-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoretil)sulfonil]fenil}-3-(trifluorometil)-1H-1,2,4-triazol-5-amina (conocida por el documento WO2006/043635), {1'-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]-5-fluoro-espiro[indol-3,4'-piperidin]-1(2H)-il]}(2-cloropiridin-4-il)metanona (conocida por el documento WO2003/106457), 2-cloro-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]piperidin-4-il}-4-(trifluorometil)fenil]isonicotinamida (conocida por el documento WO2006/003494), 3-(2,5-dimetilfenil)-4-hidroxi-8-metoxi-1,8-diazaespiro[4.5]dec-3-en-2-ona (conocida por el documento WO2009/049851), 3-(2,5-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1,8-diazaespiro[4.5]dec-3-en-4-il-etilcarbonato (conocido por el documento WO2009/049851), 4-(but-2-in-1-iloxi)-6-(3,5-dimetilpiperidin-1-il)-5-fluoropirimidina (conocida por el documento WO2004/099160), 4-(but-2-in-1-iloxi)-6-(3-clorofenil)pirimidina (conocida por el documento WO2003/076415), PF1364 (n.º de registro de CAS 1204776-60-2), 2-[2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil}amino)-5-cloro-3-metilbenzoil]-2-metilhidrazincarboxilato de metilo (conocido por el documento WO2005/085216), 2-[2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil}amino)-5-cian-3-metilbenzoil]-2-etilhidrazincarboxilato de metilo (conocido por el documento WO2005/085216), 2-[2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil}amino)-5-cian-3-metilbenzoil]-2-metilhidrazincarboxilato de metilo (conocido por el documento WO2005/085216), 2-[3,5-dibrom-2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil}amino)benzoil]-2-etilhidrazincarboxilato de metilo (conocido por el documento WO2005/085216), N-[2-(5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-il)-4-cloro-6-metilfenil]-3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-

carboxamida (conocida por el documento CN102057925), 8-cloro-N-[(2-cloro-5-metoxifenil)sulfonil]-6-(trifluorometil)imidazo[1,2-a]piridin-2-carboxamida (conocida por el documento WO2010/129500), 4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-2-metil-N-(1-oxidotietan-3-il)benzamida (conocida por el documento WO2009/080250), N-[(2E)-1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]piridin-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoracetamida (conocida por el documento WO2012/029672), 1-[(2-cloro-1,3-tiazol-5-il)metil]-4-oxo-3-fenil-4H-pirido[1,2-a]pirimidin-1-ilo-2-olato (conocido por el documento WO2009/099929), 1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]-4-oxo-3-fenil-4H-pirido[1,2-a]pirimidin-1-ilo-2-olato (conocido por el documento WO2009/099929), 4-(3-{2,6-dicloro-4-[(3,3-dicloroprop-2-en-1-il)oxil]fenoxi}propoxi)-2-metoxi-6-(trifluorometil)pirimidina (conocida por el documento CN101337940), N-[2-(terc-butilcarbamoil)-4-cloro-6-metilfenil]-1-(3-cloropiridin-2-il)-3-(fluorometoxi)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocida por el documento WO2008/134969), 3-[benzoil(metil)amino]-N-[2-bromo-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]-6-(trifluorometil)fenil]-2-fluoro-benzamida (conocida por el documento WO 2010018714), [2-(2,4-diclorofenil)-3-oxo-4-oxaespiro[4.5]dec-1-en-1-il]-carbonato de butilo (conocido por el documento CN 102060818), 4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il]-N-[(Z)-metoxiimino-metil]-2-metil-benzamida (conocida por el documento WO2007/026965), 3E)-3-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-1,1,1-trifluoro-propan-2-ona (conocida por el documento WO2013/144213, N-(metilsulfonil)-6-[2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-il]piridin-2-carboxamida (conocida por el documento WO2012/000896), N-[3-(bencilcarbamoil)-4-clorofenil]-1-metil-3-(pentafluoretil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboxamida conocida por el documento WO2010/051926).

#### Fungicidas

Los principios activos especificados con su "nombre común" son conocidos, por ejemplo se describen en el "Pesticide Manual" o en internet (por ejemplo: <http://www.alanwood.net/pesticides>).

Todos los componentes de mezcla fungicidas expuestos de las clases (1) a (15) pueden formar opcionalmente sales con bases o ácidos correspondientes, siempre que estén presentes grupos funcionales adecuados. Además para los componentes de mezclas fungicidas expuestos de las clases (1) a (15) están incluidas también formas tautoméricas, siempre que sea posible la tautomería.

- 1) Inhibidores de la síntesis de ergosterol, por ejemplo (1.01) aldimorf, (1.02) azaconazol, (1.03) bitertanol, (1.04) bromuconazol, (1.05) ciproconazol, (1.06) diclobutrazol, (1.07) difenoconazol, (1.08) diniconazol, (1.09) diniconazol-M, (1.10) dodemorf, (1.11) dodemorf acetato, (1.12) epoxiconazol, (1.13) etaconazol, (1.14) fenarimol, (1.15) fenbuconazol, (1.16) fenhexamida, (1.17) fenpropidina, (1.18) fenpropimorf, (1.19) fluquinconazol, (1.20) flurprimidol, (1.21) flusilazol, (1.22) flutriafol, (1.23) furconazol, (1.24) furconazol-cis, (1.25) hexaconazol, (1.26) imazalil, (1.27) imazalil sulfato, (1.28) imibenconazol, (1.29) ipconazol, (1.30) metconazol, (1.31) miclobutanilo, (1.32) naffifina, (1.33) nuarimol, (1.34) oxpoconazol, (1.35) paclobutrazol, (1.36) pefurazoato, (1.37) penconazol, (1.38) piperalina, (1.39) procloraz, (1.40) propiconazol, (1.41) protioconazol, (1.42) piributicarb, (1.43) pirifenox, (1.44) quinconazol, (1.45) simeconazol, (1.46) espiroxamina, (1.47) tebuconazol, (1.48) terbinafina, (1.49) tetraconazol, (1.50) triadimefon, (1.51) triadimenol, (1.52) tridemorf, (1.53) triflumizol, (1.54) triforina, (1.55) triticonazol, (1.56) uniconazol, (1.57) uniconazol-p, (1.58) viniconazol, (1.59) voriconazol, (1.60) 1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)cicloheptanol, (1.61) éster metílico de ácido 1-(2,2-dimetil-2,3 -dihidro-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxílico, (1.62) N'-{5-(difluorometil)-2-metil-4-[3-(trimetilsilil)propoxi]fenil}-N-etil-N-metilimidofornamida, (1.63) N-etil-N-metil-N'-[2-metil-5-(trifluorometil)-4-[3-(trimetilsilil)propoxi]fenil]imidofornamida, (1.64) O-[1-(4-metoxifenoxi)-3,3-dimetilbutan-2-il]-1H-imidazol-1-carbotioato, (1.65) pirisoxazol, (1.66) 2-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.67) tiocianato de 1-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-ilo, (1.68) 5-(alilsulfanil)-1-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (1.69) 2-[1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.70) 2-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.71) 2-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.72) tiocianato de 1-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-ilo, (1.73) tiocianato de 1-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-ilo, (1.74) 5-(alilsulfanil)-1-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (1.75) 5-(alilsulfanil)-1-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (1.76) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.77) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.78) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.79) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.80) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.81) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.82) 2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.83) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.84) 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1.85) 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.86) 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)pentan-2-ol, (1.87) 2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.88) 2-[2-cloro-4-(2,4-diclorofenoxi)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1.89) (2R)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1R)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.90) (2R)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1S)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.91) (2S)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1S)-2,2-

diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.92) (2S)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1R)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.93) (1S,2R,5R)-5-(4-clorobencil)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetil)ciclopentanol, (1.94) (1R,2S,5S)-5-(4-clorobencil)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetil)ciclopentanol, (1.95) 5-(4-clorobencil)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetil)ciclopentanol.

5  
 2) Inhibidores de la cadena respiratoria en el complejo I o II, por ejemplo (2.01) bixafen, (2.02) boscalida, (2.03) carboxina, (2.04) diflumentorim, (2.05) fenfuram, (2.06) fluopiram, (2.07) flutolanil, (2.08) fluxaproxad, (2.09) furametpir, (2.10) furmeciclox, (2.11) isopirazam (mezcla de racemato syn-epimérico 1RS,4SR,9RS y racemato anti-epimérico 1RS,4SR,9SR), (2.12) isopirazam (racemato anti-epimérico 1RS,4SR,9SR), (2.13) isopirazam (enantiómero anti-epimérico 1R,4S,9S), (2.14) isopirazam (enantiómero anti-epimérico 1S,4R,9R), (2.15) isopirazam (racemato epimero syn 1RS,4SR,9RS), (2.16) isopirazam (enantiómero syn-epimérico 1R,4S,9R), (2.17) isopirazam (enantiómero epimero syn 1S,4R,9S), (2.18) mepronil, (2.19) oxicarboxina, (2.20) penflufen, (2.21) pentiopirad, (2.22) sedaxano, (2.23) tfluzamida, (2.24) 1-metil-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluoretoksi)fenil]-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.25) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluoretoksi)fenil]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.26) 3-(difluorometil)-N-[4-fluoro-2-(1,1,2,3,3,3-hexafluoropropoxi)fenil]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.27) N-[1-(2,4-diclorofenil)-1-metoxipropan-2-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.28) 5,8-difluoro-N-[2-(2-fluoro-4-[[4-(trifluorometil)piridin-2-il]oxi]fenil)etil]quinazolin-4-amina, (2.29) benzovindiflupir, (2.30) N-[(1S,4R)-9-(diclorometilen)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.31) N-[(1R,4S)-9-(diclorometilen)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.32) 3-(difluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.33) 1,3,5-trimetil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.34) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.35) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.36) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.37) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.38) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.39) 1,3,5-trimetil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.40) 1,3,5-trimetil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.41) benodanil, (2.42) 2-cloro-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)piridin-3-carboxamida, (2.43) isofetamida, (2.44) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[2'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.45) N-(4'-clorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.46) N-(2',4'-diclorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.47) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[4'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.48) N-(2',5'-difluorbifenil-2-il)-1-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.49) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[4'-(prop-1-en-1-il)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.50) 5-fluoro-1,3-dimetil-N-[4'-(prop-1-en-1-il)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.51) 2-cloro-N-[4'-(prop-1-en-1-il)bifenil-2-il]nicotinamida, (2.52) 3-(difluorometil)-N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-en-1-il)bifenil-2-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.53) N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-en-1-il)bifenil-2-il]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.54) 3-(difluorometil)-N-(4'-etinilbifenil-2-il)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.55) N-(4'-etinilbifenil-2-il)-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.56) 2-cloro-N-(4'-etinilbifenil-2-il)nicotinamida, (2.57) 2-cloro-N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-en-1-il)bifenil-2-il]nicotinamida, (2.58) 4-(difluorometil)-2-metil-N-[4'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1,3-tiazol-5-carboxamida, (2.59) 5-fluoro-N-[4'-(3-hidroxi-3-metilbut-1-en-1-il)bifenil-2-il]-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.60) 2-cloro-N-[4'-(3-hidroxi-3-metilbut-1-en-1-il)bifenil-2-il]nicotinamida, (2.61) 3-(difluorometil)-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-en-1-il)bifenil-2-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.62) 5-fluoro-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-en-1-il)bifenil-2-il]-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.63) 2-cloro-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-en-1-il)bifenil-2-il]nicotinamida, (2.64) 1,3-dimetil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.65) 1,3-dimetil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.66) 1,3-dimetil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.67) 3-(difluorometil)-N-metoxi-1-metil-N-[1-(2,4,6-triclorofenil)propan-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.68) 3-(difluorometil)-N-(7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.69) 3-(difluorometil)-N-[(3R)-7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.70) 3-(difluorometil)-N-[(3S)-7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida.

3) Inhibidores de la cadena respiratoria en el complejo III, por ejemplo (3.01) ametoctradin, (3.02) amisulbrom, (3.03) azoxistrobina, (3.04) ciazofamida, (3.05) coumetoxistrobina, (3.06) coumoxistrobina, (3.07) dimoxistrobina, (3.08) enoxastrobina, (3.09) famoxadona, (3.10) fenamidona, (3.11) flufenoxistrobina, (3.12) fluoxastrobina, (3.13) kresoxim-metilo, (3.14) metominostrobin, (3.15) orisastrobina, (3.16) picoxistrobina, (3.17) piraclostrobin, (3.18) pirametostrobin, (3.19) piraoxistrobin, (3.20) piribencarb, (3.21) triclopiricarb, (3.22) trifloxistrobin, (3.23) (2E)-2-(2-[[6-(3-cloro-2-metilfenoxi)-5-fluorpirimidin-4-il]oxi]fenil)-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida, (3.24) (2E)-2-(metoxiimino)-N-metil-2-(2-[[{(1E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etiliden}amino]oxi]metil]fenil)acetamida, (3.25) (2E)-2-(metoxiimino)-N-metil-2-(2-[[{(E)-{(1-[3-(trifluorometil)fenil]etoxi]imino)metil]fenil}acetamida, (3.26) (2E)-2-(2-[[{(1E)-1-(3-[[{(E)-1-fluoro-2-fenilvinil]oxi]fenil]etiliden}amino]oxi]metil]fenil)-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida, (3.27) fenaminostrobin, (3.28) 5-metoxi-2-metil-4-(2-[[{(1E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etiliden}amino]oxi]metil]fenil)-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-ona, (3.29) éster metílico del ácido (2E)-2-(2-[[{(ciclopropil[(4-metoxifenil]imino)metil]sulfanil]metil]fenil)-3-metoxi-acrílico, (3.30) N-(3-etil-3,5,5-trimetilciclohexil)-3-formamido-2-hidroxibenzamida, (3.31) 2-(2-[[2,5-dimetilfenoxi]metil]fenil)-2-metoxi-N-metilacetamida, (3.32) 2-(2-[[2,5-

dimetilfenoxi)metil]fenil)-2-metoxi-N-metilacetamida, (3.33) (2E,3Z)-5-[[1-(4-clorofenil)-1H-pirazol-3-il]oxi]-2-(metoxiimino)-N,3-dimetilpent-3-enamida.

4) Inhibidores de la mitosis y la división celular, por ejemplo (4.01) benomil, (4.02) carbendazima, (4.03) clorofenazol, (4.04) dietofencarb, (4.05) etaboxam, (4.06) fluopicolida, (4.07) fuberidazol, (4.08) pencicurón, (4.09) tiabendazol, (4.10) tiofanato-metilo, (4.11) tiofanato, (4.12) zoxamida, (4.13) 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina, (4.14) 3-cloro-5-(6-cloropiridin-3-il)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)piridazina.

5) Compuestos que pueden atacar en varios sitios ("Multisite Action"), por ejemplo (5.01) mezcla de Burdeos, (5.02) captafol, (5.03) captan, (5.04) clorotalonil, (5.05) hidróxido de cobre, (5.06) naftenato de cobre, (5.07) óxido de cobre, (5.08) oxiclورو de cobre, (5.09) sulfato de cobre(2+), (5.10) diclofluanida, (5.11) ditionona, (5.12) dodine, (5.13) dodine base libre, (5.14) ferbam, (5.15) fluorofolpet, (5.16) folpet, (5.17) guazatina, (5.18) guazatina acetato, (5.19) iminooctadina, (5.20) iminooctadinalbesilato, (5.21) iminooctadintriacetato, (5.22) mancobre, (5.23) mancozeb, (5.24) maneb, (5.25) metiram, (5.26) metiram-zinc, (5.27) oxina-cobre, (5.28) propamidina, (5.29) propineb, (5.30) azufre y preparaciones de azufre inclusive polisulfuro de calcio, (5.31) tiram, (5.32) tolilfluanida, (5.33) zineb, (5.34) ziram, (5.35) anilazina.

6) Compuestos que pueden inducir una reacción de defensa del huésped, por ejemplo (6.01) acibenzolar-S-metilo, (6.02) isotianilo, (6.03) probenazol, (6.04) tiadinilo, (6.05) laminarina.

7) Inhibidores de la biosíntesis de aminoácidos y proteínas, por ejemplo (7.01) andoprim, (7.02) blasticidina-S, (7.03) ciprodinil, (7.04) kasugamicina, (7.05) kasugamicina clorhidrato hidrato, (7.06) mepanipirim, (7.07) pirimetanil, (7.08) 3-(5-fluoro-3,3,4,4-tetrametil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina, (7.09) oxitetraciclina, (7.10) estreptomina.

8) Inhibidores de la producción de ATP, por ejemplo (8.01) fentina acetato, (8.02) fentina cloruro, (8.03) fentina hidróxido, (8.04) siltiofam.

9) Inhibidores de la síntesis de la pared celular, por ejemplo (9.01) bentiavalicarb, (9.02) dimetomorf, (9.03) flumorf, (9.04) iprovalicarb, (9.05) mandipropamida, (9.06) polioxina, (9.07) polioxorim, (9.08) validamicina A, (9.09) valifenalato, (9.10) polioxina B, (9.11) (2E)-3-(4-terc-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona, (9.12) (2Z)-3-(4-terc-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona.

10) Inhibidores de la síntesis de lípidos y membrana, por ejemplo (10.01) bifenilo, (10.02) cloroneb, (10.03) dicloran, (10.04) edifenfós, (10.05) etridiazol, (10.06) iodocarb, (10.07) iprobenfós, (10.08) isoprotiolano, (10.09) propamocarb, (10.10) propamocarb clorhidrato, (10.11) protiocarb, (10.12) pirazofós, (10.13) quintozeno, (10.14) tecnazeno, (10.15) tolclofós-metilo.

11) Inhibidores de la biosíntesis de melanina, por ejemplo (11.01) carpropamida, (11.02) diclocimet, (11.03) fenoxanil, (11.04) ftalida, (11.05) piroquilona, (11.06) triciclazol, (11.07) {3-metil-1-[(4-metilbenzoil)amino]butan-2-il}carbarnato de 2,2,2-trifluoroetilo.

12) Inhibidores de la síntesis de ácidos nucleicos, por ejemplo (12.01) benalaxil, (12.02) benalaxil-M (kiralaxil), (12.03) bupirimat, (12.04) clozilacon, (12.05) dimetirimol, (12.06) etirimol, (12.07) furalaxil, (12.08) himexazol, (12.09) metalaxil, (12.10) metalaxil-M (mefenoxam), (12.11) ofurace, (12.12) oxadixil, (12.13) ácido oxolínico, (12.14) octilina.

13) Inhibidores de la transducción de señales, por ejemplo (13.01) clozolinato, (13.02) fencipclonil, (13.03) fludioxonil, (13.04) iprodiona, (13.05) procimidona, (13.06) quinoxifeno, (13.07) vinclozolina, (13.08) proquinazid.

14) Compuestos que pueden actuar como desacopladores, por ejemplo (14.01) dinapacril, (14.02) dinocap, (14.03) ferimzon, (14.04) fluazinam, (14.05) meptildinocap.

