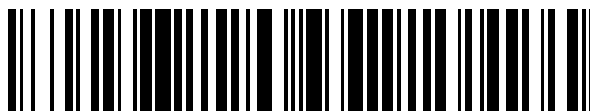


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 762 958**

51 Int. Cl.:

C07D 471/04 (2006.01)

A01N 43/90 (2006.01)

C07D 491/04 (2006.01)

C07D 495/04 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **27.06.2016 PCT/EP2016/064778**

87 Fecha y número de publicación internacional: **05.01.2017 WO17001311**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **27.06.2016 E 16731935 (9)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **18.09.2019 EP 3317275**

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

30 Prioridad:

01.07.2015 EP 15174759
07.09.2015 EP 15184066

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
26.05.2020

73 Titular/es:

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

72 Inventor/es:

JUNG, PIERRE, JOSEPH, MARCEL;
EDMUNDS, ANDREW y
MUEHLEBACH, MICHEL

74 Agente/Representante:

LEHMANN NOVO, María Isabel

ES 2 762 958 T3

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

DESCRIPCIÓN

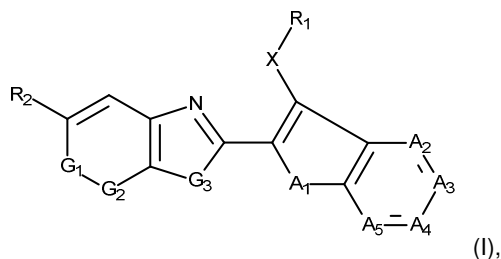
Derivados tetracíclicos activos como plaguicidas con sustituyentes que contienen azufre

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

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

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

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



en donde

15 A₁ representa S, O o NCH₃;

A₂, A₃, A₄ y A₅, independientemente entre sí, representan CR₃ o N;

X es S, SO o SO₂;

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

25 R₂ es hidrógeno, halógeno, haloalquil C₁-C₄sulfanilo, haloalquil C₁-C₄sulfínilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, haloalcoxi C₁-C₄, -SF₅, haloalquilcarbonilo C₁-C₄, ciano, haloalquilo C₁-C₆; o es haloalquilo C₁-C₆ sustituido por uno o dos sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en hidroxilo, metoxi y ciano; o es cicloalquilo C₃-C₆ que puede estar mono- o polisustituido por sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano, haloalquilo C₁-C₄ y alquilo C₁-C₄;

30 cada R₃ es, independientemente entre sí, hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, -SF₅, hidroxilo, amino, NR₉R₁₀, C(O)NR₉R₁₀, haloalquilo C₁-C₆, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, haloalquil C₁-C₄sulfanilo, haloalquil C₁-C₄sulfínilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfanilo, alquil C₁-C₄sulfínilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, haloalcoxi C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆,

alquilcarbonilo C₁-C₄, alcocarbonilo C₁-C₆, o es cicloalquilo C₃-C₆ que puede estar mono- o polisustituido con R₇, o es cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ que puede estar mono- o polisustituido con R₈;

G₁ es NR₄ y G₂ es C(Y); o

G₂ es NR₅ y G₁ es C(Y);

Y es O o S;

35 G₃ es NR₆;

- R₆ es alquilo C₁-C₄, que puede estar mono- o poli-sustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno y alquil C₁-C₂sulfonilo;
- 5 R₄ y R₅ son, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, o son cicloalquilo C₃-C₆, que puede estar mono- o poli-sustituido con R₇; o son cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, que puede estar mono- o poli-sustituido con R₈; o
- R₄ y R₅ son, independientemente entre sí, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆sulfanilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₆sulfinilo, haloalquil C₁-C₆sulfanilo, haloalquil C₁-C₆sulfonilo, haloalquil C₁-C₆sulfinilo, amino o hidroxilo;
- R₄ y R₅ son, independientemente entre sí, alquilo C₁-C₄ sustituido por R₁₁; o
- 10 R₄ y R₅ son, independientemente entre sí, alqueno C₂-C₆ sustituido por R₁₁; o
- R₄ y R₅ son, independientemente entre sí, alquino C₂-C₆ sustituido por R₁₁;
- R₇ y R₈, independientemente entre sí, son halógeno, nitro, ciano, haloalcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄;
- R₉ y R₁₀, independientemente entre sí, are hidrógeno, ciano, alcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆,
- 15 alquil C₁-C₂-cicloalquilo C₃-C₆, -C(O)Oalquilo C₁-C₃ o alquilo C₁-C₆;
- R₁₁ es ciano, alquil C₁-C₆sulfanilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfinilo, haloalquil C₁-C₄sulfanilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, haloalquil C₁-C₆sulfinilo, alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ o fenilo, dicho fenilo y dicho cicloalquilo C₃-C₆ pueden estar mono- o poli-sustituidos por sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alquilo C₁-C₄, ciano, haloalquilo C₁-C₄ y alcoxi C₁-C₄;
- 20 y sales, estereoisómeros, enantiómeros, tautómeros y N-óxidos agroquímicamente aceptables de esos compuestos.
- Compuestos de fórmula I que tienen al menos un centro básico pueden formar, por ejemplo, sales por adición de ácidos, por ejemplo con ácidos inorgánicos fuertes tales como ácidos minerales, por ejemplo ácido perclórico, ácido sulfúrico, ácido nítrico, un ácido fosforoso o un ácido hidrohálico, con ácidos carboxílicos orgánicos fuertes, tales como ácidos alcano C₁-C₄carboxílicos que están no sustituidos o están sustituidos, por ejemplo, con halógeno, por ejemplo ácido acético, tales como ácidos dicarboxílicos saturados o insaturados, por ejemplo ácido oxálico, ácido malónico, ácido succínico, ácido maleico, ácido fumárico o ácido ftálico, tales como ácidos hidroxicarboxílicos, por ejemplo, ácido ascórbico, ácido láctico, ácido málico, ácido tartárico o ácido cítrico, o tales como ácido benzoico, o con ácidos sulfónicos orgánicos, tales como ácidos alcano C₁-C₄-o aril-sulfónicos que están no sustituidos o están sustituidos, por ejemplo, con halógeno, por ejemplo ácido metano- o p-tolueno-sulfónico. Compuestos de fórmula I que tienen al menos un grupo
- 25 ácido pueden formar, por ejemplo, sales con bases, por ejemplo, sales minerales tales como sales con un metal alcalino o un metal alcalinotérreo, por ejemplo, sales de sodio, potasio o magnesio o sales con amoniaco o una amina orgánica, tal como morfolina, piperidina, pirrolidina, una mono-, di- o tri-alquilamina inferior, por ejemplo, etil-, dietil-, trietil- o dimetil-propilamina, o una mono-, di- o tri-hidroxialquilamina inferior, por ejemplo, mono-, di- o tri-etanolamina.
- Los grupos alquilo que aparecen en las definiciones de los sustituyentes pueden ser de cadena lineal o ramificada y son, por ejemplo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, iso-butilo, terc-butilo, pentilo, hexilo y sus isómeros ramificados. Los radicales alquilsulfanilo, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alcoxi, alqueno y alquino se derivan de los radicales alquilo mencionados. Los grupos alqueno y alquino pueden ser mono- o poliinsaturados. Di-alquil C₁amino es dimetilamino.
- 35 Halógeno es, en general, flúor, cloro, bromo o yodo. Esto también se aplica, correspondientemente, a halógeno en combinación con otros significados, tales como haloalquilo o halofenilo.
- Los grupos haloalquilo tienen preferentemente una longitud de cadena de 1 a 6 átomos de carbono. Haloalquilo es, por ejemplo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorometilo, diclorometilo, triclorometilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2-cloroetilo, pentafluoroetilo, 1,1-difluoro-2,2,2-tricloroetilo, 2,2,3,3-tetrafluoroetilo y 2,2,2-tricloroetilo.
- 45 Alcoxi es, por ejemplo, metoxi, etoxi, propoxi, i-propoxi, n-butoxi, isobutoxi, sec-butoxi y terc-butoxi y también los radicales isoméricos pentilo y hexilo.
- Alcoxialquilo es, por ejemplo, metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, n-propoximetilo, n-propoxietilo, isopropoximetilo o isopropoxietilo.

Alcoxicarbonilo es, por ejemplo, metoxicarbonilo (que es alcoxi C₁carbonilo), etoxicarbonilo, propoxicarbonilo, isopropoxicarbonilo, *n*-butoxicarbonilo, *tert*-butoxicarbonilo, *n*-pentoxicarbonilo o hexoxicarbonilo.

Alquilsulfanilo es, por ejemplo, metilsulfanilo, etilsulfanilo, propilsulfanilo, isopropilsulfanilo, butilsulfanilo, pentilsulfanilo y hexilsulfanilo.

5 Alquilsulfinilo es, por ejemplo, metilsulfinilo, etilsulfinilo, propilsulfinilo, isopropilsulfinilo, un butilsulfinilo, pentilsulfinilo y hexilsulfinilo.

Alquilsulfonilo es, por ejemplo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, propilsulfonilo, isopropilsulfonilo, butilsulfonilo, pentilsulfonilo y hexilsulfonilo.

Haloalquilsulfanilo es, por ejemplo, trifluorometilsulfanilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfanilo y pentafluoroetilsulfanilo.

10 Haloalquilsulfinilo es, por ejemplo, trifluorometilsulfinilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfinilo o pentafluoroetilsulfinilo.

Haloalquilsulfonilo es, por ejemplo, trifluorometilsulfonilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfonilo y pentafluoroetilsulfonilo.

Cicloalquilo es, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo.

15 En el contexto de la presente invención "de mono a polisustituido" en la definición de los sustituyentes, significa típicamente, dependiendo de la estructura química de los sustituyentes, de monosustituido a siete veces sustituido, preferentemente de monosustituido a cinco veces sustituido, más preferentemente mono, doblemente o triplemente sustituido.

Preferentemente, R₉ y R₁₀, independientemente entre sí, are hidrógeno, ciano, alcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alquil C₁-C₂-cicloalquilo C₃-C₆ o alquilo C₁-C₆.

En compuestos preferidos de fórmula I,

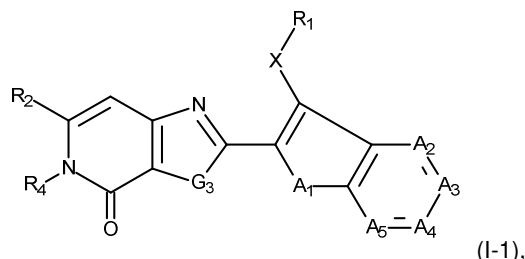
20 R₄ y R₅ son, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, o son cicloalquilo C₃-C₆, que puede estar mono- o poli-sustituido con R₇; o son cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, que puede estar mono- o poli-sustituido con R₈; o

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

R₄ y R₅ son, independientemente entre sí, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆sulfanilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₆sulfinilo, haloalquil C₁-C₆sulfanilo, haloalquil C₁-C₆sulfonilo, haloalquil C₁-C₆sulfinilo, amino o hidroxilo; y

30 R₇ y R₈, independientemente entre sí, son halógeno, nitro, ciano, haloalcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄.

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



en donde los sustituyentes X, R₁, R₂, R₄, G₃, A₁, A₂, A₃, A₄ y A₅ son como se definen en la fórmula I anterior.

Son realizaciones más preferidas de la invención:

35 Realización (A1):

Se prefieren compuestos de fórmula I-1, en donde

A₁ representa S, O o NCH₃;

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

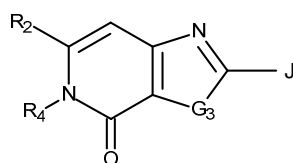
R₂ es halógeno, haloalquil C₁-C₄sulfanilo, haloalquil C₁-C₄sulfinilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, haloalcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, ciano o es cicloalquilo C₃-C₆, que puede estar mono- o polisustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano y alquilo C₁-C₄; y

5

X, R₄, G₃, A₂, A₃, A₄ y A₅ son como se definen en la fórmula I anterior.

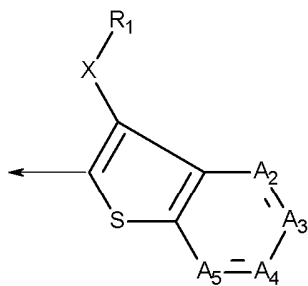
Realización (A2):

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

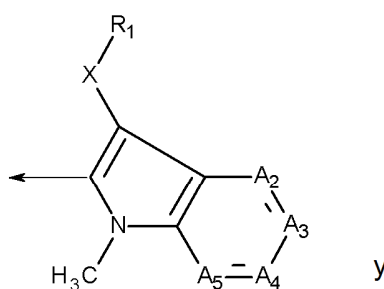


(I-1a),

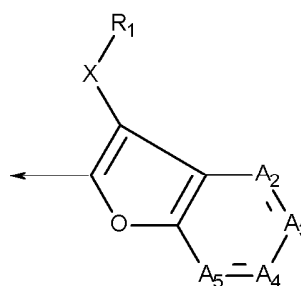
10 en donde J se selecciona del grupo que consiste en



J1



J2



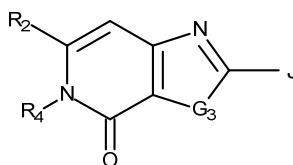
J3

;

en donde G₃, R₁, R₂, R₄, X, A₂, A₃, A₄ y A₅ son como se definen en la Realización (A1) anterior.

Realización (A3):

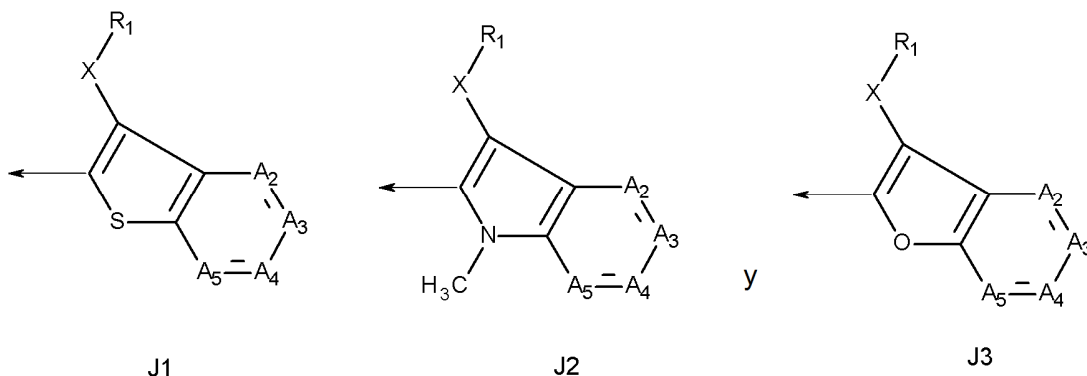
Se prefieren, además, compuestos de fórmula I-1a,



(I-1a),

15

en donde J se selecciona del grupo que consiste en



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

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

5 X, R₄ y G₃ son como se definen en la fórmula I anterior;

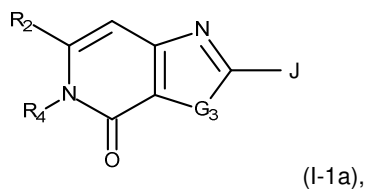
A₂, A₃, A₄ y A₅, independientemente entre sí, representan CR₃ o N; y

cada R₃ es, independientemente entre sí, hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, hidroxilo, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-cicloalquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₆, haloalqueno C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, ciclohaloalquil C₃-C₆-cicloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, haloalquil C₁-C₄tio, haloalquil C₁-C₄sulfinilo o haloalquil C₁-C₄sulfonilo.

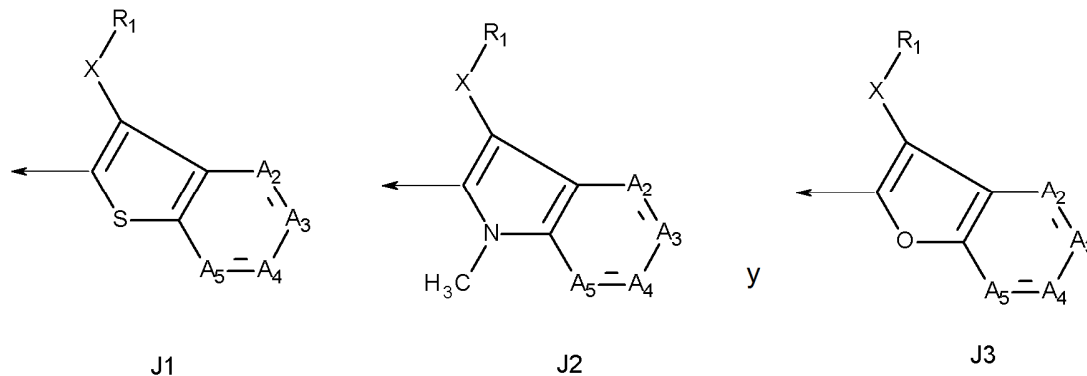
10

Realización (A4):

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



en donde J se selecciona del grupo que consiste en



15

R₁ es alquilo C₁-C₄;

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

X y R₄ son como se definen en la fórmula I anterior;

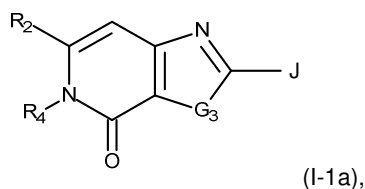
G₃ es N-R₆, en donde R₆ es como se define en la fórmula I anterior;

A₂, A₃, A₄ y A₅, independientemente entre sí, representan CR₃ o N; y

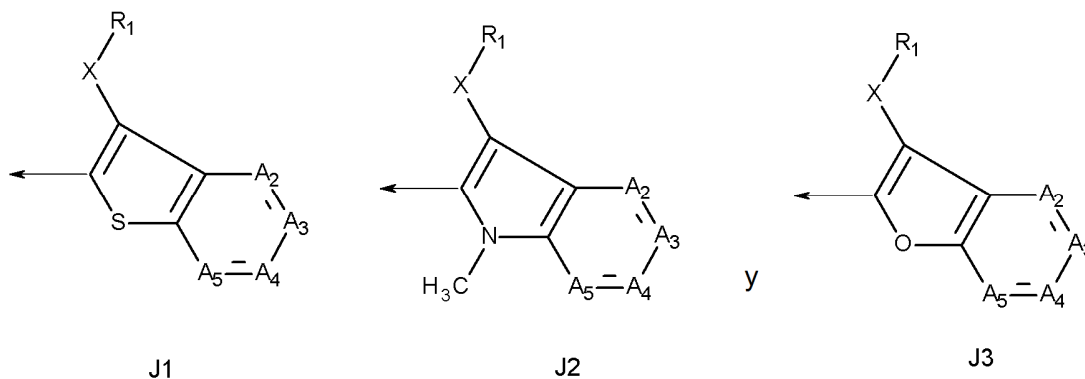
- 5 cada R₃ es, independientemente entre sí, hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, hidroxilo, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-cicloalquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, ciclohaloalquil C₃-C₆-cicloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, haloalquil C₁-C₄tio, haloalquil C₁-C₄sulfinilo o haloalquil C₁-C₄sulfonilo.

Realización (A5):

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



en donde J se selecciona del grupo que consiste en



R₁ es alquilo C₁-C₄;

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

X y R₄ son como se definen en la fórmula I anterior;

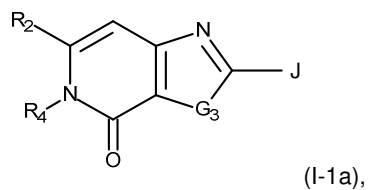
G₃ es N-R₆, en donde R₆ es como se define en la fórmula I anterior;

A₂, A₃, A₄ y A₅, independientemente entre sí, representan CR₃ o N; y

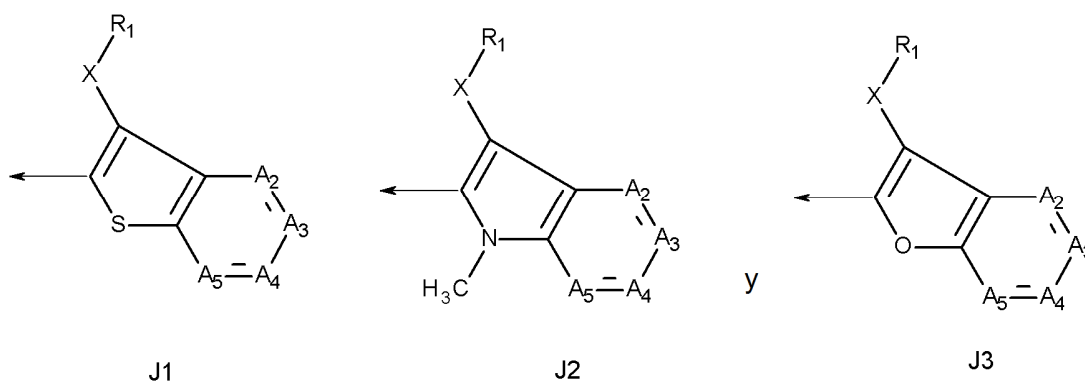
- 20 cada R₃ es, independientemente entre sí, hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, haloalquil C₁-C₄tio, haloalquil C₁-C₄sulfinilo o haloalquil C₁-C₄sulfonilo.

Realización (A6):

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



en donde J se selecciona del grupo que consiste en



R₁ es etilo;

5 R₂ es CF₃;

X y R₄ son como se definen en la fórmula I anterior;

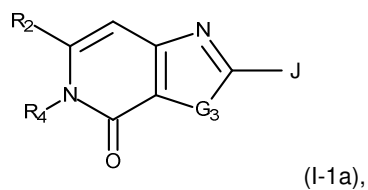
G₃ es N-R₆, en donde R₆ es como se define en la fórmula I anterior;

A₂, A₃, A₄ y A₅, independientemente entre sí, representan CR₃ o N; y

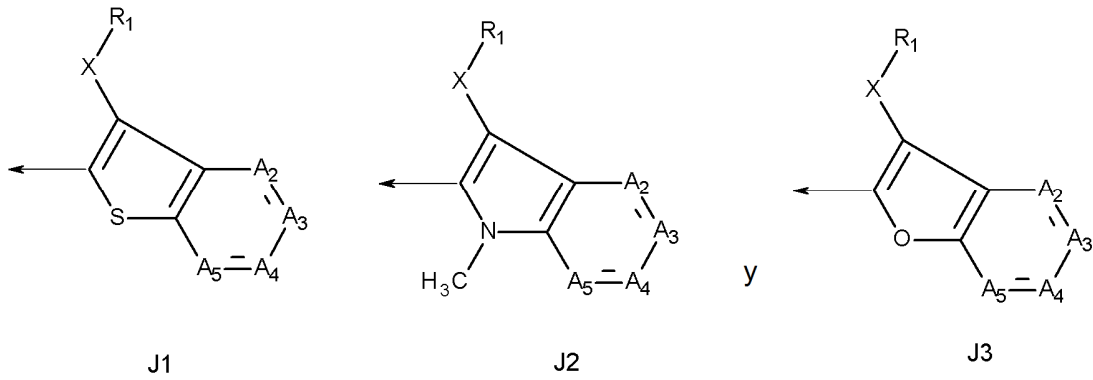
10 cada R₃ es, independientemente entre sí, hidrógeno, bromo, cloro, yodo, flúor, ciano, metilo, etilo, isopropilo, propilo, CF₃, CF₃CH₂-, CH₃O-, -SCF₃, -S(O)CF₃ o -S(O)₂CF₃.

Realización (A7):

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



en donde J se selecciona del grupo que consiste en



R₁ es etilo;

R₂ es CF₃;

X y R₄ son como se definen en la fórmula I anterior;

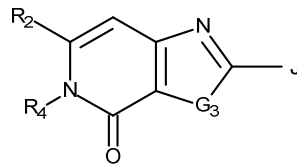
5 G₃ es N-R₆, en donde R₆ es como se define en la fórmula I anterior;

A₂, A₃, A₄ y A₅, independientemente entre sí, representan CR₃ o N; y

cada R₃ es, independientemente entre sí, hidrógeno, bromo, cloro, yodo, flúor, ciano, metilo, o CF₃.

Realización (A8):

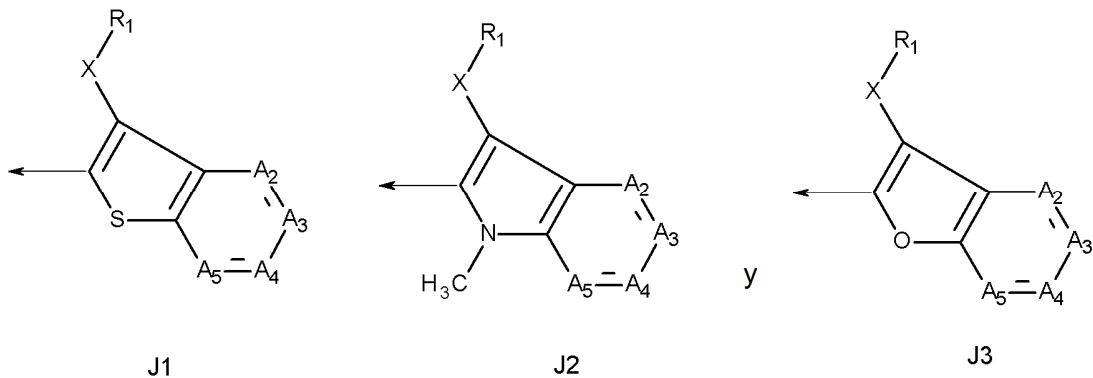
Se prefieren, además, compuestos de fórmula I-1a,



(I-1a),

10

en donde J se selecciona del grupo que consiste en



A es C-H o N;

R₁ es etilo;

R₂ es CF₃;

X y R₄ son como se definen en la fórmula I anterior;

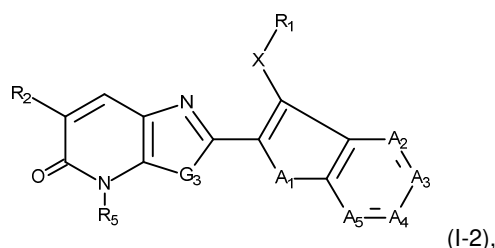
G₃ es N-R₆, en donde R₆ es como se define en la fórmula I anterior;

A₂, A₃, A₄ y A₅, independientemente entre sí, representan CR₃ o N; y

5 cada R₃ es, independientemente entre sí, hidrógeno en todos los grupos J.

En todas las realizaciones preferidas de fórmula I, I-1 e I-1a anteriores, independientemente X es preferentemente S o SO₂, R₄ es preferentemente metilo o etilo, y R₆ es preferentemente metilo.