15) Compuestos adicionales, por ejemplo (15.001) bentiazol, (15.002) betoxazina, (15.003) capsimicina, (15.004) carvona, (15.005) quinometionato, (15.006) pirofenona (clazafenona), (15.007) cufraneb, (15.008) ciflufenamida, (15.009) cimoxanil, (15.010) ciprosulfamida, (15.011) dazomet, (15.012) debacarb, (15.013) diclorofen, (15.014) diclomezin, (15.015) difenzoquat, (15.016) difenzoquat metilsulfato, (15.017) difenilamina, (15.018) ecomat, (15.019) fenpirazamina, (15.020) flumetover, (15.021) fluoroimid, (15.022) flusulfamida, (15.023) flutianil, (15.024) fosetil-aluminio, (15.025) fosetil-calcio, (15.026) fosetil-sodio, (15.027) hexaclorobenceno, (15.028) irumamicina, (15.029) metasulfocarb, (15.030) metilisotiocianato, (15.031) metrafenona, (15.032) mildiomicina, (15.033) natamicina, (15.034) dimetilditiocarbarnato de níquel, (15.035) nitrotal-isopropilo, (15.036) oxamocarb, (15.037) oxifentina, (15.038) pentaclorofenol y sales, (15.039) fenotrina, (15.040) ácido fosfórico y sus sales, (15.041) propamocarb-fosetilato, (15.042) propanosina-sodio, (15.043) pirimorf, (15.044) pirrolnitrina, (15.045) tebufloquina, (15.046) tecloftalam, (15.047) tolifenida, (15.048) triazóxido, (15.049) triclarnida, (15.050) zarilarnida, (15.051) éster (3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[[{3-[(isobutiriloxi)metoxi]-4-metoxipiridin-2-il}carbonil)amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-ílico de ácido 2-metilpropanoico, (15.052) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, (15.053) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-

il]etanona, (15.054) oxatiapiprolina, (15.055) éster 1-(4-metoxifenoxi)-3,3-dimetilbutan-2-ílico de ácido 1H-imidazol-1-carboxílico, (15.056) 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonyl)piridina, (15.057) 2,3-dibutil-6-clorotieno[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona, (15.058) 2,6-dimetil-1H,5H-[1,4]ditiino[2,3-c:5,6-c']dipirrol-1,3,5,7(2H,6H)-tetrona, (15.059) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(5R)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il})piperidin-1-il]etanona, (15.060) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(5S)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il})piperidin-1-il]etanona, (15.061) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-{4-[4-(5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il]etanona, (15.062) 2-butoxi-6-yodo-3-propil-4H-cromen-4-ona, (15.063) 2-cloro-5-[2-cloro-1-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-4-metil-1H-imidazol-5-il]piridina, (15.064) 2-fenilfenol y sales, (15.065) 3-(4,4,5-trifluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina, (15.066) nitrilo de ácido 3,4,5-tricloropiridin-2,6-dicarboxílico, (15.067) 3-cloro-5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-metilpiridazina, (15.068) 4-(4-clorofenil)-5-(2,6-difluorofenil)-3,6-dimetilpiridazina, (15.069) 5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-tiol, (15.070) 5-cloro-N'-fenil-N'-(prop-2-in-1-il)tiofeno-2-sulfonohidrazida, (15.071) 5-fluoro-2-[(4-fluorobencil)oxi]pirimidin-4-amina, (15.072) 5-fluoro-2-[(4-metilbencil)oxi]pirimidin-4-amina, (15.073) 5-metil-6-octil[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, (15.074) éster etílico de ácido (2Z)-3-amino-2-ciano-3-fenilacrílico, (15.075) N'-(4-{[3-(4-clorobencil)-1,2,4-tiadiazol-5-il]oxi}-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.076) N-(4-clorobencil)-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]propanamida, (15.077) N-[(4-clorofenil)(ciano)metil]-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]propanamida, (15.078) N-[(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)metil]-2,4-dicloronicotinamida, (15.079) N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloronicotinamida, (15.080) N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2-fluoro-4-yodonicotinamida, (15.081) N-[(E)-[(ciclopropilmetoxi)imino] 6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-fenilacetamid, (15.082) N-[(Z)-[(ciclopropilmetoxi)imino]6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-fenilacetamida, (15.083) N'-(4-{[3-*terc*-butil-4-ciano-1,2-tiazol-5-il]oxi}-2-cloro-5-metilfenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.084) N-metil-2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil})piperidin-4-il)-N-(1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il)-1,3-tiazol-4-carboxamida, (15.085) N-metil-2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil})piperidin-4-il)-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il]-1,3-tiazol-4-carboxamida, (15.086) N-metil-2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil})piperidin-4-il)-N-[(1S)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il]-1,3-tiazol-4-carboxamida, (15.087) {6-[[[(1-Metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]amino]oxi]metil]piridin-2-il}-carbamidsäurepentilester, (15.088) ácido fenazin-1-carboxílico, (15.089) quinolin-8-ol, (15.090) quinolin-8-olsulfato (2:1), (15.091) éster *terc*-butílico de ácido de {6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]amino]oxi]metil]piridin-2-il}carbamida, (15.092) (5-bromo-2-metoxi-4-metil-piridin-3-il)(2,3,4-trimetoxi-6-metilfenil)metanona, (15.093) N-[2-(4-{[3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]oxi}-3-metoxifenil)etil]-N2-(metilsulfonyl)valinamida, (15.094) ácido 4-oxo-4-[(2-feniletil)amino]butanoico, (15.095) éster but-3-en-1-ílico de ácido de {6-[[[(Z)-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]-amino]oxi]metil]piridin-2-il}carbamida, (15.096) 4-amino-5-fluoro-pirimidin-2-ol (forma tautomérica: 4-amino-5-fluoropirimidin-2(1H)-ona), (15.097) éster propílico de ácido 3,4,5-trihidroxibenzoico, (15.098) [3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (15.099) (S)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (15.100) (R)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (15.101) 2-fluoro-6-(trifluorometil)-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)benzamida, (15.102) 2-(6-bencilpiridin-2-il)quinazolina, (15.103) 2-[6-(3-fluoro-4-metoxifenil)-5-metilpiridin-2-il]quinazolina, (15.104) 3-(4,4-difluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina, (15.105) ácido abscísico, (15.106) N'-[5-bromo-6-(2,3-dihidro-1H-inden-2-iloxi)-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.107) N'-[5-bromo-6-[1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.108) N'-[5-bromo-6-[(1R)-1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.109) N'-[5-bromo-6-[(1S)-1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.110) N'-[5-bromo-6-[(cis-4-isopropilciclohexil)oxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.111) N'-[5-bromo-6-[(trans-4-isopropilciclohexil)oxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.112) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.113) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropilbencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.114) N-(2-*terc*-butilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.115) N-(5-cloro-2-etilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.116) N-(5-cloro-2-isopropilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.117) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-5-fluorobencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.118) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(5-fluoro-2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.119) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropil-5-fluorobencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.120) N-(2-ciclopentil-5-fluorobencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.121) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-fluoro-6-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.122) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-5-metilbencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.123) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropil-5-metilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.124) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropil-5-metilbencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.125) N-(2-*terc*-butil-5-metilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.126) N-[5-cloro-2-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.127) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-N-[5-metil-2-(trifluorometil)bencil]-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.128) N-[2-cloro-6-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.129) N-[3-cloro-2-fluoro-6-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.130) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-4,5-dimetilbencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.131) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.132) N'-(2,5-dimetil-4-fenoxifenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.133) N'-[4-[(4,5-dicloro-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilfenil]-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.134) N-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.135) 9-fluoro-2,2-dimetil-5-(quinolin-3-il)-

2,3-dihidro-1,4-benzoxazepina, (15.136) 2-[2-fluoro-6-[(8-fluoro-2-metilquinolin-3-il)oxi]fenil]propan-2-ol, (15.137) 2-[2-[(7,8-difluoro-2-metilquinolin-3-il)oxi]-6-fluorofenil]propan-2-ol, (15.138) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.139) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.140) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2-cloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.141) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-cloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.142) N-(2-bromo-6-fluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.143) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-bromfenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.144) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-bromo-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.145) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-clorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.146) N-(2-Bromfenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.147) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2-clorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.148) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.149) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.150) N'-(4-{3-[(difluorometil)sulfanil]fenoxi}-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.151) N'-(2,5-dimetil-4-{3-[(1,1,2,2-tetrafluoretil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.152) N'-(2,5-dimetil-4-{3-[(2,2,2-trifluoretil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.153) N'-(2,5-dimetil-4-{3-[(2,2,3,3-tetrafluorpropil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.154) N'-(2,5-dimetil-4-{3-[(pentafluoretil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.155) N'-(4-{3-(difluorometoxi)fenil}sulfanil)-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.156) N'-(2,5-dimetil-4-{3-(1,1,2,2-tetrafluoretoxi)fenil}sulfanil}fenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.157) N'-(2,5-dimetil-4-{3-(2,2,2-trifluoretoxi)fenil}sulfanil}fenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.158) N'-(2,5-dimetil-4-{3-(2,2,3,3-tetrafluorpropoxi)fenil}sulfanil}fenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.159) N'-(2,5-dimetil-4-{3-(pentafluoretoxi)fenil}sulfanil}fenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.160) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-(prop-2-en-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il]etanona, (15.161) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-fluoro-6-(prop-2-en-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il]etanona, (15.162) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-cloro-6-(prop-2-en-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il]etanona, (15.163) 2-{3-[2-(1-{3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il}fenilmetanosulfonato, (15.164) 2-{3-[2-(1-{3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il}-3-clorofenilmetanosulfonato, (15.165) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{(5S)-5-[2-(prop-2-en-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il]etanona, (15.166) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{(5R)-5-[2-(prop-2-en-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il]etanona, (15.167) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{(5S)-5-[2-fluoro-6-(prop-2-en-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il]etanona, (15.168) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{(5R)-5-[2-fluoro-6-(prop-2-en-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il]etanona, (15.169) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{(5S)-5-[2-cloro-6-(prop-2-en-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il]etanona, (15.170) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{(5R)-5-[2-cloro-6-(prop-2-en-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il]etanona, (15.171) 2-{(5S)-3-[2-(1-{3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il}fenilmetanosulfonato, (15.172) 2-{(5R)-3-[2-(1-{3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il}fenilmetanosulfonato, (15.173) 2-{(5S)-3-[2-(1-{3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il}-3-clorofenilmetanosulfonato, (15.174) 2-{(5R)-3-[2-(1-{3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il}-3-clorofenilmetanosulfonato.

Pesticidas biológicos como componentes de mezcla

Los compuestos de fórmula (I) pueden combinarse con pesticidas biológicos.

45 Los pesticidas biológicos abarcan en particular bacterias, hongos, levaduras, extractos vegetales, y productos de este tipo, que se formaron por microorganismos inclusive proteínas y productos metabólicos secundarios.

Los pesticidas biológicos abarcan bacterias tales como bacterias esporógenas, bacterias que colonizan las raíces y bacterias que actúan como insecticidas, fungicidas o nematocidas biológicos. Ejemplos de bacterias de este tipo,

que se emplean o pueden usarse como pesticidas biológicos, son:

50 *Bacillus amyloliquefaciens*, cepa FZB42 (DSM 231179), o *Bacillus cereus*, en particular *B. cereus* cepa CNCM I-1562 o *Bacillus firmus*, cepa I-1582 (número de registro de CNCM I-1582) o *Bacillus pumilus*, en particular cepa GB34 (n.º de registro ATCC 700814) y cepa QST2808 (n.º de registro NRRL B-30087), o *Bacillus subtilis*, en particular cepa GB03 (n.º de registro ATCC SD-1397), o *Bacillus subtilis* cepa QST713 (n.º de registro NRRL B-21661) o *Bacillus subtilis* cepa OST 30002 (n.º de registro NRRL B-50421) *Bacillus thuringiensis*, en particular *B. thuringiensis* subespecies israelensis (serotipo H-14), cepa AM65-52 (n.º de registro ATCC 1276), o *B. thuringiensis* subsp. aizawai, en particular cepa ABTS-1857 (SD-1372), o *B. thuringiensis* subsp. kurstaki cepa HD-1, o *B. thuringiensis* subsp. tenebrionis cepa NB 176 (SD-5428), *Pasteuria penetrans*, *Pasteuria* spp. (nematodo *Rotylenchulus reniformis*)-PR3 (número de registro ATCC SD-5834), *Streptomyces microflavus* cepa AQ6121 (= QRD 31.013, NRRL B-50550), *Streptomyces galbus* cepa AQ 6047 (número de registro NRRL 30232).

60 Ejemplos de hongos y levaduras, que se emplean o pueden usarse como pesticidas biológicos, son:

*Beauveria bassiana*, en particular cepa ATCC 74040, *Coniothyrium minitans*, en particular cepa CON/M/91-8 (n.º de

registro DSM-9660), *Lecanicillium* spp., en particular cepa HRO LEC 12, *Lecanicillium lecanii*, (ehemals bekannt como *Verticillium lecanii*), en particular cepa KV01, *Metarhizium anisopliae*, en particular cepa F52 (DSM3884/ ATCC 90448), *Metschnikowia fructicola*, en particular cepa NRRL Y-30752, *Paecilomyces fumosoroseus* (neu: *Isaria fumosorosea*), en particular cepa IFPC 200613, o cepa Apopka 97 (número de registro ATCC 20874), *Paecilomyces lilacinus*, en particular P. lilacinus cepa 251 (AGAL 89/030550), *Talaromyces flavus*, en particular cepa V117b, *Trichoderma atroviride*, en particular cepa SC1 (número de registro CBS 122089), *Trichoderma harzianum*, en particular T. harzianum rifai T39. (número de registro CNCM I-952).

Ejemplos de virus que se emplean o pueden usarse como pesticidas biológicos, son:

10 *Adoxophyes orana* (gusano de la piel de manzana) *granulovirus* (GV), *Cydia pomonella* (gusano de la manzana) *granulovirus* (GV), *Helicoverpa armigera* (gusano de la cápsula del algodón) virus de la polihedrosis nuclear (NPV), *Spodoptera exigua* (gusano soldado) mNPV, *Spodoptera frugiperda* (cogollero) mNPV, *Spodoptera littoralis* (rosquilla negra africana) NPV.

Están abarcadas también bacterias y hongos, que se agregan como plantas o partes de plantas u órganos de plantas "inoculantes" y mediante sus propiedades especiales promueven el crecimiento de las plantas y la salud de las plantas.

15 Como ejemplos se mencionan:

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

Ejemplos de extractos vegetales y productos de este tipo, que se formaron por microorganismos inclusive proteínas y productos metabólicos secundarios, que se emplean o pueden usarse como pesticidas biológicos, son:

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

Protectores como componentes de mezcla

30 Los compuestos de fórmula (I) pueden combinarse con protectores, tales como por ejemplo benoxacor, cloquintocet (-mexilo), ciometrinil, cipro sulfamida, diclorimid, fenclorazol (-etilo), fenclorim, flurazol, fluxofenim, furilazol, isoxadifeno (-etilo), mefenpir (-dietilo), anhídrido naftálico, oxabetrinil, 2-metoxi-N-({4-[(metilcarbamil)amino]fenil}sulfonil)benzamida (CAS 129531-12-0), 4-(dicloroacetil)-1-oxa-4-azaspiro[4.5]decano (CAS 71526-07-3), 2,2,5-trimetil-3-(dicloroacetil)-1,3-oxazolidina (CAS 52836-31-4).

35 Plantas y partes de plantas

De acuerdo con la invención, pueden tratarse todas las plantas y partes de plantas. Por plantas se entienden en este sentido todas las plantas y poblaciones de plantas tales como plantas salvajes o plantas de cultivo deseadas e indeseadas (inclusive plantas de cultivo que aparecen de manera natural), por ejemplo cereales (trigo, arroz, triticale, cebada, centeno, avena), maíz, soja, patata, remolacha azucarera, caña de azúcar, tomates, pimientos y pimientos picantes, pepinos, melones, zanahorias, sandías, cebolla, lechuga, espinacas, puerro, judías, *Brassica oleracea* (por ejemplo col), guisantes y otras especies de verduras, algodón, tabaco, colza, así como plantas frutales (con las frutas manzanas, peras, frutas cítricas y uvas). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que pueden obtenerse por procedimientos convencionales de fitogenética y de optimización o por procedimientos biotecnológicos y de ingeniería genética o combinaciones de estos procedimientos, incluyendo las plantas transgénicas e incluyendo las variedades de plantas que se pueden proteger o que no se pueden proteger por derechos de obtención vegetal. Por plantas se han de entender todos los estadios de desarrollo de las plantas, por ejemplo simiente, esquejes así como plantas jóvenes (no maduras) hasta plantas maduras. Por partes de plantas se han de entender todas las partes y órganos aéreos y subterráneos de las plantas, como brote, hoja, flor y raíz, exponiéndose a modo de ejemplo hojas, agujas, tallos, troncos, flores, cuerpos fructíferos, frutos y simientes así como raíces, bulbos y rizomas. A las partes de plantas también pertenece el producto de la cosecha (plantas o partes de plantas recogidas) así como material de propagación vegetativo y generativo, por ejemplo, esquejes, tubérculos, rizomas, acodos y simientes.

El tratamiento de acuerdo con la invención de las plantas y partes de plantas con los compuestos de fórmula (I) tiene lugar directamente o por acción sobre su entorno, hábitat o espacio de almacenamiento según los procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo, por inmersión, pulverización, evaporación, nebulización, espolvoreo, extensión, inyección y, en el caso del material de propagación, en particular en el caso de las semillas, además por envolturas simples o multicapa.

Tal como ya se ha mencionado, de acuerdo con la invención, pueden tratarse todas las plantas y sus partes. En una forma de realización preferente, se tratan tipos de plantas y variedades de plantas silvestres u obtenidas por

procedimientos fitogenéticos biológicos convencionales, como cruzamiento o fusión de protoplastos, así como sus partes. En otra forma de realización preferente, se tratan plantas transgénicas y variedades de plantas que se han obtenido por procedimientos de ingeniería genética, dado el caso, en combinación con procedimientos convencionales (*Genetically Modified Organisms*, organismos modificados genéticamente) y sus partes. El término "partes" o "partes de las plantas" o "partes de plantas" se ha explicado anteriormente. De manera especialmente preferente, de acuerdo con la invención, se tratan plantas de las variedades de plantas en cada caso comercialmente disponibles o en uso. Por variedades de plantas se entienden plantas con nuevas propiedades ("rasgos"), que se han obtenido tanto mediante cultivo convencional, mediante mutagénesis o se han cultivado mediante técnicas de ADN recombinante. Estos pueden ser variedades, razas, biotipos y genotipos.

10 Plantas transgénicas, tratamiento de las semillas y acontecimientos de integración

A las plantas o variedades de plantas transgénicas (obtenidas mediante ingeniería genética) preferentes que se van a tratar de acuerdo con la invención pertenecen todas las plantas que han obtenido material genético por la modificación de ingeniería genética, que otorga a estas plantas propiedades ("rasgos") valiosas especialmente ventajosas. Ejemplos de tales propiedades son mejor crecimiento de la planta, tolerancia aumentada con respecto a temperaturas altas o bajas, tolerancia aumentada frente a sequía o frente a salinidad en el agua o en el suelo, mayor rendimiento de floración, simplificación de la cosecha, aceleración de la maduración, mayores rendimientos de cosecha, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos de cosecha, mejor capacidad de almacenamiento y/o procesabilidad de los productos de la cosecha. Otros ejemplos, y especialmente destacados, de tales propiedades son una capacidad de defensa aumentada de las plantas contra parásitos animales y microbianos, tales como insectos, arácnidos, nematodos, ácaros, caracoles, provocada por ejemplo por toxinas generadas en las plantas, especialmente aquellas que se generan por el material genético de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo, por los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF así como sus combinaciones) en las plantas, asimismo una capacidad de defensa elevada de las plantas contra hongos fitopatógenos, bacterias y/o virus, provocada por ejemplo por resistencia sistémica adquirida (SAR), sistemina, fitoalexina, elicitores así como genes de resistencia y proteínas y toxinas expresadas de manera correspondiente, así como una tolerancia aumentada de las plantas frente a determinados principios activos herbicidas, por ejemplo, imidazolinonas, sulfonil-ureas, glifosatos o fosfinotricina (por ejemplo, gen "PAT"). Los genes que otorgan respectivamente las propiedades ("rasgos") deseadas también pueden presentarse en combinaciones entre sí en las plantas transgénicas. Como ejemplos de plantas transgénicas se mencionan las importantes plantas de cultivo, como cereales (trigo, arroz, triticale, cebada, centeno, avena), maíz, soja, patata, remolacha azucarera, caña de azúcar, tomates, guisantes y otras especies de verduras, algodón, tabaco, colza, así como plantas frutales (con las frutas manzanas, peras, frutas cítricas y uvas), en donde maíz, soja, trigo, arroz, patata, algodón, caña de azúcar, tabaco y colza se destacan especialmente. Como propiedades ("rasgos") se destacan especialmente la capacidad de defensa elevada de las plantas contra insectos, arácnidos, nematodos y caracoles.

35 Protección de plantas - tipos de tratamiento

El tratamiento de las plantas y partes de plantas con los compuestos de fórmula (I) tiene lugar directamente o por acción sobre su entorno, hábitat o espacio de almacenamiento según los procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo, por inmersión, rociado, pulverización, riego, evaporación, atomización, nebulización, esparcimiento, espumación, propagación, extendido, inyección, vertido (empapado), riego por goteo y, en el caso del material de propagación, en particular en el caso de las semillas, además mediante aplicación como recubrimiento en seco, desinfección en mojado, desinfección en suspensión, incrustación, envoltura de una capa o múltiples capas, etc. Asimismo es posible esparcir los compuestos de fórmula (I) según el procedimiento de volumen ultrabajo o inyectar la forma de aplicación o el compuesto de fórmula (I) en sí en la tierra.

45 Un tratamiento directo preferido de las plantas es la aplicación en las hojas, es decir los compuestos de fórmula (I) se aplican sobre el follaje, debiendo adaptarse la frecuencia de tratamiento y la cantidad de aplicación a la infestación de la plaga respectiva.

En el caso de compuestos que actúan de manera sistémica, los compuestos de fórmula (I) llegan a las plantas también a través de las raíces. El tratamiento de las plantas tiene lugar entonces mediante la acción de los compuestos de fórmula (I) sobre el hábitat de la planta. Esto puede ser por ejemplo mediante empapado, mezclado en el suelo o el caldo de cultivo, es decir la ubicación de la planta (por ejemplo el suelo o sistemas hidropónicos) se impregna con una forma líquida de los compuestos de fórmula (I), o mediante la aplicación en la tierra, es decir los compuestos de fórmula (I) se incorporan en forma sólida, (por ejemplo en forma de un granulado) en la ubicación de las plantas. En el caso de cultivos de arrozales, esto puede ser también mediante dosificación del compuesto de fórmula (I) en una forma de aplicación sólida (por ejemplo como granulado) en un campo de arroz inundado.

55 Tratamiento de semillas

Combatir plagas animales mediante el tratamiento de las semillas de plantas se conoce desde hace mucho tiempo y es objeto de mejoras continuas. No obstante, en el caso del tratamiento de semillas, se produce una serie de problemas que no siempre pueden resolverse satisfactoriamente. Así, es deseable desarrollar procedimientos para proteger las semillas y la planta en germinación que hagan superflua o al menos reduzcan considerablemente la

5 aplicación adicional de pesticidas durante el almacenamiento, tras la siembra o tras la emergencia de las plantas. Además, es deseable optimizar la cantidad del principio activo empleado para que la semilla y la planta en germinación se protejan lo mejor posible frente al ataque por plagas animales, pero sin dañar la propia planta por el principio activo utilizado. En particular, procedimientos para el tratamiento de semillas también deberían incluir las propiedades insecticidas o nematocidas intrínsecas de plantas transgénicas tolerantes o resistentes a plagas para conseguir una protección óptima de la semilla y de las plantas en germinación con un gasto mínimo de pesticidas.

10 Por lo tanto, la presente invención es adecuada también en particular para un procedimiento para proteger semillas y plantas en germinación antes del ataque de plagas, tratándose la semilla con uno de los compuestos de fórmula (I). El procedimiento de acuerdo con la invención para la protección de semillas y plantas en germinación frente al ataque de plagas comprende asimismo un procedimiento, en el que la semilla se trata simultáneamente en un proceso o secuencialmente con un compuesto de fórmula (I) y componente de mezcla. Este comprende asimismo también un procedimiento en el que la semilla se trata en diferentes tiempos con un compuesto de fórmula (I) y componente de mezcla.

15 En el caso de semillas que se trataron en diferentes tiempos con un compuesto de fórmula (I) y componente de mezcla, las sustancias individuales pueden estar contenidas en diferentes capas sobre la semilla. A este respecto, las capas que contienen un compuesto de fórmula (I) y componentes de mezcla, pueden estar dado el caso separadas por una capa intermedia.

20 Una de las ventajas que se presentan cuando actúa de manera sistémica uno de los compuestos de fórmula (I), es que el tratamiento de la semilla no protege frente a plagas animales solamente la semilla en sí, sino también las plantas que resultan de la misma tras la emergencia. De esta manera, el tratamiento inmediato del cultivo puede suprimirse en el momento de la siembra o poco después.

Otro objeto se basa en que mediante el tratamiento de las semillas con un compuesto de fórmula (I) pueden promoverse la germinación y emergencia de la semilla tratada.

25 Del mismo modo, resulta ventajoso considerar que los compuestos de fórmula (I) también pueden emplearse en particular en semillas transgénicas.

Los compuestos de fórmula (I) pueden emplearse asimismo en combinación con agentes de la tecnología de señalización, mediante lo cual tiene lugar una mejor colonización con simbioses, tales como por ejemplo rizobios, micorrizas y/o bacterias u hongos endofíticos, y/o se produce una fijación de nitrógeno optimizada.

30 Los compuestos de fórmula (I) son adecuados para la protección de semillas de cualquier variedad de plantas, que se emplea en la agricultura, en invernaderos, en bosques o en horticultura. A este respecto, se trata en particular de semillas de cereales (por ejemplo trigo, cebada, centeno, mijo y avena), maíz, algodón, soja, arroz, patatas, girasol, café, tabaco, canola, colza, remolacha (por ejemplo, remolacha azucarera y remolacha forrajera), cacahuete, verduras (por ejemplo tomate, pepino, judía, coles, cebolla y lechuga), plantas frutales, céspedes y plantas ornamentales. Se da especial importancia al tratamiento de las semillas de cereales (tales como trigo, cebada, centeno y avena), maíz, soja, algodón, canola, colza y arroz.

35 Tal como ya se ha mencionado anteriormente, tiene una particular importancia también el tratamiento de semillas transgénicas con un compuesto de fórmula (I). A este respecto, en el caso de las semillas se trata de plantas que por regla general contienen al menos un gen heterólogo, que controla la expresión de un polipéptido con en particular propiedades insecticidas o nematocidas. Los genes heterólogos en semillas transgénicas pueden proceder a este respecto de microorganismos tales como Bacillus, Rhizobium, Pseudomonas, Serratia, Trichoderma, Clavibacter, Glomus o Gliocladium. La presente invención es adecuada especialmente para el tratamiento de semillas transgénicas, que contienen al menos un gen heterólogo, que procede de Bacillus sp. De manera especialmente preferente se trata a este respecto de un gen heterólogo, que procede de Bacillus thuringiensis.

40 En el contexto de la presente invención, el compuesto de fórmula (I) se aplica sobre las semillas. Preferentemente, las semillas se tratan en un estado en el que es tan estable que no aparece ningún daño durante el tratamiento. Generalmente, el tratamiento de las semillas puede realizarse en cualquier momento entre la cosecha y la siembra. Habitualmente, se usan semillas que se separaron de la planta y se liberaron de espádice, cáscaras, tallos, vainas, lana o pulpa. Así, por ejemplo, pueden usarse semillas que se han cosechado, limpiado y secado hasta un contenido en humedad almacenable. Como alternativa, también se pueden usar semillas que después del secado se han tratado, por ejemplo, con agua y después se han vuelto a secar, por ejemplo imprimación. En el caso de material de semilla de arroz es también posible usar semillas que se hincharon previamente por ejemplo en agua hasta un estadio determinado (estadio de pecho de paloma), lo que a su vez lleva a una germinación mejorada y a una emergencia uniforme.

45 Generalmente, durante el tratamiento de la semilla tiene que tenerse en cuenta que la cantidad del compuesto de fórmula (I) y/u otros aditivos aplicados sobre la semilla se seleccione de manera que no se perjudique la germinación de la semilla o no se dañe la planta que surge de la misma. Esto tiene que tenerse en cuenta, sobre todo, en el caso de principios activos que pueden mostrar efectos fitotóxicos en determinadas dosis de aplicación.

Los compuestos de fórmula (I) se aplican por regla general en forma de una formulación adecuada sobre las semillas. Formulaciones y procedimientos adecuados para el tratamiento de semillas son conocidos por el experto en la materia.

5 Los compuestos de fórmula (I) pueden transferirse a las formulaciones de desinfectante habituales, tales como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, espumas, pastas o masas de envoltura para semillas, así como formulaciones de ULV.

Estas formulaciones se preparan de manera conocida, mezclándose compuestos de fórmula (I) con aditivos habituales, tales como por ejemplo extensores habituales así como disolventes o diluyentes, colorantes, humectantes, dispersantes, emulsionantes, antiespumantes, agentes conservantes, espesantes secundarios, pegamentos, giberelinas y también agua.

10 Como colorantes que pueden estar contenidas en las formulaciones de desinfectante que pueden usarse de acuerdo con la invención, se tienen en cuenta todos los colorantes habituales para tales fines. A este respecto pueden usarse tanto polímeros poco solubles en agua como colorantes solubles en agua. Como ejemplos se mencionan entre otros los colorantes conocidos con las denominaciones Rhodamin B, C.I. Pigment Red 112 y C.I. Solvent Red 1.

15 Como humectantes que pueden estar contenidas en las formulaciones de desinfectante que pueden usarse de acuerdo con la invención, se tienen en cuenta todas las sustancias habituales para la formulación de principios activos agroquímicos, que promueven la humectación. Preferentemente pueden usarse sulfonatos de alquilnaftaleno, tales como sulfonatos de diisopropil- o diisobutil-naftaleno.

20 Como dispersantes y/o emulsionantes, que pueden estar contenidas en las formulaciones de desinfectante que pueden usarse de acuerdo con la invención, se tienen en cuenta todos los dispersantes no iónicos, aniónicos y catiónicos habituales para la formulación de principios activos agroquímicos. Pueden usarse preferentemente dispersantes no iónicos o aniónicos o mezclas de dispersantes no iónicos o aniónicos. Como dispersantes no iónicos adecuados se mencionan en particular polímeros de bloque de óxido de etileno-óxido de propileno, alquilfenolpoliglicol éter así como trisrilfenolpoliglicol éter y sus derivados fosfatados o sulfatados. Dispersantes aniónicos adecuados son en particular ligninsulfonatos, sales de poli(ácido acrílico) y condensados de arilsulfonato-formaldehído.

25 Como antiespumantes pueden estar contenidos en las formulaciones de desinfectante que pueden emplearse de acuerdo con la invención todas las sustancias antiespumantes habituales para la formulación de principios activos agroquímicos. Preferentemente pueden usarse antiespumantes de silicona y estearato de magnesio.

30 Como agente conservante pueden estar presentes en las formulaciones de desinfectante que pueden usarse de acuerdo con la invención todas las sustancias que pueden emplearse para tales fines en agentes agroquímicos. A modo de ejemplo se mencionan diclorofeno y hemiformal de alcohol bencílico.

Como espesantes secundarios que pueden estar contenidas en las formulaciones de desinfectante que pueden usarse de acuerdo con la invención, se tienen en cuenta todas las sustancias que pueden emplearse para tales fines en agentes agroquímicos. Preferentemente se tienen en cuenta derivados de celulosa, derivados de ácido acrílico, xantana, arcillas modificadas y ácido silícico altamente dispersado.

35 Como adhesivos, que pueden estar contenidas en las formulaciones de desinfectante que pueden usarse de acuerdo con la invención, se tienen en cuenta todos los aglutinantes habituales que pueden emplearse en desinfectantes. Preferentemente se mencionan polivinilpirrolidona, poli(acetato de vinilo), poli(alcohol vinílico) y tilosa.

40 Como giberelinas, que pueden estar contenidas en las formulaciones de desinfectante que pueden usarse de acuerdo con la invención, se tienen en cuenta preferentemente las giberelinas A1, A3 (= ácido giberélico), A4 y A7, de manera especialmente preferente se usa el ácido giberélico. Las giberelinas son conocidas (véase R. Wegler "Chemie der Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmittel", vol. 2, Springer Verlag, 1970, páginas 401-412).

45 Las formulaciones de desinfectante que pueden usarse de acuerdo con la invención pueden emplearse o bien directamente o bien después de dilución previa con agua para el tratamiento de semillas de las más diversas especies. De este modo, los concentrados o las preparaciones que pueden obtenerse a partir de los mismos mediante dilución con agua pueden emplearse para la desinfección de la semilla de cereales, tales como trigo, cebada, centeno, avena y triticale, así como de la semilla de maíz, arroz, colza, guisante, judías, algodón, girasol, soja y nabo o también de semillas de verduras de la más diversa naturaleza. Las formulaciones de desinfectante que pueden usarse de acuerdo con la invención o sus formas de aplicación diluidas pueden emplearse también para la desinfección de semillas de plantas transgénicas.

50 Para el tratamiento de semillas con las formulaciones de desinfectante que pueden usarse de acuerdo con la invención o formas de aplicación preparadas a partir de las mismas se tienen en cuenta todos los aparatos de mezclado que pueden emplearse habitualmente para la desinfección. En detalle en la desinfección se procede de modo que las semillas se añaden a una mezcladora en el funcionamiento discontinuo o continuo, se agrega la cantidad deseada en cada caso a las formulaciones de desinfectante o bien como tal o bien después de dilución previa con agua y se  
55 mezcla hasta la distribución uniforme sobre la semilla. Dado el caso a esto le sigue un proceso de secado.

La cantidad de aplicación de formulaciones de desinfectante que pueden usarse de acuerdo con la invención puede variarse en dentro de gran intervalo. Depende del contenido respectivo de los compuestos de fórmula (I) en las formulaciones y de la semilla. Las cantidades de aplicación en el caso del compuesto de fórmula (I) se encuentran en general entre 0,001 y 50 g por kilogramo de semilla, preferentemente entre 0,01 y 15 g por kilogramo de semilla.

5 Salud animal

En el campo de la salud animal, es decir el campo de la medicina veterinaria, son efectivos los compuestos de fórmula (I) contra parásitos animales, en particular ectoparásitos o endoparásitos. El término endoparásitos abarca en particular helmintos y protozoos tales como coccidios. Los ectoparásitos son habitual y preferentemente artrópodos, en particular insectos y ácaros.

10 En el campo de la medicina veterinaria, los compuestos de fórmula (I) que presentan una toxicidad favorable frente a animales de sangre caliente, para combatir parásitos que aparecen en la cría de animales y cría de ganado en animales útiles, animales reproductores, animales de zoo, animales de laboratorio, animales de ensayo y animales de compañía. Estos son efectivos contra todos o cada uno de los estadios de desarrollo de los parásitos.

15 Entre los animales útiles agrícolas figuran por ejemplo mamíferos tales como ovejas, cabras, caballos, burros, camellos, búfalos, conejos, renos, gamos y en particular ganado vacuno y cerdos; aves de corral tales como pavos, patos, gansos y en particular gallinas; pescados y crustáceos, por ejemplo en la acuicultura y también insectos tales como abejas.

Entre los animales domésticos figuran por ejemplo mamíferos tales como hámsteres, conejillos de indias, ratas, ratones, chinchillas, hurones y en particular perros, gatos, aves enjauladas, reptiles, anfibios y peces de acuario.

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

De acuerdo con una forma de realización preferida adicional, los compuestos de fórmula (I) se administran en aves, en concreto aves enjauladas y en particular aves de corral.

25 Mediante el uso de los compuestos de fórmula (I) para combatir parásitos animales se reducirán o prevendrán la enfermedad, mortalidad y disminución del rendimiento (en carne, leche, lana, pieles, huevos, miel y similares), de modo que se permite una cría de ganado más económico y más sencillo y puede conseguirse un bienestar de los animales.

30 Con respecto al campo de la salud animal, el término "combate" o "combatir", significa que mediante los compuestos de fórmula (I) puede reducirse eficazmente la aparición del parásito respectivo en un animal que está infectado con parásitos de este tipo en una medida inofensiva. Más precisamente, "combatir" en el presente contexto, significa que el compuesto de fórmula (I) puede destruir los parásitos respectivos, impedir su crecimiento o impedir su multiplicación.

Entre los artrópodos figuran:

35 del orden anoplúridos, por ejemplo *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp., *Solenopotes* spp.; del orden malofágidos y los subórdenes ambliceros y ischnóceros, por ejemplo *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp., *Felicola* spp.; del orden dípteros y los subórdenes nematóceros y braquíceros, por ejemplo *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp., *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides* spp., *Chrysops* spp., *Odagmia* spp., *Wilhelmia* spp., *Hybomitra* spp., *Atylotus* spp., *Tabanus* spp., *Haematopota* spp., *Philipomyia* spp., *Braula* spp., *Musca* spp., *Hydrotaea* spp., *Stomoxys* spp., *Haematobia* spp., *Morellia* spp., *Fannia* spp., *Glossina* spp., *Calliphora* spp., *Lucilia* spp., *Chrysomyia* spp., *Wohlfahrtia* spp., *Sarcophaga* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Gasterophilus* spp., *Hippobosca* spp., *Lipoptena* spp., *Melophagus* spp., *Rhinoestrus* spp., *Tipula* spp.; del orden sifonápteros, por ejemplo *Pulex* spp., *Ctenocephalides* spp., *Tunga* spp., *Xenopsylla* spp., *Ceratophyllus* spp.;

del orden heterópteros, por ejemplo *Cimex* spp., *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp.; así como insectos molestos y plagas antihigiénicas del orden blatáridos.

45 Además, entre los artrópodos figuran:

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

Entre los protozoos parasitarios figuran:

- 5 Mastigophora (Flagellata), tal como por ejemplo Trypanosomatidae, por ejemplo Trypanosoma b. brucei, T.b. gambiense, T.b. rhodesiense, T. congolense, T. cruzi, T. evansi, T. equinum, T. lewisi, T. percae, T. simiae, T. vivax, Leishmania brasiliensis, L. donovani, L. tropica, tal como por ejemplo Trichomonadidae, por ejemplo Giardia lamblia, G. canis;
- Sarcomastigophora (Rhizopoda), tal como Entamoebidae, por ejemplo Entamoeba histolytica, Hartmanellidae, por ejemplo Acanthamoeba sp., Harmanella sp.;
- 10 Apicomplexa (Sporozoa), tal como Eimeridae, por ejemplo Eimeria acervulina, E. adenoides, E. alabamensis, E. anatis, E. anserina, E. arloingi, E. ashata, E. auburnensis, E. bovis, E. brunetti, E. canis, E. chinchillae, E. clupearum, E. columbae, E. contorta, E. crandalis, E. deblickei, E. dispersa, E. ellipsoidales, E. falciformis, E. faurei, E. flavescens, E. gallopavonis, E. hagani, E. intestinalis, E. iroquoia, E. irresidua, E. labbeana, E. leucarti, E. magna, E. maxima, E. media, E. meleagridis, E. meleagritidis, E. mitis, E. necatrix, E. ninakohlyakimovae, E. ovis, E. parva, E. pavonis, E. perforans, E. phasani, E. piriformis, E. praecox, E. residua, E. scabra, E. spec., E. stiedai, E. suis, E. tenella, E. truncata, E. truttae, E. zuernii, Globidium spec., Isospora belli, I. canis, I. felis, I. ohioensis, I. rivolta, I. spec., I. suis, Cystisopora spec., Cryptosporidium spec., en particular C. parvum; tal como Toxoplasmodidae, por ejemplo Toxoplasma gondii, Hammondia heydonii, Neospora caninum, Besnoitia besnoitii; tal como Sarcocystidae, por ejemplo Sarcocystis bovicanis, S. bovi hominis, S. ovicanis, S. ovifelis, S. neurona, S. spec., S. sui hominis, tal como Leucozooidae, por ejemplo Leucozytozoon simondi, tal como Plasmodiidae, por ejemplo Plasmodium berghei, P. falciparum, P. malariae, P. ovale, P. vivax, P. spec., tal como Piroplasma, por ejemplo Babesia argentina, B. bovis, B. canis, B. spec., Theileria parva, Theileria spec., tal como Adeleina, por ejemplo Hepatozoon canis, H. spec.
- 15
- 20

Entre los endoparásitos patógenos, en cuyo caso se trata de helmintos, figuran helmintos planos (por ejemplo monogéneos, cestodos y trematodos), lombrices, acantocéfalos y Pentastoma. Entre estos figuran:

- 25 Monogenea: por ejemplo: Gyrodactylus spp., Dactylogyrus spp., Polystoma spp.;
- Cestodes: aus der Ordnung Pseudophillidea zum Ejemplo: Diphylobothrium spp., Spirometra spp., Schistocephalus spp., Ligula spp., Bothridium spp., Diplogonoporus spp.;
- 30 del orden ciclofílidos por ejemplo: Mesocestoides spp., Anoplocephala spp., Paranoplocephala spp., Moniezia spp., Thysanosoma spp., Thysaniezia spp., Avitellina spp., Stilesia spp., Cittotaenia spp., Andrya spp., Bertiella spp., Taenia spp., Echinococcus spp., Hydatigera spp., Davainea spp., Raillietina spp., Hymenolepis spp., Echinolepis spp., Echinocotile spp., Diorchis spp., Dipylidium spp., Joyeuxiella spp., Diplopylidium spp.;
- 35 Trematodes: aus der Klasse Digenea zum Ejemplo: Diplostomum spp., Posthodiplostomum spp., Schistosoma spp., Trichobilharzia spp., Ornithobilharzia spp., Austrobilharzia spp., Gigantobilharzia spp., Leucochloridium spp., Brachylaima spp., Echinostoma spp., Echinoparyphium spp., Echinochasmus spp., Hypoderaeum spp., Fasciola spp., Fascioloides spp., Fasciolopsis spp., Cyclocoelum spp., Typhlocoelum spp., Paramphistomum spp., Calicophoron spp., Cotylophoron spp., Gigantocotyle spp., Fiscoederius spp., Gastrothylacus spp., Notocotylus spp., Catatropis spp., Plagiorchis spp., Prosthogonimus spp., Dicrocoelium spp., Eurytrema spp., Troglotrema spp., Paragonimus spp., Collyriclum spp., Nanophyetus spp., Opisthorchis spp., Clonorchis spp. Metorchis spp., Heterophyes spp., Metagonimus spp.;
- 40 Lombrices: triquinélidos por ejemplo: Trichuris spp., Capillaria spp., Paracapillaria spp., Eucoleus spp., Trichomosoides spp., Trichinella spp.;
- del orden tilénquidos por ejemplo: Micronema spp., Strongyloides spp.;
- 45 del orden rabdítidos por ejemplo: Strongylus spp., Triodontophorus spp., Oesophagodontus spp., Trichonema spp., Gyalocephalus spp., Cyliodromus spp., Poterostomum spp., Cyclocercus spp., Cylicostephanus spp., Oesophagostomum spp., Chabertia spp., Stephanurus spp., Ancylostoma spp., Uncinaria spp., Necator spp., Bunostomum spp., Globocephalus spp., Syngamus spp., Cyathostoma spp., Metastrongylus spp., Dictyocaulus spp., Muellerius spp., Protostrongylus spp., Neostongylus spp., Cystocaulus spp., Pneumostongylus spp., Spicocaulus spp., Elaphostongylus spp., Parelaphostongylus spp., Crenosoma spp., Paracrenosoma spp., Oslerus spp., Angiostrongylus spp., Aelurostrongylus spp., Filaroides spp., Parafilaroides spp., Trichostrongylus spp., Haemonchus spp., Ostertagia spp., Teladorsagia spp., Marshallagia spp., Cooperia spp., Nippostrongylus spp., Heligmosomoides spp., Nematodirus spp., Hyostongylus spp., Obeliscoides spp., Amidostomum spp., Ollulanus spp.;
- 50 del orden espirúridos por ejemplo: Oxyuris spp., Enterobius spp., Passalurus spp., Syphacia spp., Aspiculuris spp., Heterakis spp.; Ascaris spp., Toxascaris spp., Toxocara spp., Baylisascaris spp., Parascaris spp., Anisakis spp., Ascaridia spp.; Gnathostoma spp., Physaloptera spp., Thelazia spp., Gongylonema spp., Habronema spp., Parabronema spp., Draschia spp., Dracunculus spp.; Stephanofilaria spp., Parafilaria spp., Setaria spp., Loa spp., Dirofilaria spp., Litomosoides spp., Brugia spp., Wuchereria spp., Onchocerca spp., Spirocerca spp.;
- 55

acantocéfalos: del orden de los Oligacanthorhynchida por ejemplo: *Macracanthorhynchus* spp., *Prosthenorchis* spp.; del orden polimórfidos por ejemplo: *Filicollis* spp.; del orden Moniliformida por ejemplo: *Moniliformis* spp.;

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

Pentastoma: del orden porocefálicos por ejemplo *Linguatula* spp.

- 5 En el campo de la medicina veterinaria y la cría de ganado tiene lugar la administración de los compuestos de fórmula (I) según procedimientos conocidos en general, tales como por vía enteral, parenteral, dérmica o nasal en forma de preparaciones adecuadas. La administración puede tener lugar de manera profiláctica o terapéutica.

De este modo, una forma de realización de la presente invención se refiere al uso de un compuesto de fórmula (I) como fármaco.

- 10 Otro aspecto se refiere al uso de un compuesto de fórmula (I) como agente antiendoparasitario, en particular como un helminticida o un agente contra protozoos. Los compuestos de fórmula (I) son adecuados para el uso como agente antiendoparasitario, en particular como un helminticida o agente contra protozoos, por ejemplo en la cría de animales, en la cría de ganado, en establos y en el sector de la higiene.

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

Control de vectores

- 20 Los compuestos de fórmula (I) pueden emplearse también en el control de vectores. Un vector en el sentido de la presente invención es un artrópodo, en particular un insecto o arácnido, que es capaz de transmitir agentes patógenos tales como por ejemplo virus, gusanos, organismos unicelulares y bacterias de un depósito (planta, animal, ser humano, etc.) a un huésped. Los agentes patógenos pueden transmitirse o bien de manera mecánica (por ejemplo tracoma por moscas que no pican) a un huésped, o tras inyección (por ejemplo parásitos de malaria por mosquitos) en un huésped.

Ejemplos de vectores y las enfermedades o agentes patógenos transmitidos por estos son:

- 25 1) mosquitos
- Anopheles: malaria, Filarirose;
  - Culex: encefalitis japonesa, Filariasis, otras enfermedades virales, transmisión por gusanos;
  - Aedes: fiebre amarilla, fiebre del Dengue, Filariasis, otras enfermedades virales;
  - Simulium: transmisión por gusanos en particular *Onchocerca volvulus*;
- 30 2) piojos: infecciones cutáneas, tifus exantemático (tifus epidémico);
- 3) pulgas: peste, tifus exantemático endémico;
- 4) moscas: enfermedad del sueño (tripanosomiasis); cólera, otras enfermedades bacterianas;
- 5) ácaros: acarosis, tifus exantemático, rickettsiosis, tularemia, encefalitis de San Luis, meningitis vírica (FSME), fiebre de Crimea-Congo, borreliosis;
- 35 6) garrapatas: borreliosis tales como *Borrelia duttoni*, encefalitis centroeuropea, fiebre Q (*Coxiella burnetii*), babesias (*Babesia canis canis*).

Ejemplos de vectores en el sentido de la presente invención son insectos tales como áfidos, moscas, cigarras o trips, que pueden transmitir virus de plantas a las plantas. Otros vectores que pueden transmitir virus de plantas, son arañas, piojos, escarabajos y nematodos.

- 40 Otros ejemplos de vectores en el sentido de la presente invención son insectos y arácnidos tales como mosquitos, en particular de los géneros *Aedes*, *Anopheles*, por ejemplo *A. gambiae*, *A. arabiensis*, *A. funestus*, *A. dirus* (Malaria) y *Culex*, piojos, pulgas, moscas, ácaros y garrapatas, que pueden transmitir agentes patógenos a animales y/o seres humanos.

Un control de vector es también posible cuando los compuestos de fórmula (I) rompen la resistencia.

- 45 Los compuestos de fórmula (I) son adecuados para su uso en la prevención de enfermedades o frente a agentes patógenos, que se transmiten por vectores. Por lo tanto, otro aspecto de la presente invención es el uso de compuestos de fórmula (I) para el control de vectores, por ejemplo en la agricultura, en horticultura, en bosques, en jardines e

instalaciones de ocio así como en la protección de productos almacenados y de materiales.

Protección de materiales técnicos

5 Los compuestos de fórmula (I) son adecuados para la protección de materiales técnicos contra el ataque o la destrucción por insectos, por ejemplo del orden coleópteros, himenópteros, isópteros, lepidópteros, psicópteros y zigentomos.

Por materiales técnicos se entienden en el presente contexto materiales no vivos, tales como preferentemente plásticos, adhesivos, colas, papeles y cartones, cuero, madera, productos del procesamiento de la madera y pinturas. La aplicación de la invención para la protección de la madera es especialmente preferida.

10 En otra forma de realización, los compuestos de fórmula (I) se emplean junto con al menos otro insecticida y/o al menos un fungicida.

En otra forma de realización, los compuestos de fórmula (I) se encuentran como un pesticida listo para usar (ready-to-use), es decir, puede aplicarse sin cambios adicionales en el material correspondiente. Como insecticidas adicionales o como fungicidas se tienen en cuenta en particular los mencionados anteriormente.

15 Sorprendentemente se descubrió también que los compuestos de fórmula (I) pueden usarse para la protección frente al crecimiento sobre objetos, en particular de cascos de embarcaciones, tamices, redes, obras de construcción, muelles y instalaciones de señalización, que están relacionadas con agua de mar o agua salobre. Igualmente, los compuestos de fórmula (I) pueden emplearse solos o en combinaciones con otros principios activos como agentes antiincrustación.

Combatir plagas animales en el sector de la higiene

20 Los compuestos de fórmula (I) son adecuados para combatir plagas animales en el sector de la higiene. En particular, la invención puede usarse en la protección del hogar, de la higiene y de reservas, principalmente para combatir insectos, arácnidos y ácaros, que aparecen en espacios cerrados, tal como por ejemplo viviendas, naves industriales, oficinas, cabinas de vehículos. Para combatir las plagas animales, los compuestos de fórmula (I) se usan solos o en combinación con otros principios activos y/o agentes auxiliares. Preferentemente se usan en productos de insecticida doméstico. Los compuestos de fórmula (I) son eficaces contra especies sensibles y resistentes así como contra todos los estados de desarrollo.

25 Entre estas plagas figuran por ejemplo plagas de la clase arácnidos, de los órdenes escorpiones, arañas y opiliones, de las clases quilópodos y diplópodos, de la clase insectos el orden blatodeos, de los órdenes coleópteros, dermápteros, dípteros, heterópteros, himenópteros, isópteros, lepidópteros, fitirápteros, psicópteros, saltatorios u ortópteros, sifonápteros y zigentomos y de la clase malacostraca el orden isópodos.

30 La aplicación tiene lugar por ejemplo en aerosoles, pulverizaciones sin presión, por ejemplo pulverizaciones de bombeo y atomización, nebulizadores, formadores de niebla, espumas, geles, productos de evaporador con placas de evaporador de celulosa o plástico, evaporadores líquidos, evaporadores de gel y de membrana, evaporadores accionados por propelente, sistemas de evaporación sin energía o pasivos, papeles antipolillas, bolsitas antipolillas y geles antipolillas, como gránulos o polvos, en cebos de dispersión o estaciones de cebo.

**Explicación de los procedimientos y productos intermedios**

Los siguientes ejemplos de preparación y de uso ilustran la invención. Los productos se caracterizaron por medio es espectroscopía de RMN de <sup>1</sup>H y/o CL/EM (cromatografía de líquidos espectrometría de masas).

40 La determinación de los valores de logP tuvo lugar de acuerdo con la directiva OECD 117 (directiva de la CE 92/69/EEC) mediante HPLC (cromatografía líquida de alta resolución) en columnas (C18) de fase inversa (RP), con los siguientes procedimientos:

[a] La determinación con la CL-EM en el intervalo ácido tiene lugar a pH 2,7 con el 0,1 % de ácido fórmico acuoso y acetonitrilo (contiene el 0,1 % de ácido fórmico) como eluyentes; gradiente lineal del 10 % de acetonitrilo al 95 % de acetonitrilo.

45 [b] La determinación con la CL-EM en el intervalo neutro tiene lugar a pH 7,8 con solución acuosa 0,001 molar de hidrogenocarbonato de amonio y acetonitrilo como eluyentes; gradiente lineal del 10 % de acetonitrilo al 95 % de acetonitrilo.

50 La calibración tiene lugar con alcan-2-onas no ramificadas (con 3 a 16 átomos de carbono), cuyos valores de logP son conocidos (determinación de los valores de logP por medio de los tiempos de retención mediante interpolación lineal entre dos alcanonas sucesivas).

Los espectros de RMN se determinaron con un aparato Bruker Avance 400, equipado con un cabezal de muestra de flujo (volumen 60 µl). En casos individuales se midieron los espectros de RMN con un aparato Bruker Avance II 600.

Los datos de RMN de  $^1\text{H}$  de ejemplos seleccionados se anotan en forma de listas de picos de RMN de  $^1\text{H}$ . Con respecto a cada pico de señal se expone en primer lugar el valor  $\delta$  en ppm y entonces la intensidad de señal entre paréntesis. Los pares de números de valor  $\delta$  - intensidad de señal de distintos picos de señal se enumeran separados uno de otro por punto y coma.

- 5 La lista de picos de un ejemplo tiene por lo tanto la forma:  
 $\delta_1$  (intensidad 1);  $\delta_2$  (intensidad 2);.....;  $\delta_i$  (intensidad i);.....;  $\delta_n$  (intensidad n)

10 La intensidad de señales más intensas se correlaciona con la altura de las señales en un ejemplo impreso de un espectro de RMN en cm y muestra las relaciones reales de las intensidades de señal. En el caso de señales anchas, pueden mostrarse varios picos o el centro de la señal y su intensidad relativa en comparación con la señal más intensa en el espectro.

Para la calibración del desplazamiento químico de los espectros de RMN de  $^1\text{H}$  se emplea tetrametilsilano y/o el desplazamiento químico del disolvente, en particular en el caso de espectros que se miden en DMSO. Por lo tanto, en las listas de picos de RMN puede aparecer el pico de tetrametilsilano, pero no obligatoriamente.

15 Las listas de los picos de RMN de  $^1\text{H}$  son similares a las impresiones clásicas de RMN de  $^1\text{H}$  y contienen por lo tanto habitualmente todos los picos que se exponen en una interpretación clásica de RMN.

Además, al igual que las impresiones clásicas de RMN de  $^1\text{H}$ , pueden mostrar señales de disolvente, señales de estereoisómeros de los compuestos objetivo, que son asimismo objeto de la invención, y/o picos de impurezas.

20 En los datos de las señales de compuestos en el intervalo Delta de disolventes y/o agua se muestran en nuestras listas de picos de RMN de  $^1\text{H}$  los picos de disolvente habituales, por ejemplo picos de DMSO en DMSO- $\text{D}_6$  y el pico de agua, que habitualmente presentan en promedio una intensidad elevada.

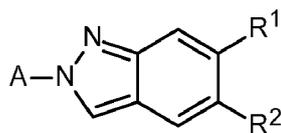
Los picos de estereoisómeros de los compuestos de prueba y/o picos de impurezas tienen habitualmente en promedio una intensidad menor que los picos de los compuestos objetivo (por ejemplo con una pureza de >90 %).

25 Tales estereoisómeros y/o impurezas pueden ser típicos del procedimiento de preparación respectivo. Sus picos pueden por lo tanto a este respecto ayudar a reconocer la reproducción del presente procedimiento de preparación por medio de "huellas dactilares de producto secundario".

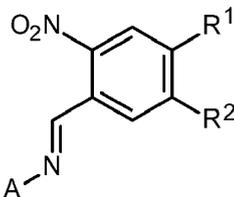
Un experto, que calcula los picos de los compuestos objetivo con procedimientos conocidos (MestreC, ACD-Simulation, pero también con valores esperados evaluados empíricamente), puede aislar según sea necesario los picos de los compuestos objetivo, empleándose dado el caso filtros de intensidad adicionales. Este aislamiento sería similar a la selección de picos en cuestión en la interpretación clásica de RMN de  $^1\text{H}$ .

30 Otros detalles referentes a listas de picos de RMN de  $^1\text{H}$  pueden extraerse de Research Disclosure Database número 564025.

#### Síntesis general de 2-(hetaril)-indazoles 4,5-disustituídos de fórmula (I):



#### Etapa 1: Síntesis de compuestos de fórmula (A-3)



35 A una solución de 119,6 mmol de *orto*-nitro-benzaldehído de fórmula (A-1) en 75 mmol de tolueno se añadieron 19,6 mmol de un compuesto de amino heterocíclico (A-2), 1,0 mmol de ácido *para*-toluenosulfónico (PTSA), 5,9 mmol de tamiz molecular de 4A y sulfato de magnesio. A continuación se agita la mezcla de reacción durante 18 horas a temperatura de reflujo. El control por medio de cromatograma de capa fina (eluyente: éster etílico de ácido acético)

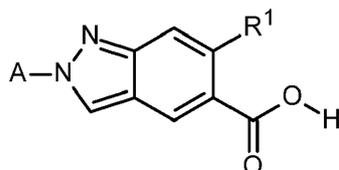
40 mostró que la reacción había finalizado. La mezcla de reacción se filtró y el filtrado dio, después de concentrar, los productos brutos (A-3), que se hicieron reaccionar adicionalmente sin purificación adicional.

#### Etapa 2: Síntesis de 2-(hetaril)-indazoles 4,5-disustituídos de fórmula (I)

5 A 19,6 mmol de los compuestos de fórmula (A-3) se añadieron a temperatura ambiente 58,8 mmol de fosfito de trietilo. A continuación se agitó la mezcla de reacción a 140 °C durante aproximadamente 18 horas. El control por medio de cromatograma de capa fina (eluyente: éter de petróleo : éster etílico de ácido acético = 1:1) mostró que la reacción había finalizado. Después de concentrar la mezcla de reacción a vacío se purificó el residuo restante por medio de cromatografía CombiFlash (gradiente de eluyente: del 100 % de éter de petróleo al 70 % de éster etílico de ácido acético/éter de petróleo).

#### Síntesis general de ácidos 2-(heteril)-indazol-5-carboxílicos 4-sustituídos de fórmula (I, R<sup>2</sup> = COOH)

##### Procedimiento A:

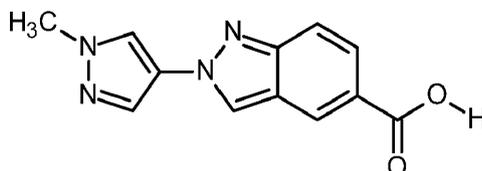


10 A 7,03 mmol de los compuestos de fórmula (I; R<sup>2</sup> = COOCH<sub>3</sub>) en una mezcla de 10 ml de tetrahidrofurano y 10 ml de agua se añadieron a temperatura ambiente 21,1 mmol de solución de hidróxido de sodio. A continuación se agitó la mezcla de reacción durante aproximadamente 18 horas a 70 °C. El control por medio de cromatograma de capa fina (eluyente: éter de petróleo : éster etílico de ácido acético = 1:1) mostró que la reacción había finalizado. Después de concentrar la mezcla de reacción a vacío se ajustó el residuo restante con ácido clorhídrico 12 N a un pH = 3. Después se separó por filtración el sólido precipitado, se lavó con agua y se secó.

##### Procedimiento B:

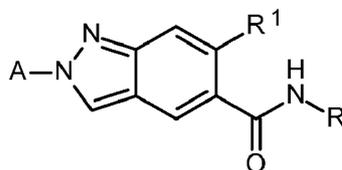
20 1 eq. de los compuestos de fórmula (I; R<sup>2</sup> = COOCH<sub>3</sub>) se disolvió en metanol (3 ml/mmol) y se mezcló a temperatura ambiente 1,5 eq. de hidróxido de litio 1 M. A continuación se agitó la mezcla de reacción durante 2 horas a 50 °C. Después se ajustó la mezcla de reacción mediante adición de ácido clorhídrico 1 M a un valor de pH = 3. Si se ha formado un sólido, este se separó por filtración y se secó. En el otro caso, se extrajo la solución de reacción con diclorometano (3 x 3 ml/mmol). Las fases orgánicas reunidas se secaron sobre sulfato de magnesio y se concentraron a vacío.