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



10 en donde los sustituyentes X, R₁, R₂, R₅, G₃, A₁, A₂, A₃, A₄ y A₅ son como se definen en la fórmula I anterior.

Son realizaciones más preferidas de la invención:

Realización (B1):

Se prefieren compuestos de fórmula I-2, en donde

A₁ representa S, O o NCH₃;

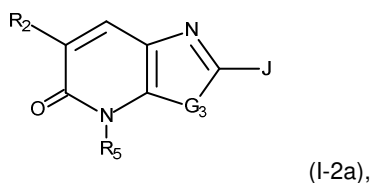
15 R₁ es alquilo C₁-C₄, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆;

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

X, R₅, G₃, A₂, A₃, A₄ y A₅ son como se definen en la fórmula I anterior.

20 Realización (B2):

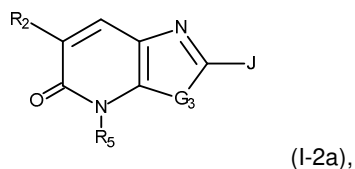
Se prefieren, además, compuestos de fórmula I-2a,



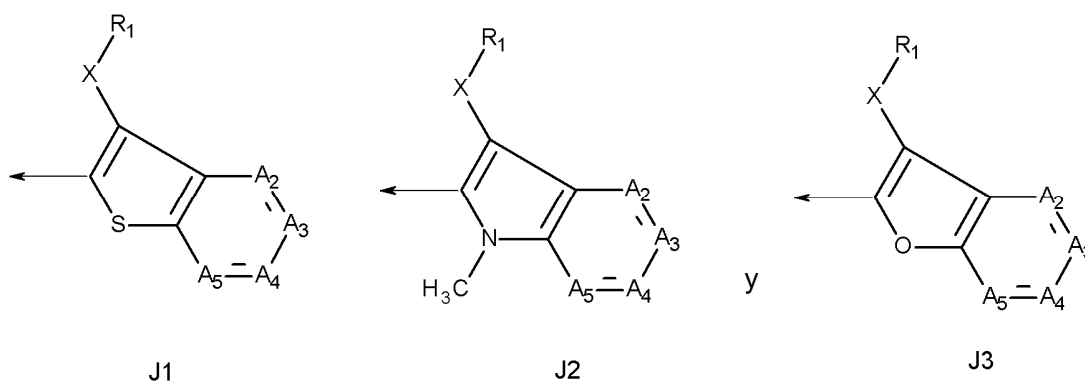
en donde J se selecciona del grupo que consiste en

Realización (B4):

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



en donde J se selecciona del grupo que consiste en



5

R₁ es alquilo C₁-C₄;

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

X y R₅ son como se definen en la fórmula I anterior;

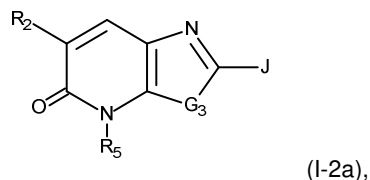
G₃ es N-R₆, en donde R₆ es como se define en la fórmula I anterior;

10 A₂, A₃, A₄ y A₅, independientemente entre sí, representan CR₃ o N; y

cada R₃ es, independientemente entre sí, hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, hidroxilo, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-cicloalquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₆, haloalqueno C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, ciclohaloalquil C₃-C₆-cicloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, haloalquil C₁-C₄tio, haloalquil C₁-C₄sulfinilo o haloalquil C₁-C₄sulfonilo.

15 Realización (B5):

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



en donde J se selecciona del grupo que consiste en

R₂ es CF₃;

X y R₅ son como se definen en la fórmula I anterior;

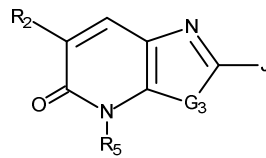
G₃ es N-R₆, en donde R₆ es como se define en la fórmula I anterior;

A₂, A₃, A₄ y A₅, independientemente entre sí, representan CR₃ o N; y

- 5 cada R₃ es, independientemente entre sí, hidrógeno, bromo, cloro, yodo, flúor, ciano, metilo, etilo, isopropilo, propilo, CF₃, CF₃CH₂-, CH₃O-, -SCF₃, -S(O)CF₃ o -S(O)₂CF₃.

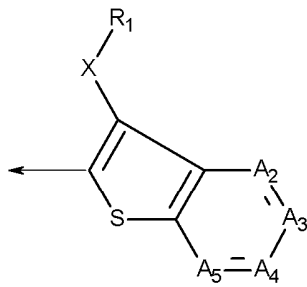
Realización (B7):

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

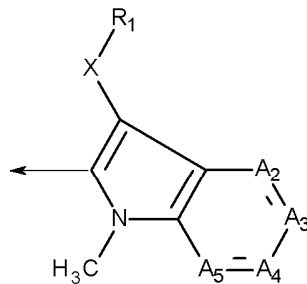


(I-2a),

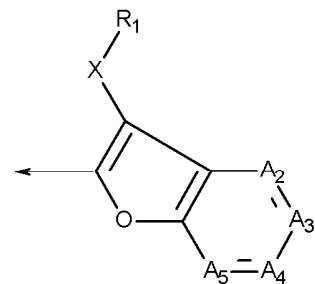
- 10 en donde J se selecciona del grupo que consiste en



J1



J2



J3

R₁ es etilo;

R₂ es CF₃;

X y R₅ son como se definen en la fórmula I anterior;

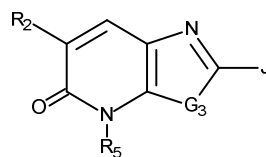
- 15 G₃ es N-R₆, en donde R₆ es como se define en la fórmula I anterior;

A₂, A₃, A₄ y A₅, independientemente entre sí, representan CR₃ o N; y

cada R₃ es, independientemente entre sí, hidrógeno, bromo, cloro, yodo, flúor, ciano, metilo, o CF₃.

Realización (B8):

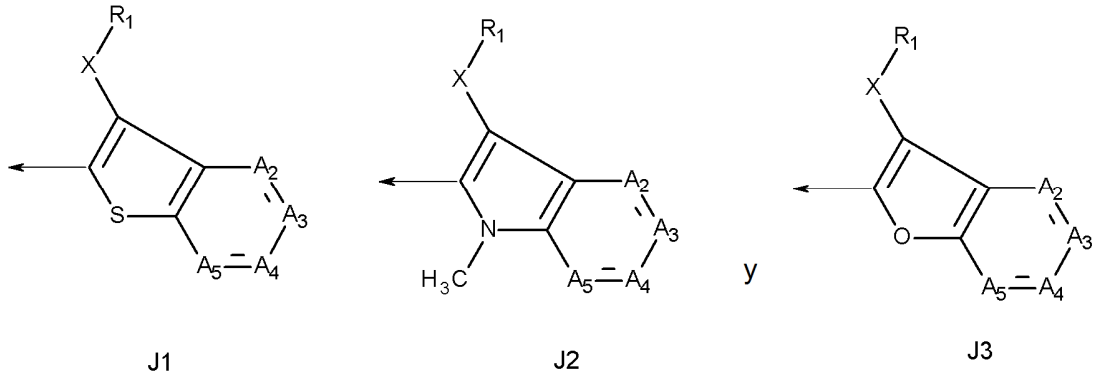
Se prefieren, además, compuestos de fórmula I-2a,



(I-2a),

20

en donde J se selecciona del grupo que consiste en



A es C-H o N;

R₁ es etilo;

5 R₂ es CF₃;

X y R₅ son como se definen en la fórmula I anterior;

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

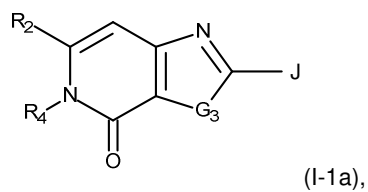
A₂, A₃, A₄ y A₅, independientemente entre sí, representan CR₃ o N; y

cada R₃ es, independientemente entre sí, hidrógeno en todos los grupos J.

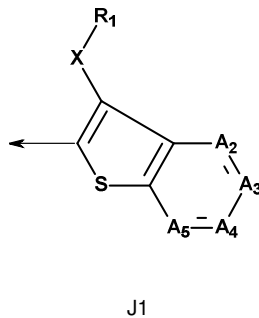
10 En todas las realizaciones preferidas de fórmula I-2 e I-2a anteriores, independientemente X es preferentemente S o SO₂, R₅ es preferentemente metilo o etilo, y R₆ es preferentemente metilo.

En todas las realizaciones preferidas A2-A8 y B2-B8, J es preferentemente J1.

Una realización preferida adicional de los compuestos de fórmula I está representado por los compuestos de fórmula I-1a



15 en donde J es J1



R₁ es alquilo C₁-C₂;

R₂ es haloalquilo C₁-C₂;

X es S, S(O) o SO₂;

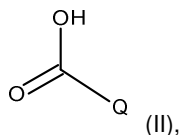
G₃ es N-R₆, en donde R₆ es alquilo C₁-C₂;

R₄ es alquilo C₁-C₂ o ciclopropilo;

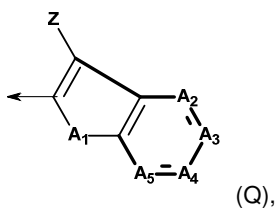
- 5 A₂, A₃, A₄ y A₅, independientemente entre sí, son CR₃ en donde R₃ es hidrógeno, halógeno, haloalquilo C₁-C₂, ciclopropilo, ciano, amino o N-C(O)Oalquilo C₁-C₃.

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

- 10 WO 2011/043404, WO 2011/040629, WO 2010/125985, WO 2012/086848, WO 2013/018928, WO 2013/191113, WO 2013/180193 y WO 2013/180194, y comprende la reacción de un compuesto de fórmula II,

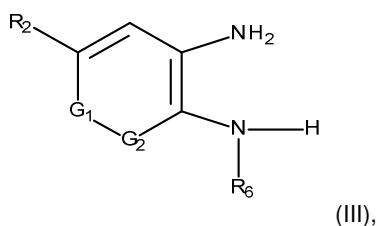


en donde Q es el grupo



- 15 en donde Z es X-R₁ o un grupo saliente, por ejemplo, un halógeno, y en donde X, R₁, A₁ y A₂ son como se describen en la fórmula I anterior, y en donde la flecha en el radical Q muestra el punto de unión al átomo de carbono del grupo carboxilo en el compuesto de fórmula II,

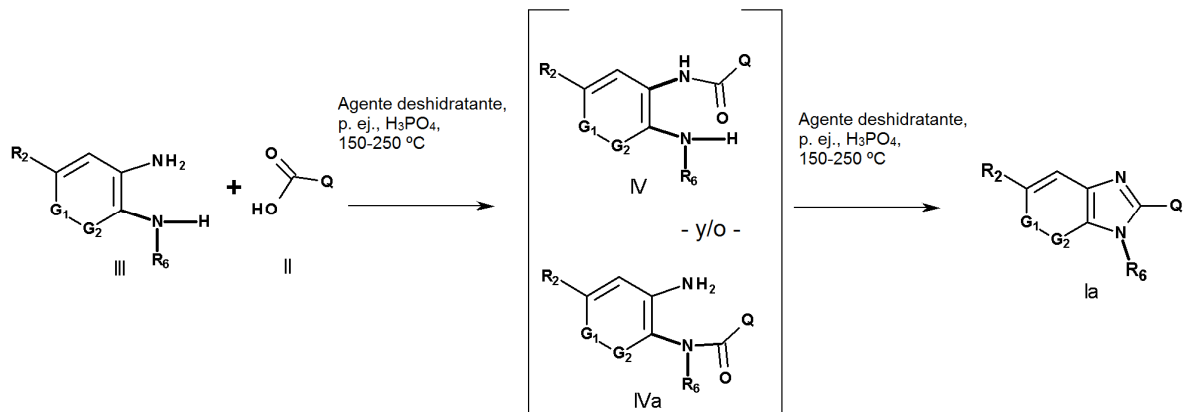
con un compuesto de fórmula III,



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

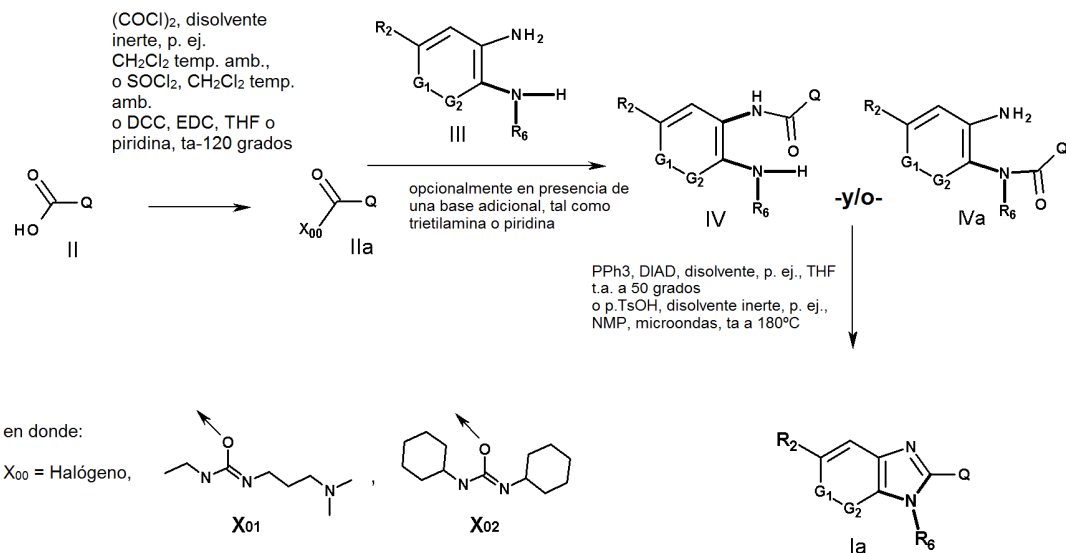
Procedimientos de este tipo son bien conocidos y se han descrito, por ejemplo, en el documento WO 2008/128968 o el documento WO 2006/003440. El procedimiento se resume en el esquema 1 para compuestos de fórmula Ia:

Esquema 1



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

Esquema 2



10

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

15 i) la activación del compuesto de fórmula II, en donde Q es como se define arriba, por métodos conocidos por los expertos en la técnica y descritos en, por ejemplo, Tetrahedron, 2005, 61 (46), 10827-10852, para formar especies activadas IIa, en donde Q es como se define arriba y en donde X₀₀ es halógeno, preferentemente cloro. Por ejemplo, compuestos IIa, en los que X₀₀ es halógeno, preferentemente cloro, se forman mediante el tratamiento de II con, por ejemplo, cloruro de oxalilo (COCl)₂ o cloruro de tionilo SOCl₂ en presencia de cantidades catalíticas de N,N-

5 dimetilformamida DMF en disolventes inertes, tales como cloruro de metileno CH_2Cl_2 o tetrahidrofurano THF, a temperaturas entre 20 y 100°C, preferentemente 25°C. Alternativamente, el tratamiento de compuestos de fórmula II con, por ejemplo, 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil) carbodiimida EDC o dicitclohexilcarbodiimida DCC generará una especie activada IIa, en donde X_{00} es X_{01} o X_{02} , respectivamente, en un disolvente inerte, tal como piridina o tetrahidrofurano THF, opcionalmente en presencia de una base, tal como trietilamina, a temperaturas entre 25-180°C; seguido por

10 ii) tratamiento de las especies activadas IIa con un compuesto de fórmula III (o una sal del mismo), en donde R_6 , R_2 , G_1 y G_2 son como se describen bajo la fórmula I anterior, opcionalmente en presencia de una base, tal como trietilamina o piridina, en disolventes inertes, tales como diclorometano, tetrahidrofurano, dioxano o tolueno, a temperaturas entre 0 y 80°C, para formar los compuestos de fórmula IV y/o IVa (o una mezcla de los mismos).

15 Los compuestos de fórmula IV y/o IVa (o una mezcla de los mismos) pueden convertirse adicionalmente en compuestos de fórmula Ia, en donde Q es como se ha definido anteriormente, y en donde R_6 , R_2 , G_1 y G_2 son como se describen en la fórmula I anterior, por deshidratación, por ejemplo, calentando los compuestos IV y/o IVa (o una mezcla de los mismos) en presencia de un catalizador de ácido, tal como, por ejemplo, ácido metanosulfónico, o ácido *para*-toluenosulfónico TsOH, en un disolvente inserte, tal como N-metil pirrolidina NMP a temperaturas entre 25-180°C, preferentemente 100-170°C, opcionalmente en condiciones de microondas o en ácido acético, a temperaturas entre 25-180°C, preferentemente 100-170°C, opcionalmente en condiciones de microondas. Procedimientos de este tipo se han descrito previamente, por ejemplo, en el documento WO 2010/125985.

20 Compuestos de fórmula Ia, en donde Q es como se define arriba, y en donde Z es un grupo lábil, por ejemplo halógeno, preferentemente flúor o cloro, y en donde R_6 , R_2 , G_1 y G_2 son como se describen bajo la fórmula I anterior, pueden reaccionar con compuestos de fórmula V

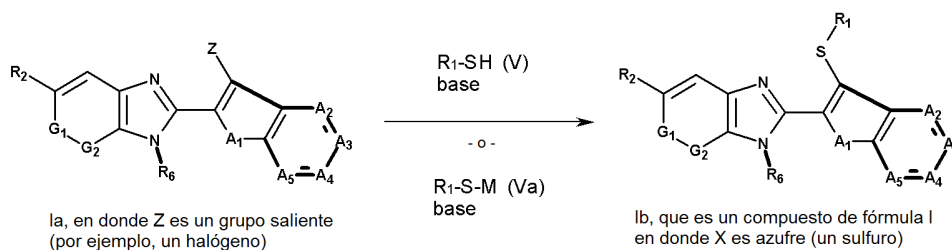
$R_1\text{-SH}$ (V),

25 o una de sus sales, en donde R_1 es como se define en la fórmula I, opcionalmente en presencia de una base adecuada, tal como carbonatos de metales alcalinos, por ejemplo carbonato de sodio y carbonato de potasio, o hidruros de metales alcalinos, tales como hidruro de sodio, o hidróxidos de metales alcalinos, tales como hidróxido de sodio e hidróxido de potasio, en un disolvente inerte a temperaturas preferentemente entre 25-120°C, para generar compuestos de fórmula Ib, en donde R_1 es como se describe en la fórmula I anterior, y en la que R_6 , A_1 , R_2 , A_2 , G_1 y G_2 son como se describen bajo la fórmula I anterior. Ejemplos de disolventes a utilizar incluyen éteres, tales como THF, etilenglicol dimetiléter, terc-butilmetiléter y 1,4-dioxano, hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno y xileno, nitrilos, tales como acetonitrilo o disolventes apróticos polares, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metil-2-pirrolidona o dimetilsulfóxido. Una química similar se ha descrito previamente, tal como, por ejemplo, en el documento WO2013/018928. Ejemplos de sales del compuesto de fórmula V incluyen compuestos de fórmula Va

$R_1\text{-S-M}$ (Va),

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

35 Esquema 3

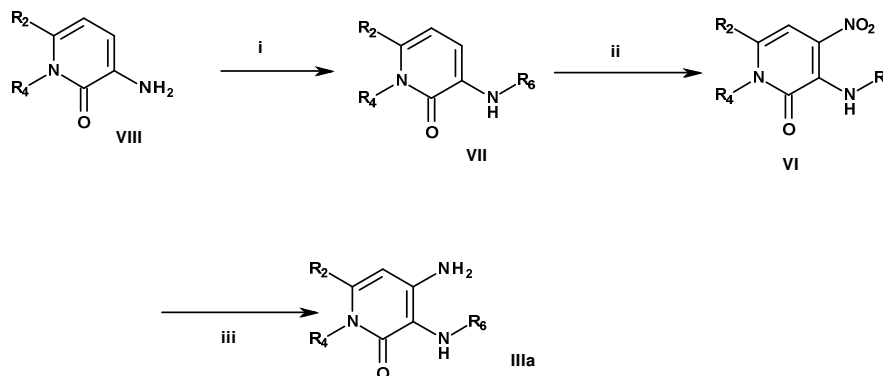


40 Alternativamente, esta reacción se puede llevar a cabo en presencia de un catalizador de paladio, tal como tris(dibencilidenacetona)dipaladio(0), en presencia de un ligando de fósforo, tal como xanthphos, en un disolvente inerte, por ejemplo, xileno a temperaturas entre 100-160°C, preferentemente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

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

La secuencia para preparar compuestos de fórmula IIIa, en donde R₂, R₄ y R₆ son como se describen bajo la fórmula I anterior, a partir de compuestos de fórmula VIII, puede implicar i. alquilación del compuesto VIII con R₆-X_{LG}, en donde R₆ es como se describe en la fórmula I anterior y en donde X_{LG} es un grupo lábil, tal como halógeno, preferentemente yodo, bromo o cloro, en presencia de una base, tal como carbonato de sodio, carbonato de potasio o carbonato de cesio, o hidruro de sodio, en un disolvente apropiado, tal como, por ejemplo, N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida o acetonitrilo, para generar un compuesto de fórmula VII, en donde R₆, R₄ y R₂ son como se describen en la fórmula I anterior; ii. una reacción de nitración del compuesto VII en condiciones clásicas, por ejemplo, véase, por ejemplo, *Advanced Organic Chemistry: Reactions, Mechanisms, and Structure*, Cuarta Edición por Jerry March, 1992 (Editorial Wiley Nueva York, N. Y.) páginas 523-525; y finalmente iii. una reacción de reducción del compuesto VI en condiciones clásicas, por ejemplo, véase, por ejemplo, *Advanced Organic Chemistry: Reactions, Mechanisms, and Structure*, Cuarta Edición de Jerry March, 1992 (Editorial Wiley Nueva York, N. Y.) p 1216-1217. Véase el esquema 4.

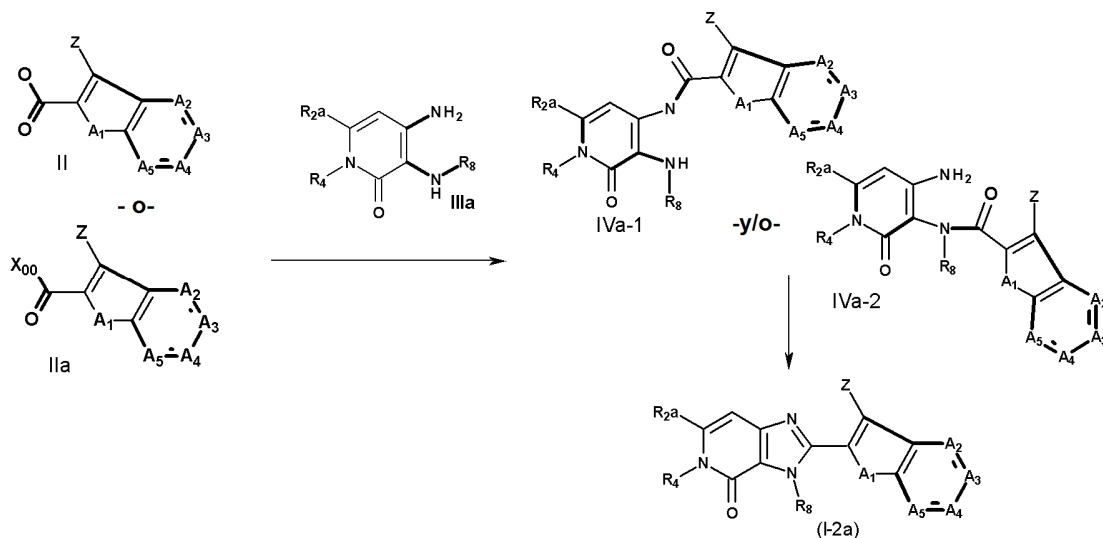
Esquema 4



25 Compuestos de fórmula VIII pueden prepararse por métodos conocidos por una persona experta en la técnica, por ejemplo, *Synthesis* 2005, N^o 8, págs 1269-1278 y *Synthesis* 2011, N^o 7, págs. 1149-1156.

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

Esquema 5



Alternativamente, la secuencia para preparar compuestos de fórmula IIIb, en donde R_2 , R_5 y R_6 son como se describen bajo la fórmula I anterior, a partir de compuestos de fórmula XII, puede implicar i. alquilación del compuesto XII con R_5 - X_{LG} , en donde R_5 es como se describe en la fórmula I anterior y en donde X_{LG} es un grupo lábil, tal como halógeno, preferentemente yodo, bromo o cloro, en presencia de una base, tal como carbonato de sodio, carbonato de potasio o carbonato de cesio, o hidruro de sodio, en un disolvente apropiado, tal como, por ejemplo, N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida o acetonitrilo, para generar un compuesto de fórmula XI, en donde R_6 , R_5 y R_2 son como se describen bajo la fórmula I anterior;

5

10 ii. una reacción de sustitución de nucleófilos vicaria (VNS) del compuesto XI en condiciones estándar, por ejemplo, como se describe en J. Org. Chem., Vol. 61, N.º 2, 1996 p 442;

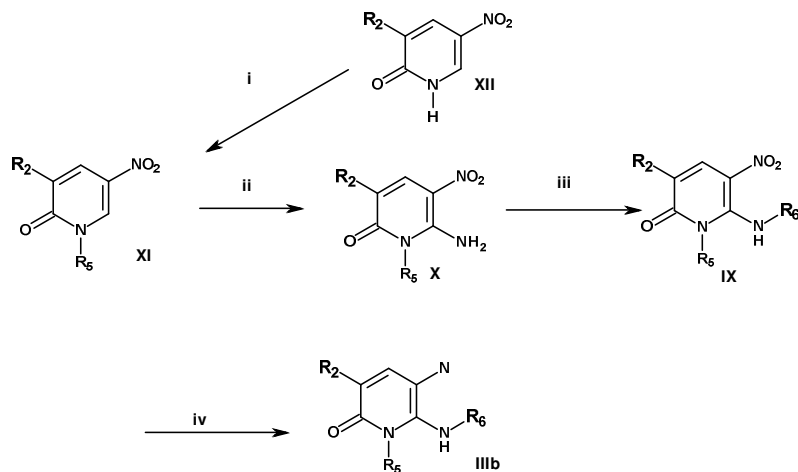
iii. la alquilación del compuesto X con R_6 - X_{LG} , en donde R_6 es como se describe en la fórmula I anterior y en donde X_{LG} es un grupo saliente, tal como halógeno, preferentemente yodo, bromo o cloro, en presencia de una base, tal como carbonato de sodio, carbonato de potasio o carbonato de cesio, o hidruro de sodio, en un disolvente apropiado, tal como, por ejemplo, N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida o acetonitrilo, para generar un compuesto de fórmula IX, en donde R_6 , R_5 y R_2 son como se describen en la fórmula I anterior, y finalmente

15

iv. una reacción de reducción del compuesto IX en condiciones clásicas, por ejemplo, véase, por ejemplo, Advanced Organic Chemistry: Reactions, Mechanisms, and Structure, Cuarta Edición de Jerry March, 1992 (Editorial Wiley Nueva York, N. Y.) p 1216-1217. Véase el esquema 6.