#### Ácido 2-(1-metil-1H-pirazol-4-il)-2H-indazol-5-carboxílico (I, A = 1-metil-1H-pirazol-4-ilo; R<sup>1</sup> = H, R<sup>2</sup> = COOH)



25 Este compuesto se preparó a partir de 3,46 g (13,5 mmol) de éster metílico de ácido 2-(1-metil-1H-pirazol-4-il)-2H-indazol-5-carboxílico de manera correspondiente a la síntesis general mencionada. Se obtuvieron 2,87 g (88 % de rendimiento) del compuesto del título.  
IQPA EM, m/z = 243 [M+H]<sup>+</sup>

#### Síntesis general de amidas de ácido 2-(heteril)-indazol-5-carboxílicos 4-sustituídos de fórmula (I, R<sup>2</sup> = CONHR)



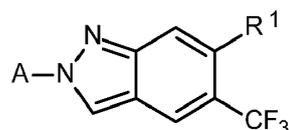
30 **a) Carbonildiimidazol, procedimiento de (CDI):**

35 En una primera etapa de reacción se añadieron a temperatura ambiente a una solución de 0,84 mmol de ácido 2-(heteril)-indazol-5-carboxílico en 8 ml de *N,N*-dimetilformamida, 134 mg (0,84 mmol) de carbonildiimidazol (CDI), a continuación se agitó la mezcla de reacción durante 2 horas. En una segunda etapa de reacción 1,04 mmol del componente reactivo así preparado en 8 ml de *N,N*-dimetilformamida a temperatura ambiente con 1,04 mmol de hidruro de sodio al 60 %. Después de una hora se añadieron 0,84 mmol de la amina respectiva y se agitó durante 18 horas más a temperatura ambiente. Para el tratamiento se mezcló con agua, se concentró a vacío y el residuo restante se purificó por medio de cromatografía en columna sobre gel de sílice (gradiente de eluyente: diclorometano : metanol = 50:1 a 5:1).

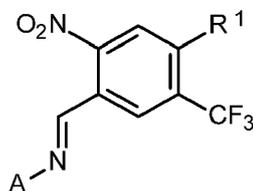
**b) Procedimiento de fosgeno:**

5 En una primera etapa de reacción se añadieron a 0 °C a una solución de 1,0 mmol de ácido 2-(hetaril)-indazol-5-carboxílico en 12 ml de diclorometano 5 gotas de *N,N*-dimetilformamida y 3 mmol de fosgeno. A continuación se agitó la mezcla de reacción durante 3 horas a temperatura ambiente. Después de concentrar la mezcla de reacción a vacío se obtuvo cloruro de ácido 2-(hetaril)-indazol-5-carboxílico.

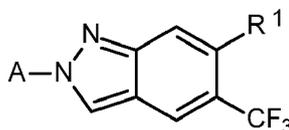
10 En una segunda etapa de reacción se añadió 1,0 mmol del cloruro de ácido 2-(hetaril)-indazol-5-carboxílico así preparado en 15 ml de diclorometano a temperatura ambiente, se mezcló con 3,0 mmol de la amina respectiva y con 4 mmol de *N,N*-diisopropiletilamina (DIPEA). Después se agitó la mezcla de reacción durante 18 horas a temperatura ambiente. Para el tratamiento se concentró la mezcla de reacción a vacío y el residuo restante se purificó por medio de CombiFlash (gradiente de eluyente: diclorometano hasta el 4 % de metanol en diclorometano).

**Síntesis general de 2-(hetaril)-5-trifluorometil-indazoles 4-substituidos de fórmula (I, R<sup>2</sup> = CF<sub>3</sub>)****Etapa 1: Síntesis de 2-nitro-5-(trifluorometil)-benzaldehído (A-1)**

15 A una solución de 4,9 mmol de 2-metil-1-nitro-4-(trifluorometil)-benceno en 15 ml de *N,N*-dimetilformamida se añadieron gota a gota a temperatura ambiente 63,7 mmol de *N,N*-dimetilformamida-*O*, *O*-dimetilacetilo. A continuación se agitó la mezcla de reacción durante 18 horas a 140 °C. Después se concentró la mezcla de reacción a vacío y el residuo restante se mezcló con 15 ml de tetrahidrofurano y 15 ml de agua. A continuación se añadieron 147 mmol de peryodato de sodio (NaIO<sub>4</sub>) y la mezcla de reacción se agitó adicionalmente durante 18 horas a temperatura ambiente. Después se extrajo la mezcla de reacción con diclorometano y la fase orgánica se concentró a vacío. El residuo restante se sometió a cromatografía por medio de ISCO (gradiente de eluyente: 100 % de éter de petróleo al 10 % de éster etílico de ácido acético en éter de petróleo).

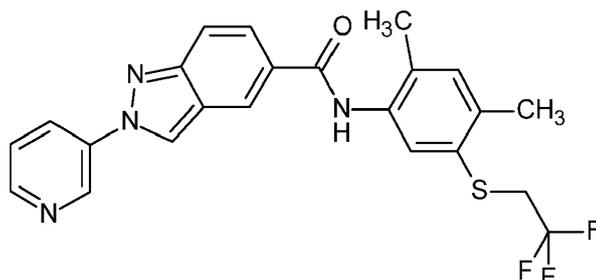
**Etapa 2: Síntesis de compuestos de fórmula (A-3); R<sup>1</sup> = H; R<sup>2</sup> = CF<sub>3</sub>)**

25 A una solución de 0,913 mmol de 2-nitro-5-trifluorometil-benzaldehído (A-1, R<sup>1</sup> = H) en 75 ml de tolueno se añadieron 1,095 mmol de un compuesto de amino heterocíclico (A-2), 0,046 mmol de PTSA, 0,27 mmol de tamiz molecular de 4A y sulfato de magnesio. A continuación se agitó la mezcla de reacción durante 18 horas a temperatura de reflujo. La mezcla de reacción se filtró y el filtrado dio, después de concentrar, los productos brutos (A-3), que se hicieron reaccionar adicionalmente sin purificación adicional.

**Etapa 3: Síntesis de 2-(hetaril)-5-trifluorometil-indazoles 4-substituidos de fórmula (I, R<sup>1</sup> = H; R<sup>2</sup> = CF<sub>3</sub>)**

30 A 0,913 mmol de los compuestos de fórmula (A-3) se añadieron a temperatura ambiente 2,739 mmol de fosfito de trietilo. A continuación se agitó la mezcla de reacción a 140 °C durante aproximadamente 18 horas. El control por medio de cromatograma de capa fina (eluyente: éter de petróleo : éster etílico de ácido acético = 1:1) mostró que la reacción había finalizado. Después de concentrar la mezcla de reacción a vacío se sometió a cromatografía el residuo restante por medio de ISCO (gradiente de eluyente: 100 % de éter de petróleo al 20 % de éster etílico de ácido acético/éter de petróleo).

**Ejemplo 81: N-{2,4-Dimetil-5-[(2,2,2-trifluoretil)sulfanil]fenil}-2-(piridin-3-il)-2*H*-indazol-5-carboxamida**

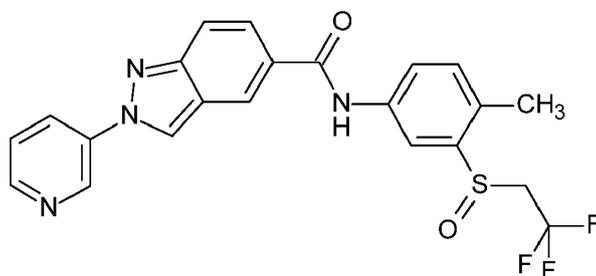


5 Bajo una atmósfera de argón se añadieron gota a gota a una solución de 251 mg (1,07 mmol) de 2,4-dimetil-5-[(2,2,2-trifluoretil)sulfanil]anilina en 5 ml de 1,2-dicloroetano lentamente 0,53 ml (1,07 mmol) de una solución 2 M de trimetilaluminio en tolueno. La solución se agitó durante 30 minutos a temperatura ambiente, se mezcló con 200 mg (0,71 mmol) de 2-(piridin-3-il)-2H-indazol-5-carboxilato de metilo y a continuación se agitó durante la noche a 100 °C. Después de enfriar a temperatura ambiente se mezcló la mezcla de reacción cuidadosamente con una solución saturada de tartrato de sodio y potasio y a continuación se extrajo varias veces con diclorometano. Las fases orgánicas reunidas se secaron con sulfato de sodio, se filtraron y el disolvente se retiró a presión reducida. El residuo se separó por cromatografía por medio de MPLC sobre gel de sílice (gradiente: acetato de etilo/ciclohexano 0:100 → 100:0). Se obtuvieron 102 mg (90 % de pureza, 28 % de rendimiento) de la *N*-{2,4-dimetil-5-[(2,2,2-trifluoretil)sulfanil]fenil}-2-(piridin-3-il)-2H-indazol-5-carboxamida.

15 **RMN de <sup>1</sup>H (400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):** RMN de <sup>1</sup>H (400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ = 9,967(3,6);9,462(5,6);9,448(0,4);9,390(3,2);9,384(3,3);8,702(2,3);8,699(2,5);8,690(2,4);8,687(2,5);8,557(5,0);8,539(1,5);8,536(1,8) ;8,533(1,9);8,529(1,5);7,921(1,4);7,918(1,3);7,899(2,6);7,895(2,6);7,851(3,5);7,828(1,8);7,698(1,8);7,686(1,8);7,678(1,8);7,666(1,7);7,571(5,2);7,208(4,7);4,038(0,4);4,021(0,4);3,892(1,1);3,866(3,5);3,840(3,6);3,814(1,2);3,317(32,3);2,675(0,4);2,671(0,5);2,666(0,4);2,524(1,5);2,510(31,3);2,506(61,7);2,502(81,3);2,497(60,7);2,493(30,4);2,385(14,2);2,333(0,5);2,329(0,6);2,324(0,5);2,226(16,0);2,204(1,4);2,185(0,9);1,988(1,9);1,193(0,5);1,175(1,0);1,158(0,5);0,008(1,4);0,000(38,9);-0,008(1,4) ppm.

De manera análoga se prepararon los compuestos 82, 83, 84, y 91 mencionados en las Tablas 1 y 3.

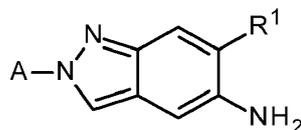
20 **Ejemplo 94: *N*-{4-Metil-3-[(2,2,2-trifluoretil)sulfanil]fenil}-2-(piridin-3-il)-2H-indazol-5-carboxamida**



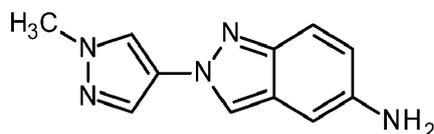
25 A una solución de 50 mg (0,11 mmol) de *N*-{4-metil-3-[(2,2,2-trifluoretil)sulfanil]fenil}-2-(piridin-3-il)-2H-indazol-5-carboxamida en 2,5 ml ácido acético se añadió una cantidad catalítica de wolframato de sodio y a 0 °C se agregaron 98 μl (0,11 mmol) de solución de peróxido de hidrógeno al 3,5 %. La mezcla de reacción se agitó durante una hora a 0 °C y durante la noche a temperatura ambiente. A continuación se añadieron 4 μl (44 μmol) de solución de peróxido de hidrógeno al 35 % y se agitó durante una noche más a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se diluyó con agua y diclorometano. La fase orgánica se separó y se lavó sucesivamente con agua así como solución de hidrogenosulfuro de sodio concentrado. A continuación se secó con sulfato de sodio, se filtró y el disolvente se retiró a presión reducida. El residuo se separó por cromatografía por medio de MPLC sobre gel de sílice (gradiente: acetato de etilo/ciclohexano 20:80 → 100:0). Se obtuvieron 19,8 mg (95 % de pureza, 37 % de rendimiento) de la *N*-{4-metil-3-[(2,2,2-trifluoretil)sulfanil]fenil}-2-(piridin-3-il)-2H-indazol-5-carboxamida.

35 **RMN de <sup>1</sup>H (400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):** RMN de <sup>1</sup>H (400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ = 10,618(4,2);9,478(6,2);9,394(3,7);9,387(3,8);8,706(2,5);8,703(2,8);8,695(2,7);8,691(2,9);8,600(4,5);8,563(1,4);8,560(1,7);8,557(1,6) ;8,553(1,5);8,543(1,6);8,539(1,7);8,536(1,8);8,532(1,5);8,373(3,9);8,368(4,2);8,314(0,3);8,000(1,9);7,995(1,9);7,980(2,1);7,974(2,1);7,940(1,7);7,936(1,8);7,917(3,3);7,913(3,5);7,869(4,0);7,847(2,1);7,703(2,0);7,691(1,9);7,682(1,9);7,670(1,9);7,367(3,0);7,346(2,8);4,181(1,0);4,171(0,5);4,153(1,1);4,143(1,3);4,126(0,5);4,116(1,3);4,089(0,4);3,949(0,3);3,922(1,2);3,913(0,4);3,895(1,4);3,885(1,1);3,868(0,5);3,858(1,0);3,832(0,3);3,318(50,7);2,791(0,6);2,676(0,6);2,671(0,8);2,667(0,6);2,635(0,5);2,524(2,4);2,511(44,9);2,507(91,6);2,502(122,3);2,497(92,4);2,493(47,8);2,351(16,0);2,333(0,9);2,329(1,0);2,324(0,8);1,336(0,7);1,299(0,5);1,259(0,8);1,250(1,0);1,234(0,5);0,146(0,6);0,008(5,1);0,000(138,3);-0,008(6,3);-0,150(0,6) ppm.

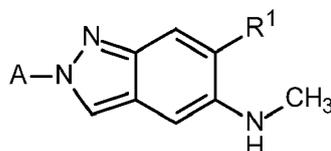
De manera análoga se prepararon los compuestos 96 y 97 mencionados en las Tablas 1 y 3.

**Síntesis general de 2-(heteril)-2H-indazol-5-aminas de fórmula (I, R<sup>2</sup> = NH<sub>2</sub>)**

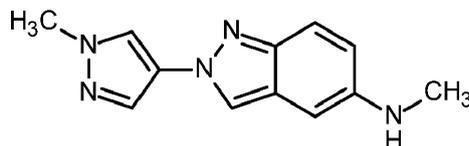
5 Los ácidos 2-(heteril)-indazol-5-carboxílicos 4-sustituídos de fórmula (I; R<sup>2</sup> = COOH) se disolvieron bajo atmósfera de gas protector (argón) en 1,4-dioxano anhidro (4 ml/mmol) y después se mezclaron con 1,5 eq. de difenilfosforilazida (DPPA) así como 1,5 eq. de trietilamina. A continuación se agitó la mezcla de reacción durante 3 horas a temperatura ambiente. Después de la adición de ácido clorhídrico 1 M (4 ml/mmol) se agitó la mezcla de reacción durante 30 minutos a 100 °C. Después de enfriar a temperatura ambiente, se ajustó mediante adición de una solución de carbonato de sodio el valor de pH = 7 y la mezcla de reacción se extrajo con diclorometano (3 x 4 ml/mmol). La fase orgánica reunida se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a vacío. El producto bruto restante se purificó a través de una columna de gel de sílice, como eluyente se usó un gradiente del 0 % al 5 % de metanol en diclorometano.

**2-(1-Metil-1H-pirazol-4-il)-2H-indazol-5-aminas de fórmula (I, A = 1-metil-1H-pirazol-4-ilo; R<sup>1</sup> = H, R<sup>2</sup> = NH<sub>2</sub>)**

15 Este compuesto se preparó a modo de ejemplo a partir de 2,87 g (11,8 mmol) de ácido 2-(1-metil-1H-pirazol-4-il)-2H-indazol-5-carboxílico de manera correspondiente a la síntesis general mencionada. Se obtuvieron 2,06 g (81 % de rendimiento d. t.; pureza según HPLC-EM 98 %) del compuesto del título. IQPA EM, m/z = 214 [M+H]<sup>+</sup>

**Síntesis general de N-metil-2-(heteril)-2H-indazol-5-aminas de fórmula (I, R<sup>2</sup> = NHCH<sub>3</sub>)****Procedimiento A:**

20 A una suspensión, que se compone de las 2-(heteril)-2H-indazol-5-aminas correspondientes de fórmula (I, R<sup>2</sup> = NH<sub>2</sub>) y 5 eq. de paraformaldehído en metanol (50 ml/mmol) se añadió gota a gota una solución de metanolato de sodio, que se preparó previamente a partir de 5 eq. de sodio y metanol (5 ml/mmol). Después se agitó la mezcla de reacción durante 1 hora a temperatura de reflujo y se mezcló con 5 eq. de borohidruro de sodio. A continuación se agitó la mezcla de reacción durante 30 minutos más y se enfrió a temperatura ambiente. Entonces se agregó solución de hidróxido de sodio 1 M (50 ml/mmol) y la mezcla de reacción se extrajo con diclorometano (3 x 50 ml/mmol). La fase orgánica reunida se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y se concentró a vacío.

**N-Metil-2-(1-metil-1H-pirazol-4-il)-2H-indazol-5-aminas de fórmula (I, A = 1-metil-1H-pirazol-4-ilo; R<sup>1</sup> = H, R<sup>2</sup> = NH<sub>2</sub>)**

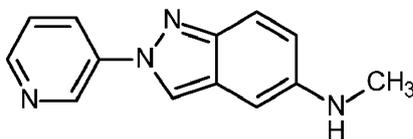
30 Este compuesto se preparó a modo de ejemplo a partir de 9,90 g (4,6 mmol) de 2-(1-metil-1H-pirazol-4-il)-2H-indazol-5-amina de manera correspondiente a la síntesis general mencionada. Se obtuvieron 1,20 g (100 % de rendimiento d. t.; pureza según HPLC-EM 99 %) del compuesto del título. IQPA EM, m/z = 228 [M+H]<sup>+</sup>

**Procedimiento B:****35 Etapa 1:**

Los 5-bromo-2-(heteril)-2H-indazoles (véase compuesto 49, etapa 2) se disolvieron bajo atmósfera de gas protector (argón) en 1,4-dioxano anhidro (3 ml/mmol) y a continuación se mezclaron con 1,2 eq. de carbamato de *tert*-butilo, 2 eq. de carbonato de cesio, 0,05 eq. de tris(dibencilidenacetona)dipaladio y 0,1 eq. de Xantphos. La mezcla de reacción

se agitó durante 6 horas a temperatura de reflujo y después se enfrió a temperatura ambiente. Después se mezcló la mezcla de reacción con agua (3 ml/mmol) y se extrajo con éster etílico de ácido acético (3 x 3 ml/mmol). La fase orgánica se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y se concentró a vacío. El producto bruto restante se purificó a través de una columna de gel de sílice, como eluyente se usó un gradiente del 0 % al 7 % de metanol en diclorometano.

5 **N-Metil-(2-piridin-3-il)-2H-indazol-5-aminas de fórmula (I, A = piridin-3-il-; R<sup>1</sup> = H, R<sup>2</sup> = NH<sub>2</sub>)**

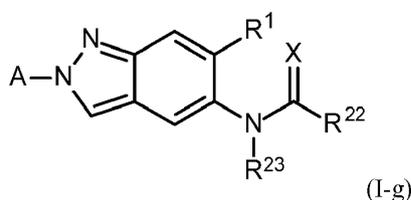


Este compuesto se preparó a modo de ejemplo a partir de 1,67 g (5,4 mmol) de (2-(2-piridin-3-il)-2H-indazol-5-il)carbamato de *tert*-butilo de manera correspondiente a la síntesis general mencionada. Se obtuvieron 686 mg (57 % de rendimiento d. t.; pureza según HPLC-EM 93 %) del compuesto del título.