20

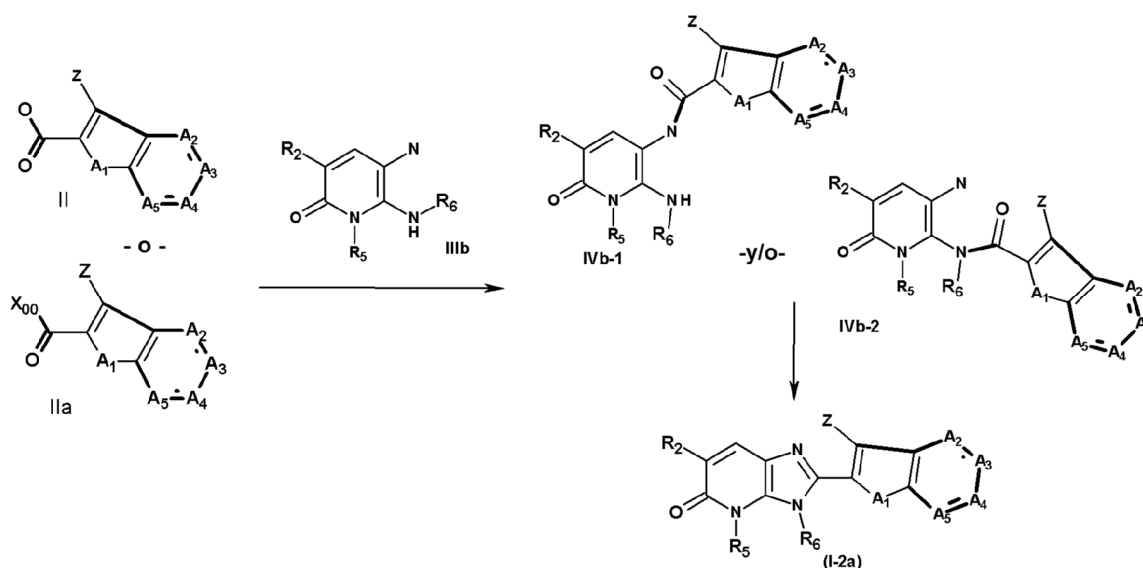
Esquema 6



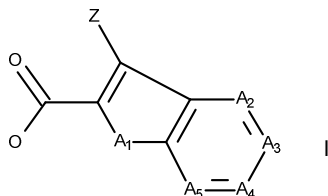
Compuestos de fórmula XII están disponibles comercialmente o pueden prepararse por métodos conocidos por una persona experta en la técnica.

- 5 Los compuestos de fórmula I-1a, en donde Z es X-R₁ o un grupo saliente, por ejemplo, halógeno, y en donde X, R₁, R₂, R₅, R₆ y A son como se describen en la fórmula I anterior, pueden prepararse por reacción entre compuestos de fórmula II, respectivamente IIa, en donde Z es X-R₁ o un grupo saliente, por ejemplo, halógeno, y en donde X, R₁ y A son como se describen en la fórmula I anterior, y en la que X₀₀ es como se ha descrito anteriormente, y compuestos de fórmula IIIb, en donde R₅, R₆ y R₂ son como se describen en la fórmula I anterior, se preparan en condiciones similares a las de la preparación de compuestos de fórmula Ia a partir de los compuestos de fórmula II/IIa y III descritos anteriormente (véase el esquema 1 y 2). Esto se ilustra para los compuestos de fórmula XXII en el esquema 7:

Esquema 7



Compuestos de fórmula II,



5 en donde Z es X-R₁ o un grupo saliente o un grupo que puede transformarse en grupo saliente, tal como, por ejemplo, halógeno, amina o nitro, y en donde X, R₁, A₁ y A₂ son como se describen en la fórmula I anterior, pueden conocerse, estar disponible comercialmente, o pueden prepararse por métodos conocidos por un experto en la técnica.

Los compuestos de fórmula IIc, en donde Q es como se ha definido anteriormente, y en donde Z es un grupo saliente, por ejemplo, halógeno, preferentemente flúor, cloro, y en donde A₁, A₂, A₃, A₄ y A₅ son como se describen en la fórmula I anterior, y en donde R es alquilo o hidrógeno, pueden hacerse reaccionar con compuestos de fórmula V

R₁-SH (V),

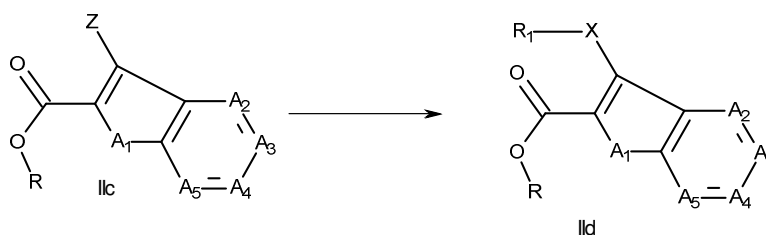
10 o una sal de los mismos, en donde R₁ es como se define en la fórmula I, opcionalmente en presencia de una base adecuada, tal como carbonatos de metales alcalinos, por ejemplo, carbonato de sodio y carbonato de potasio, o hidruros de metales alcalinos tales como hidruro de sodio, o hidróxidos de metales alcalinos tales como hidróxido de sodio e hidróxido de potasio, en un disolvente inerte a temperaturas preferentemente entre 25-120°C, para generar los compuestos de fórmula IIId, en donde R es alquilo o hidrógeno, R₁ es como se describe en la fórmula I anterior, y en la

15 que A₁, A₂, A₃, A₄ y A₅ son como se describen en la fórmula I anterior. Ejemplos de disolventes a utilizar incluyen éteres, tales como THF, etilenglicol dimetiléter, terc-butilmetiléter y 1,4-dioxano, hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno y xileno, nitrilos, tales como acetonitrilo o disolventes apróticos polares, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metil-2-pirrolidona o dimetilsulfóxido. Los ejemplos de sales de los compuestos de fórmula V incluyen los compuestos de fórmula Va

20 R₁-S-M (Va),

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

Esquema 8



25 Alternativamente, los compuestos de fórmula IIc, en donde Z es una amina y en donde A₁, A₂, A₃, A₄ y A₅ son como se definen en la fórmula I anterior, y en donde R es alquilo o hidrógeno, pueden transformarse en los compuestos de fórmula IIId a través de diazotización y reacción con disulfuro de dialquilo. Esta transformación es bien conocida y podría realizarse por métodos conocidos por una persona experta en la técnica (véase, por ejemplo: Synthetic Communications, 31(12), 1857-1861; 2001 u Organic & Biomolecular Chemistry, 6(4), 745-761; 2008).

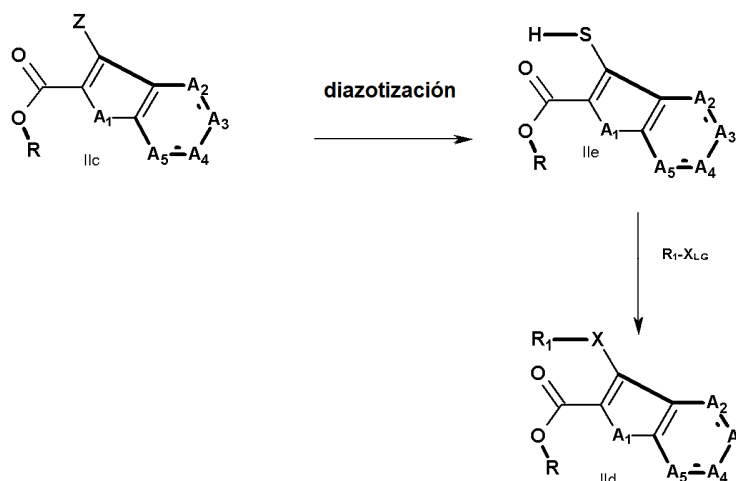
30 Los compuestos de fórmula IIc, en donde Z es una amina y en donde A₁, A₂, A₃, A₄ y A₅ son como se definen

en la fórmula I anterior, y en donde R es alquilo o hidrógeno, pueden transformarse en los compuestos de fórmula IIe a través de diazotización y reacción con sulfuro de sodio, seguido de reducción. Esta transformación es muy conocida y podría realizarse mediante métodos conocidos por un experto en la técnica (véase, por ejemplo, el documento US 20040116734 o Chemische Berichte, 120(7), 1151-73; 1987). La alquilación de un compuesto IIe con R₁-X_{LG}, donde R₁ es tal como se ha descrito en la fórmula I anteriormente y donde X_{LG} es un grupo saliente, tal como halógeno, preferentemente yodo, bromo o cloro, en presencia de una base, tal como carbonato de sodio, carbonato de potasio o

35

carbonato de cesio, o hidruro de sodio, en un disolvente apropiado, tal como, por ejemplo, *N,N*-dimetilformamida, *N,N*-dimetilacetamida o acetonitrilo, para generar un compuesto de fórmula IId, donde R₁ es tal como se ha descrito en la fórmula I anteriormente. Véase el esquema 9.

Esquema 9

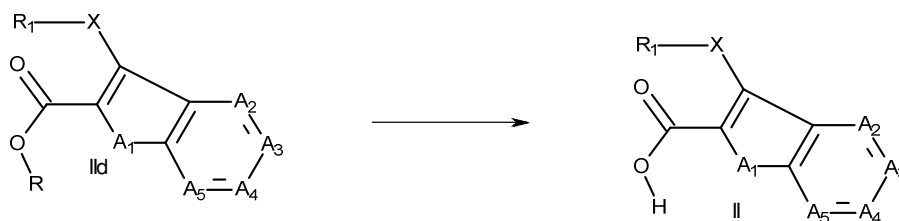


5

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

10

Esquema 10



15

Alternativamente, un compuesto de fórmula II puede prepararse por reacción de un compuesto de fórmula (X) en donde Z es un grupo saliente como nitro o halógeno tal como flúor, y en donde A₁, A₂, A₃, A₄ y A₅ son como se describen en la fórmula I anterior por reacción de un compuesto de fórmula V.

R₁-SH (V),

20

para obtener los compuestos de fórmula Xd, o una sal de los mismos, en donde R₁ es como se define en la fórmula I, opcionalmente en presencia de una base adecuada, tal como carbonatos de metales alcalinos, por ejemplo, carbonato de sodio y carbonato de potasio, o hidruros de metales alcalinos tales como hidruro de sodio, o hidróxidos de metales alcalinos tales como hidróxido de sodio e hidróxido de potasio, en un disolvente inerte a temperaturas preferentemente entre 25-120°C, para generar los compuestos de fórmula XIIb, en donde R₁ es como se describe en la fórmula I anterior, y en la que A₁, A₂, A₃, A₄ y A₅ son como se describen en la fórmula I anterior. Ejemplos de disolventes a utilizar incluyen éteres, tales como THF, etilenglicol dimetiléter, *tert*-butilmetiléter y 1,4-dioxano, hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno y xileno, nitrilos, tales como acetonitrilo o disolventes apróticos polares, tales como *N,N*-dimetilformamida, *N,N*-

25

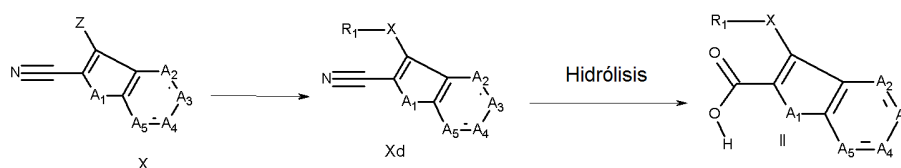
dimetilacetamida, N-metil-2-pirrolidona o dimetilsulfóxido. Ejemplos de sales del compuesto de fórmula V incluyen compuestos de fórmula Va

R_1-S-M (Va),

- 5 en donde R_1 es como se define anteriormente y en donde M es, por ejemplo, sodio o potasio. Los compuestos de fórmula II se pueden preparar por hidrólisis del ciano del compuesto de fórmula Xd en condiciones ácidas o básicas. Esta transformación es muy conocida y podría realizarse mediante métodos conocidos por un experto en la técnica (véase, por ejemplo, *Comprehensive Organic Transformations. A Guide to Functional Group Preparations*. Editado por Richard C. Larock **1989** p 993, editores VCH).

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

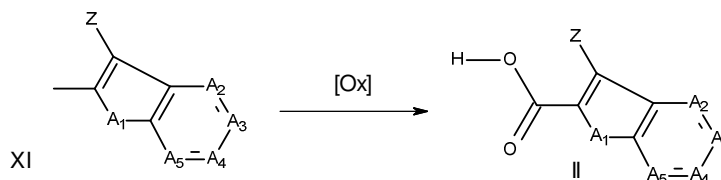
10 Esquema 11



Los compuestos de fórmula X son conocidos, están comercializados o se pueden preparar mediante métodos conocidos por un experto en la técnica.

- 15 Como alternativa, el compuesto de fórmula II se puede preparar por reacción de un compuesto de fórmula (XI) donde Z es un grupo saliente tal como nitro o halógeno, tal como flúor, y donde A_1 , A_2 , A_3 , A_4 y A_5 son tal como se han descrito en la fórmula I anteriormente por oxidación en presencia de un oxidante, tal como oxígeno, peróxido de hidrógeno o un óxido metálico, tal como trióxido de cromo con o sin ácido tal como ácido sulfúrico con o sin catalizador metálico. Esta transformación es bien conocida y podría realizarse por métodos conocidos por una persona experta en la técnica (véase, por ejemplo: *Comprehensive Organic Transformations: A Guide to Functional Group Preparations*. Editado por Richard C. Larock **1989** p 823, editores VCH). Esto se ilustra para compuestos de fórmula II en el esquema 12:

20 Esquema 12

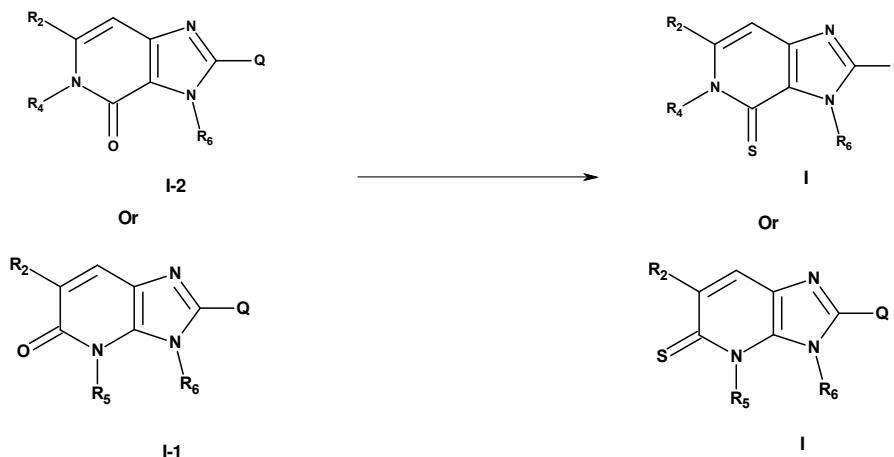


Los compuestos de fórmula XI son conocidos, están comercializados o se pueden preparar mediante métodos conocidos por un experto en la técnica.

- 25 Compuestos de fórmula I, en donde Y es S, pueden prepararse (esquema 13) haciendo reaccionar compuestos de fórmula I-1 o I-2, en donde Y es O, con un reactivo que podría transferir un átomo de azufre, tal como, por ejemplo, el reactivo de Lawesson, en un disolvente, tal como, por ejemplo, dimetilformamida o tolueno, habitualmente a una temperatura entre 50 y 150°C. Una persona experta en la técnica conoce este tipo de transformación y, por ejemplo, se describe en *Tetrahedron* (2007), 63(48), 11862-11877 o el documento US20120309796.

30

Esquema 13:



Alternativamente, el O del C(O) puede transformarse en S en los intermedios como, por ejemplo, los compuestos de fórmula XII, XI, X, IX, IIIb o VII, VIII, VI o IIIa.

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

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

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

- 25 La reacción se realiza ventajosamente a una temperatura comprendida en el intervalo de aproximadamente -80°C a aproximadamente +140°C, preferentemente de aproximadamente -30°C a aproximadamente +100°C, en muchos casos en el intervalo comprendido entre temperatura ambiente y aproximadamente +80°C.

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

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

- 35 Las sales de los compuestos de fórmula I se pueden preparar de un modo conocido *per se*. Por tanto, por ejemplo, las sales de adición de ácidos de los compuestos de fórmula I se obtienen por tratamiento con un ácido adecuado o un

reactivo de intercambio iónico adecuado y las sales con bases se obtienen por tratamiento con una base adecuada o con un reactivo de intercambio iónico adecuado.

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

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

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

15 Los compuestos de fórmula I y, cuando sea apropiado, los tautómeros de estos, en cada caso en forma libre o en forma de sal, pueden estar presentes en forma de uno de los isómeros que son posibles o como una mezcla de estos, por ejemplo, en forma de isómeros puros, tales como enantiómeros y/o diastereómeros, o como mezclas de isómeros, tales como mezclas de enantiómeros, por ejemplo, racematos, mezclas de diastereómeros o mezclas de racematos, dependiendo de la cantidad, configuración absoluta y relativa de los átomos de carbono asimétricos que existen en la molécula y/o dependiendo de la configuración de dobles enlaces no aromáticos que existen en la molécula; la invención se refiere a los isómeros puros y también a todas las mezclas de isómeros que son posibles y debe entenderse en cada caso en este sentido anteriormente y a continuación en la presente, incluso cuando no se mencionen los detalles estereoquímicos específicamente en cada caso.

25 Las mezclas de diastereómeros o mezclas de racemato de compuestos de fórmula I, en forma libre o en forma de sal, que se pueden obtener dependiendo de los materiales de partida y procedimientos que se hayan elegido, se pueden separar de forma conocida en los diastereómeros puros o racematos basándose en las diferencias fisicoquímicas de los componentes, por ejemplo, mediante cristalización fraccionada, destilación y/o cromatografía.

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

40 Pueden obtenerse diastereómeros o enantiómeros puros de acuerdo con la invención no solo separando mezclas de isómeros adecuadas, sino también mediante métodos de síntesis diastereoselectivos o enantioselectivos en general conocidos, por ejemplo, llevando a cabo el proceso de acuerdo con la invención con materiales de partida de una estereoquímica adecuada.

Pueden prepararse N-óxidos haciendo reaccionar un compuesto de fórmula I con un agente oxidante adecuado, por ejemplo, el aducto de H₂O₂/urea en presencia de un anhídrido de ácido, por ejemplo, anhídrido trifluoroacético. Dichas oxidaciones son conocidas por la bibliografía, por ejemplo, de *J. Med. Chem.* **1989**, 32, 2561 o

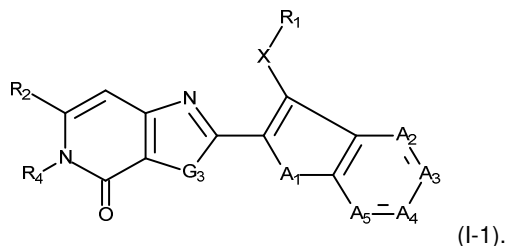
45 el documento WO 00/15615.

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

50 Los compuestos de fórmula I y, cuando sea apropiado, los tautómeros de estos, en cada caso en forma libre o en forma de sal, se pueden obtener también, si es apropiado, en forma de hidratos y/o incluir otros disolventes, por ejemplo los que se puedan haber utilizado para la cristalización de los compuestos que están presentes en forma sólida.

Los compuestos de acuerdo con las siguientes tablas 1 a 2 que figuran a continuación pueden prepararse de acuerdo con los métodos descritos anteriormente. Los ejemplos que siguen pretenden ilustrar la invención y mostrar compuestos preferidos de fórmula I. "Ph" representa el grupo fenilo.

Tabla 1: Esta tabla divulga 77 compuestos de la fórmula I-1:



5

Tabla 1:

Comp. N.º	X	R ₁	R ₂	R ₄	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	A ₅	G ₃
1,001	S	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₃	S	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
1,002	SO	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₃	S	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
1,003	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₃	S	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
1,004	S	-CH ₂ CH ₃	-SCF ₃	CH ₃	S	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
1,005	SO	-CH ₂ CH ₃	-SCF ₃	CH ₃	S	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
1,006	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	-SCF ₃	CH ₃	S	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
1,007	S	-CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₃	S	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
1,008	SO	-CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₃	S	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
1,009	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₃	S	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
1,010	S	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
1,011	SO	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
1,012	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
1,013	S	-CH ₂ CH ₃	-SCF ₃	CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
1,014	SO	-CH ₂ CH ₃	-SCF ₃	CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃

ES 2 762 958 T3

Comp. N.º	X	R ₁	R ₂	R ₄	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	A ₅	G ₃
1,015	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	-SCF ₃	CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
1,016	S	-CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
1,017	SO	-CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
1,018	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
1,019	S	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₃	S	CH	C-CF ₃	CH	CH	N-CH ₃
1,020	SO	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₃	S	CH	C-CF ₃	CH	CH	N-CH ₃
1,021	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₃	S	CH	C-CF ₃	CH	CH	N-CH ₃
1,022	S	-CH ₂ CH ₃	-SCF ₃	CH ₃	S	CH	C-CF ₃	CH	CH	N-CH ₃
1,023	SO	-CH ₂ CH ₃	-SCF ₃	CH ₃	S	CH	C-CF ₃	CH	CH	N-CH ₃
1,024	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	-SCF ₃	CH ₃	S	CH	C-CF ₃	CH	CH	N-CH ₃
1,025	S	-CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₃	S	CH	C-CF ₃	CH	CH	N-CH ₃
1,026	SO	-CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₃	S	CH	C-CF ₃	CH	CH	N-CH ₃
1,027	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₃	S	CH	C-CF ₃	CH	CH	N-CH ₃
1,028	S	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
1,029	SO	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
1,030	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
1,031	S	-CH ₂ CH ₃	-SCF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
1,032	SO	-CH ₂ CH ₃	-SCF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
1,033	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	-SCF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
1,034	S	-CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
1,035	SO	-CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃

ES 2 762 958 T3

Comp. N.º	X	R ₁	R ₂	R ₄	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	A ₅	G ₃
1,036	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
1,037	S	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
1,038	SO	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
1,039	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
1,040	S	-CH ₂ CH ₃	-SCF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
1,041	SO	-CH ₂ CH ₃	-SCF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
1,042	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	-SCF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
1,043	S	-CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
1,044	SO	-CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
1,045	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
1,046	S	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	C-CF ₃	CH	CH	N-CH ₃
1,047	SO	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	C-CF ₃	CH	CH	N-CH ₃
1,048	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	C-CF ₃	CH	CH	N-CH ₃
1,049	S	-CH ₂ CH ₃	-SCF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	C-CF ₃	CH	CH	N-CH ₃
1,050	SO	-CH ₂ CH ₃	-SCF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	C-CF ₃	CH	CH	N-CH ₃
1,051	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	-SCF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	C-CF ₃	CH	CH	N-CH ₃
1,052	S	-CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	C-CF ₃	CH	CH	N-CH ₃
1,053	SO	-CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	C-CF ₃	CH	CH	N-CH ₃
1,054	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	C-CF ₃	CH	CH	N-CH ₃
1,055	S	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-A	CH	N-CH ₃
1,056	SO	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-A	CH	N-CH ₃

ES 2 762 958 T3

Comp. N.º	X	R ₁	R ₂	R ₄	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	A ₅	G ₃
1,057	S	-CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-A	CH	N-CH ₃
1,058	SO	-CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-A	CH	N-CH ₃
1,059	S	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CH(CH ₂) ₂	CH	N-CH ₃
1,060	SO	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CH(CH ₂) ₂	CH	N-CH ₃
1,061	S	-CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CH(CH ₂) ₂	CH	N-CH ₃
1,062	SO	-CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CH(CH ₂) ₂	CH	N-CH ₃
1,063	S	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₂ CF ₃	CH	N-CH ₃
1,064	SO	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₂ CF ₃	CH	N-CH ₃
1,065	S	-CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₂ CF ₃	CH	N-CH ₃
1,066	SO	-CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₂ CF ₃	CH	N-CH ₃
1,066	S	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-SCF ₃	CH	N-CH ₃
1,067	SO	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-SCF ₃	CH	N-CH ₃
1,068	S	-CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-SCF ₃	CH	N-CH ₃
1,069	SO	-CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-SCF ₃	CH	N-CH ₃
1,070	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-A	CH	N-CH ₃
1,071	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CH(CH ₂) ₂	CH	N-CH ₃
1,072	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₂ CF ₃	CH	N-CH ₃
1,073	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-SCF ₃	CH	N-CH ₃
1,074	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	-CH ₃	S	CH	CH	C-A	CH	N-CH ₃
1,075	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	-CH ₃	S	CH	CH	C-CH(CH ₂) ₂	CH	N-CH ₃
1,076	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	-CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₂ CF ₃	CH	N-CH ₃

ES 2 762 958 T3

Comp. N.º	X	R ₁	R ₂	R ₄	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	A ₅	G ₃
1,077	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	-CH ₃	S	CH	CH	C-SCF ₃	CH	N-CH ₃

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

Tabla 2: Esta tabla divulga 77 compuestos de la fórmula I-2:

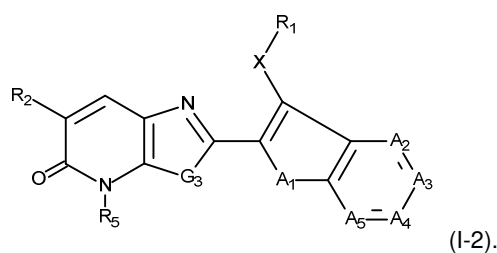


Tabla 2:

Comp. N.º	X	R ₁	R ₂	R ₅	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	A ₅	G ₃
2,001	S	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₃	S	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
2,002	SO	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₃	S	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
2,003	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₃	S	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
2,004	S	-CH ₂ CH ₃	-SCF ₃	CH ₃	S	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
2,005	SO	-CH ₂ CH ₃	-SCF ₃	CH ₃	S	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
2,006	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	-SCF ₃	CH ₃	S	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
2,007	S	-CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₃	S	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
2,008	SO	-CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₃	S	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
2,009	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₃	S	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
2,010	S	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
2,011	SO	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
2,012	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
2,013	S	-CH ₂ CH ₃	-SCF ₃	CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃

ES 2 762 958 T3

Comp. N.º	X	R ₁	R ₂	R ₅	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	A ₅	G ₃
2,014	SO	-CH ₂ CH ₃	-SCF ₃	CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
2,015	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	-SCF ₃	CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
2,016	S	-CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
2,017	SO	-CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
2,018	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
2,019	S	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₃	S	CH	CF ₃	CH	CH	N-CH ₃
2,020	SO	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₃	S	CH	C-CF ₃	CH	CH	N-CH ₃
2,021	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₃	S	CH	C-CF ₃	CH	CH	N-CH ₃
2,022	S	-CH ₂ CH ₃	-SCF ₃	CH ₃	S	CH	C-CF ₃	CH	CH	N-CH ₃
2,023	SO	-CH ₂ CH ₃	-SCF ₃	CH ₃	S	CH	C-CF ₃	CH	CH	N-CH ₃
2,024	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	-SCF ₃	CH ₃	S	CH	C-CF ₃	CH	CH	N-CH ₃
2,025	S	-CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₃	S	CH	C-CF ₃	CH	CH	N-CH ₃
2,026	SO	-CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₃	S	CH	C-CF ₃	CH	CH	N-CH ₃
2,027	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₃	S	CH	C-CF ₃	CH	CH	N-CH ₃
2,028	S	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
2,029	SO	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
2,030	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
2,031	S	-CH ₂ CH ₃	-SCF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
2,032	SO	-CH ₂ CH ₃	-SCF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
2,033	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	-SCF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
2,034	S	-CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃

ES 2 762 958 T3

Comp. N.º	X	R ₁	R ₂	R ₅	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	A ₅	G ₃
2,035	SO	-CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
2,036	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
2,037	S	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
2,038	SO	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
2,039	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
2,040	S	-CH ₂ CH ₃	-SCF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
2,041	SO	-CH ₂ CH ₃	-SCF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
2,042	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	-SCF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
2,043	S	-CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
2,044	SO	-CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
2,045	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
2,046	S	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	C-CF ₃	CH	CH	N-CH ₃
2,047	SO	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	C-CF ₃	CH	CH	N-CH ₃
2,048	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	C-CF ₃	CH	CH	N-CH ₃
2,049	S	-CH ₂ CH ₃	-SCF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	C-CF ₃	CH	CH	N-CH ₃
2,050	SO	-CH ₂ CH ₃	-SCF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	C-CF ₃	CH	CH	N-CH ₃
2,051	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	-SCF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	C-CF ₃	CH	CH	N-CH ₃
2,052	S	-CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	C-CF ₃	CH	CH	N-CH ₃
2,053	SO	-CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	C-CF ₃	CH	CH	N-CH ₃
2,054	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	C-CF ₃	CH	CH	N-CH ₃
2,055	S	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-A	CH	N-CH ₃

ES 2 762 958 T3

Comp. N.º	X	R ₁	R ₂	R ₅	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	A ₅	G ₃
2,056	SO	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-A	CH	N-CH ₃
2,057	S	-CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-A	CH	N-CH ₃
2,058	SO	-CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-A	CH	N-CH ₃
2,059	S	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CH(CH ₂) ₂	CH	N-CH ₃
2,060	SO	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CH(CH ₂) ₂	CH	N-CH ₃
2,061	S	-CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CH(CH ₂) ₂	CH	N-CH ₃
2,062	SO	-CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CH(CH ₂) ₂	CH	N-CH ₃
2,063	S	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₂ CF ₃	CH	N-CH ₃
2,064	SO	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₂ CF ₃	CH	N-CH ₃
2,065	S	-CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₂ CF ₃	CH	N-CH ₃
2,066	SO	-CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₂ CF ₃	CH	N-CH ₃
2,066	S	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-SCF ₃	CH	N-CH ₃
2,067	SO	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-SCF ₃	CH	N-CH ₃
2,068	S	-CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-SCF ₃	CH	N-CH ₃
2,069	SO	-CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-SCF ₃	CH	N-CH ₃
2,070	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-A	CH	N-CH ₃
2,071	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CH(CH ₂) ₂	CH	N-CH ₃
2,072	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₂ CF ₃	CH	N-CH ₃
2,073	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃	S	CH	CH	C-SCF ₃	CH	N-CH ₃
2,074	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	-CH ₃	S	CH	CH	C-A	CH	N-CH ₃
2,075	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	-CH ₃	S	CH	CH	C-CH(CH ₂) ₂	CH	N-CH ₃

Comp. N.º	X	R ₁	R ₂	R ₅	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	A ₅	G ₃
2,076	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	-CH ₃	S	CH	CH	C-CF ₂ CF ₃	CH	N-CH ₃
2,077	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	CF ₃	-CH ₃	S	CH	CH	C-SCF ₃	CH	N-CH ₃

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

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

Son ejemplos de las plagas animales mencionadas anteriormente:

del orden *Acarina*, por ejemplo,

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

del orden *Anoplura*, por ejemplo,

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

del orden *Coleoptera*, por ejemplo,

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

30 del orden *Diptera*, por ejemplo,

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

del orden *Hemiptera*, por ejemplo,

40 Acanthocoris scabrator, Acrosternum spp, Adelphocoris lineolatus, Amblypelta nitida, Bathycoelia thalassina, Blissus spp, Cimex spp., Clavigralla tomentosicollis, Creontiades spp, Distantiella theobroma, Dichelops furcatus, Dysdercus spp., Edessa spp, Euschistus spp., Eurydema pulchrum, Eurygaster spp., Halyomorpha halys, Horcias nobilellus, Leptocoris spp., Lygus spp, Margarodes spp, Murgantia histrionic, Neomegalotomus spp, Nesidiocoris tenuis, Nezara spp., Nysius

simulans, Oebalus insularis, Piesma spp., Piezodorus spp, Rhodnius spp., Sahlbergella singularis, Scaptocoris castanea, Scotinophara spp. , Thyanta spp , Triatoma spp., Vatica illudens;

5 Acyrthosium pisum, Adalgas spp, Agalliana ensigera, Agonoscena targionii, Aleurodicus spp, Aleurocanthus spp, Aleurolobus barodensis, Aleurothrixus floccosus, Aleyrodes brassicae, Amarasca biguttula, Amritodus atkinsoni, Aonidiella spp., Aphididae, Aphis spp., Aspidiotus spp., Aulacorthum solani, Bactericera cockerelli, Bemisia spp, Brachycaudus spp, Brevicoryne brassicae, Cacopsylla spp, Cavariella aegopodii Scop., Ceroplaster spp., Chrysomphalus aonidium, Chrysomphalus dictyospermi, Cicadella spp, Cofana spectra, Cryptomyzus spp, Cicadulina spp, Coccus hesperidum, Dalbulus maidis, Dialeurodes spp, Diaphorina citri, Diuraphis noxia, Dysaphis spp, Empoasca spp., Eriosoma larigerum, Erythroneura spp., Gascardia spp., Glycaspis brimblecombei, Hyadaphis pseudobrassicae, 10 Hyalopterus spp, Hyperomyzus pallidus, Idioscopus clypealis, Jacobiasca lybica, Laodelphax spp., Lecanium corni, Lepidosaphes spp., Lopaphis erysimi, Lyogenys maidis, Macrosiphum spp., Mahanarva spp, Metcalfa pruinosa, Metopolophium dirhodum, Myndus crudus, Myzus spp., Neotoxoptera sp, Nephrotettix spp., Nilaparvata spp., Nippolachnus piri Mats, Odonaspis ruthae, Oregma lanigera Zehnter, Parabemisia myricae, Paratrioza cockerelli, Parlatoria spp., Pemphigus spp., Peregrinus maidis, Perkinsiella spp, Phorodon humuli, Phylloxera spp, Planococcus 15 spp., Pseudaulacaspis spp., Pseudococcus spp., Pseudatomoscelis seriatus, Psylla spp., Pulvinaria aethiopica, Quadraspidiotus spp., Quesada gigas, Recilia dorsalis, Rhopalosiphum spp., Saissetia spp., Scaphoideus spp., Schizaphis spp., Sitobion spp., Sogatella furcifera, Spissistilus festinus, Tarophagus Proserpina, Toxoptera spp, Trialeurodes spp, Tridiscus sporoboli, Trionymus spp, Trioza erytrae , Unaspis citri, Zygina flammigera, Zyginidia scutellaris;

20 del orden *Hymenoptera*, por ejemplo,

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

del orden *Isoptera*, por ejemplo,

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

del orden *Lepidoptera*, por ejemplo,

30 Acleris spp., Adoxophyes spp., Aegeria spp., Agrotis spp., Alabama argillaceae, Amylois spp., Anticarsia gemmatalis, Archips spp., Argyrotaenia spp, Argyrotaenia spp., Autographa spp., Bucculatrix thurberiella, Busseola fusca, Cadra cautella, Carposina nipponensis, Chilo spp., Choristoneura spp., Chrysoteuchia topiaria, Clysia ambiguella, Cnaphalocrocis spp., Cnephasia spp., Cochylis spp., Coleophora spp., Colias lesbia, Cosmophila flava, Crambus spp, Crocidolomia binotalis, Cryptophlebia leucotreta, Cydalima perspectalis, Cydia spp., Diaphania perspectalis, Diatraea spp., Diparopsis castanea, Earias spp., Eldana saccharina, Ephestia spp., Epinotia spp, Estigmene acrea, Etiella zinckenella, Eucosma spp., Eupoecilia ambiguella, Euproctis spp., Euxoa spp., Feltia jaculiferia, Grapholita spp., Hedyia nubiferana, Heliothis spp., Hellula undalis, Herpetogramma spp, Hyphantria cunea, Keiferia lycopersicella, Lasmopalpus 35 lignosellus, Leucoptera scitella, Lithocollethis spp., Lobesia botrana, Loxostege bifidalis, Lymantria spp., Lyonetia spp., Malacosoma spp., Mamestra brassicae, Manduca sexta, Mythimna spp, Noctua spp, Operophtera spp., Orniodes indica, Ostrinia nubilalis, Pammene spp., Pandemis spp., Panolis flammea, Papaipema nebris, Pectinophora gossypiella, Perileucoptera coffeella, Pseudaletia unipuncta, Phthorimaea operculella, Pieris rapae, Pieris spp., Plutella xylostella, Prays spp., Pseudoplusia spp, Rachiplusia nu, Richia albicosta, Scirpophaga spp., Sesamia spp., Sparganothis spp., 40 Spodoptera spp., Sylepta derogate, Synanthedon spp., Thaumetopoea spp., Tortrix spp., Trichoplusia ni, Tuta absoluta, y Yponomeuta spp.;

del orden *Mallophaga*, por ejemplo,

Damalinea spp. y Trichodectes spp.;

del orden *Orthoptera*, por ejemplo,

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

del orden *Psocoptera*, por ejemplo,

Liposcelis spp.;

del orden *Siphonaptera*, por ejemplo,

Ceratophyllus spp., Ctenocephalides spp. y Xenopsylla cheopis;

del orden *Thysanoptera*, por ejemplo,

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

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

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

10

Cultivos diana adecuados son, en particular, cereales, tales como trigo, cebada, centeno, avena, arroz, o sorgo; remolacha, tal como remolacha azucarera o forrajera; frutas, por ejemplo, frutas de pepita, frutas con hueso o frutas sin semilla, tales como manzanas, peras, ciruelas, melocotones, almendras, cerezas o bayas, por ejemplo, fresas, frambuesas o moras; cultivos leguminosos, tales como judías, lentejas, guisantes o soja; cultivos oleaginosos, tales como colza oleaginosa, mostaza, amapolas, olivos, girasoles, cocos, ricino, cacao o cacahuètes; cucurbitáceas, tales como calabazas, pepinos o melones; plantas textiles, tales como algodón, lino, cáñamo o yute; frutas cítricas, tales como naranjas, limones, pomelos o mandarinas; hortalizas, tales como espinacas, lechuga, espárragos, coles, zanahorias, cebollas, tomates, patatas o pimientos dulces; Lauráceas, tales como aguacate, canela o alcanfor; y también tabaco, frutos secos, café, berenjenas, caña de azúcar, té, pimienta, vides, lúpulos, la familia de los plátanos y plantas de látex.

15

20

Las composiciones y/o métodos de la presente invención también pueden usarse en cualquier cultivo ornamental y/o de hortalizas, incluyendo flores, arbustos, árboles latifolios y árboles perennifolios.

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

25

30

35

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

40

45

Las especies ornamentales preferidas incluyen violeta africana, *Begonia*, *Dahlia*, *Gerbera*, *Hydrangea*, *Verbena*, *Rosa*, *Kalanchoe*, *Poinsettia*, *Aster*, *Centaurea*, *Coreopsis*, *Delphinium*, *Monarda*, *Phlox*, *Rudbeckia*, *Sedum*, *Petunia*, *Viola*, *Impatiens*, *Geranium*, *Chrysanthemum*, *Ranunculus*, *Fuchsia*, *Salvia*, *Hortensia*, romero, salvia, hierba de San Juan, menta, pimienta dulce, tomate y pepino.

50

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

(preferentemente en hortalizas, viñas), *Leptinotarsa* (preferentemente en patatas) y *Chilo supressalis* (preferentemente en arroz).

En un aspecto adicional, la invención también se puede referir a un método para controlar los daños a las plantas y partes de estas ejercidos por nematodos parasitarios de plantas (nematodos endoparasitarios, semiendoparasitarios y ectoparasitarios), especialmente nematodos parasitarios de plantas tales como nematodos de los nudos de raíz, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica*, *Meloidogyne arenaria* y otras especies de *Meloidogyne*; nematodos formadores de quistes, *Globodera rostochiensis* y otras especies de *Globodera*; *Heterodera avenae*, *Heterodera glycines*, *Heterodera schachtii*, *Heterodera trifolii* y otras especies de *Heterodera*; nematodos de agallas de semillas, especies de *Anguina*; nematodos de tallo y foliares, especies de *Aphelenchoides*; nematodos de picadura, *Belonolaimus longicaudatus* y otras especies de *Belonolaimus*; nematodos del pino, *Bursaphelenchus xylophilus* y otras especies de *Bursaphelenchus*; nematodos de anillo, especies de *Criconema*, especies de *Criconemella*, especies de *Criconemoides*, especies de *Mesocriconema*; nematodos de tallo y bulbo, *Ditylenchus destructor*, *Ditylenchus dipsaci* y otras especies de *Ditylenchus*; nematodos de punzón, especies de *Dolichodorus*; nematodos de espiral, *Helicotylenchus multicinctus* y otras especies de *Helicotylenchus*; nematodos de vaina y envolventes, especies de *Hemicycliophora* y especies de *Hemicriconemoides*; especies de *Hirshmanniella*; nematodos lanza, especies de *Hoploaimus*; nematodos falsos de nudo de raíz, especies de *Nacobbus*; nematodos aguja, *Longidorus elongatus* y otras especies de *Longidorus*; nematodos alfiler, especies de *Pratylenchus*; nematodos de lesiones, *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus curvatus*, *Pratylenchus goodeyi* y otras especies de *Pratylenchus*; nematodos excavadores, *Radopholus similis* y otras especies de *Radopholus*; nematodos reniformes, *Rotylenchus robustus*, *Rotylenchus reniformis* y otras especies de *Rotylenchus*; especies de *Scutellonema*; nematodos de raíz corta y gruesa, *Trichodorus primitivus* y otras especies de *Trichodorus*, especies de *Paratrichodorus*; nematodos que causan atrofia, *Tylenchorhynchus claytoni*, *Tylenchorhynchus dubius* y otras especies de *Tylenchorhynchus*; nematodos de cítricos, especies de *Tylenchulus*; nematodos daga, especies de *Xiphinema*; y otras especies de nematodos parasitarios de plantas, tales como *Subanguina* spp., *Hypsoperine* spp., *Macroposthonia* spp., *Melinius* spp., *Punctodera* spp. y *Quinislucius* spp.

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

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

Toxinas que pueden expresarse mediante plantas transgénicas de este tipo incluyen, por ejemplo, proteínas insecticidas, por ejemplo proteínas insecticidas de *Bacillus cereus* o *Bacillus popilliae*; o proteínas insecticidas de *Bacillus thuringiensis* tales como δ -endotoxinas, p. ej., *Cry1Ab*, *Cry1Ac*, *Cry1F*, *Cry1Fa2*, *Cry2Ab*, *Cry3A*, *Cry3Bb1* o *Cry9C*, o proteínas insecticidas vegetativas (*Vip*), p. ej., *Vip1*, *Vip2*, *Vip3* o *Vip3A*; o proteínas insecticidas de bacterias que colonizan nematodos, por ejemplo *Photorhabdus* spp. o *Xenorhabdus* spp. tales como *Photorhabdus luminescens*, *Xenorhabdus nematophilus*; toxinas producidas por animales tales como toxinas de escorpiones, toxinas de arácnidos, toxinas de avispas y otras neurotoxinas específicas de insectos; toxinas producidas por hongos, tales como toxinas de *Streptomyces*, lectinas de plantas tales como lectinas de guisantes, lectinas de cebada o lectinas de campanillas de invierno; aglutininas; inhibidores de proteinasas tales como inhibidores de tripsina, inhibidores de serina proteasa, patatina, cistatina, inhibidores de papaína; proteínas inactivadoras de ribosomas (*RIP*) tales como ricina, *RIP* de maíz, abrina, luffin, saporina o briodina; enzimas del metabolismo de esteroides tales como 3-hidroxiesteroxidasa, ecdiesteroido-UDP-glicosil-transferasa, colesterol oxidasa, inhibidores de ecdisona, *HMG-COA-reductasa*, bloqueadores de canales de iones tales como bloqueadores de canales de sodio o calcio, hormona esterasa juvenil, receptores de hormonas diuréticas, estilbena sintasa, bibencil sintasa, quitinasas y glucanasas.

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

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

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

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

10 Existe constancia de plantas transgénicas que contienen uno o más genes que codifican resistencia a insecticidas y expresan una o más toxinas, y algunas de ellas se pueden adquirir de proveedores comerciales. Ejemplos de plantas de este tipo son: YieldGard® (variedad de maíz que expresa una toxina Cry1 Ab); YieldGard Rootworm® (variedad de maíz que expresa una toxina Cry3Bb1); YieldGard Plus® (variedad de maíz que expresa un Cry1 Ab y una toxina Cry3Bb1); Starlink®(variedad de maíz que expresa una toxina Cry9C); Herculex I ®(variedad de maíz que expresa una toxina Cry1 Fa2 y la enzima fosfotricina N-acetiltransferasa (PAT) para lograr tolerancia al herbicida glufosinato de amonio); NuCOTN 33B® (variedad de algodón que expresa una toxina Cry1Ac); Bollgard I® (variedad de algodón que expresa una toxina Cry1Ac); Bollgard II® (variedad de algodón que expresa una toxina Cry1Ac y Cry2Ab); VipCot® (variedad de algodón que expresa una toxina Vip3A y Cry1 Ab); NewLeaf® (variedad de patata que expresa una toxina Cry3A); NatureGard®, Agrisure® GT Advantage (rasgo tolerante al glifosato GA21), Agrisure® CB Advantage (rasgo del taladrador del maíz Bt11 (CB)) y Protecta®.

Ejemplos adicionales de cultivos transgénicos de este tipo son:

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

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

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

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

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

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

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

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

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

10 Los cultivos se pueden modificar también para la resistencia potenciada a patógenos de hongos (por ejemplo, Fusarium, Anthracnose o Phytophthora), bacterias (por ejemplo, Pseudomonas) o virus (por ejemplo, virus del enrollamiento de la hoja de patata, virus del bronceado del tomate, virus del mosaico del pepino).

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

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

20 Las sustancias antipatógenas que pueden expresarse por dichas plantas transgénicas incluyen, por ejemplo, bloqueadores de canales iónicos, tales como bloqueadores de canales de sodio y calcio, por ejemplo, las toxinas víricas KP1, KP4 o KP6; estilbeno sintasas; bibencilo sintasas; quitinasas; glucanasas; las denominadas "proteínas relacionadas con la patogénesis" (PRP; véase, por ejemplo, el documento EP-A-0 392 225); sustancias antipatógenas producidas por microorganismos, por ejemplo, antibióticos peptídicos o antibióticos heterocíclicos (véase, por ejemplo, el documento WO 95/33818) o factores proteínicos o polipeptídicos que participan en la defensa de la planta contra patógenos (denominados "genes de resistencia a enfermedades de plantas", como se describe en el documento WO 03/000906).

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

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

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

40 Los sustratos, incluidos los materiales no tejidos, de tela o mallas a tratar pueden estar hechos de fibras naturales tales como algodón, rafia, yute, lino, sisal, arpillera o lana, o fibras sintéticas tales como poliamida, poliéster, polipropileno, poliacrilonitrilo o similares. Los poliésteres son particularmente adecuados. Los métodos de tratamiento de textiles son conocidos, p. ej., el documento WO 2008/151984, WO 03/034823, US 5631072, WO 2005/64072,

45 WO 2006/128870, EP 1724392, WO 2005/113886 o WO 2007/090739.

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

En el campo de la inyección/tratamiento de troncos de árboles, los compuestos de acuerdo con la presente invención son especialmente adecuados contra insectos barrenadores de la madera del orden de los lepidópteros, tal como se ha mencionado anteriormente, y del orden de los coleópteros, especialmente contra los barrenadores de la madera enumerados en las siguientes tablas A y B:

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

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

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

Familia	Especie	Huésped o cultivo infestado
Buprestidae	<i>Agrilus anxius</i>	Abedul
	<i>Agrilus politus</i>	Sauce, Arce
	<i>Agrilus sayi</i>	Baya, Helecho dulce
	<i>Agrilus vittaticollis</i>	Manzana, Pera, Arándano, Cornijuelo, Espino blanco
	<i>Chrysobothris femorata</i>	Manzano, Damasco, Haya, Arce negundo, Cerezo, Castaño, Grosella, Olmo, Espino blanco, Almez, Nogal americano, Castaño de Indias, Tilo, Arce, Fresno de Montaña, Roble, Pecán, Peral, Melocotonero, Caqui, Ciruelo, Álamo, Membrillo, Ciclamor, <i>Amelanchier</i> , Sicómoro, Nuez, Sauce
	<i>Texania campestris</i>	Tilo, haya, arce, roble, sicómoro, sauce, chopo amarillo,
Cerambycidae	<i>Goes pulverulentus</i>	Haya, Olmo, Roble rojo, Roble negro, Roble cereza, Roble de agua, Sicómoro
	<i>Goes tigrinus</i>	Roble
	<i>Neoclytus acuminatus</i>	Fresno, Nogal americano, Roble, Nuez, Abedul, Haya, Arce, Carpe lupulino del este, Cornejo, Caqui, Ciclamor, Acebo, Almez, Falsa Acacia, Acacia de tres espinas, Álamo amarillo, Castaño, Naranja de Luisiana, Sassafras, Lila, Caoba de la montaña, Peral, Cerezo, Ciruelo, Melocotonero, Manzano, Olmo, Tilo americano, Liquidámbar
	<i>Neoptychodes trilineatus</i>	Higo, Aliso, Mora, Sauce, Almez occidental

ES 2 762 958 T3

Familia	Especie	Huésped o cultivo infestado
	<i>Oberea ocellata</i>	Zumaque, Manzano, Melocotonero, Ciruelo, Peral, Grosella, Moral
	<i>Oberea tripunctata</i>	Corneja, Viburno, Olmo, Acedera, Arándano, Rododendro, Azalea, Laurel, Álamo, Sauce, Morera
	<i>Oncideres cingulata</i>	Nogal americano, Pecán, Caqui, Olmo, Oxidendro, Tilo americano, Acacia de tres espinas, Cornejo, Eucalipto, Roble, Almez, Arce, Árboles frutales
	<i>Saperda calcarata</i>	Chopo
	<i>Strophiona nitens</i>	Castaño, Roble, Nogal americano, Nogal, Haya, Arce
Scolytidae	<i>Corthylus columbianus</i>	Arce, Roble, Chopo amarillo, Haya, Acer negundo, Sicomoro, Abedul, Tilo, Castaño, Olmo
	<i>Dendroctonus frontalis</i>	Pino
	<i>Dryocoetes betulae</i>	Abedul, Liquidámbar, Cerezo silvestre, Haya, Peral
	<i>Monarthrum fasciatum</i>	Roble, Arce, Abedul, Castaño, Liquidambar, Tupelo, Álamo, Nogal americano, Mimosa, Manzano, Melocotonero, Pino
	<i>Phloeotribus liminaris</i>	Melocotonero, Cerezo, Ciruelo, Cerezo Negro, Olmo, Moral, Fresno de montaña
	<i>Pseudopityophthorus pruinosus</i>	Roble, Haya Americana, Cereza negra, Ciruela Chickasaw, Castaño, Arce, Nogal americano, Carpes, Carpe lupulino
Sesiidae	<i>Paranthrene simulans</i>	Roble, Castaño americano
	<i>Sannina uroceriformis</i>	Caqui
	<i>Synanthedon exitiosa</i>	Melocotonero, Ciruelo, Nectarino, Cerezo, Damasco, Almendro, Cerezo negro
	<i>Synanthedon pictipes</i>	Melocotonero, Ciruelo, Cerezo, Haya, Cerezo negro
	<i>Synanthedon rubrofascia</i>	Nyssa
	<i>Synanthedon scitula</i>	Cornejo, Pecán, Nogal americano, Roble, Castaño, Haya, Abedul, Cerezo negro, Olmo, Fresno de la montaña, Viburno, Sauce, Manzano, Níspero japonés, <i>Physocarpus</i> , <i>Myrica</i>
	<i>Vitacea polistiformis</i>	Vid

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

10 En particular, la presente invención se puede usar para controlar plagas de insectos que se alimentan de las raíces del césped incluyendo larvas blancas (tales como *Cyclocephala* spp. (por ejemplo, gusano blanco enmascarado, *C. lurida*), *Rhizotrogus* spp. (por ejemplo, gusano blanco europeo, *R. majalis*), *Cotinus* spp. (por ejemplo, escarabajo de junio verde, *C. nitida*), *Popillia* spp. (por ejemplo, escarabajo japonés, *P. japonica*), *Phyllophaga* spp. (por ejemplo, escarabajo de mayo/junio), *Ataenius* spp. (por ejemplo, ataenius del césped negro, *A. spretulus*), *Maladera* spp. (por ejemplo, escarabajo de jardín asiático, *M. castanea*) y *Tomarus* spp.), perlas del suelo (*Margarodes* spp.), grillos topo (leonados, del sur y de ala corta; *Scapteriscus* spp., *Gryllotalpa africana*) y larvas de moscas grulla (mosca grulla europea, *Tipula* spp.).