10 IQPA EM, m/z = 225 [M+H]<sup>+</sup>

**Síntesis general de compuestos de fórmula (I-g)**

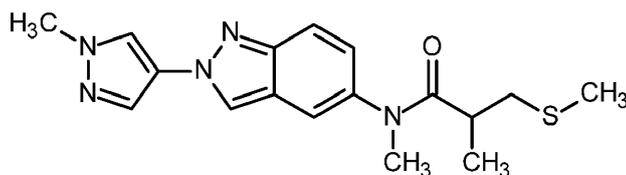
**Procedimiento A:**



15 Las *N*-metil-2-(hetaril)-2H-indazol-5-aminas respectivas de fórmula (I, A = hetarilo; R<sup>1</sup> = H, R<sup>2</sup> = NH-CH<sub>3</sub>) se disolvieron en diclorometano anhidro (5 ml/mmol) y se mezclaron a 0 °C con agitación con 1,2 eq. de los ácidos correspondientes, 2,4 eq. de diisopropiletilamina (base de Hünig) y 1,5 eq. de una solución al 50 % de anhídrido de ácido propilfosfónico (T3P) en tetrahydrofurano. A continuación se agitó adicionalmente la mezcla de reacción durante 30 minutos más a 0 °C y después 20 horas a temperatura ambiente. Tras finalizar la reacción se disolvió la mezcla de reacción en diclorometano (5 ml/mmol) y se lavó en primer lugar con solución acuosa de carbonato de potasio (5 ml/mmol) y después con agua (5 ml/mmol). La fase orgánica se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y se concentró a vacío. El producto bruto restante se purificó a través de una columna de gel de sílice, como eluyente se usó un gradiente del 0 % al 5 % de metanol en diclorometano.

20

**Ejemplo 105: N,2-Dimetil-N-(2-(1-metil-1H-pirazol-4-il)-2H-indazol-5-il)-3-(metiltio)propanamida**



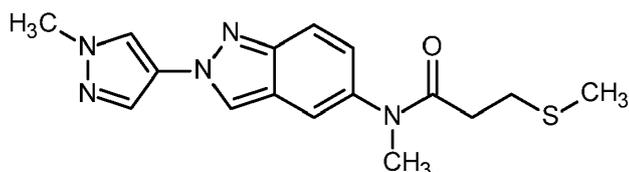
25 Este compuesto se preparó a modo de ejemplo a partir de 300 mg (1,3 mmol) de 2-(1-metil-1H-pirazol-4-il)-2H-indazol-5-amina de manera correspondiente a la síntesis general mencionada. Se obtuvieron 389 mg (86 % de rendimiento d. t.; pureza según HPLC-EM 98 %) del compuesto del título.

30 RMN de <sup>1</sup>H (300 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ = 0,99 (3H, d, J=6,4 Hz), 1,79 (3H, s), 2,30 (1H, dd, J<sub>1</sub>=11,8 Hz, J<sub>2</sub>=4,9 Hz), 2,57-2,77 (2H, m), 3,21 (3H, s), 3,93 (3H, s), 3,93 (3H, s), 7,22 (1H, dd, J<sub>1</sub>=9,0 Hz, J<sub>2</sub>=1,7 Hz), 7,71-7,81 (2H, m), 8,08 (1H, s), 8,43 (1H, s), 8,86 (1H, s) ppm.

**Procedimiento B:**

35 Las *N*-metil-2-(hetaril)-2H-indazol-5-aminas respectivas de fórmula (I, A = hetarilo; R<sup>1</sup> = H, R<sup>2</sup> = NH-CH<sub>3</sub>) se mezclaron en diclorometano anhidro (10 ml/mmol) a 0 °C con 1,2 eq. de piridina. Después se añadieron gota a gota 1,1 eq. del cloruro de ácido correspondiente y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. A continuación se lavó la mezcla de reacción con agua (2 x 5 ml/mmol). La fase orgánica se secó, se filtró sobre sulfato de magnesio y se concentró a vacío. El producto bruto restante se purificó por medio de HPLC.

**Ejemplo 106: N-Metil-N-(2-(1-metil-1H-pirazol-4-il)-2H-indazol-5-il)-3-(metiltio)propanamida**



Este compuesto se preparó a modo de ejemplo a partir de 300 mg (1,3 mmol) de 2-(1-metil-1H-pirazol-4-il)-2H-indazol-5-amina de manera correspondiente a la síntesis general mencionada. Se obtuvieron 452 mg (100 % de rendimiento d. t.; pureza según HPLC-EM 97 %) del compuesto del título.

5 IQPA EM,  $m/z = 330 [M+H]^+$

RMN de  $^1H$  (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta = 1,88$  (3H, s), 2,34 (2H, t,  $J=7,1$  Hz), 2,62 (2H, t,  $J=7,1$  Hz), 3,20 (3H, s), 3,93 (3H, s), 7,21 (1H, dd,  $J_1=8,9$  Hz,  $J_2=1,5$  Hz), 7,70-7,79 (2H, m), 8,08 (1H, s), 8,44 (1H, s), 8,85 (1H, s).

De manera análoga se preparó el compuesto 107 mencionado en la Tabla 1.

### **Procedimiento C:**

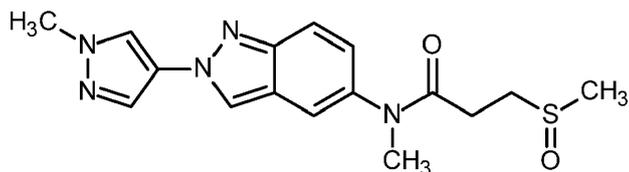
- 10 Las *N*-metil-2-(hetaril)-2H-indazol-5-aminas respectivas de fórmula (I, A = hetarilo;  $R^1 = H$ ,  $R^2 = NH-CH_3$ ) se añadieron en *N,N*-dimetilformamida (3 ml/mmol) y se mezclaron con 1,0 eq. del carboxílico ácido correspondiente, 1,1 eq. de 1-hidroxi-benzotriazol (HOBt), 1,1 eq. de diisopropiletilamina (base de Hünig) y 1,1 eq. de 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil)carbodiimida (EDCI) y se agitó durante 8 horas a 60 °C. después se disuelve la mezcla de reacción en diclorometano (5 ml/mmol) y se lava con agua (3 x 5 ml/mmol). La fase orgánica se secó, se filtró sobre sulfato de
- 15 magnesio y se concentró a vacío. El producto bruto restante se purificó por medio de HPLC.

De manera análoga se prepararon los compuestos 114 a 118 mencionados en las Tablas 1 y 2.

### **Procedimiento general para la sulfinil-oxidación**

- A una solución de las amidas correspondientes en ácido acético glacial (5 ml/mmol) se añadieron 0,9 eq. de hidrato de perborato de sodio ( $NaBO_3 \cdot 4H_2O$ ) y la mezcla de reacción se agitó durante 1 hora a 60 °C. Después se añadió solución saturada de hidrogenocarbonato de sodio hasta que cesó el desprendimiento de gas. A continuación se extrajo la mezcla de reacción con éster etílico de ácido acético (3x 5 ml/mmol). La fase orgánica se secó, se filtró sobre sulfato de magnesio y se concentró a vacío. El producto bruto restante se purificó a través de una columna de gel de sílice, como eluyente se usó un gradiente del 0 % al 5 % de metanol en diclorometano.
- 20

### **Ejemplo 119: *N*-Metil-*N*-(2-(1-metil-1H-pirazol-4-il)-2H-indazol-5-il)-3-(metilsulfinil) propanamida**



- 25 Este compuesto se preparó a modo de ejemplo a partir de 80 mg (0,24 mmol) de *N*-metil-*N*-(2-(1-metil-1H-pirazol-4-il)-2H-indazol-5-il)-3-(metiltio)propanamida de manera correspondiente a la síntesis general mencionada. Se obtuvieron 71 mg (85 % de rendimiento d. t.; pureza según HPLC-EM 86 %) del compuesto del título.

IQPA EM,  $m/z = 346 [M+H]^+$

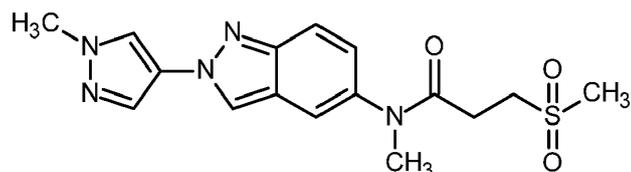
- 30 RMN de  $^1H$  (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta = 2,55$  (3H, s), 2,59-2,72 (2H, m), 2,79-2,90 (1H, m), 3,05-3,18 (1H, m), 3,33 (3H, s), 4,00 (3H, s), 7,10 (1H, dd,  $J_1=9,0$  Hz,  $J_2=1,9$  Hz), 7,54 (1H, d,  $J=1,3$  Hz), 7,80 (1H, d,  $J=9,0$  Hz), 7,89 (1H, s), 7,94 (1H, s), 8,22 (1H, s) ppm.

De manera análoga se preparó el compuesto 120 mencionado en las Tablas 1 y 2.

### **Procedimiento general para la sulfonil-oxidación**

- 35 A una solución de las amidas correspondientes en ácido acético glacial (5 ml/mmol) se añadieron 2,2 eq. de hidrato de perborato de sodio ( $NaBO_3 \cdot 4H_2O$ ) y la mezcla de reacción se agitó durante 1 hora a 60 °C. Después se añadió solución saturada de hidrogenocarbonato de sodio hasta que cesó el desprendimiento de gas. A continuación se extrajo la mezcla de reacción con éster etílico de ácido acético (3x 5 ml/mmol). La fase orgánica se secó, se filtró sobre sulfato de magnesio y se concentró a vacío. El producto bruto restante se purificó a través de una columna de gel de sílice, como eluyente se usó un gradiente del 0 % al 5 % de metanol en diclorometano.
- 40

### **Ejemplo 125: *N*-Metil-*N*-(2-(1-metil-1H-pirazol-4-il)-2H-indazol-5-il)-3-(metilsulfonil)propanamida**



Este compuesto se preparó a modo de ejemplo a partir de 80 mg (0,24 mmol) de *N*-metil-*N*-(2-(1-metil-1H-pirazol-4-il)-2*H*-indazol-5-il)-3-(metiltio)propanamida de manera correspondiente a la síntesis general mencionada. Se obtuvieron 60 mg (68 % de rendimiento d. t.; pureza según HPLC-EM 97 %) del compuesto del título.

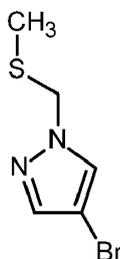
5 IQPA EM,  $m/z = 362 [M+H]^+$

RMN de  $^1H$  (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta = 2,70$  (2H, t,  $J=7,2$  Hz), 2,94 (3H, s), 3,35 (3H, s), 3,40 (2H, t,  $J=7,2$  Hz), 4,03 (3H, s), 7,12 (1H, dd,  $J_1=9,0$  Hz,  $J_2=1,6$  Hz), 7,57 (1H, s), 7,83 (1H, d,  $J=8,8$  Hz), 7,92 (1H, s), 7,97 (1H, s), 8,25 (1H, s) ppm.

De manera análoga se prepararon los compuestos 127 y 130 mencionados en las Tablas 1 y 2.

## 10 Síntesis de los productos intermedios:

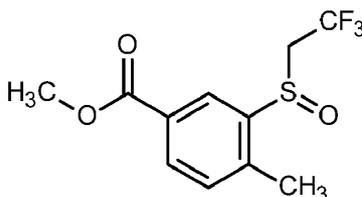
### 4-Bromo-1-[(metilsulfanil)metil]-1*H*-pirazol



A una solución de 100 mg (0,68 mmol) de 4-bromo-1*H*-pirazol en dimetilformamida absoluta se añadieron a 0 °C en porciones 41 mg (1,02 mmol) de hidruro de sodio. La mezcla de reacción se agitó durante 15 min a temperatura ambiente, se mezcló con 0,11 ml (1,4 mmol) de dimetilsulfuro de cloro y se agitó durante la noche a temperatura ambiente. A continuación se mezcló con agua y se extrajo repetidamente con acetato de etilo. Las fases orgánicas reunidas se secaron con sulfato de sodio, se filtraron y el disolvente se retiró a presión reducida. Se obtuvieron 100 mg (93 % de pureza, 66 % de rendimiento) del 4-bromo-1-[(metilsulfanil)metil]-1*H*-pirazol.

20 RMN de  $^1H$  (400,0 MHz,  $d_6$ -DMSO): RMN de  $^1H$  (400,0 MHz,  $d_6$ -DMSO):  $\delta = 8,069(4,4); 7,591(3,9); 5,242(10,2); 3,319(8,9); 2,502(15,8); 2,157(0,5); 2,121(16,0); 2,029(0,4); 2,024(0,5); 1,236(0,4); 0,002(7,1); 0,000(10,0)$

Éster metílico de ácido 4-metil-3-((2,2,2-trifluoretil)sulfinil)benzoico



### Etapa 1: Síntesis de éster metílico de ácido 4-metil-3-((2,2,2-trifluoretil)tio)benzoico

25 A una solución de 943 mg (5,17 mmol) de éster metílico de ácido 3-mercapto-4-metil-benzoico (véase la preparación en el documento WO/2010/094695 A1) en 15 ml de DMF se añadieron 1,07 g (7,8 mmol) de carbonato de potasio y 5,61  $\mu$ l (1,1 mmol) de yoduro de 2,2,2-trifluoroetilo. A continuación se agitó la mezcla de reacción durante 20 horas a temperatura ambiente. Después se diluyó la mezcla de reacción con 50 ml de agua y se extrajo dos veces con 50 ml de diclorometano. Las fases orgánicas reunidas se secaron con sulfato de magnesio, se filtraron y el disolvente se retiró a presión reducida. El producto bruto restante se purificó por medio de cromatografía ultrarrápida. Como eluyente se usó un gradiente del 0 % al 10 % de éster etílico de ácido acético en *n*-heptano. Se obtuvieron 990 mg (pureza: 93 %; 72 % de rendimiento) de éster metílico de ácido 4-metil-3-((2,2,2-trifluoretil)tio)benzoico.

30 IQPA EM,  $m/z = 265 [M+H]^+$

### Etapa 2:

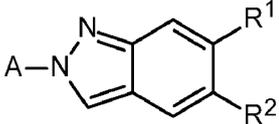
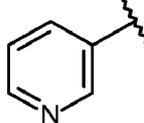
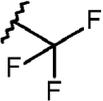
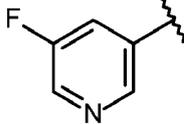
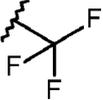
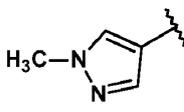
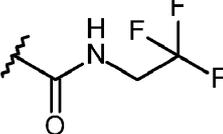
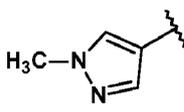
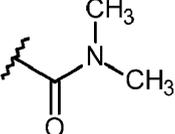
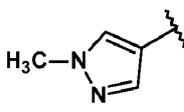
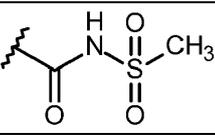
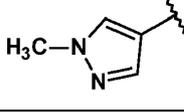
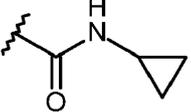
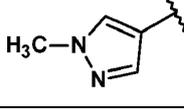
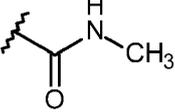
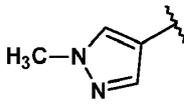
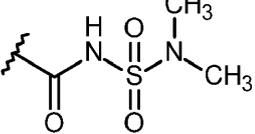
35 A una solución de 960 mg (3,6 mmol) de éster metílico de ácido 4-metil-3-((2,2,2-trifluoretil)tio)benzoico en 27 ml se añadieron 559 mg (3,6 mmol; 1,0 eq.) de hidrato de perborato de sodio ( $NaBO_3 \cdot 4H_2O$ ) y la mezcla de reacción se agitó durante 1 hora a 60 °C. Después se añadió solución saturada de hidrogenocarbonato de sodio hasta que cesó el desprendimiento de gas. A continuación se extrajo la mezcla de reacción con éster etílico de ácido acético (3x

30 ml/mmol). La fase orgánica se secó, se filtró sobre sulfato de magnesio y se concentró a vacío. Se obtuvieron 1,08 g (pureza: 96 %; 100 % de rendimiento) de éster metílico de ácido 4-metil-3-((2,2,2-trifluoretil)tio)benzoico. IQPA EM, m/z = 281 [M+H]<sup>+</sup>

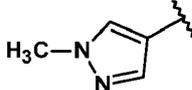
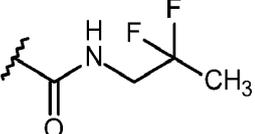
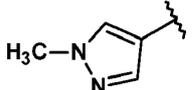
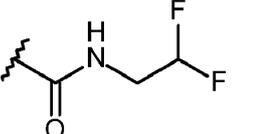
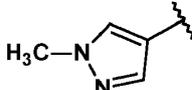
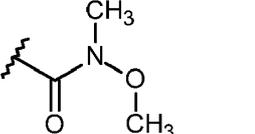
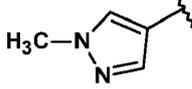
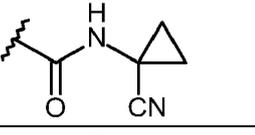
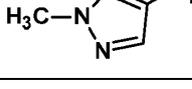
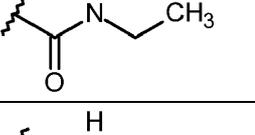
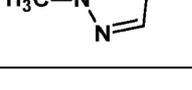
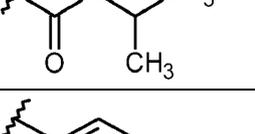
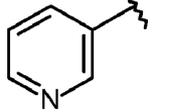
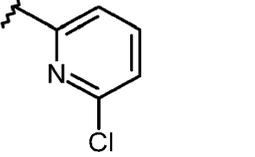
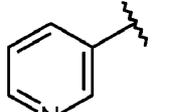
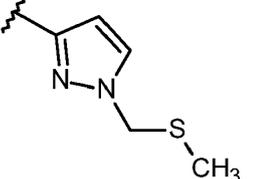
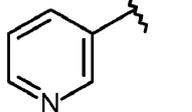
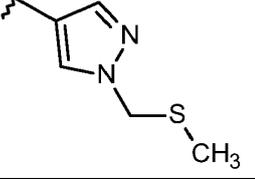
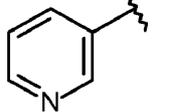
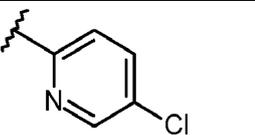
Compuestos de fórmula (I) se exponen en la siguiente Tabla.