15 La presente invención también se puede usar para controlar plagas de insectos de césped que están en viviendas de techo de paja, incluyendo gardamas (tal como el gusano cogollero *Spodoptera frugiperda*, y el gusano cogollero común *Pseudaletia unipuncta*), gusanos cortadores, gusanos picudos (*Sphenophorus* spp., tales como *S. venatus verstitus* y *S. parvulus*), y gusanos de la hierba (tales como *Crambus* spp. y los gusanos de la hierba tropicales, *Herpetogramma phaeopteralis*).

20 La presente invención también se puede usar para controlar plagas de insectos de césped que viven sobre el suelo y se alimentan de hojas de césped, incluyendo chinches (tales como chinches australes, *Blissus insularis*), ácaro de Bermuda (*Eriophyes cynodoniensis*), piojo harinoso de zacate Rhodes (*Antonina graminis*), chicharrita de dos líneas (*Prospapia bicincta*), saltahojas, gusanos cortadores (familia *Noctuidae*) y chinches verdes.

La presente invención también se puede usar para controlar otras plagas de césped tales como hormigas rojas importadas (*Solenopsis invicta*) que crean hormigueros en el césped.

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

Ejemplos de dichos parásitos son:

Del orden de los anopluros: *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp. y *Phtirus* spp., *Solenopotes* spp..

30 Del orden de los malófagos: *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp. y *Felicola* spp..

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

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

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

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

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

45 De los órdenes *Actinedida* (*Prostigmata*) y *Acaridida* (*Astigmata*), por ejemplo, *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Ornithocheyletia* spp., *Myobia* spp., *Psorergates*spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Listrophorus* spp., *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp. y *Laminosioptes* spp..

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

5 Las composiciones de acuerdo con la invención se pueden utilizar, por ejemplo, contra las siguientes plagas: escarabajos, tales como *Hylotrupes bajulus*, *Chlorophorus pilosis*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinuspsecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Ernobius mollis*, *Priobium carpini*, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*, *Lyctus planicollis*, *Lyctus linearis*, *Lyctus pubescens*, *Trogoxylon aequale*, *Minthesrugicollis*, *Xyleborus spec.*, *Tryptodendron spec.*, *Apate monachus*, *Bostrychus capucins*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxylon spec.* y *Dinoderus minutus* y también himenópteros tales como *Sirex juvencus*, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus* y *Urocerus augur* y termitas, 10 tales como *Kaloterms flavicollis*, *Cryptoterms brevis*, *Heteroterms indicola*, *Reticuliterms flavipes*, *Reticuliterms santonensis*, *Reticuliterms lucifugus*, *Mastoterms darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis* y *Coptoterms formosanus* y colas de cerdas tales como *Lepisma saccharina*.

15 Los compuestos de acuerdo con la invención se pueden utilizar como agentes plaguicidas en forma no modificada, pero generalmente se formulan en composiciones de diversas maneras utilizando adyuvantes de formulación, tales como soportes, disolventes y sustancias tensioactivas. Las formulaciones pueden estar en diversas formas físicas, por ejemplo, en forma de polvos espolvoreables, geles, polvos humectables, gránulos dispersables en agua, comprimidos dispersables en agua, miniesferas efervescentes, concentrados emulsionables, concentrados microemulsionables, emulsiones de aceite en agua, suspensiones en aceite, dispersiones acuosas, dispersiones oleosas, suspoemulsiones, 20 suspensiones de cápsulas, gránulos emulsionables, líquidos solubles, concentrados solubles en agua (con agua o un disolvente orgánico miscible en agua como vehículo), películas poliméricas impregnadas o en otras formas conocidas, por ejemplo, del Manual sobre desarrollo y empleo de las especificaciones de la FAO y la OMS para plaguicidas, Naciones Unidas, quinta edición, segunda revisión (2010). Dichas formulaciones pueden usarse directamente o diluidas antes de su uso. Las diluciones pueden prepararse, por ejemplo, con agua, fertilizantes líquidos, micronutrientes, organismos biológicos, aceite o disolventes.

25 Las formulaciones pueden prepararse, por ejemplo, mezclando el principio activo con los adyuvantes de formulación para obtener composiciones en forma de sólidos finamente divididos, gránulos, soluciones, dispersiones o emulsiones. Los principios activos también pueden formularse con otros adyuvantes, tales como sólidos finamente divididos, aceites de vaselina, aceites de origen vegetal o animal, aceites modificados de origen vegetal o animal, disolventes orgánicos, agua, sustancias tensioactivas o combinaciones de los mismos.

30 Los principios activos también pueden estar contenidos en microcápsulas muy finas. Las microcápsulas contienen los principios activos en un soporte poroso. Esto permite liberar los principios activos en el entorno en cantidades controladas (p. ej., liberación lenta). Las microcápsulas habitualmente tienen un diámetro de 0.1 a 500 micrómetros. Contienen principios activos en una cantidad de aproximadamente el 25 al 95% en peso del peso de la cápsula. Los principios activos pueden estar en forma de un sólido monolítico, en forma de partículas finas en dispersión sólida o 35 líquida o en forma de una solución adecuada. Las membranas de encapsulación pueden comprender, por ejemplo, cauchos naturales o sintéticos, celulosa, copolímeros de estireno/butadieno, poliacrilonitrilo, poliacrilato, poliésteres, poliamidas, poliureas, poliuretano o polímeros modificados químicamente y xantatos de almidón u otros polímeros que son conocidos por la persona experta en la técnica. Alternativamente, pueden formarse microcápsulas muy finas en las que el principio activo está contenido en forma de partículas finamente divididas en una matriz sólida de sustancia base, 40 pero las microcápsulas no están encapsuladas en sí mismas.

Los adyuvantes de formulación que son adecuados para la preparación de las composiciones de acuerdo con la invención son conocidos *per se*. Como soportes líquidos se pueden utilizar: agua, tolueno, xileno, éter de petróleo, aceites vegetales, acetona, metil etil cetona, ciclohexanona, anhídridos de ácidos, acetonitrilo, acetofenona, acetato de amilo, 2-butanona, carbonato de butileno, clorobenceno, ciclohexano, ciclohexanol, ésteres alquílicos del ácido acético, 45 alcohol de diacetona, 1,2-dicloropropano, dietanolamina, p-dietilbenceno, dietilenglicol, abietato de dietilenglicol, dietilenglicol butil éter, dietilenglicol etil éter, dietilenglicol metil éter, *N,N*-dimetilformamida, dimetilsulfóxido, 1,4-dioxano, dipropilenglicol, dipropilenglicol metil éter, dibenzoato de dipropilenglicol, diproxitol, alquilpirrolidona, acetato de etilo, 2-etilhexanol, carbonato de etileno, 1,1,1-tricloroetano, 2-heptanona, alfa-pineno, d-limoneno, lactato de etilo, etilenglicol, etilenglicol butil éter, etilenglicol metil éter, gamma-butirolactona, glicerol, acetato de glicerol, diacetato de glicerol, 50 triacetato de glicerol, hexadecano, hexilenglicol, acetato de isoamilo, acetato de isobornilo, isoctano, isoforona, isopropilbenceno, miristato de isopropilo, ácido láctico, laurilamina, óxido de mesitilo, metoxipropanol, metil isoamil cetona, metil isobutil cetona, laurato de metilo, octanoato de metilo, oleato de metilo, cloruro de metileno, m-xileno, *n*-hexano, *n*-octilamina, ácido octadecanoico, acetato de octilamina, ácido oleico, oleilamina, o-xileno, fenol, polietilenglicol, ácido propiónico, lactato de propilo, carbonato de propileno, propilenglicol, propilenglicol metil éter, p-xileno, tolueno, 55 fosfato de trietilo, trietilenglicol, ácido xilenosulfónico, parafina, aceite mineral, tricloroetileno, percloroetileno, acetato de etilo, acetato de amilo, acetato de butilo, propilenglicol metil éter, dietilenglicol metil éter, metanol, etanol, isopropanol, y

alcoholes de elevado peso molecular, tales como alcohol amílico, alcohol tetrahidrofurfurílico, hexanol, octanol, etilenglicol, propilenglicol, glicerol, *N*-metil-2-pirrolidona y similares.

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

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

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

25 Las composiciones de acuerdo con la invención pueden incluir un aditivo que comprende un aceite de origen vegetal o animal, un aceite mineral, ésteres alquílicos de aceites de este tipo o mezclas de aceites de este tipo y derivados de aceites. La cantidad de aditivo de aceite en la composición de acuerdo con la invención es generalmente del 0.01 al 10 %, basado en la mezcla a aplicar. Por ejemplo, el aditivo de aceite se puede añadir a un tanque de rociado en la concentración deseada después de que se haya preparado una mezcla de rociado. Aditivos de aceite preferidos comprenden aceites minerales o un aceite de origen vegetal, por ejemplo, aceite de colza, aceite de oliva o aceite de girasol, aceite vegetal emulsionado, ésteres alquílicos de aceites de origen vegetal, por ejemplo los derivados metílicos, o un aceite de origen animal, tal como aceite de pescado o sebo de ternera. Aditivos de aceite preferidos comprenden ésteres alquílicos de ácidos grasos C₈-C₂₂, especialmente los derivados metílicos de los ácidos grasos C₁₂-C₁₈, por ejemplo, los ésteres metílicos del ácido láurico, el ácido palmítico y el ácido oleico (laurato de metilo, palmitato de metilo y oleato de metilo, respectivamente). Se conocen muchos derivados de aceites del Compendium of Herbicide Adjuvants, 10^a Edición, Southern Illinois University, 2010.

40 Las composiciones de la invención comprenden generalmente del 0.1 al 99 % en peso, especialmente del 0.1 al 95 % en peso de compuestos de la presente invención y del 1 al 99.9 % en peso de un adyuvante de formulación que incluye preferentemente del 0 al 25 % en peso de una sustancia tensioactiva. Aunque los productos comerciales pueden formularse preferentemente como concentrados, el usuario final normalmente empleará formulaciones diluidas.

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

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

Concentrados emulsionables:

principio activo:	del 1 al 95 %, preferentemente del 60 al 90 %
agente tensioactivo:	del 1 al 30 %, preferentemente del 5 al 20 %
vehículo líquido:	del 1 al 80 %, preferentemente del 1 al 35 %

ES 2 762 958 T3

Polvos:

principio activo: del 0.1 al 10 %, preferentemente del 0.1 al 5 %
 vehículo sólido: del 99.9 al 90 %, preferentemente del 99.9 al 99 %

Concentrados en suspensión:

5 principio activo: del 5 al 75 %, preferentemente del 10 al 50 %
 agua: del 94 al 24 %, preferentemente del 88 al 30 %
 agente tensioactivo: del 1 al 40 %, preferentemente del 2 al 30 %

Polvos humectables:

principio activo: del 0.5 al 90 %, preferentemente del 1 al 80 %
 10 agente tensioactivo: del 0.5 al 20 %, preferentemente del 1 al 15 %
 vehículo sólido: del 5 al 95 %, preferentemente del 15 al 90 %

Gránulos:

principio activo: del 0.1 al 30 %, preferentemente del 0.1 al 15 %
 vehículo sólido: del 99.5 al 70 %, preferentemente del 97 al 85 %

15 Los siguientes Ejemplos ilustran la invención adicionalmente pero sin limitarla.

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

La combinación se mezcla completamente con los adyuvantes y la mezcla se muele completamente en un molino adecuado para obtener polvos humectables que se pueden diluir con agua para obtener suspensiones de la concentración deseada.

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

20

ES 2 762 958 T3

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

<u>Concentrado emulsionable</u>	
principios activos	10 %
éter octilfenólico de polietilenglicol (4-5 moles de óxido de etileno)	3 %
dodecilbencenosulfonato de calcio	3 %
poliglicol éter de aceite de ricino (35 mol de óxido de etileno)	4 %
Ciclohexanona	30 %
mezcla de xilenos	50 %

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

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

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

<u>Gránulos extrusores</u>	
Principios activos	15 %
lignosulfonato de sodio	2 %
carboximetilcelulosa	1 %
caolín	82 %

- 10 La combinación se mezcla y se muele con los adyuvantes, y la mezcla se humedece con agua. Se extruye la mezcla y después se seca en una corriente de aire.

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

Se aplica la combinación finamente molida uniformemente, en una mezcladora, sobre el caolín humedecido con polietilenglicol. De esta forma se obtienen gránulos recubiertos que no generan polvo.

Concentrado en suspensión

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

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

Concentrado fluido para el tratamiento de semillas

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

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

Suspensión de cápsulas de liberación lenta

- 15 Se mezclan 28 partes de la combinación con 2 partes de un disolvente aromático y 7 partes de una mezcla de diisocianato de tolueno/polifenilisocianato de polimetileno (8:1). Esta mezcla se emulsiona en una mezcla de 1.2 partes de alcohol polivinílico, 0.05 partes de un antiespumante y 51.6 partes de agua hasta que se consigue el tamaño de partícula deseado. Se añade a esta emulsión una mezcla de 2.8 partes de 1,6-diaminohexano en 5.3 partes de agua. Se agita la mezcla hasta que finaliza la reacción de polimerización. La suspensión de cápsulas obtenida se estabiliza añadiendo 0.25 partes de un espesante y 3 partes de un agente dispersante. La formulación de suspensión de cápsulas
- 20 contiene un 28 % de los principios activos. El diámetro medio de cápsula es de 8-15 micrómetros. La formulación resultante se aplica a las semillas en forma de una suspensión acuosa en un aparato adecuado para ese propósito.

- 25 Los tipos de formulación incluyen un concentrado de emulsión (EC), un concentrado de suspensión (SC), una suspo-emulsión (SE), una suspensión de cápsulas (CS), un gránulo dispersable en agua (WG), un gránulo emulsionable (EG), una emulsión, agua en aceite (EO), una emulsión, aceite en agua (EW), una microemulsión (ME), una dispersión de aceite (OD), un aceite miscible fluido (OF), un líquido miscible en aceite (OL), un concentrado soluble (SL), una suspensión de volumen ultra bajo (SU), un líquido de volumen ultra bajo (UL), un concentrado técnico (TK), un

concentrado dispersable (DC), un polvo humectable (WP), un gránulo soluble (SG) o cualquier formulación técnicamente factible en combinación con adyuvantes agrícola-mente aceptables.

Ejemplos de preparación:

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

Métodos LCMS:

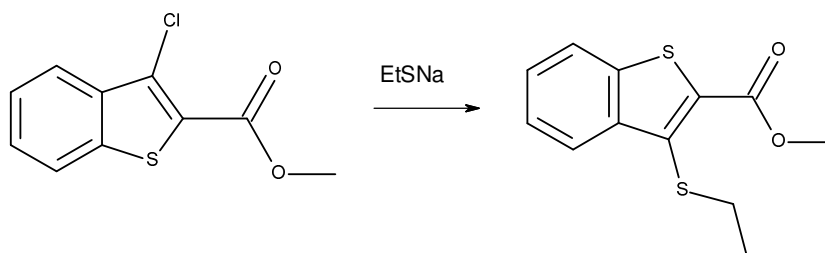
Método A (SQD13):

10 Los espectros se registraron en un espectrómetro de masas de Waters (espectrómetro de masas de cuadrupolo simple SQD) equipado con una fuente de electropulverización (polaridad: iones positivos o negativos, Capilar: 3.00 kV, Intervalo del cono: 30-60 V, Extractor: 2.00 V, Temperatura de la Fuente: 150°C, Temperatura de Desolvatación: 350°C, Flujo del Gas del Cono: 0 l/h, flujo del gas de desolvatación: 650 l/h, Intervalo de masas: de 100 a 900 Da) y una UPLC Acquity de Waters: bomba binaria, compartimiento de columna calentado y detector de matriz de diodos. Desgasificador de disolventes, bomba binaria, compartimiento térmico de columna y detector de matriz de diodos. Columna: Waters UPLC
15 HSS T3, 1.8 μm , 30 x 2.1 mm, temp: 60 °C, intervalo de Longitudes de onda del DAD (nm): de 210 a 500, Gradiente de disolventes: A = agua + 5% de MeOH + 0.05 % de HCOOH, B= Acetonitrilo + 0.05 % de HCOOH: gradiente: gradiente: 0 min 0 % de B, 100 % de A; 1.2-1.5 min 100 % B; flujo (ml/min) 0.85.

Síntesis de compuestos intermedios:

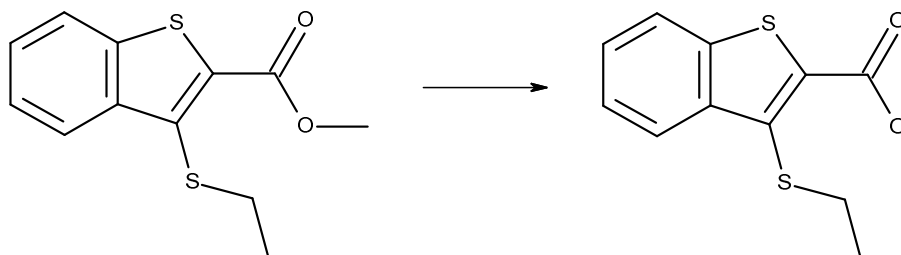
Compuesto Intermedio I1: Síntesis de ácido 3-etilsulfanilbenzotiofen-2-carboxílico:

20 Etapa A: 3-etilsulfanilbenzotiofen-2-carboxilato de metilo:



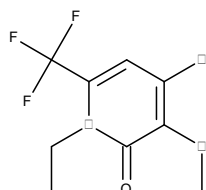
25 A una solución agitada de 3-clorobenzotiofen-2-carboxilato de metilo (comercializado, 1 g) en *N,N*-dimetilformamida (8.61 ml) se le añadió etanotiolato de sodio (0.506 g, 1 equiv.). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. A continuación, se añadieron 0.25 eq. de etanotiolato de sodio. La reacción se controló por TLC. Después de la finalización del material de partida, la mezcla de reacción se diluyó con agua y se extrajo con acetato de etilo (2 X). Las fases orgánicas se combinaron y se secaron con Na_2SO_4 . Se filtraron, se concentraron y se purificaron por cromatografía en columna usando ciclohexano-acetato de etilo para dar el compuesto deseado (0.92 g; Rendimiento = 85 %). ^1H RMN (400 MHz, CDCl_3): δ (ppm) 8,20 (m, 1H), 7,82(m, 1H), 7,48 (m, 2H), 3,97 (s, 3H), 3,04(c, 2H), 1,20 (t, 3H).

30 Etapa B: Ácido 3-etilsulfanilbenzotiofen-2-carboxílico:

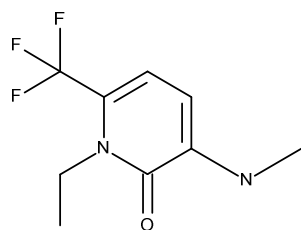


- 5 A una solución agitada de 3-etilsulfanilbenzotiofeno-2-carboxilato de metilo (0.9 g) en una mezcla de THF (14.3 ml) y agua (3.57 ml) se le añadió hidróxido de litio monohidratado (1.1 eq., 0.094 g) a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se agitó durante 2 horas a temperatura ambiente. La reacción se controló por TLC. Después de la finalización del material de partida, la mezcla de reacción se acidificó con cloruro de hidrógeno (1 N) y se extrajo con acetato de etilo (2). Las fases orgánicas se combinaron y se secaron con Na₂SO₄. Se filtraron, se concentraron a presión reducida para dar el sólido en bruto, que se usó sin purificación en la siguiente etapa (804 mg, Rendimiento del 94.62 %). ¹H RMN (400 MHz, DMSO-d₆): δ (ppm) 8,10 (m, 2H), 7,57 (m, 2H), 3,04 (c, 2H), 1,10 (t, 3H).

Intermedio I2: 4-amino-1-etil-3-(metilamino)-6-(trifluorometil)piridin-2-ona:

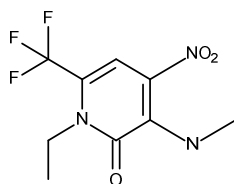


- 10 **Etapa A: 1-etil-3-(metilamino)-6-(trifluorometil)piridin-2-ona:**



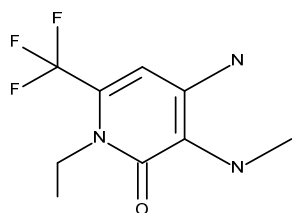
- 15 A una solución de 3-amino-1-etil-6-(trifluorometil)piridin-2-ona (5.00 g, 24.3 mmol, disponible comercialmente o sintetizada por analogía con la bibliografía, por ejemplo, Synthesis 2005, N.º 8, págs. 1269–1278 y Synthesis 2011, N.º 7, págs. 1149–1156) en acetonitrilo (150 ml) se le añadió formaldehído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

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



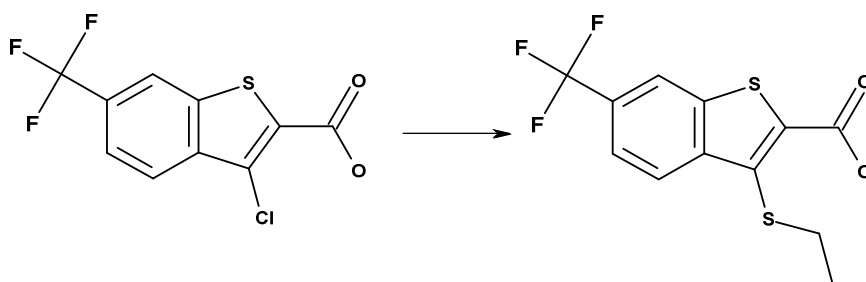
La 1-etil-3-(metilamino)-4-nitro-6-(trifluorometil)piridin-2-ona se preparó según el Ejemplo 3, etapa B. LC-MS(Método A) : RT 0,98, 266 (M+H⁺), 264 (M-H⁺).

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



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

Compuesto Intermedio I3: Síntesis del ácido 3-etilsulfanil-6-(trifluorometil)benzotiofen-2-carboxílico:



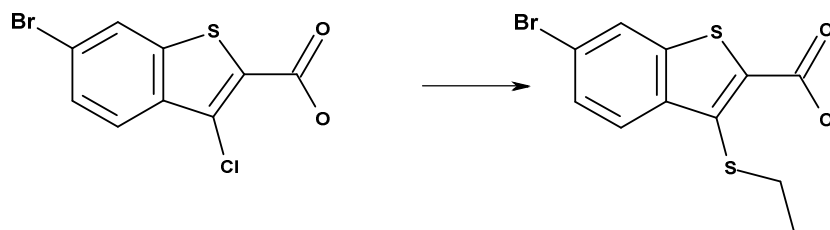
5

A una solución agitada de ácido 3-cloro-6-(trifluorometil)benzotiofen-2-carboxílico (10 g) (disponible comercialmente, 1 g) en N,N-dimetilformamida (71.7 ml) se le añadió etanotiolato de sodio (12.132 g). La mezcla de reacción se agitó durante 1 hora a 50°C, la temperatura se aumentó a 100°C durante 4 horas y después la reacción se agitó a temperatura ambiente durante 24 horas. La mezcla de reacción se diluyó con agua y se extrajo con acetato de etilo (1 X). Después de la separación, la fase acuosa se acidificó con 1 mol de HCl y se extrajo con acetato de etilo (3 X). Las capas orgánicas combinadas se combinaron, se secaron sobre sulfato de sodio, se filtraron, se concentraron al vacío. El ácido 3-etilsulfanil-6-(trifluorometil) benzotiofen-2-carboxílico (4.21 g) obtenido se usó sin purificación adicional en la siguiente etapa.

10

LC-MS(Método A) : RT 1,07, 307 (M+H⁺).

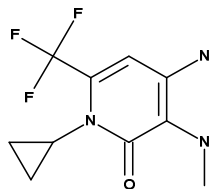
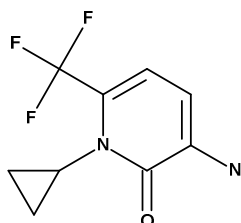
Compuesto Intermedio I4: Síntesis de ácido 3-etilsulfanil-6-(bromo)benzotiofen-2-carboxílico:



20

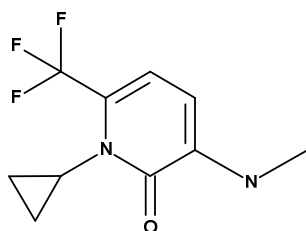
A una solución agitada de ácido 3-cloro-6-(bromo) benzotiofen-2-carboxílico (7.3 g) (disponible comercialmente, 1 g) en N,N-dimetilformamida (50 ml) se le añadió etanotiolato de sodio (4.7 g). La mezcla de reacción se agitó durante 1.5 horas a 100°C. La mezcla de reacción se diluyó con agua y se extrajo con acetato de etilo (1 X). Después de la separación, la fase acuosa se acidificó con 1 mol de HCl y se extrajo con acetato de etilo (3 X). Las capas orgánicas combinadas se combinaron, se secaron sobre sulfato de sodio, se filtraron, se concentraron al vacío. El residuo obtenido se purificó por HPLC (fase inversa) para dar el ácido 3-etilsulfanil-6-(bromo)benzotiofen-2-carboxílico (3.06 g) obtenido que se usó sin purificación adicional en la siguiente etapa. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 13,7 (sb, 1H), 8,12 (s, 1H), 7,96 (d, 1H), 7,68 (d, 1H), 3,0 (c, 2H), 1,26(t, 3H).

25

Compuesto Intermedio I5: 4-amino-1-ciclopropil-3-(metilamino)-6-(trifluorometil)piridin-2-ona**Etapa A:** 1-ciclopropil-3-(amino)-6-(trifluorometil)piridin-2-ona

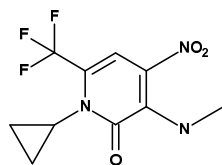
5 Una bomba sellada se cargó con N-[2-oxo-6-(trifluorometil)piran-3-il]benzamida (disponible comercialmente, Número de registro de CAS 312615-59-1, 30 g, 105.9 mmol), tetrahidrofurano (132.4 ml, 1620 mmol) y ciclopropilamina (8.24 ml, 116.5 mmol). La mezcla se agitó durante la noche a 70°C. El vial sellado se enfrió y la mezcla de reacción se disolvió con agua y acetato de etilo (250 ml/250 ml). La fase acuosa se extrajo con acetato de etilo (3x) y la capa orgánica combinada se secó sobre sulfato de sodio, se filtró, se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en
10 columna usando ciclohexano-acetato de etilo para dar el material de partida y 23 g de

N-[1-ciclopropil-2-hidroxi-6-oxo-2-(trifluorometil)-3H-piridin-5-il]benzamida. La N-[1-ciclopropil-2-hidroxi-6-oxo-2-(trifluorometil)-3H-piridin-5-il]benzamide se disolvió en cloruro de hidrógeno (563 g, 473.1 ml, 5710 mmol) y la mezcla se agitó a 100°C durante una noche. El precipitado de ácido benzoico se eliminó por filtración y el filtrado se basificó a pH 7-8 con una solución de hidróxido de sodio conc. Después, la fase acuosa se extrajo (3x) con AcOEt y las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio, se filtraron y se concentraron al vacío. El residuo se purificó por
15 cromatografía en columna usando ciclohexano-acetato de etilo para dar 12 g de 1-ciclopropil-3-(amino)-6-(trifluorometil)piridin-2-ona. LC-MS(Método A) : RT 0,79, 219 (M+H⁺). ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 6,59 (d, 1 H), 6,33 (d, 1 H), 4,60 (sb, 2 H), 3,07 (m, 1H), 1,24(m, 2H), 1,02 (m, 2H).

Etapa B: 1-ciclopropil-3-(metilamino)-6-(trifluorometil)piridin-2-ona

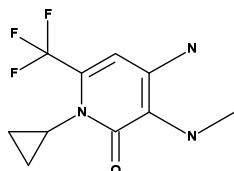
20

La 1-ciclopropil-3-(metilamino)-4-nitro-6-(trifluorometil)piridin-2-ona se preparó según el Ejemplo 14, etapa A. LC-MS(Método A) : RT 0,93, 233 (M+H⁺).

Etapa C: 1-ciclopropil-3-(metilamino)-4-nitro-6-(trifluorometil)piridin-2-ona

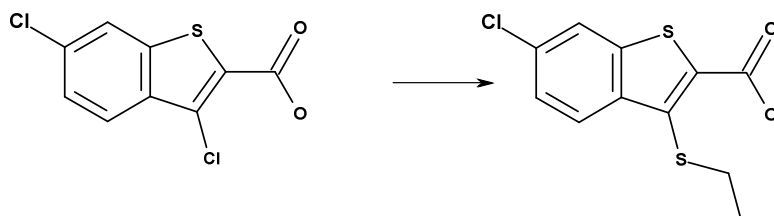
La 1-ciclopropil-3-(metilamino)-4-nitro-6-(trifluorometil)piridin-2-ona se preparó según el Ejemplo I2, etapa C. LC-MS(Método A) : RT 0,98, 278 (M+H⁺).

Etapa D: 4-amino-1-ciclopropil-3-(metilamino)-6-(trifluorometil)piridin-2-ona



- 5 La 4-amino-1-ciclopropil-3-(metilamino)-6-(trifluorometil)piridin-2-ona se preparó según el Ejemplo I2, etapa D. LC-MS (Método A): TR 0.52, 247 (M⁺H⁺). Alternativamente, la 4-amino-1-ciclopropil-3-(metilamino)-6-(trifluorometil)piridin-2-ona puede prepararse a través de hidrogenación en presencia de Pd/C en etanol usando una reacción clásica. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 6,28 (s, 1 H), 4,08 (sb, 2H), 3,81 (sb, 1H), 2,97(m, 1H), 2,63 (s, 3H), 1,18(m, 2H), 0,98 (m, 2H).

Compuesto Intermedio I6: Síntesis de ácido 3-etilsulfanil-6-(cloro)benzotiofen-2-carboxílico:

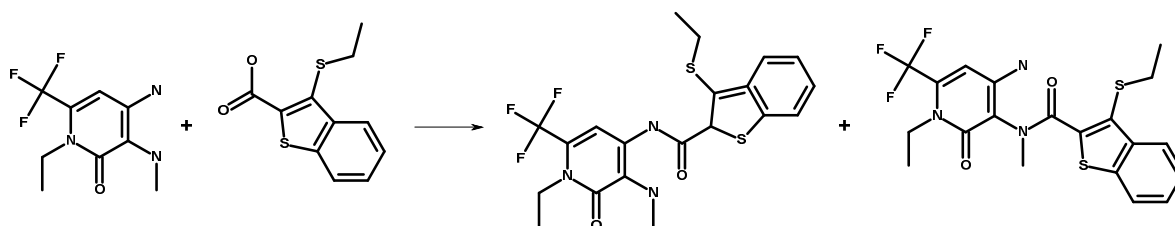


10

El Intermedio I6 se obtuvo usando el ácido 3,6-diclorobenzotiofen-2-carboxílico (disponible comercialmente) en forma del material de partida y el mismo método que se ha descrito para el Intermedio I5. ¹H RMN (400 MHz, DMSO-d₆): δ (ppm) 13,75 (sb, 1H), 8,28 (s, 1H), 8,10 (d, 1H), 7,57 (d, 1H), 3,04 (c, 2H), 1,10 (t, 3H).

Ejemplo P1: Preparation de 5-etil-2-(3-etilsulfanilbenzotiofen-2-il)-3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-4-ona:

- 15 Etapa A: Preparación de N-[1-etil-3-(metilamino)-2-oxo-6-(trifluorometil)-4-piridil]-3-etilsulfanil-benzotiofen-2-carboxamida y N-[4-amino-1-etil-2-oxo-6-(trifluorometil)-3-piridil]-3-etilsulfanil-N-metil-benzotiofen-2-carboxamida:

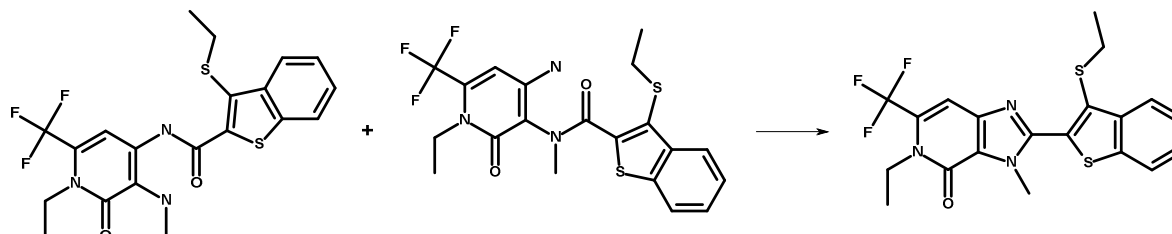


- 20 A una suspensión de ácido 3-etilsulfanilbenzotiofen-2-carboxílico (Intermedio I1, 0.103 g, 0.434 mmol) en diclorometano (4 ml) se le añadió una gota de N,N-dimetilformamida seguido de cloruro de oxalilo (0.0681 ml, 0.765 mmol). Después del final del desprendimiento de gas, la mezcla de reacción estaba en forma de una solución de color amarillo pálido. Ésta última se evaporó a presión reducida a una temperatura de baño de 60°C. El residuo de cloruro de 5-bromo-3-etilsulfanil-piridin-2-carbonilo se disolvió de nuevo en 2 ml de THF.

- 25 A una solución de 4-amino-1-etil-3-(metilamino)-6-(trifluorometil)piridin-2-ona (Intermedio I3: 0.100 g, 0.425 mmol) en acetato de etilo (5 ml) se le añadió N,N-dietiletanamina (0.150 ml, 1.06 mmol). La solución resultante se enfrió con un baño de hielo, antes de la adición lenta de la solución de cloruro de acilo anterior. La mezcla resultante se agitó durante 1 hora a temperatura ambiente. La solución se neutralizó mediante la adición de una solución de cloruro de hidrógeno (1 N) y acetato de etilo y la fase acuosa se extrajo dos veces con acetato de etilo. La solución orgánica se secó sobre sulfato de sodio y se evaporó a presión reducida para producir una mezcla de N-[1-etil-3-(metilamino)-2-oxo-6-(trifluorometil)-4-piridil]-3-etilsulfanil-benzotiofen-2-carboxamida y N-[4-amino-1-etil-2-oxo-6-(trifluorometil)-3-piridil]-3-

etilsulfanil-N-metil-benzotiofen-2-carboxamida. Esta mezcla se usó sin purificación adicional para la siguiente etapa. LC-MS (Método A): RT 1,03, 456 (M⁺+H⁺), 454 (M⁺-H⁺).

Etapa B: Preparación de 5-etil-2-(3-etilsulfanilbenzotiofen-2-il)-3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-4-ona:

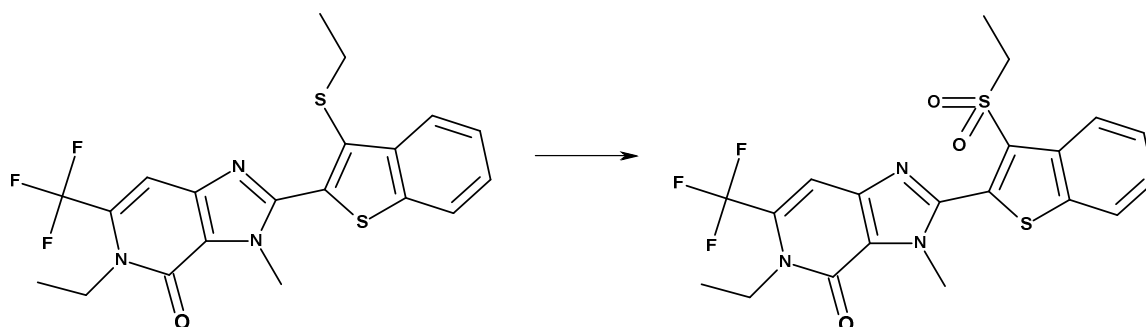


- 5 Una mezcla de N-[1-etil-3-(metilamino)-2-oxo-6-(trifluorometil)-4-piridil]-3-etilsulfanil-benzotiofen-2-carboxamida y N-[4-amino-1-etil-2-oxo-6-(trifluorometil)-3-piridil]-3-etilsulfanil-N-metil-benzotiofen-2-carboxamida (0.185 g, 0.4061 mmol) en ácido acético (1 ml) se calentó a 160°C durante 1h en un microondas. La reacción se controló por TLC. Después de la finalización del material de partida, la mezcla de reacción se diluyó con agua. El precipitado se eliminó por filtración y el sólido se lavó con agua. El sólido se disolvió en acetato de etilo, se secó sobre sulfato de sodio, se filtró y se concentró al vacío para dar el compuesto deseado en forma de un sólido de color blanco (0.16 g; Rendimiento = 90 %). Este compuesto se usó sin purificación adicional en la siguiente etapa. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 1,06 (t, 3 H), 1,40 (t, 3 H), 2,68 (c, 2 H), 4,12 (s, 3 H), 4,26 (c, 2 H), 7,30 (s, 1 H), 7,52 (m, 2 H), 7,92 (d, 1 H), 8,10 (d, 1 H).

Usando el mismo procedimiento de dos etapas, se prepararon los siguientes compuestos:

Producto	Material de partida	LC-MS (Método A) de los intermedios (Etapa A)	¹ H RMN (400 MHz, CDCl ₃) o/y LC-MS (Método A) del producto
A3	Intermedio I2 e I3	LC-MS (Método A): RT 1,13, 524 (M ⁺ +H ⁺), 523 (M ⁺ -H ⁺).	1,06 (t, 3 H), 1,41 (t, 3 H), 2,68 (c, 2 H), 4,13 (s, 3 H), 4,27 (c, 2 H), 7,30 (s, 1 H), 7,76 (d, 1 H), 8,22 (m, 2 H)
A5	Intermedio I2 e I4	LC-MS (Método A): RT 1,12, 536 (M ⁺ +H ⁺), 534 (M ⁺ -H ⁺).	1,04 (t, 3 H), 1,40 (d, 3 H), 2,66 (c, 2 H), 4,12 (s, 3 H), 4,26 (c, 2 H), 7,29 (s, 1 H), 7,64 (d, 1 H), 7,95 (d, 1 H), 8,06 (s, 1 H)
A7	Intermedio I5 e I6	LC-MS (Método A): RT 1,09, 502 (M ⁺ +H ⁺), 500 (M ⁺ -H ⁺).	LC-MS (Método A): RT 1,31, 484 (M ⁺ +H ⁺).
A9	Intermedio I5 e I4	LC-MS (Método A): RT 1,11, 546-548 (M ⁺ +H ⁺), 544-546 (M ⁺ -H ⁺).	LC-MS (Método A): RT 1,34, 528-530 (M ⁺ +H ⁺).
A13	Intermedio I5 e I3	LC-MS (Método A): RT 1,11, 536 (M ⁺ +H ⁺), 534 (M ⁺ -H ⁺).	LC-MS (Método A): RT 1,32, 518(M ⁺ +H ⁺).
A15	Intermedio I5 e I1	LC-MS (Método A): RT 1,00, 468 (M ⁺ +H ⁺), 466 (M ⁺ -H ⁺).	LC-MS (Método A): RT 1,25, 450 (M ⁺ +H ⁺).

- 15 **Ejemplo P2:** Preparación de 5-etil-2-(3-etilsulfonilbenzotiofen-2-il)-3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c] piridin-4-ona:



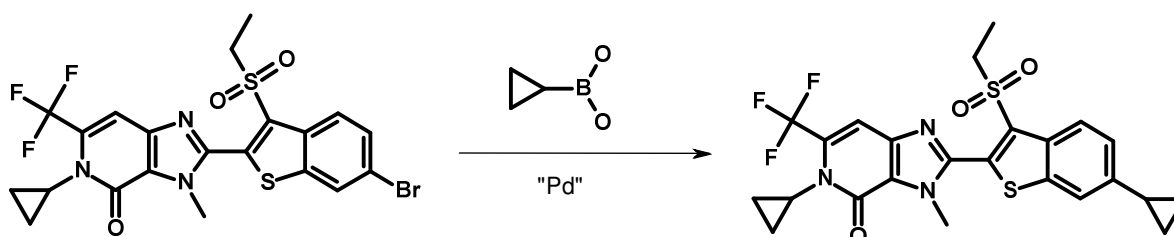
5 A una solución agitada del compuesto de 5-etil-2-(3-etilsulfanilbenzotiofen-2-il)-3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-4-ona (A1, 0.149 g, 0.341 mmol) en diclorometano (5 ml) se le añadió *m*-CPBA (0.161 g, 0.698 mmol) a temperatura ambiente. Después, la mezcla de reacción se agitó durante 1 hora a temperatura ambiente. La reacción se controló por TLC. Después de la finalización del inicio, la mezcla de reacción se inactivó con tiosulfato de sodio saturado y se extrajo con diclorometano (3 x). Las capas combinadas de diclorometano se combinaron, se secaron sobre sulfato de sodio, se filtraron y se concentraron al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna usando ciclohexano-acetato de etilo para dar el compuesto deseado en forma de un sólido de color blanco (0.15 g; Rendimiento = 94 %). ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 1,30 (t, 3 H), 1,39 (t, 3 H), 3,33 (c, 2 H), 4,08 (s, 3 H), 4,25 (c, 2 H), 7,24 (s, 1 H), 7,62 (m, 2 H), 7,96 (d, 1 H), 8,52 (d, 1 H).

10

Usando el mismo procedimiento, se prepararon los siguientes compuestos:

Producto	Material partida de	¹ H RMN (400 MHz, CDCl ₃) δ ppm o LC-MS (Método A) del producto
A4	A3	1,31 (t, 3 H), 1,39 (t, 3 H), 3,35 (c, 2 H), 4,08 (s, 3 H), 4,25 (c, 2 H), 7,24 (s, 1 H), 7,85 (d, 1 H), 8,28 (s, 1 H), 8,68 (d, 1 H).
A6	A5	1,29 (t, 3 H), 1,39 (t, 3 H), 3,32 (c, 2 H), 4,07 (s, 3 H), 4,24 (c, 2 H), 7,23 (s, 1 H), 7,73 (m, 1 H), 8,13 (s, 1 H), 8,39 (d, 1 H).
A8	A7	LC-MS (Método A): RT 1,15, 516 (M ⁺ +H ⁺).
A10	A9	LC-MS (Método A): RT 1,16, 560-562 (M ⁺ +H ⁺).
A14	A13	LC-MS (Método A): RT 1,16, 550 (M ⁺ +H ⁺).
A16	A15	LC-MS (Método A): RT 1,07, 482 (M ⁺ +H ⁺).

Ejemplo P3: Preparación de 5-ciclopropil-2-(6-ciclopropil-3-etilsulfonil-benzotiofen-2-il)-3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-4-ona **A11**

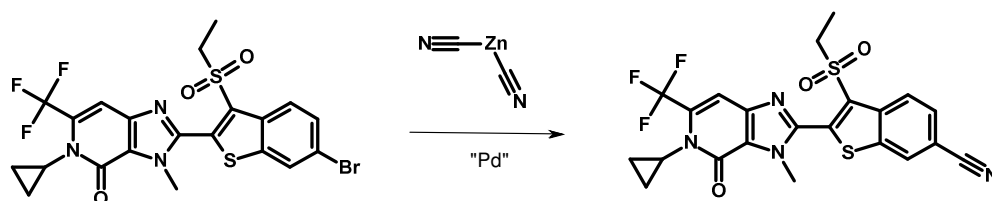


15

A una solución de 2-(6-bromo-3-etilsulfonil-benzotiofen-2-il)-5-ciclopropil-3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-4-ona **A6** (0.18 g) en una mezcla de tolueno (2.3 ml) y agua (2.3 ml) se le añadió ácido ciclopropilborónico (0.104 g),

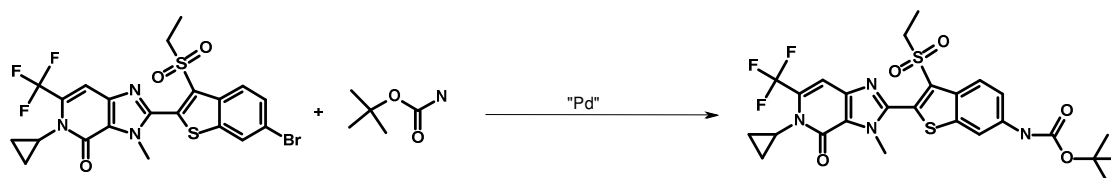
5 tetraakis(trifenilfosfina)paladio (0) (0.037 g) y fosfato de potasio tribásico (0.422 g, 0.165 ml). La mezcla se calentó a reflujo después durante 4 horas. La reacción se desgasificó y se añadieron 0.05518 g más de ácido ciclopropilborónico y 0.01657 g de (complejo de dicloruro de 1,1'-bis (difenilfosfino) ferroceno-paladio (ii)-diclorometano). La reacción se desgasificó de nuevo y se calentó en el microondas a 130°C durante 20 minutos. La mezcla de reacción se inactivó con hidróxido de sodio (1 N) y se extrajo con diclorometano (3 x). Las capas combinadas de diclorometano se combinaron, se secaron sobre sulfato de sodio, se filtraron y se concentraron al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna usando ciclohexano-acetato de etilo (del 40 al 0%) para dar el compuesto deseado en forma de un sólido (Rendimiento = 84 %). LC-MS (Método A): RT 1,19, 523 (M⁺+H⁺).

10 **Ejemplo P4:** Preparación de 2-[5-ciclopropil-3-metil-4-oxo-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-2-il]-3-etilsulfonil-benzotiofen-6-carbonitrilo **A12**



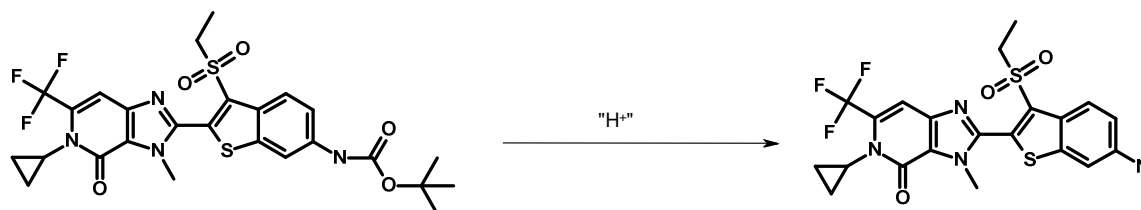
15 Una solución de 2-(6-bromo-3-etilsulfonil-benzotiofen-2-il)-5-ciclopropil-3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-4-ona **A6** (190 mg), Pd₂dba₃ (16 mg), S-Phos (15 mg) y Zn(CN)₂ (325 mg) en 2.9 ml de DMF se desgasificó y después se calentó a 150°C durante 30 min en el reactor de microondas. La solución se diluyó con hidróxido de sodio (1 N) y se extrajo con acetato de etilo (2 veces). Las capas orgánicas combinadas se combinaron, se lavaron con hidróxido de sodio (1 N), se secaron sobre Na₂SO₄, se filtraron y se concentraron hasta sequedad. El producto en bruto se purificó sobre gel de sílice, FCC (CombiFlash Rf150; 4 g SiO₂; ciclohexano (del 40% al 0%):acetato de etilo para proporcionar el compuesto del título **A12** (rendimiento del 94%). LC-MS (Método A): RT 1,04, 507 (M⁺+H⁺).

20 **Ejemplo P5:** Preparación de N-[2-[5-ciclopropil-3-metil-4-oxo-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-2-il]-3-etilsulfonil-benzotiofen-6-il]carbamato de terc-butilo **A17**



25 Se disolvió 2-(6-bromo-3-etilsulfonil-benzotiofen-2-il)-5-ciclopropil-3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-4-ona **A6** (0.109 g) en 1,4-dioxano anhidro (1.1 ml) y se añadieron carbamato de terc-butilo (0.027 g), carbonato de cesio (0.088 g) y dicalohexil-[2-(2,4,6-triisopropilfenil)fenil]fosfano (Xphos, 0.009 g) en una atmósfera de nitrógeno. La mezcla se desgasificó durante 10' y se añadieron 0.0014 g de acetato de paladio II. La mezcla de reacción se calentó a 110°C en un baño de aceite precalentado durante 3.5 horas, después se enfrió a temperatura ambiente y se añadió una solución acuosa de NaOH (1 N). La fase acuosa se extrajo con diclorometano (3 x). Las capas combinadas de diclorometano se combinaron, se lavaron con salmuera, se secaron sobre sulfato de sodio, se filtraron y se concentraron al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna usando ciclohexano-acetato de etilo (del 0 al 40%) para dar el compuesto deseado. LC-MS(Método A): RT 1,17, 597 (M⁺+H⁺), 595 (M⁻-H⁺).

30 **Ejemplo P6:** Preparación de 2-(6-amino-3-etilsulfonil-benzotiofen-2-il)-5-ciclopropil-3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-4-ona **A18**



5 Se añadió ácido clorhídrico (4 M en Dioxano) (0.31 ml) a una solución de N-[2-[5-ciclopropil-3-metil-4-oxo-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-2-il]-3-etilsulfonyl-benzotiofen-6-il]carbamato de terc-butilo **A17** (0.074 g) en 1,4-dioxano (0.37 ml) y después la solución se calentó a 50°C durante 1 hora. Se añadió una solución acuosa de NaOH (1 N). La fase acuosa se extrajo con diclorometano (3 x). Las capas combinadas de diclorometano se combinaron, se lavaron con salmuera, se secaron sobre sulfato de sodio, se filtraron y se concentraron al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna usando ciclohexano-acetato de etilo (del 0 al 40%) para dar el compuesto deseado. LC-MS(Método A): RT 0,96, 498 (M⁺+H⁺), 495 (M⁺- H⁺).

La Tabla B divulga compuestos preferidos de fórmula I-1a preparados de acuerdo con los ejemplos preparatorios descritos anteriormente:

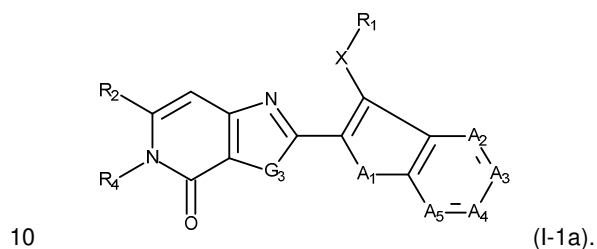





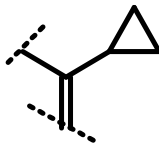



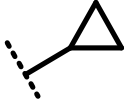


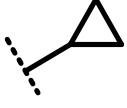


Tabla B:

Comp. N.º	X	R ₁	A ₁	R ₂	R ₄	A ₂	A ₃	A ₄	A ₅	G ₃
A1	S	-CH ₂ CH ₃	S	CF ₃	-CH ₂ CH ₃	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
A2	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	S	CF ₃	-CH ₂ CH ₃	CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
A3	S	-CH ₂ CH ₃	S	CF ₃	-CH ₂ CH ₃	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
A4	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	S	CF ₃	-CH ₂ CH ₃	CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
A5	S	-CH ₂ CH ₃	S	CF ₃	-CH ₂ CH ₃	CH	CH	C-A	CH	N-CH ₃
A6	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	S	CF ₃	-CH ₂ CH ₃	CH	CH	C-A	CH	N-CH ₃
A7	S	-CH ₂ CH ₃	S	CF ₃		CH	CH	C-Cl	CH	N-CH ₃
A8	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	S	CF ₃		CH	CH	C-Cl	CH	N-CH ₃
A9	S	-CH ₂ CH ₃	S	CF ₃		CH	CH	C-A	CH	N-CH ₃

A10	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	S	CF ₃		CH	CH	C-A	CH	N-CH ₃
A11	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	S	CF ₃		CH	CH		CH	N-CH ₃
A12	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	S	CF ₃		CH	CH	C-CN	CH	N-CH ₃
A13	S	-CH ₂ CH ₃	S	CF ₃		CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
A14	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	S	CF ₃		CH	CH	C-CF ₃	CH	N-CH ₃
A15	S	-CH ₂ CH ₃	S	CF ₃		CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
A16	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	S	CF ₃		CH	CH	CH	CH	N-CH ₃
A17	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	S	CF ₃		CH	CH	C-NHC(O)OtBu	CH	N-CH ₃
A18	SO ₂	-CH ₂ CH ₃	S	CF ₃		CH	CH	C-NH ₂	CH	N-CH ₃

La actividad de las composiciones de acuerdo con la invención puede ampliarse considerablemente y adaptarse a las circunstancias predominantes mediante la adición de otros principios activos como insecticidas, acaricidas y/o fungicidas.