5

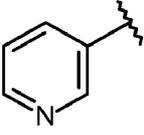
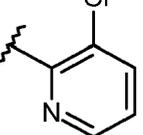
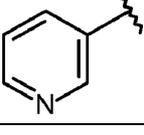
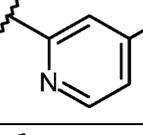
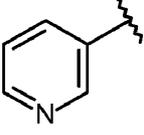
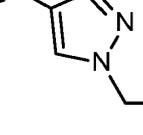
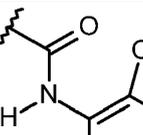
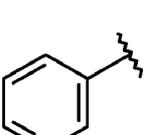
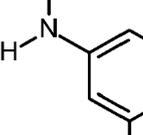
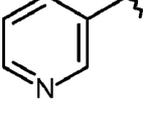
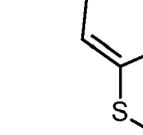
**Tabla 1**

Compuestos de fórmula					
					
N.º de compuesto	A	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Rendimiento [en mg]	Pureza [en %]
6*)		H		30,0	99,1
16		H		45,9	96,9
37		H		78,7	96,7
38		H		80,5	99,7
39		H		51,8	92,8
40		H		53,7	99,2
41		H		60,4	99,6
42		H		37,7	100

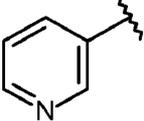
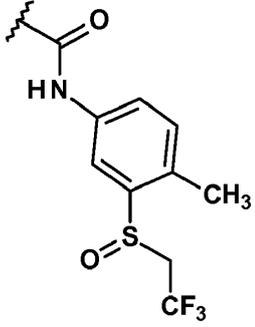
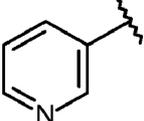
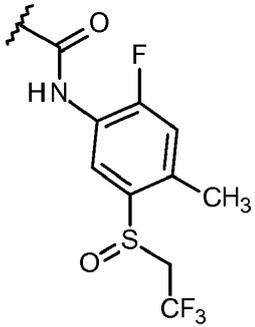
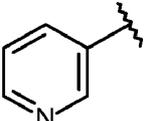
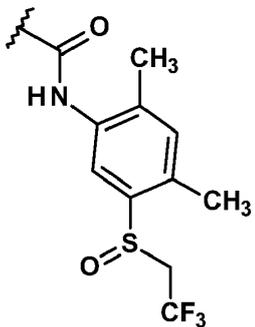
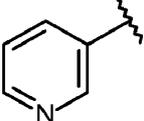
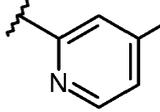
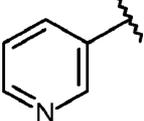
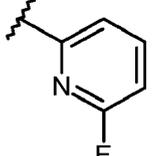
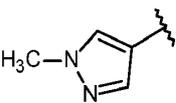
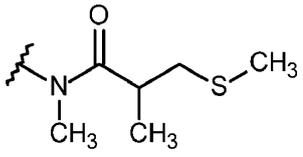
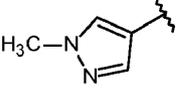
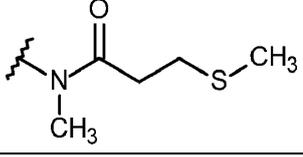
(continuación)

N.º de compuesto	A	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Rendimiento [en mg]	Pureza [en %]
43		H		67,4	99,4
44		H		78,3	98,5
45		H		64,7	98,6
46		H		78,5	98,7
47		H		62,7	99,4
48		H		65,3	98,4
61		H		56	100
62		H		10	97
63		H		62	100
67		H		73	97

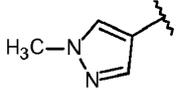
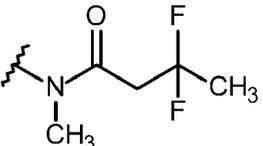
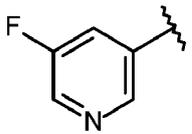
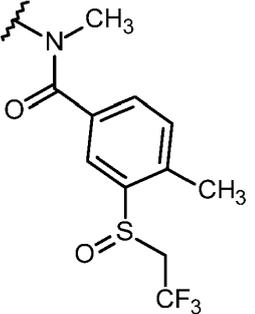
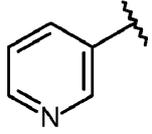
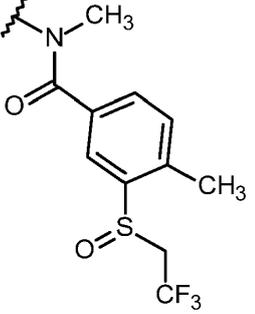
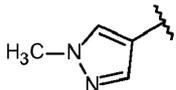
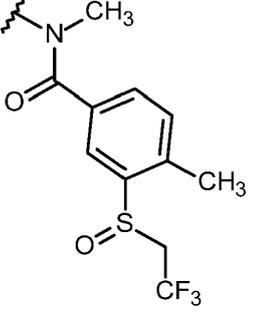
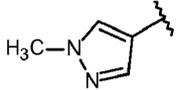
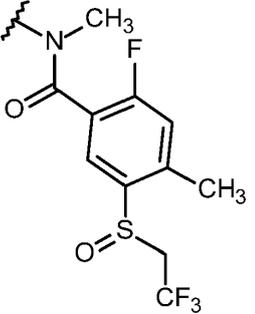
(continuación)

N.º de compuesto	A	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Rendimiento [en mg]	Pureza [en %]
68		H		55	97
69		H		46	100
74		H		55	91
81		H		28	90
82		H		32	99
91		H		93	99

(continuación)

N.º de compuesto	A	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Rendimiento [en mg]	Pureza [en %]
94		H		37	95
96		H		51	95
97		H		15	97
101		H			
104		H			
105		H		40,8	98
106		H		54,5	97

(continuación)

N.º de compuesto	A	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Rendimiento [en mg]	Pureza [en %]
107		H		59,7	98
114		H		42,4	89
115		H		44	99
116		H		42,4	89
117		H		45,5	96

(continuación)

N.º de compuesto	A	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Rendimiento [en mg]	Pureza [en %]
118		H		42,9	94
119		H		43,7	86
120		H		60,1	95
125		H		59,9	97
127 <sup>**</sup> )		H		54	98

\*) cristalizado con 1 x HCOOH; \*\*) cristalizado con 1 x CH<sub>3</sub>COOH

**Tabla 2**

Datos analíticos de los compuestos indicados 1-48 y 105-128		
N.º de Ej.	Tiempo de retención [min]	RMN de <sup>1</sup> H [δ (ppm)] o CL-EM [m/z]
6	2,881	RMN de <sup>1</sup> H (400,0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): δ = 7,53; 7,90; 8,11; 8,31; 8,61; 8,73; 9,21 (8H, =CH, arilo/ hetarilo). CL-EM = 364,0 (M+1); 263,21 (calculado)
16	2,902	RMN de <sup>1</sup> H (400,0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): δ = 7,53; 7,88; 8,10; 8,14; 8,58; 8,63; 9,04 (7H, =CH, arilo/ hetarilo). CL-EM = 282,0 (M+1); 281,20 (calculado)
37	2,447	RMN de <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ = 3,92 (s, 3H, CH <sub>3</sub> ); 4,11 (m, 2H, CH <sub>2</sub> ); 7,71; 7,77; 8,10; 8,44; 9,02; 9,09 (6H, =CH, arilo/ hetarilo). CL-EM = 324,0 (M+1); 323,27 (calculado)
38	1,690	RMN de <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ = 2,99 (s, 6H, 2 x CH <sub>3</sub> ); 3,92 (s, 3H, CH <sub>3</sub> ); 7,29; 7,68; 7,82; 8,08; 8,43; 8,87 (6H, =CH, arilo/ hetarilo). CL-EM = 270,1 (M+1); 269,30 (calculado)
39	1,037	RMN de <sup>1</sup> H (300,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ = 3,39; 3,93 (2s, 6H, 2 x CH <sub>3</sub> ); 7,74; 8,12; 8,48; 8,53; 9,09 (6H, =CH, arilo/ hetarilo). CL-EM = 320,0 (M+1); 319,33 (calculado)

ES 2 747 794 T3

(continuación)

Datos analíticos de los compuestos indicados 1-48 y 105-128		
N.º de Ej.	Tiempo de retención [min]	RMN de <sup>1</sup> H [δ (ppm)] o CL-EM [m/z]
40	1,997	RMN de <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ = 0,59; 0,69; 2,85 (3m, 5H, ciclopropilo); 3,92 (s, 3H, CH <sub>3</sub> ); 7,66; 7,73; 8,09; 8,27; 8,45; 8,96 (6H, =CH, arilo/ hetarilo). CL-EM = 282,1 (M+1); 281,31 (calculado)
41	1,843	RMN de <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ = 2,80; 3,92; (2s, 6H, 2xCH <sub>3</sub> ); 7,67; 7,73; 8,09; 8,29; 8,45; 8,98 (6H, =CH, arilo/ hetarilo). CL-EM = 282,1 (M+1); 255,27 (calculado)
42	1,695	RMN de <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ = 2,89; 3,92; (2s, 6H, 2xCH <sub>3</sub> ); 7,71; 7,75; 7,76; 8,12; 8,48; 9,06 (6H, =CH, arilo/hetarilo), 11,79 (a, 1H, NH). CL-EM = 349,1 (M+1); 348,38 (calculado)
43	2,350	RMN de <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ = 1,63; 3,76 (t+m, 5H, CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 3,92 (s, 1H, CH <sub>3</sub> ); 7,74; 8,10; 8,38; 8,46; 8,84; 9,00 (6H, =CH, arilo/ hetarilo). CL-EM = 320,1 (M+1); 319,3093
44	2,454	RMN de <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ = 3,68; 6,14 (2m, 3H, CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> ); 3,92 (s, 1H, CH <sub>3</sub> ); 7,75; 8,10; 8,37; 8,45; 8,88; 9,01 (6H, =CH, arilo/ hetarilo). CL-EM = 306,1 (M+1); 305,28 (calculado)
45	2,033	RMN de <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ = 3,28; 3,33; 3,92 (2s, 9H, 3xCH <sub>3</sub> ); 3,92 (s, 1H, CH <sub>3</sub> ); 7,49; 7,68; 8,09; 8,44; 8,93 (6H, =CH, arilo/ hetarilo). CL-EM = 286,1 (M+1); 285,30 (calculado)
46	2,053	RMN de <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ = 1,29; 1,56; (2m, 4H, 2xCH <sub>2</sub> ); 3,92 (s, 1H, CH <sub>3</sub> ); 7,71; 8,10; 8,34; 8,46; 9,02; 9,34 (6H, =CH, arilo/ hetarilo). CL-EM = 307,1 (M+1); 306,32 (calculado)
47	1,968	RMN de <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ = 1,14; 3,29; (t+q, 5H, CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 3,92 (s, 1H, CH <sub>3</sub> ); 7,67; 7,75; 8,09; 8,30; 8,49; 8,97 (6H, =CH, arilo/ hetarilo). CL-EM = 270,1 (M+1); 269,30 (calculado)
48	2,127	RMN de <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ = 1,18; 4,13 (d+m, 5H, CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ); 3,92 (s, 3H, CH <sub>3</sub> ); 7,70; 8,09; 8,24; 8,31; 8,45; 8,95 (6H, =CH, arilo/ hetarilo). CL-EM = 284,2 (M+3); 283,32 (calculado)
105		RMN de <sup>1</sup> H (300 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) δ= 0,99 (3H, d, J=6,4 Hz), 1,79 (3H, s), 2,30 (1H, dd, J1=11,8 Hz, J2=4,9 Hz), 2,57-2,77 (2H, m), 3,21 (3H, s), 3,93 (3H, s), 7,22 (1H, dd, J1=9,0 Hz, J2=1,7 Hz), 7,71-7,81 (2H, m), 8,08 (1H, s), 8,43 (1H, s), 8,86 (1H, s).
106	1,10	RMN de <sup>1</sup> H (300 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) δ = 1,88 (3H, s), 2,34 (2H, t, J=7,1 Hz), 2,62 (2H, t, J=7,1 Hz), 3,20 (3H, s), 3,93 (3H, s), 7,21 (1H, dd, J1=8,9 Hz, J2=1,5 Hz), 7,70-7,79 (2H, m), 8,08 (1H, s), 8,44 (1H, s), 8,85 (1H, s). CL-EM = 330,2 (M+1); 329,42 (calculado)
119	1,16	RMN de <sup>1</sup> H (300 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) δ = 2,55 (3H, s), 2,59-2,72 (2H, m), 2,79-2,90 (1H, m), 3,05-3,18 (1H, m), 3,33 (3H, s), 4,00 (3H, s), 7,10 (1H, dd, J1=9,0 Hz, J2=1,9 Hz), 7,54 (1H, d, J=1,3 Hz), 7,80 (1H, d, J=9,0 Hz), 7,89 (1H, s), 7,94 (1H, s), 8,22 (1H, s). CL-EM = 346,2 (M+1); 345,42 (calculado)
120	0,86	RMN de <sup>1</sup> H (300,0 MHz, d <sub>6</sub> -CDCl <sub>3</sub> ): δ = 1,13; 1,21; 2,50; 3,14; 3,25; 3,33; 3,99 (alquilo); 7,12-7,18; 7,55-7,8; 8,23 (6H, =CH, arilo/ hetarilo). CL-EM = 360,2 (M+1); 359,45 (calculado)
125	0,90	RMN de <sup>1</sup> H (300 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) δ = 2,70 (2H, t, J=7,2 Hz), 2,94 (3H, s), 3,35 (3H, s), 3,40 (2H, t, J=7,2 Hz), 4,03 (3H, s), 7,12 (1H, dd, J1=9,0 Hz, J2=1,6 Hz), 7,57 (1H, s), 7,83 (1H, d, J=8,8 Hz), 7,92 (1H, s), 7,97 (1H, s), 8,25 (1H, s) CL-EM = 362,2 (M+1); 361,42 (calculado)
127	0,92	RMN de <sup>1</sup> H (300,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ = 1,04; 1,78; 2,96; 3,92 (alquilo); 7,24; 7,75; 7,78; 8,08; 8,43; 8,88 (6H, =CH, arilo/ hetarilo). CL-EM = 376,1 (M+1); [sin CH <sub>3</sub> COOH]

Tabla 3

Datos analíticos de los compuestos indicados a partir del Ej. n.º 61			
N.º de Ej.	logP[a]	logP[b]	RMN de <sup>1</sup> H [δ (ppm)] o CL-EM [m/z]
61	2,79	2,80	RMN de <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,372(9,4);9,366(9,6);9,351(16,0);9,350(15,8);8,692(6,4);8,688(7,0);8,680(6,8);8,677(7,0);8,555(11,1);8,542(4,0);8,538(4,4);8,535(4,2);8,532(3,8);8,521(4,1);8,517(4,4);8,514(4,6);8,511(3,9);8,315(0,5);8,104(8,0);8,098(6,9);8,094(6,6);8,085(10,7);8,075(7,8);8,071(7,8);7,985(7,3);7,965(12,8);7,946(6,1);7,875(9,0);7,852(7,4);7,691(5,0);7,690(5,0);7,679(4,9);7,670(4,9);7,658(4,7);7,477(10,2);7,458(9,4);3,320(58,1);2,677(0,8);2,672(1,1);2,668(0,8);2,525(2,9);2,512(61,4);2,508(125,1);2,503(166,2);2,499(123,8);2,494(62,2);2,334(0,8);2,330(1,1);2,325(0,8);1,398(4,1);0,146(0,4);0,008(3,0);0,000(90,2);-0,008(3,8);-0,150(0,4)
62	1,97	2,11	RMN de <sup>1</sup> H (601,6 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): δ= 9,216(1,9);9,212(1,9);9,199(0,3);8,704(1,3);8,702(1,4);8,697(1,4);8,694(1,3);8,554(3,4);8,553(3,3);8,440(0,5);8,323(0,8);8,320(0,9);8,318(0,9);8,316(0,8);8,309(0,9);8,306(1,1);8,304(1,0);8,302(0,9);7,900(3,0);7,882(1,7);7,867(1,8);7,854(0,5);7,814(0,6);7,596(2,8);7,593(2,8);7,537(1,1);7,529(1,2);7,523(1,0);7,515(1,2);7,464(1,7);7,462(1,6);7,449(1,5);7,447(1,5);7,261(23,5);6,412(2,9);6,409(2,8);5,220(8,1);5,210(0,6);5,196(1,3);5,082(0,5);2,289(16,0);2,248(0,8);2,228(0,9);2,200(2,2);1,574(8,2);0,005(0,8);0,000(21,7);-0,006(0,9)
63	2,02		RMN de <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,353(2,1);9,347(2,1);9,158(3,6);8,659(1,4);8,656(1,6);8,648(1,5);8,644(1,5);8,515(0,8);8,511(0,9);8,509(0,9);8,505(0,8);8,494(0,9);8,491(0,9);8,488(1,0);8,484(0,8);8,337(3,9);8,031(4,0);7,965(2,6);7,771(1,4);7,748(2,0);7,664(1,2);7,652(1,2);7,645(2,3);7,643(2,6);7,631(1,2);7,623(1,3);7,619(1,3);5,290(8,0);3,322(10,6);2,525(0,5);2,512(9,7);2,508(19,6);2,503(26,1);2,499(19,5);2,494(10,0);2,190(16,0);0,008(0,6);0,000(15,6);-0,008(0,7)
67	2,8	2,78	RMN de <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,374(8,4);9,369(8,5);9,338(14,7);9,336(14,2);8,724(7,9);8,723(8,3);8,718(8,4);8,717(8,0);8,686(6,0);8,682(6,6);8,674(6,4);8,670(6,5);8,544(12,8);8,542(12,8);8,534(4,1);8,524(3,9);8,520(4,0);8,517(4,3);8,514(3,6);8,314(0,6);8,136(12,2);8,132(7,9);8,113(16,0);8,109(8,4);8,036(8,1);8,029(7,8);8,014(5,4);8,008(5,5);7,862(8,2);7,839(7,1);7,686(4,7);7,684(4,6);7,674(4,5);7,672(4,4);7,665(4,5);7,663(4,4);7,653(4,5);7,651(4,3);7,627(0,5);7,615(0,3);7,598(0,4);3,321(179,5);2,676(1,0);2,672(1,3);2,667(1,0);2,663(0,5);2,525(3,2);2,520(5,0);2,512(71,7);2,507(149,0);2,503(198,9);2,498(144,8);2,494(69,7);2,338(0,4);2,334(0,9);2,329(1,3);2,325(1,0);1,989(0,8);1,176(0,4);0,146(0,4);0,008(2,9);0,000(98,3);-0,009(3,3);-0,150(0,4)
68	2,17	2,21	RMN de <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,371(8,7);9,365(8,7);9,336(15,4);9,334(16,0);8,689(6,1);8,686(6,8);8,678(6,6);8,674(7,4);8,671(8,5);8,667(8,2);8,659(7,9);8,656(8,0);8,540(3,7);8,537(4,3);8,534(4,2);8,530(3,8);8,520(4,1);8,516(4,3);8,513(4,6);8,509(3,9);8,160(7,5);8,158(10,3);8,157(10,4);8,154(8,5);8,090(7,4);8,086(7,8);8,069(8,2);8,066(8,0);7,851(7,4);7,831(5,4);7,829(9,3);7,827(5,9);7,689(4,8);7,687(5,0);7,677(4,8);7,675(4,9);7,665(10,3);7,661(8,7);7,656(5,3);7,655(5,1);7,642(6,7);7,638(6,9);7,629(0,8);7,617(0,4);7,601(0,5);7,567(0,4);7,552(0,3);7,549(0,3);7,473(8,2);7,462(7,9);7,453(7,6);7,441(7,7);5,756(7,7);3,324(44,9);2,674(0,4);2,528(1,0);2,523(1,6);2,514(19,5);2,510(40,5);2,505(55,7);2,501(42,3);2,496(20,8);2,332(0,4);1,250(0,3);0,008(0,5);0,000(15,6);-0,009(0,5)

ES 2 747 794 T3

(continuación)