Las mezclas de los compuestos de fórmula I con otros principios activos como insecticidas, acaricidas y/o fungicidas también pueden presentar otras ventajas sorprendentes, las cuales también pueden describirse, en un sentido más amplio, como actividad sinérgica. Por ejemplo, mejor tolerancia por las plantas, fitotoxicidad reducida, los insectos se pueden controlar en sus diferentes fases de desarrollo o un comportamiento mejor durante su producción, por ejemplo, durante la molienda o mezcladura, durante su almacenamiento o durante su uso.

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

Se prefieren las siguientes mezclas de los compuestos de fórmula I con principios activos (la abreviatura "TX" significa "un compuesto seleccionado del grupo que consiste en los compuestos descritos en las Tablas 1, 2 y B de la presente invención"):

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

un acaricida seleccionado a partir del grupo de sustancias constituido por 1,1-bis(4-clorofenil)-2-etoxietanol (nombre según la IUPAC) (910) + TX, bencenosulfonato de 2,4-diclorofenilo (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1059) + TX, 2-fluoro-*N*-metil-*N*-1-naftilacetamida (nombre según la IUPAC) (1295) + TX, 4-clorofenil fenil sulfona (nombre según la IUPAC) (981) + TX, abamectina (1) + TX, acequinocilo (3) + TX, acetoprol [CCN] + TX, acrinatrina (9) + TX, aldicarb (16) + TX, aldoxicarb (863) + TX, alfa-cipermetrina (202) + TX, amiditió (870) + TX, amidoflumet [CCN] + TX, amidotiato (872) + TX, amitón (875) + TX, hidrogenooxalato de amitón (875) + TX, amitraz (24) + TX, aramita (881) + TX, óxido arsenioso (882) + TX, AVI 382 (código de compuesto) + TX, AZ 60541 (código de compuesto) + TX, azinfos-etilo (44) + TX, azinfos-metilo (45) + TX, azobenceno (nombre según la IUPAC) (888) + TX, azociclotina (46) + TX, azotoato (889) + TX, benomilo (62) + TX, benoxafos [CCN] + TX, benzoximato (71) + TX, benzoato de bencilo (nombre según la IUPAC) [CCN] + TX, bifenazato (74) + TX, bifentrina (76) + TX, binapacril (907) + TX, brofenvalerato + TX, bromocicleno (918) + TX, bromofos (920) + TX, bromofos-etilo (921) + TX, bromopropilato (94) + TX, buprofezina (99) + TX, butocarboxim (103) + TX, butoxicarboxim (104) + TX, butilpiridabeno + TX, polisulfuro de calcio (nombre según la IUPAC) (111) + TX, camfeclor (941) + TX, carbanolato (943) + TX, carbarilo (115) + TX, carbofurano (118) + TX, carbofenotió (947) + TX, CGA 50'439 (código de desarrollo) (125) + TX, quinometionato (126) + TX, clorbensida (959) + TX, clordimeform (964) + TX, clorhidrato de clordimeform (964) + TX, clorfenapir (130) + TX, clorfenetol (968) + TX, clorfensón (970) + TX, clorfensulfuro (971) + TX, clorfenvinfos (131) + TX, clorobencilato (975) + TX, cloromebuform (977) + TX, clorometiurón (978) + TX, cloropropilato (983) + TX, cloropirifos (145) + TX, cloropirifos-metilo (146) + TX, clortiofos (994) + TX, cinerina I (696) + TX, cinerina II (696) + TX, cinerinas (696) + TX, clofentezina (158) + TX, closantel [CCN] + TX, coumafos (174) + TX, crotamitón [CCN] + TX, crotiofos (1010) + TX, cufranab (1013) + TX, ciantoato (1020) + TX, ciflumetofeno (n.º de Reg. CAS: 400882-07-7) + TX, cihalotrina (196) + TX, cihexatina (199) + TX, cipermetrina (201) + TX, DCPM (1032) + TX, DDT (219) + TX, demefión (1037) + TX, demefión-O (1037) + TX, demefión-S (1037) + TX, demetón (1038) + TX, demetón-metilo (224) + TX, demetón-O (1038) + TX, demetón-O-metilo (224) + TX, demetón-S (1038) + TX, demetón-S-metilo (224) + TX, demetón-S-metilsulfona (1039) + TX, diafentiurón (226) + TX, dialifos (1042) + TX, diazinon (227) + TX, diclofluanida (230) + TX, diclorvos (236) + TX, diclifos + TX, dicofol (242) + TX, dicrotofos (243) + TX, dienoclor (1071) + TX, dimefox (1081) + TX, dimetoato (262) + TX, dinactina (653) + TX, dinex (1089) + TX, dinex-diclexina (1089) + TX, dinobutón (269) + TX, dinocap (270) + TX, dinocap-4 [CCN] + TX, dinocap-6 [CCN] + TX, dinoción (1090) + TX, dinopentón (1092) + TX, dinosulfón (1097) + TX, dinoterbón (1098) + TX, dioxatión (1102) + TX, difenilsulfona (nombre según la IUPAC) (1103) + TX, disulfiram [CCN] + TX, disulfotón (278) + TX, DNOC (282) + TX, dofenapina (1113) + TX, doramectina [CCN] + TX, endosulfano (294) + TX, endotió (1121) + TX, EPN (297) + TX, eprinomectina [CCN] + TX, etiona (309) + TX, etoato-metilo (1134) + TX, etoxazol (320) + TX, etrimfos (1142) + TX, fenazaflor (1147) + TX, fenazaquina (328) + TX, óxido de fenbutatina (330) + TX, fenotiocarb (337) + TX, fenpropatrina (342) + TX, fenpirad + TX, fenpíroximato (345) + TX, fensón (1157) + TX, fentripanilo (1161) + TX, fenvalerato (349) + TX, fipronilo (354) + TX, fluacripirim (360) + TX, fluazurón (1166) + TX, flubenzimina (1167) + TX, flucicloخور (366) + TX, flucitrinato (367) + TX, fluenetilo (1169) + TX, flufenoxurón (370) + TX, flumetrina (372) + TX, fluorbensida (1174) + TX, fluvalinato (1184) + TX, FMC 1137 (código de desarrollo) (1185) + TX, formetanato (405) + TX, clorhidrato de formetanato (405) + TX, formotió (1192) + TX, formparanato (1193) + TX, gamma-HCH (430) + TX, gliodina (1205) + TX, halfenprox (424) + TX, heptenofos (432) + TX, ciclopropanocarboxilato de hexadecilo (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1216) + TX, hexitiazox (441) + TX, yodometano (nombre según la IUPAC) (542) + TX, isocarbofos (473) + TX, *O*-(metoxiaminotiofosforil)salicilato de isopropilo (nombre de la IUPAC) (473) + TX, ivermectina [CCN] + TX, jasmolina I (696) + TX, jasmolina II (696) + TX, jodfenfos (1248) + TX, lindano (430) + TX, lufenurón (490) + TX, malatió (492) + TX, malonobeno (1254) + TX, mecarbam (502) + TX, mefosfolano (1261) + TX, mesulfeno [CCN] + TX, metacriofos (1266) + TX, metamidofos (527) + TX, metidatió (529) + TX, metiocarb (530) + TX, metomilo (531) + TX, bromuro de metilo (537) + TX, metolcarb (550) + TX, mevinfos (556) + TX, mexacarbato (1290) + TX, milbemectina (557) + TX, milbemicina oxima [CCN] + TX, mipafox (1293) + TX, monocrotofos (561) + TX, morfotió (1300) + TX, moxidectina

- [CCN] + TX, naled (567) + TX, NC-184 (código de compuesto) + TX, NC-512 (código de compuesto) + TX, nifluridida (1309) + TX, nikkomicinas [CCN] + TX, nitrilacarb (1313) + TX, complejo de nitrilacarb y cloruro de cinc 1:1 (1313) + TX, NNI-0101 (código de compuesto) + TX, NNI-0250 (código de compuesto) + TX, ometoato (594) + TX, oxamilo (602) + TX, oxideprofos (1324) + TX, oxidisulfotón (1325) + TX, pp'-DDT (219) + TX, paratión (615) + TX, permetrina (626) + TX, aceites del petróleo (628) + TX, fenkaptón (1330) + TX, fentoato (631) + TX, forato (636) + TX, fosalona (637) + TX, fosfolán (1338) + TX, fosmet (638) + TX, fosfamidón (639) + TX, foxim (642) + TX, pirimifos-metilo (652) + TX, policloroterpenos (nombre tradicional) (1347) + TX, polinactinas (653) + TX, proclonol (1350) + TX, profenofos (662) + TX, promacilo (1354) + TX, propargita (671) + TX, propetamfos (673) + TX, propoxur (678) + TX, protidatión (1360) + TX, protoato (1362) + TX, piretrina I (696) + TX, piretrina II (696) + TX, piretrinas (696) + TX, piridabeno (699) + TX, piridafentión (701) + TX, pirimidifeno (706) + TX, pirimitato (1370) + TX, quinalfos (711) + TX, quintiofos (1381) + TX, R-1492 (código de desarrollo) (1382) + TX, RA-17 (código de desarrollo) (1383) + TX, rotenona (722) + TX, escradán (1389) + TX, sebufos + TX, selamectina [CCN] + TX, SI-0009 (código de compuesto) + TX, sofamida (1402) + TX, espirodiclofeno (738) + TX, espiromesifeno (739) + TX, SSI-121 (código de desarrollo) (1404) + TX, sulfiram [CCN] + TX, sulfluramid (750) + TX, sulfotep (753) + TX, azufre (754) + TX, SZI-121 (código de desarrollo) (757) + TX, tau-fluvalinato (398) + TX, tebufenpirad (763) + TX, TEPP (1417) + TX, terbam + TX, tetraclorvinfos (777) + TX, tetradifon (786) + TX, tetranactina (653) + TX, tetrasul (1425) + TX, tiafenox + TX, tiocarboxima (1431) + TX, tiofanox (800) + TX, tiometón (801) + TX, tioquinox (1436) + TX, turingiensina [CCN] + TX, triamifos (1441) + TX, triaratenó (1443) + TX, triazofos (820) + TX, triazurón + TX, triclorfón (824) + TX, trifenofos (1455) + TX, trinactina (653) + TX, vamidotión (847) + TX, vaniliprol [CCN] e YI-5302 (código del compuesto) + TX,
- un algicida seleccionado del grupo de sustancias constituido por betoxazina [CCN] + TX, dioctanoato de cobre (nombre según la IUPAC) (170) + TX, sulfato de cobre (172) + TX, cibutrina [CCN] + TX, diclono (1052) + TX, diclorofeno (232) + TX, endotal (295) + TX, fentina (347) + TX, cal hidratada [CCN] + TX, nabam (566) + TX, quinoclamina (714) + TX, quinonamida (1379) + TX, simazina (730) + TX, acetato de trifenilestaño (nombre según la IUPAC) (347) e hidróxido de trifenilestaño (nombre según la IUPAC) (347) + TX,
- un antihelmíntico seleccionado del grupo de sustancias constituido por abamectina (1) + TX, crufomato (1011) + TX, doramectina [CCN] + TX, emamectina (291) + TX, benzoato de emamectina (291) + TX, eprinomectina [CCN] + TX, ivermectina [CCN] + TX, milbemicina oxima [CCN] + TX, moxidectina [CCN] + TX, piperazina [CCN] + TX, selamectina [CCN] + TX, espinosad (737) y tiofanato (1435) + TX,
- un avicida seleccionado del grupo de sustancias constituido por cloralosa (127) + TX, endrina (1122) + TX, fentiona (346) + TX, piridin-4-amina (nombre según la IUPAC) (23) y estricnina (745) + TX,
- un bactericida seleccionado del grupo de sustancias constituido por 1-hidroxi-1*H*-piridin-2-tiona (nombre según la IUPAC) (1222) + TX, 4-(quinoxalin-2-ilamino)bencenosulfonamida (nombre según la IUPAC) (748) + TX, sulfato de 8-hidroxiquinolina (446) + TX, bronopol (97) + TX, dioctanoato de cobre (nombre según la IUPAC) (170) + TX, hidróxido de cobre (nombre según la IUPAC) (169) + TX, cresol [CCN] + TX, diclorofeno (232) + TX, dipiritiona (1105) + TX, dodicina (1112) + TX, fenaminosulf (1144) + TX, formaldehído (404) + TX, hidrargafeno [CCN] + TX, kasugamicina (483) + TX, clorhidrato de kasugamicina hidrato (483) + TX, bis(dimetilditiocarbamato) de níquel (nombre según la IUPAC) (1308) + TX, nitrapirina (580) + TX, octilnona (590) + TX, ácido oxolínico (606) + TX, oxitetraciclina (611) + TX, hidroxiquinolinsulfato de potasio (446) + TX, probenazol (658) + TX, estreptomina (744) + TX, sesquisulfato de estreptomina (744) + TX, tecloftalam (766) + TX, y tiomersal [CCN] + TX,
- un agente biológico seleccionado del grupo de sustancias que consiste en *Adoxophyes orana* GV (12) + TX, *Agrobacterium radiobacter* (13) + TX, *Amblyseius* spp. (19) + TX, *Anagrapha falcifera* NPV (28) + TX, *Anagrus atomus* (29) + TX, *Aphelinus abdominalis* (33) + TX, *Aphidius colemani* (34) + TX, *Aphidoletes aphidimyza* (35) + TX, *Autographa californica* NPV (38) + TX, *Bacillus firmus* (48) + TX, *Bacillus sphaericus* Neide (nombre científico) (49) + TX, *Bacillus thuringiensis* Berliner (nombre científico) (51) + TX, *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai* (nombre científico) (51) + TX, *Bacillus thuringiensis* subsp. *israelensis* (nombre científico) (51) + TX, *Bacillus thuringiensis* subsp. *japonensis* (nombre científico) (51) + TX, *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki* (nombre científico) (51) + TX, *Bacillus thuringiensis* subsp. *tenebrionis* (nombre científico) (51) + TX, *Beauveria bassiana* (53) + TX, *Beauveria brongniartii* (54) + TX, *Chrysoperla carnea* (151) + TX, *Cryptolaemus montrouzieri* (178) + TX, *Cydia pomonella* GV (191) + TX, *Dacnusa sibirica* (212) + TX, *Diglyphus isaea* (254) + TX, *Encarsia formosa* (nombre científico) (293) + TX, *Eretmocerus eremicus* (300) + TX, *Helicoverpa zea* NPV (431) + TX, *Heterorhabditis bacteriophora* and *H. megidis* (433) + TX, *Hippodamia convergens* (442) + TX, *Leptomastix dactylopii* (488) + TX, *Macrolophus caliginosus* (491) + TX, *Mamestra brassicae* NPV (494) + TX, *Metaphycus helvolus* (522) + TX, *Metarhizium anisopliae* var. *acidum* (nombre científico) (523) + TX, *Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae* (nombre científico) (523) + TX, *Neodiprion sertifer* NPV y *N. lecontei* NPV (575) + TX, *Orius* spp. (596) + TX, *Paecilomyces fumosoroseus* (613) + TX, *Phytoseiulus persimilis* (644) + TX, virus de la polihedrosis nuclear multicapsídico por *Spodoptera exigua* (nombre científico) (741) + TX, *Steinernema bibionis* (742) + TX, *Steinernema carpocapsae* (742) + TX, *Steinernema feltiae* (742) + TX, *Steinernema glaseri* (742) + TX, *Steinernema riobrave* (742) + TX, *Steinernema riobravense* (742) + TX, *Steinernema*

scapterisci (742) + TX, *Steinernema* spp. (742) + TX, *Trichogramma* spp. (826) + TX, *Typhlodromus occidentalis* (844) y *Verticillium lecanii* (848) + TX,

un esterilizante del suelo seleccionado del grupo de sustancias que consiste en yodometano (nombre según la IUPAC) (542) y bromuro de metilo (537) + TX,

5 un quimioesterilizante seleccionado del grupo de sustancias que consiste en afolato [CCN] + TX, bisazir [CCN] + TX, busulfán [CCN] + TX, diflubenzurón (250) + TX, dimatif [CCN] + TX, hemel [CCN] + TX, hempa [CCN] + TX, metepa [CCN] + TX, metiotepa [CCN] + TX, afolato de metilo [CCN] + TX, morzid [CCN] + TX, penflurón [CCN] + TX, tepa [CCN] + TX, tiohempa [CCN] + TX, tiotepa [CCN] + TX, tretamina [CCN] y uredepa [CCN] + TX,

10 una feromona de insecto seleccionada del grupo de sustancias que consiste en acetato de (*E*)-dec-5-en-1-ilo con (*E*)-dec-5-en-1-ol (nombre según la IUPAC) (222) + TX, acetato de (*E*)-tridec-4-en-1-ilo (nombre según la IUPAC) (829) + TX, (*E*)-6-metilhept-2-en-4-ol (nombre según la IUPAC) (541) + TX, acetato de (*E,Z*)-tetradeca-4,10-dien-1-ilo (nombre según la IUPAC) (779) + TX, acetato de (*Z*)-dodec-7-en-1-ilo (nombre según la IUPAC) (285) + TX, (*Z*)-hexadec-11-enal (nombre según la IUPAC) (436) + TX, acetato de (*Z*)-hexadec-11-en-1-ilo (nombre según la IUPAC) (437) + TX, acetato de (*Z*)-hexadec-13-en-11-in-1-ilo (nombre según la IUPAC) (438) + TX, (*Z*)-icos-13-en-10-ona (nombre según la IUPAC) (448) + TX, (*Z*)-tetradec-7-en-1-al (nombre según la IUPAC) (782) + TX, (*Z*)-tetradec-9-en-1-ol (nombre según la IUPAC) (783) + TX, acetato de (*Z*)-tetradec-9-en-1-ilo (nombre según la IUPAC) (784) + TX, acetato de (*7E,9Z*)-dodeca-7,9-dien-1-ilo (nombre según la IUPAC) (283) + TX, acetato de (*9Z,11E*)-tetradeca-9,11-dien-1-ilo (nombre según la IUPAC) (780) + TX, acetato de (*9Z,12E*)-tetradeca-9,12-dien-1-ilo (nombre según la IUPAC) (781) + TX, 14-metiloctadec-1-eno (nombre según la IUPAC) (545) + TX, 4-metilnonan-5-ol con 4-metilnonan-5-ona (nombre según la IUPAC) (544) + TX, alfa-multistriatina [CCN] + TX, brevicomina [CCN] + TX, codlelura [CCN] + TX, codlemona (167) + TX, cuclura (179) + TX, dispartlura (277) + TX, acetato de dodec-8-en-1-ilo (nombre según la IUPAC) (286) + TX, acetato de dodec-9-en-1-ilo (nombre según la IUPAC) (287) + TX, dodeca-8 + TX, acetato de 10-dien-1-ilo (nombre según la IUPAC) (284) + TX, dominicalura [CCN] + TX, 4-metiocetanoato de etilo (nombre según la IUPAC) (317) + TX, eugenol [CCN] + TX, frontalina [CCN] + TX, gossiplura (420) + TX, grandlura (421) + TX, grandlura I (421) + TX, grandlura II (421) + TX, grandlura III (421) + TX, grandlura IV (421) + TX, hexalura [CCN] + TX, ipsdienol [CCN] + TX, ipsenol [CCN] + TX, japonilura (481) + TX, lineatina [CCN] + TX, litlura [CCN] + TX, looplura [CCN] + TX, medlura [CCN] + TX, ácido megatomoico [CCN] + TX, metil eugenol (540) + TX, muscalura (563) + TX, acetato de octadeca-2,13-dien-1-ilo (nombre según la IUPAC) (588) + TX, acetato de octadeca-3,13-dien-1-ilo (nombre según la IUPAC) (589) + TX, orfralura [CCN] + TX, orictalura (317) + TX, ostramona [CCN] + TX, siglura [CCN] + TX, sordidina (736) + TX, sulcatol [CCN] + TX, acetato de tetradec-11-en-1-ilo (nombre según la IUPAC) (785) + TX, trimedlura (839) + TX, trimedlura A (839) + TX, trimedlura B₁ (839) + TX, trimedlura B₂ (839) + TX, trimedlura C (839) y trunc-call [CCN] + TX,

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

40 un insecticida seleccionado del grupo de sustancias que consiste en 1-dicloro-1-nitroetano (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1058) + TX, 1,1-dicloro-2,2-bis(4-etilfenil)etano (nombre según la IUPAC) (1056), + TX, 1,2-dicloropropano (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1062) + TX, 1,2-dicloropropano con 1,3-dicloropropeno (nombre según la IUPAC) (1063) + TX, 1-bromo-2-cloroetano (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (916) + TX, acetato de 2,2,2-tricloro-1-(3,4-diclorofenil)etilo (nombre según la IUPAC) (1451) + TX, metilfosfato de 2,2-diclorovinilo y 2-etilsulfinitilo (nombre según la IUPAC) (1066) + TX, dimetilcarbamato de 2-(1,3-ditiolan-2-il)fenilo (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1109) + TX, tiocianato de 2-(2-butoxi)etilo (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (935) + TX, metilcarbamato de 2-(4,5-dimetil-1,3-dioxolan-2-il)fenilo (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1084) + TX, 2-(4-cloro-3,5-xililoxi)etanol (nombre según la IUPAC) (986) + TX, fosfato de 2-clorovinil dietilo (nombre según la IUPAC) (984) + TX, 2-imidazolidona (nombre según la IUPAC) (1225) + TX, 2-isovalerilindan-1,3-diona (nombre según la IUPAC) (1246) + TX, metilcarbamato de 2-metil(prop-2-inil)aminofenilo (nombre según la IUPAC) (1284) + TX, laurato de 2-tiocianatoetilo (nombre según la IUPAC) (1433) + TX, 3-bromo-1-cloroprop-1-eno (nombre según la IUPAC) (917) + TX, dimetilcarbamato de 3-metil-1-fenilpirazol-5-ilo (nombre según la IUPAC) (1283) + TX, metilcarbamato de 4-metil(prop-2-inil)amino-3,5-xililo (nombre según la IUPAC) (1285) + TX, dimetilcarbamato de 5,5-dimetil-3-oxociclohex-1-enilo (nombre según la IUPAC) (1085) + TX, abamectina (1) + TX, acefato (2) + TX, acetamiprid (4) + TX, acetona [CCN] + TX, acetoprol [CCN] + TX, acrinatrina (9) + TX, acrilonitrilo (nombre según la IUPAC) (861) + TX, alanicarb (15) + TX, aldnicarb (16) + TX, aldnicarb (863) + TX, aldrina (864) + TX, aletrina (17) + TX, alosamidina [CCN] + TX, alixicarb (866) + TX, alfa-cipermetrina (202) + TX, alfa-ecdisona [CCN] + TX, fosforo de aluminio (640) + TX, amiditió (870) + TX, amidotiato (872) + TX, aminocarb (873) + TX, amitón (875) + TX, hidrogenooxalato de amitón (875) + TX, amitraz (24) + TX, anabasina (877) + TX, atidatió (883) + TX, AVI 382