Datos analíticos de los compuestos indicados a partir del Ej. n.º 61			
N.º de Ej.	logP[a]	logP[b]	RMN de <sup>1</sup> H [δ (ppm)] o CL-EM [m/z]
69	2,62	2,66	RMN de <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,382(9,0);9,376(9,2);9,341(16,0);8,687(6,1);8,684(6,6);8,676(6,6);8,673(6,7);8,663(10,4);8,650(10,4);8,619(11,1);8,553(3,6);8,549(4,2);8,546(4,1);8,543(3,6);8,532(3,9);8,528(4,3);8,526(4,4);8,522(3,6);8,313(0,6);8,231(10,8);8,227(11,2);8,181(6,0);8,177(6,0);8,158(6,9);8,154(7,0);7,857(8,3);7,834(7,3);7,686(4,9);7,674(4,8);7,665(4,8);7,653(4,6);7,501(6,7);7,496(6,8);7,488(6,5);7,483(6,5);3,316(106,8);2,676(0,9);2,671(1,2);2,667(0,9);2,525(3,7);2,507(133,7);2,502(180,6);2,498(138,2);2,334(0,9);2,329(1,3);2,325(1,0);0,008(1,2);0,000(32,1);-0,008(1,3)
74	1,17	1,19	RMN de <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,354(2,8);9,349(3,1);9,172(4,7);8,658(2,2);8,647(2,3);8,512(1,5);8,491(1,6);8,360(0,4);8,274(4,9);8,213(0,4);8,175(5,0);8,014(0,3);7,997(3,8);7,784(1,9);7,761(2,7);7,665(1,7);7,655(3,8);7,645(1,8);7,633(3,2);5,769(0,5);5,755(0,7);5,545(2,1);5,512(2,8);5,325(2,9);5,293(2,2);3,321(17,1);3,075(1,0);2,671(0,4);2,596(16,0);2,503(58,2);2,330(0,4);2,075(0,5);0,000(19,0)
81	3,15	3,12	RMN de <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,967(3,6);9,462(5,6);9,448(0,4);9,390(3,2);9,384(3,3);8,702(2,3);8,699(2,5);8,690(2,4);8,687(2,5);8,557(5,0);8,539(1,5);8,536(1,8);8,533(1,9);8,529(1,5);7,921(1,4);7,918(1,3);7,899(2,6);7,895(2,6);7,851(3,5);7,828(1,8);7,698(1,8);7,686(1,8);7,678(1,8);7,666(1,7);7,571(5,2);7,208(4,7);4,038(0,4);4,021(0,4);3,892(1,1);3,866(3,5);3,840(3,6);3,814(1,2);3,317(32,3);2,675(0,4);2,671(0,5);2,666(0,4);2,524(1,5);2,510(31,3);2,506(61,7);2,502(81,3);2,497(60,7);2,493(30,4);2,385(14,2);2,333(0,5);2,329(0,6);2,324(0,5);2,226(16,0);2,204(1,4);2,185(0,9);1,988(1,9);1,193(0,5);1,175(1,0);1,158(0,5);0,008(1,4);0,000(38,9);-0,008(1,4)
82	3,22	3,15	RMN de <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 10,340(4,2);9,465(6,6);9,464(6,2);9,390(3,5);9,384(3,6);8,705(2,5);8,701(2,7);8,693(2,6);8,689(2,7);8,559(1,5);8,555(1,8);8,552(1,7);8,549(1,6);8,538(6,1);8,535(4,9);8,528(1,7);8,313(0,4);8,005(3,7);8,000(3,8);7,907(1,4);7,903(1,3);7,884(3,8);7,880(4,0);7,861(4,6);7,838(1,6);7,718(2,0);7,713(2,0);7,699(3,3);7,692(2,6);7,689(2,5);7,680(1,9);7,668(1,9);7,667(1,8);7,278(3,1);7,257(2,8);3,916(1,4);3,891(4,5);3,865(4,7);3,839(1,6);3,316(37,0);2,676(0,5);2,671(0,7);2,667(0,5);2,524(2,1);2,511(39,5);2,506(79,7);2,502(106,8);2,497(80,0);2,493(39,9);2,370(16,0);2,333(0,6);2,329(0,8);2,324(0,6);1,988(0,8);1,176(0,4);0,008(1,6);0,000(47,8);-0,009(1,7)
91	3,22	3,12	RMN de <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 10,202(4,5);9,474(6,5);9,389(3,7);9,383(3,8);8,704(2,5);8,701(2,8);8,693(2,7);8,689(2,8);8,576(4,5);8,560(1,6);8,556(1,8);8,554(1,8);8,550(1,6);8,539(1,6);8,536(1,8);8,533(1,9);8,529(1,6);8,313(0,3);7,913(1,5);7,909(1,5);7,890(3,4);7,886(3,6);7,857(4,3);7,844(3,4);7,834(2,3);7,824(3,3);7,699(2,0);7,687(2,0);7,678(2,0);7,667(1,9);7,313(2,8);7,284(2,8);3,918(1,4);3,892(4,3);3,866(4,5);3,840(1,6);3,317(33,8);2,676(0,3);2,671(0,5);2,667(0,4);2,511(26,0);2,507(51,7);2,502(70,1);2,498(55,4);2,465(0,6);2,429(16,0);2,333(0,4);2,329(0,5);2,324(0,4);0,008(0,5);0,000(11,8)
94	2,23	2,23	RMN de <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 10,618(4,2);9,478(6,2);9,394(3,7);9,387(3,8);8,706(2,5);8,703(2,8);8,695(2,7);8,691(2,9);8,600(4,5);8,563(1,4);8,560(1,7);8,557(1,6);8,553(1,5);8,543(1,6);8,539(1,7);8,536(1,8);8,532(1,5);8,373(3,9);8,368(4,2);8,314(0,3);8,000(1,9);7,995(1,9);7,980(2,1);7,974(2,1);7,940(1,7);7,936(1,8);7,917(3,3);7,913(3,5);7,869(4,0);7,847(2,1);7,703(2,0);7,691(1,9);7,682(1,9);7,670(1,9);7,367(3,0);7,346(2,8);4,181(1,0);4,171(0,5);4,153(1,1);4,143(1,3);4,126(0,5);4,116(1,3);4,089(0,4);3,949(0,3);3,922(1,2);3,913(0,4);3,895(1,4);3,885(1,1);3,868(0,5);3,858(1,0);3,832(0,3);3,318(50,7);2,791(0,6);2,676(0,6);2,671(0,8);2,667(0,6);2,635(0,5);2,524(2,4);2,511(44,9);2,507(91,6);2,502(122,3);2,497(92,4);2,493(47,8);2,351(16,0);2,333(0,9);2,329(1,0);2,324(0,8);1,336(0,7);1,299(0,5);1,259(0,8);1,250(1,0);1,234(0,5);0,146(0,6);0,008(5,1);0,000(138,3);-0,008(6,3);-0,150(0,6)

(continuación)

Datos analíticos de los compuestos indicados a partir del Ej. n.º 61			
N.º de Ej.	logP[a]	logP[b]	RMN de <sup>1</sup> H [δ (ppm)] o CL-EM [m/z]
96	2,19	2,14	RMN de <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 10,415(4,3);9,488(6,7);9,391(3,8);9,385(3,8);8,707(2,8);8,704(2,7);8,695(2,8);8,692(2,7);8,598(4,7);8,562(1,5);8,558(1,8);8,556(1,7);8,552(1,4);8,541(1,6);8,538(1,8);8,535(1,8);8,531(1,4);8,314(0,4);8,167(3,2);8,148(3,2);7,923(1,5);7,920(1,4);7,900(3,6);7,897(3,5);7,870(4,4);7,847(1,8);7,703(2,1);7,691(2,0);7,682(2,0);7,670(1,9);7,413(2,7);7,385(2,7);5,754(0,5);4,238(0,9);4,229(0,5);4,211(1,1);4,201(1,3);4,183(0,5);4,174(1,3);4,147(0,4);4,055(0,4);4,029(1,2);4,020(0,4);4,002(1,4);3,992(1,0);3,974(0,5);3,965(1,0);3,317(62,0);2,671(1,7);2,557(0,4);2,524(3,1);2,506(119,8);2,502(153,5);2,497(112,4);2,399(16,0);2,333(0,7);2,328(1,0);2,324(0,7);1,909(3,4);1,235(0,9);0,146(1,0);0,008(8,2);0,000(206,2);-0,008(8,5);-0,025(0,4);-0,150(1,0)
97	2,2	2,22	RMN de <sup>1</sup> H (601,6 MHz, DMF): δ= 10,128(0,3);9,505(1,0);9,504(0,9);9,455(0,5);9,451(0,5);8,740(0,4);8,738(0,4);8,732(0,4);8,730(0,4);8,705(0,7);8,091(1,0);8,052(0,4);8,049(0,4);8,037(0,7);8,034(0,7);8,024(5,2);7,906(0,6);7,891(0,5);7,326(0,8);3,465(16,0);2,921(2,9);2,918(5,7);2,915(8,1);2,912(5,6);2,909(2,7);2,751(3,1);2,747(6,3);2,744(9,0);2,741(6,3);2,738(3,1);2,438(3,0);2,433(2,9);0,005(0,5);0,000(12,7);-0,006(0,4)
101	2,04	2,21	RMN de <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,382(9,7);9,375(9,6);9,348(16,0);8,730(5,1);8,716(5,4);8,707(5,3);8,693(5,9);8,688(7,0);8,685(7,1);8,676(6,8);8,673(6,8);8,608(11,3);8,551(3,6);8,548(4,2);8,545(4,1);8,541(3,6);8,531(3,9);8,527(4,2);8,524(4,4);8,521(3,6);8,315(0,4);8,186(6,1);8,182(5,9);8,163(7,0);8,159(6,9);8,045(5,1);8,040(5,2);8,017(5,3);8,011(5,0);7,859(8,5);7,836(7,4);7,686(5,0);7,674(4,9);7,665(4,8);7,653(4,7);7,310(3,2);7,304(3,0);7,296(3,3);7,289(4,8);7,283(3,0);7,275(3,2);7,269(2,8);3,324(78,0);3,322(83,3);2,677(0,6);2,673(0,8);2,668(0,6);2,508(103,2);2,504(133,3);2,499(96,6);2,335(0,6);2,331(0,8);2,326(0,6);0,008(2,0);0,000(50,1);-0,008(2,0)
104	2,4	2,44	

**Ejemplos biológicos****Myzus persicae - Prueba de pulverización**

Disolvente:	78	partes en peso de acetona
	1,5	partes en peso de dimetilformamida
Emulsionante:	Alquilarilpoliglicol éter	

5 Para la preparación de una preparación de principio activo conveniente se disuelve 1 parte en peso de principio activo con las partes en peso indicadas de disolvente y se rellena con agua, que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm, hasta alcanzar la concentración deseada. Para la preparación de otras concentraciones de prueba se diluye con agua que contiene emulsionante.

Discos de hoja de col china (*Brassica pekinensis*), que están infestados con todos los estadios del pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*), se rocían con una preparación de principio activo de concentración deseada.

10 Después de 6 días se determina la acción en %. A este respecto, el 100 % significa que habían muerto todos los pulgones; el 0 % significa que no se destruyó ningún pulgón.

En esta prueba mostraron por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación una acción del 100 % con una cantidad de aplicación de 500 g/ha: 1, 3, 5, 7, 16, 24, 30, 32, 33, 50, 52, 61, 67, 68, 69, 74, 79, 80, 86, 87, 88, 89, 92, 96, 97, 108, 109, 112, 115, 121, 122, 128

15 En esta prueba mostraron por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación una acción del 90 % con una cantidad de aplicación de 500 g/ha: 6, 37, 62, 63, 81, 82, 94, 101, 104, 105, 114, 116, 118, 123

En esta prueba mostró por ejemplo el siguiente compuesto de los ejemplos de preparación una acción del 90 % con una cantidad de aplicación de 100 g/ha: 91

**Phaedon cochleariae - Prueba de pulverización**

Disolvente:	78,0	partes en peso de acetona
	1,5	partes en peso de dimetilformamida
Emulsionante:	Alquilarilpoliglicol éter	

5 Para la preparación de una preparación de principio activo conveniente se disuelve 1 parte en peso de principio activo con las partes en peso indicadas de disolvente y se rellena con agua, que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm, hasta alcanzar la concentración deseada. Para la preparación de otras concentraciones de prueba se diluye con agua que contiene emulsionante.

Discos de hoja de col china (*Brassica pekinensis*) se rocían con una preparación de principio activo de la concentración deseada y después de secarse se ocupan con larvas del escarabajo de la hoja del rábano picante (*Phaedon cochleariae*).

10 Después de 7 días se determina la acción en %. A este respecto el 100 % significa que se destruyeron todas las larvas de escarabajo; el 0 % significa que no se destruyó ninguna larva de escarabajo.

En esta prueba mostraron por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación una acción del 100 % con una cantidad de aplicación de 500 g/ha: 16, 38

**Spodoptera frugiperda - Prueba de pulverización**

Disolvente:	78,0	partes en peso de acetona
	1,5	partes en peso de dimetilformamida
Emulsionante:	Alquilarilpoliglicol éter	

15 Para la preparación de una preparación de principio activo conveniente se disuelve 1 parte en peso de principio activo con las partes en peso indicadas de disolvente y se rellena con agua, que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm, hasta alcanzar la concentración deseada. Para la preparación de otras concentraciones de prueba se diluye con agua que contiene emulsionante.

20 Discos de hoja de maíz (*Zea mays*) se rocían con una preparación de principio activo de la concentración deseada y después de secarse se ocupan con orugas del cogollero del maíz (*Spodoptera frugiperda*).

Después de 7 días se determina la acción en %. A este respecto, el 100 % significa que habían muerto todas las orugas; el 0 % significa que no se destruyó ninguna oruga.

En esta prueba mostraron por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación una acción del 100 % con una cantidad de aplicación de 500 g/ha: 38

25 **Tetranychus urticae - Prueba de pulverización, Resistente a OP**

Disolvente:	78,0	partes en peso de acetona
	1,5	partes en peso de dimetilformamida
Emulsionante:	Alquilarilpoliglicol éter	

Para la preparación de una preparación de principio activo conveniente se disuelve 1 parte en peso de principio activo con las partes en peso indicadas de disolvente y se rellena con agua, que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm, hasta alcanzar la concentración deseada. Para la preparación de otras concentraciones de prueba se diluye con agua que contiene emulsionante.

30 Discos de hojas de judías (*Phaseolus vulgaris*), que estaban infestadas con todos los estadios de la araña común (*Tetranychus urticae*), se rocían con una preparación de principio activo de concentración deseada.

Después de 6 días se determina la acción en %. A este respecto, el 100 % significa que se destruyeron todas las arañas; el 0 % significa que no se destruyó ninguna araña.

35 En esta prueba mostraron por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación una acción del 90 % con una cantidad de aplicación de 500 g/ha: 117

**Cooperia curticei - Prueba**

Disolvente:	dimetilsulfóxido
-------------	------------------

Para la preparación de una preparación de principio activo conveniente se mezclan 10 mg de principio activo con 0,5 ml de dimetilsulfóxido y se diluye el concentrado con "solución Ringer" hasta la concentración deseada.

40 Recipientes con la preparación de principio activo de la concentración deseada se ocupan con aproximadamente 40 larvas de nematodo (*Cooperia curticei*).

Después de 5 días se determina la muerte en %. A este respecto, el 100 % significa que habían muerto todas las larvas; el 0 % significa que no había muerto ninguna larva.

En esta prueba mostró por ejemplo el siguiente compuesto de los ejemplos de preparación una acción del 80 % con una cantidad de aplicación de 20 ppm: 67

5 **Haemonchus contortus - Prueba**  
Disolvente: dimetilsulfóxido

Para la preparación de una preparación de principio activo conveniente se mezclan 10 mg de principio activo con 0,5 ml de dimetilsulfóxido y se diluye el concentrado con "solución Ringer" hasta la concentración deseada.

10 Recipientes con la preparación de principio activo de la concentración deseada se ocupan con aproximadamente 40 larvas del nematodo del estómago rojos (*Haemonchus contortus*).

Después de 5 días se determina la muerte en %. A este respecto, el 100 % significa que habían muerto todas las larvas; el 0 % significa que no había muerto ninguna larva.

En esta prueba mostró por ejemplo el siguiente compuesto de los ejemplos de preparación una acción del 80 % con una cantidad de aplicación de 20 ppm: 67

15 **Meloidogyne incognita - Prueba**  
Disolvente: 125,0 partes en peso de acetona

Para la preparación de una preparación de principio activo conveniente se mezcla 1 parte en peso de principio activo con la cantidad indicada de disolvente y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

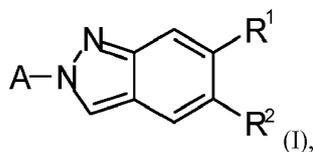
20 Se llenan recipientes con arena, solución de principio activo, una suspensión de huevo-larvas del nematodo del nudo de la raíz del sur (*Meloidogyne incognita*) y semillas de lechuga. Las semillas de lechuga germinan y las plantas se desarrollan. En las raíces se desarrollan los nudos.

Después de 14 días se determina la acción nematicida por medio de la formación de nudos en %. A este respecto el 100 % significa que no se encontraron nudos; el 0 % significa que el número de nudos en las plantas tratadas se corresponde con el control no tratado.

25 En esta prueba mostró por ejemplo el siguiente compuesto de los ejemplos de preparación una acción del 90 % con una cantidad de aplicación de 20 ppm: 104

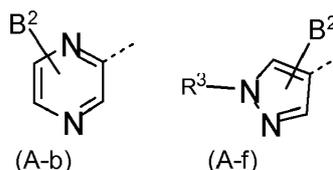
REIVINDICACIONES

1. Compuestos de fórmula (I)



en la que

5 A representa un resto A de la serie (A-b) y (A-f),

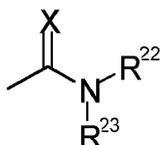


10 donde la línea discontinua significa el enlace con el átomo de nitrógeno del biciclo de fórmula (I),

B<sup>2</sup> representa hidrógeno,

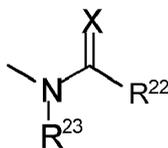
R<sup>1</sup> representa hidrógeno,

R<sup>2</sup> c) representa un resto de fórmula,



o

R<sup>2</sup> d) representa un resto de fórmula



15 X representa oxígeno,

R<sup>3</sup> representa alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>,

R<sup>22</sup> cuando R<sup>2</sup> representa el resto c), representa un resto de la serie alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> dado el caso sustituido con ciano, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfonilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, di-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-aminosulfonilo,

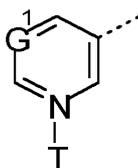
20 R<sup>23</sup> cuando R<sup>2</sup> representa el resto c), representa un resto de la serie hidrógeno y alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>,

R<sup>22</sup> cuando R<sup>2</sup> representa el resto d), representa un resto de la serie haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfinil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfonil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>,

R<sup>23</sup> cuando R<sup>2</sup> representa el resto d), representa un resto de la serie hidrógeno y alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, y en el caso de R<sup>2</sup> = d)

25 R<sup>22</sup> también representa fenilo sustituido dado el caso con halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> y haloalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfinilo, y Compuestos de fórmula (I), donde

A representa el resto A



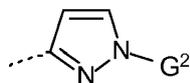
(A-a)

30 donde la línea discontinua significa el enlace con el átomo de nitrógeno del biciclo de fórmula (I),

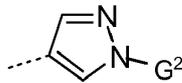
G<sup>1</sup> representa N o C-B<sup>1</sup>,

B<sup>1</sup> representa un resto de la serie hidrógeno y flúor,

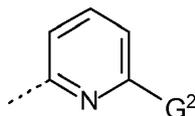
T representa un par de electrones,  
 R<sup>1</sup> representa hidrógeno,  
 R<sup>2</sup> aa) representa un resto de la serie



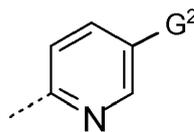
(B-3)



(B-4)

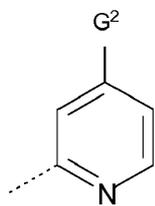


(B-21)

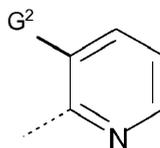


(B-22)

5



(B-35)

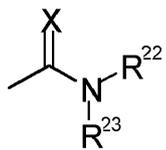


(B-36),

donde

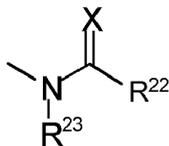
G<sup>2</sup> representa un resto de la serie halógeno, alquilitio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfinilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfonilo, haloalquilitio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfinilo, haloalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfonilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfinil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfonil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, o  
 R<sup>2</sup> c) representa un resto de fórmula

10



o

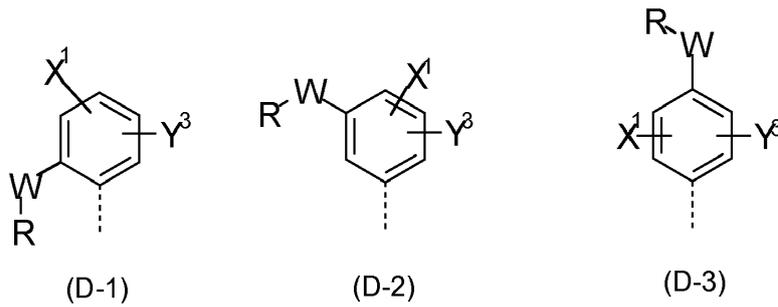
R<sup>2</sup> d) representa un resto de fórmula



15

o

R<sup>2</sup> f) representa haloalquilo,  
 X representa oxígeno,  
 R<sup>22</sup> representa un resto de la serie (D-1) a (D-3)



donde la línea discontinua significa el enlace con el átomo de nitrógeno en el resto c) o con el átomo de carbono en el resto d),

5 R representa en cada caso alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> dado el caso sustituido una, dos, tres, cuatro o cinco veces con flúor, cloro,

X<sup>1</sup> representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo,

W representa un resto de la serie S, SO y SO<sub>2</sub>,

Y<sup>3</sup> representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo y etilo.

10 2. Agentes, **caracterizados por** un contenido de al menos un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 y extensores y/o sustancias de actividad superficial habituales.

3. Uso no terapéutico de compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 o de agentes de acuerdo con la reivindicación 2 para combatir plagas.