(código de compuesto) + TX, AZ 60541 (código de compuesto) + TX, azadiractina (41) + TX, azametifos (42) + TX, azinfos-etilo (44) + TX, azinfos-metilo (45) + TX, azotoato (889) + TX, delta endotoxinas de *Bacillus thuringiensis* (52) + TX, hexafluorosilicato de bario [CCN] + TX, polisulfuro de bario (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (892) + TX, bartrina [CCN] + TX, Bayer 22/190 (código de desarrollo) (893) + TX, Bayer 22408 (código de desarrollo) (894) + TX, bendiocarb (58) + TX, benfurcarb (60) + TX, bensultap (66) + TX, beta-ciflutrina (194) + TX, beta-cipermetrina (203) + TX, bifentrina (76) + TX, bioaletrina (78) + TX, isómero de bioaletrina S-ciclopentenilo (79) + TX, bioetanometrina [CCN] + TX, biopermetrina (908) + TX, bioesmetrina (80) + TX, Bis(2-cloroetil) éter (nombre según la IUPAC) (909) + TX, bistrifluron (83) + TX, bórax (86) + TX, brofenvalerato + TX, bromfenvinfos (914) + TX, bromocicleno (918) + TX, bromo-DDT [CCN] + TX, bromofos (920) + TX, bromofos-etilo (921) + TX, bufencarb (924) + TX, buprofenzina (99) + TX, butacarb (926) + TX, butatíofos (927) + TX, butocarboxim (103) + TX, butonato (932) + TX, butoxicarboxim (104) + TX, butilpiridabeno + TX, cadusafos (109) + TX, arseniato de calcio [CCN] + TX, cianuro de calcio (444) + TX, polisulfuro de calcio (nombre según la IUPAC) (111) + TX, camfeclor (941) + TX, carbanolato (943) + TX, carbarilo (115) + TX, carbofurano (118) + TX, disulfuro de carbono (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (945) + TX, tetracloruro de carbono (nombre según la IUPAC) (946) + TX, carbofenotión (947) + TX, carbosulfán (119) + TX, cartap (123) + TX, clorhidrato de cartap (123) + TX, cevadina (725) + TX, clorbicicleno (960) + TX, clordano (128) + TX, clordecona (963) + TX, clordimeform (964) + TX, clorhidrato de clordimeform (964) + TX, cloretoxifos (129) + TX, clorfenapir (130) + TX, clorfenvinfos (131) + TX, clorfluzurón (132) + TX, clormefos (136) + TX, clorformo [CCN] + TX, cloropicrina (141) + TX, clorfoxim (989) + TX, clorprazofos (990) + TX, cloropirifos (145) + TX, cloropirifos-metilo (146) + TX, clortíofos (994) + TX, cromafenozida (150) + TX, cinerina I (696) + TX, cinerina II (696) + TX, cinerinas (696) + TX, cis-resmetrina + TX, cismetrina (80) + TX, clocitrina + TX, cloetocarb (999) + TX, closantel [CCN] + TX, clotianidina (165) + TX, acetoarsenito de cobre [CCN] + TX, arseniato de cobre [CCN] + TX, oleato de cobre [CCN] + TX, coumafos (174) + TX, coumitoato (1006) + TX, crotamitón [CCN] + TX, crotóxifos (1010) + TX, crufomato (1011) + TX, criolita (177) + TX, CS 708 (código de desarrollo) (1012) + TX, cianofenos (1019) + TX, cianofos (184) + TX, cianoato (1020) + TX, cicletrina [CCN] + TX, cicloprotrina (188) + TX, ciflutrina (193) + TX, cihalotrina (196) + TX, cipermetrina (201) + TX, cifenotrina (206) + TX, ciromazina (209) + TX, citioato [CCN] + TX, *d*-limoneno [CCN] + TX, *d*-tetrametrina (788) + TX, DAEP (1031) + TX, dazomet (216) + TX, DDT (219) + TX, decarbofurano (1034) + TX, deltametrina (223) + TX, demefión (1037) + TX, demefión-O (1037) + TX, demefión-S (1037) + TX, demetón (1038) + TX, demetón-metilo (224) + TX, demetón-O (1038) + TX, demetón-O-metilo (224) + TX, demetón-S (1038) + TX, demetón-S-metilo (224) + TX, demetón-S-metilsulfona (1039) + TX, diafentiurón (226) + TX, dialifos (1042) + TX, diamidafos (1044) + TX, diazinon (227) + TX, dicaptón (1050) + TX, diclofentión (1051) + TX, diclorvos (236) + TX, diclifos + TX, dicresilo [CCN] + TX, dicrotofos (243) + TX, diciclanilo (244) + TX, dieldrina (1070) + TX, fosfato de dietil 5-metilpirazol-3-ilo (nombre según la IUPAC) (1076) + TX, diflubenzurón (250) + TX, dilor [CCN] + TX, dimeflutrina [CCN] + TX, dimefox (1081) + TX, dimetán (1085) + TX, dimetoato (262) + TX, dimetrina (1083) + TX, dimetilvinfos (265) + TX, dimetilan (1086) + TX, dinex (1089) + TX, dinex-diclexina (1089) + TX, dinoprop (1093) + TX, dinosam (1094) + TX, dinoseb (1095) + TX, dinotefurano (271) + TX, diofenolán (1099) + TX, dioxabenzofos (1100) + TX, dioxacarb (1101) + TX, dioxatión (1102) + TX, disulfotón (278) + TX, diticrofos (1108) + TX, DNOC (282) + TX, doramectina [CCN] + TX, DSP (1115) + TX, ecdisterona [CCN] + TX, EI 1642 (código de desarrollo) (1118) + TX, emamectina (291) + TX, benzoato de emamectina (291) + TX, EMPC (1120) + TX, empentrina (292) + TX, endosulfano (294) + TX, endotión (1121) + TX, endrina (1122) + TX, EPBP (1123) + TX, EPN (297) + TX, epofenonano (1124) + TX, eprinomectina [CCN] + TX, esfenvalerato (302) + TX, etafos [CCN] + TX, etiofencarb (308) + TX, etiona (309) + TX, etiprol (310) + TX, etoato-metilo (1134) + TX, etoprofos (312) + TX, formiato de etilo (nombre según la IUPAC) [CCN] + TX, etil-DDD (1056) + TX, dibromuro de etileno (316) + TX, dicloruro de etileno (nombre químico) (1136) + TX, óxido de etileno [CCN] + TX, etofenprox (319) + TX, etrimfos (1142) + TX, EXD (1143) + TX, famfur (323) + TX, fenamifos (326) + TX, fenazaflor (1147) + TX, fenclorfos (1148) + TX, fenetacarb (1149) + TX, fenflutrina (1150) + TX, fenitrotión (335) + TX, fenobucarb (336) + TX, fenoxacrim (1153) + TX, fenoxicarb (340) + TX, fenpiritrina (1155) + TX, fenpropatrina (342) + TX, fempirad + TX, fensulfotión (1158) + TX, fentiona (346) + TX, fentió-etilo [CCN] + TX, fenvalerato (349) + TX, fipronilo (354) + TX, flonicamid (358) + TX, flubendiamida (CAS. Nº Reg.: 272451-65-7) + TX, flucofurona (1168) + TX, flucicloخورon (366) + TX, flucitrinato (367) + TX, fluenetilo (1169) + TX, flufenerim [CCN] + TX, flufenoxurón (370) + TX, flufenprox (1171) + TX, flumetrina (372) + TX, fluvalinato (1184) + TX, FMC 1137 (código de desarrollo) (1185) + TX, fonofos (1191) + TX, formetanato (405) + TX, clorhidrato de formetanato (405) + TX, formotion (1192) + TX, formparanato (1193) + TX, fosmetilán (1194) + TX, fospirato (1195) + TX, fostiazato (408) + TX, fostietán (1196) + TX, furaticarb (412) + TX, furetrina (1200) + TX, gamma-cihalotrina (197) + TX, gamma-HCH (430) + TX, guazatina (422) + TX, acetatos de guazatina (422) + TX, GY-81 (código de desarrollo) (423) + TX, halfenprox (424) + TX, halofenozida (425) + TX, HCH (430) + TX, HEOD (1070) + TX, heptaclor (1211) + TX, heptenofos (432) + TX, heterofos [CCN] + TX, hexaflumurón (439) + TX, HHDN (864) + TX, hidrametilnona (443) + TX, cianuro de hidrógeno (444) + TX, hidropreno (445) + TX, hiquincarb (1223) + TX, imidacloprid (458) + TX, imiprotrina (460) + TX, indoxacarb (465) + TX, yodometano (nombre según la IUPAC) (542) + TX, IPSP (1229) + TX, isazofos (1231) + TX, isobenzán (1232) + TX, isocarbofos (473) + TX, isodrina (1235) + TX, isofenfos (1236) + TX, isolano (1237) + TX, isoprocarb (472) + TX, O-(metoxiaminotiofosforil)salicilato de isopropilo nombre de la IUPAC) (473) + TX, isotriolano (474) + TX, isotioato (1244) + TX, isoxatión (480) + TX, ivermectina [CCN] + TX, jasmolina I (696) + TX, jasmolina II (696) + TX, jodfenfos (1248) + TX, hormona juvenil I [CCN] + TX,

hormona juvenil II [CCN] + TX, hormona juvenil III [CCN] + TX, keleván (1249) + TX, kinopreno (484) + TX, lambda-
 cihalotrina (198) + TX, arsenato de plomo [CCN] + TX, lepimectina (CCN) + TX, leptofos (1250) + TX, lindano (430) +
 TX, lirimfos (1251) + TX, lufenurón (490) + TX, litidación (1253) + TX, metilcarbamato de *m*-cumenilo (nombre según la
 5 IUPAC) (1014) + TX, fosfuro de magnesio (nombre según la IUPAC) (640) + TX, malatión (492) + TX, malonobeno
 (1254) + TX, mazidox (1255) + TX, mecarbam (502) + TX, mecarfón (1258) + TX, menazón (1260) + TX, mefosfolano
 (1261) + TX, cloruro mercurioso (513) + TX, mesulfenos (1263) + TX, metaflumizona (CCN) + TX, metam (519) + TX,
 metam-potasio (519) + TX, metam-sodio (519) + TX, metacrifos (1266) + TX, metamidofos (527) + TX, fluoruro de
 10 metanosulfonilo (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1268) + TX, metidación (529) + TX, metiocarb (530) +
 TX, metocrotofos (1273) + TX, metomilo (531) + TX, metopreno (532) + TX, metoquin-butilo (1276) + TX, metotrina
 (533) + TX, metoxiclor (534) + TX, metoxifenoazida (535) + TX, bromuro de metilo (537) + TX, isotiocianato de metilo
 (543) + TX, metilcloroformo [CCN] + TX, cloruro de metileno [CCN] + TX, metoflutrina [CCN] + TX, metolcarb (550) +
 TX, metoxadiazona (1288) + TX, mevinfos (556) + TX, mexacarbato (1290) + TX, milbemectina (557) + TX,
 milbemicina oxima [CCN] + TX, mipafox (1293) + TX, mirex (1294) + TX, monocrotofos (561) + TX, morfotión (1300) +
 15 TX, moxidectina [CCN] + TX, naftalofos [CCN] + TX, naled (567) + TX, naftaleno (nombre según la IUPAC/Chemical
 Abstracts) (1303) + TX, NC-170 (código de desarrollo) (1306) + TX, NC-184 (código de compuesto) + TX, nicotina
 (578) + TX, sulfato de nicotina (578) + TX, nifluridida (1309) + TX, nitenpiram (579) + TX, nitiazina (1311) + TX,
 nitrilacarb (1313) + TX, complejo de nitrilacarb y cloruro de cinc 1:1 (1313) + TX, NNI-0101 (código de compuesto) +
 TX, NNI-0250 (código de compuesto) + TX, nornicotina (nombre tradicional) (1319) + TX, novalurón (585) + TX,
 20 noviflumurón (586) + TX, etilfosfonotioato de *O*-5-dicloro-4-yodofenil *O*-etilo (nombre según la IUPAC) (1057) + TX,
 fosforotioato de *O,O*-dietil *O*-4-metil-2-oxo-2*H*-cromen-7-ilo (nombre según la IUPAC) (1074) + TX, fosforotioato de *O,O*-
 dietil *O*-6-metil-2-propilpirimidin-4-ilo (nombre según la IUPAC) (1075) + TX, ditiopirofosfato de *O,O,O,O*-tetrapropilo
 (nombre IUPAC) (1424) + TX, ácido oleico (nombre según la IUPAC) (593) + TX, ometoato (594) + TX, oxamilo (602) +
 TX, oxidemetón-metilo (609) + TX, oxideprofos (1324) + TX, oxidisulfotón (1325) + TX, pp'-DDT (219) + TX, para-
 25 diclorobenceno [CCN] + TX, paratión (615) + TX, paratión-metilo (616) + TX, penflurón [CCN] + TX, pentaclorofenol
 (623) + TX, laurato de pentaclorofenilo (nombre según la IUPAC) (623) + TX, permetrina (626) + TX, aceites del
 petróleo (628) + TX, PH 60-38 (código de desarrollo) (1328) + TX, fenkaptón (1330) + TX, fenotrina (630) + TX,
 fentoato (631) + TX, forato (636) + TX, fosalona (637) + TX, fosfolán (1338) + TX, fosmet (638) + TX, fosnicloro (1339)
 + TX, fosfamidón (639) + TX, fosfina (nombre según la IUPAC) (640) + TX, foxim (642) + TX, foxim-metilo (1340) + TX,
 30 pirimetafos (1344) + TX, pirimicarb (651) + TX, pirimifos-etilo (1345) + TX, pirimifos-metilo (652) + TX, isómeros de
 policlorodieciclopentadieno (nombre según la IUPAC) (1346) + TX, policloroterpenos (nombre tradicional) (1347) + TX,
 arsenito de potasio [CCN] + TX, tiocianato de potasio [CCN] + TX, praletrina (655) + TX, precoceno I [CCN] + TX,
 precoceno II [CCN] + TX, precoceno III [CCN] + TX, primidofos (1349) + TX, profenofos (662) + TX, proflutrina [CCN] +
 TX, promacilo (1354) + TX, promecarb (1355) + TX, propafos (1356) + TX, propetamfos (673) + TX, propoxur (678) +
 TX, protidación (1360) + TX, protiofos (686) + TX, protoato (1362) + TX, protrifenbuto [CCN] + TX, pimetozina (688) +
 35 TX, piraclafos (689) + TX, pirazofos (693) + TX, piresmetrina (1367) + TX, piretrina I (696) + TX, piretrina II (696) +
 TX, piretrinas (696) + TX, piridabeno (699) + TX, piridalilo (700) + TX, piridafentión (701) + TX, pirimidifeno (706) +
 TX, pirimitato (1370) + TX, piriproxifeno (708) + TX, quassia [CCN] + TX, quinalfos (711) + TX, quinalfos-metilo (1376)
 + TX, quinotiona (1380) + TX, quintiofos (1381) + TX, R-1492 (código de desarrollo) (1382) + TX, rafoxanida [CCN] +
 TX, resmetrina (719) + TX, rotenona (722) + TX, RU 15525 (código de desarrollo) (723) + TX, RU 25475 (código de
 40 desarrollo) (1386) + TX, riania (1387) + TX, rianodina (nombre tradicional) (1387) + TX, sabadilla (725) + TX, escradán
 (1389) + TX, sebufos + TX, selamectina [CCN] + TX, SI-0009 (código de compuesto) + TX, SI-0205 (código de
 compuesto) + TX, SI-0404 (código de compuesto) + TX, SI-0405 (código de compuesto) + TX, silafluofeno (728) + TX,
 SN 72129 (código de desarrollo) (1397) + TX, arseniato de sodio [CCN] + TX, cianuro de sodio (444) + TX, fluoruro de
 sodio (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1399) + TX, hexafluorosilicato de sodio (1400) + TX,
 45 pentaclorofenóxido de sodio (623) + TX, seleniato de sodio (nombre según la IUPAC) (1401) + TX, tiocianato de sodio
 [CCN] + TX, sofamida (1402) + TX, espinosad (737) + TX, espiromesifeno (739) + TX, spirotetmat (CCN) + TX,
 sulcuforon (746) + TX, sulcufurón-sodio (746) + TX, sulfuramid (750) + TX, sulfotep (753) + TX, fluoruro de sulfurilo
 (756) + TX, sulprofos (1408) + TX, aceites de alquitrán (758) + TX, tau-fluvalinato (398) + TX, tazimcarb (1412) + TX,
 50 TDE (1414) + TX, tebufenozida (762) + TX, tebufenpirad (763) + TX, tebupirimfos (764) + TX, teflubenzurón (768) +
 TX, teflutrina (769) + TX, temefos (770) + TX, TEPP (1417) + TX, teraletrina (1418) + TX, terbam + TX, terbufos (773)
 + TX, tetracloroetano [CCN] + TX, tetraclorvinfos (777) + TX, tetrametrina (787) + TX, teta-cipermetrina (204) + TX,
 tiacloprid (791) + TX, tiafenox + TX, tiametoxam (792) + TX, tirofos (1428) + TX, tiocarboxima (1431) + TX, tiociclam
 (798) + TX, hidrógeno-oxalato de tiociclam (798) + TX, tiodicarb (799) + TX, tiofanox (800) + TX, tiometón (801) + TX,
 tionazina (1434) + TX, tiosultap (803) + TX, tiosultap-sodio (803) + TX, turingiensina [CCN] + TX, tolfenpirad (809) +
 55 TX, tralometrina (812) + TX, translutrina (813) + TX, transpermetrina (1440) + TX, triamifos (1441) + TX, triazamato
 (818) + TX, triazofos (820) + TX, triazurón + TX, triclorfón (824) + TX, triclormetafos-3 [CCN] + TX, tricloronat (1452) +
 TX, trifenofos (1455) + TX, triflumurón (835) + TX, trimetacarb (840) + TX, tripreno (1459) + TX, vamidotión (847) +
 TX, vaniliprol [CCN] + TX, veratridina (725) + TX, veratrina (725) + TX, XMC (853) + TX, xililcarb (854) + TX, YI-5302
 (código de compuesto) + TX, zeta-cipermetrina (205) + TX, zetametrina + TX, fosfuro de cinc (640) + TX, zolaprofos
 60 (1469) + TX, ZXI 8901 (código de desarrollo) (858) + TX, ciantraniliprol [736994-63-19] + TX, clorantraniliprol [500008-45-7] +
 TX, cienopirafeno [560121-52-0] + TX, ciflumetofeno [400882-07-7] + TX, pirifluquinazón [337458-27-2] + TX,

espinetoram [187166-40-1 + 187166-15-0] + TX, espirotetramat [203313-25-1] + TX, sulfoxaflor [946578-00-3] + TX, flufiprol [704886-18-0] + TX, meperflutrina [915288-13-0] + TX, tetrametilflutrina [84937-88-2] + TX, Triflumezopirim (descrito en el documento WO 2012/092115) + TX, fluxametamida (documento WO 2007/026965) + TX,

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

un nematocida seleccionado del grupo de sustancias constituido por AKD-3088 (código de compuesto) + TX, 1,2-dibromo-3-cloropropano (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1045) + TX, 1,2-dicloropropano (nombre según la IUPAC/ Chemical Abstracts) (1062) + TX, 1,2-dicloropropano con 1,3-dicloropropeno (nombre según la IUPAC) (1063) + TX, 1,3-dicloropropeno (233) + TX, 3,4-diclorotetrahidrotiofeno 1,1-dióxido (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1065) + TX, 3-(4-clorofenil)-5-metilrodanina (nombre según la IUPAC) (980) + TX, ácido 5-metil-6-tioxo-1,3,5-tiadiazinan-3-ilacético (nombre según la IUPAC) (1286) + TX, 6-isopentenilaminopurina (210) + TX, abamectina (1) + TX, acetoprol [CCN] + TX, alanicarb (15) + TX, aldicarb (16) + TX, aldoxicarb (863) + TX, AZ 60541 (código de compuesto) + TX, benclotiaz [CCN] + TX, benomilo (62) + TX, butilpiridabeno + TX, cadusafos (109) + TX, carbofurano (118) + TX, disulfuro de carbono (945) + TX, carbosulfán (119) + TX, cloropicrina (141) + TX, cloropirifos (145) + TX, cloetocarb (999) + TX, citocininas (210) + TX, dazomet (216) + TX, DBCP (1045) + TX, DCIP (218) + TX, diamidafos (1044) + TX, diclofentión (1051) + TX, diclifos + TX, dimetoato (262) + TX, doramectina [CCN] + TX, emamectina (291) + TX, benzoato de emamectina (291) + TX, eprinomectina [CCN] + TX, etoprofos (312) + TX, dibromuro de etileno (316) + TX, fenamifos (326) + TX, fempirad + TX, fensulfotión (1158) + TX, fostiazato (408) + TX, fostietán (1196) + TX, furfural [CCN] + TX, GY-81 (código de desarrollo) (423) + TX, heterofos [CCN] + TX, yodometano (nombre según la IUPAC) (542) + TX, isamidofos (1230) + TX, isazofos (1231) + TX, ivermectina [CCN] + TX, cinetina (210) + TX, mecarfón (1258) + TX, metam (519) + TX, metam-potasio (519) + TX, metam-sodio (519) + TX, bromuro de metilo (537) + TX, isotiocianato de metilo (543) + TX, milbemicina oxima [CCN] + TX, moxidectina [CCN] + TX, composición de *Myrothecium verrucaria* (565) + TX, NC-184 (código de compuesto) + TX, oxamilo (602) + TX, forato (636) + TX, fosfamidón (639) + TX, fosfocarb [CCN] + TX, sebufos + TX, selamectina [CCN] + TX, espinosad (737) + TX, terbam + TX, terbufos (773) + TX, tetraclorotiofeno (nombre según la IUPAC/ Chemical Abstracts) (1422) + TX, tiafenox + TX, tionazina (1434) + TX, triazofos (820) + TX, triazurón + TX, xilenoles [CCN] + TX, YI-5302 (código de compuesto) y zeatina (210) + TX, fluensulfona [318290-98-1] + TX,

un inhibidor de la nitrificación seleccionado del grupo de sustancias que consiste en etilxantato potásico [CCN] y nitrapirina (580) + TX,

un activador vegetal seleccionado del grupo de sustancias que consiste en acibenzolar (6) + TX, acibenzolar-S-metilo (6) + TX, probenazol (658) y extracto de *Reynoutria sachalinensis* (720) + TX,

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

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

- un repelente de animales seleccionado del grupo de sustancias que consiste en antraquinona (32) + TX, cloralosa (127) + TX, naftenato de cobre [CCN] + TX, oxiclورو de cobre (171) + TX, diazinon (227) + TX, dicitlopentadieno (nombre químico) (1069) + TX, guazatina (422) + TX, acetatos de guazatina (422) + TX, metiocarb (530) + TX, piridin-4-amina (nombre según la IUPAC) (23) + TX, tiram (804) + TX, trimetacarb (840) + TX, naftenato de cinc [CCN] y ziram (856) + TX,
- 5 un virucida seleccionado del grupo de sustancias que consiste en manina [CCN] y ribavirina [CCN] + TX,
- un protector de lesiones seleccionado del grupo de sustancias que consiste en óxido de mercurio (512) + TX, octilina (590) y tiofanato-metilo (802) + TX,
- 10 y compuestos biológicamente activos seleccionados del grupo que consiste en azaconazol [60207-31-0] + TX, bitertanol [70585-36-3] + TX, bromuconazol [116255-48-2] + TX, ciproconazol [94361-06-5] + TX, difenoconazol [119446-68-3] + TX, diniconazol [83657-24-3] + TX, epoxiconazol [106325-08-0] + TX, fenbuconazol [114369-43-6] + TX, fluquinconazol [136426-54-5] + TX, flusilazol [85509-19-9] + TX, flutriafof [76674-21-0] + TX, hexaconazol [79983-71-4] + TX, imazalilo [35554-44-0] + TX, imibenconazol [86598-92-7] + TX, ipconazol [125225-28-7] + TX, metconazol [125116-23-6] + TX, miclobutanilo [88671-89-0] + TX, pefurazoato [101903-30-4] + TX, penconazol [66246-88-6] + TX,
- 15 protioconazol [178928-70-6] + TX, pirifenox [88283-41-4] + TX, procloraz [67747-09-5] + TX, propiconazol [60207-90-1] + TX, simeconazol [149508-90-7] + TX, tebuconazol [107534-96-3] + TX, tetraconazol [112281-77-3] + TX, triadimefón [43121-43-3] + TX, triadimenol [55219-65-3] + TX, triflumizol [99387-89-0] + TX, triticonazol [131983-72-7] + TX, ancimidol [12771-68-5] + TX, fenarimol [60168-88-9] + TX, nuarimol [63284-71-9] + TX, bupirimato [41483-43-6] + TX, dimetirimol [5221-53-4] + TX, etirimol [23947-60-6] + TX, dodemorf [1593-77-7] + TX, fenpropidina [67306-00-7] + TX,
- 20 fenpropimorf [67564-91-4] + TX, espiroxamina [118134-30-8] + TX, tridemorf [81412-43-3] + TX, ciprodinilo [121552-61-2] + TX, mepanipirim [110235-47-7] + TX, pirimetanilo [53112-28-0] + TX, fencpiclonilo [74738-17-3] + TX, fludioxonilo [131341-86-1] + TX, benalaxilo [71626-11-4] + TX, furalaxilo [57646-30-7] + TX, metalaxilo [57837-19-1] + TX, R-metalaxilo [70630-17-0] + TX, ofurace [58810-48-3] + TX, oxadixilo [77732-09-3] + TX, benomilo [17804-35-2] + TX, carbendazim [10605-21-7] + TX, debacarb [62732-91-6] + TX, fuberidazol [3878-19-1] + TX, tiabendazol [148-79-8] + TX, clozolinato [84332-86-5] + TX, diclozolina [24201-58-9] + TX, iprodiona [36734-19-7] + TX, miclozolina [54864-61-8] + TX, procimidona [32809-16-8] + TX, vinclozolina [50471-44-8] + TX, boscalid [188425-85-6] + TX, carboxina [5234-68-4] + TX, fenfuram [24691-80-3] + TX, flutolanilo [66332-96-5] + TX, mepronilo [55814-41-0] + TX, oxicarboxina [5259-88-1] + TX, pentiopirad [183675-82-3] + TX, tifuluzamida [130000-40-7] + TX, guazatina [108173-90-6] + TX, dodina [2439-10-3] [112-65-2] (base libre) + TX, iminocadina [13516-27-3] + TX, azoxiestrobina [131860-33-8] + TX, dimoxiestrobina [149961-52-4] + TX, enestroburina {Proc. BCPC, Congr. Int., Glasgow, 2003, 1, 93} + TX,
- 30 fluoxaestrobina [361377-29-9] + TX, kresoxim-metilo [143390-89-0] + TX, metominoestrobina [133408-50-1] + TX, trifloxiestrobina [141517-21-7] + TX, orisaestrobina [248593-16-0] + TX, picoxiestrobina [117428-22-5] + TX, piracloestrobina [175013-18-0] + TX, ferbam [14484-64-1] + TX, mancozeb [8018-01-7] + TX, maneb [12427-38-2] + TX, metiram [9006-42-2] + TX, propineb [12071-83-9] + TX, tiram [137-26-8] + TX, zineb [12122-67-7] + TX, ziram [137-30-4] + TX, captafol [2425-06-1] + TX, captan [133-06-2] + TX, diclofluanida [1085-98-9] + TX, fluoroimida [41205-21-4] + TX, folpet [133-07-3] + TX, tolifluanida [731-27-1] + TX, mezcla de Burdeos [8011-63-0] + TX, hidróxido de cobre [20427-59-2] + TX, oxiclورو de cobre [1332-40-7] + TX, sulfato de cobre [7758-98-7] + TX, óxido de cobre [1317-39-1] + TX, mancobre [53988-93-5] + TX, oxina-cobre [10380-28-6] + TX, dinocap [131-72-6] + TX, nitrotal-isopropilo [10552-74-6] + TX, edifenfos [17109-49-8] + TX, iprobenfos [26087-47-8] + TX, isoprotiolo [50512-35-1] + TX,
- 40 fosfodifeno [36519-00-3] + TX, pirazofos [13457-18-6] + TX, tolclofos-metilo [57018-04-9] + TX, acibenzolar-S-metilo [135158-54-2] + TX, anilazina [101-05-3] + TX, bentiavalicarb [413615-35-7] + TX, blastidina-S [2079-00-7] + TX, quinometionato [2439-01-2] + TX, cloroneb [2675-77-6] + TX, clorotalonilo [1897-45-6] + TX, ciflufenamida [180409-60-3] + TX, cimoxanilo [57966-95-7] + TX, diclona [117-80-6] + TX, diclocimet [139920-32-4] + TX, diclomezina [62865-36-5] + TX, dicloran [99-30-9] + TX, dietofencarb [87130-20-9] + TX, dimetomorf [110488-70-5] + TX, SYP-LI90 (Flumorf) [211867-47-9] + TX, ditianona [3347-22-6] + TX, etaboxam [162650-77-3] + TX, etridiazol [2593-15-9] + TX, famoxadona [131807-57-3] + TX, fenamidona [161326-34-7] + TX, fenoxanilo [115852-48-7] + TX, fentina [668-34-8] + TX, ferimzona [89269-64-7] + TX, fluzinam [79622-59-6] + TX, fluopicolida [239110-15-7] + TX, flusulfamida [106917-52-6] + TX, fenhexamida [126833-17-8] + TX, fosetil-aluminio [39148-24-8] + TX, himexazol [10004-44-1] + TX, iprovalicarb [140923-17-7] + TX, IKF-916 (Ciazofamid) [120116-88-3] + TX, kasugamicina [6980-18-3] + TX, metasulfocarb [66952-49-6] + TX, metrafenona [220899-03-6] + TX, pencicurón [66063-05-6] + TX, ftalida [27355-22-2] + TX, polioxinas [11113-80-7] + TX, probenazol [27605-76-1] + TX, propamocarb [25606-41-1] + TX, proquinazid [189278-12-4] + TX, piroquilón [57369-32-1] + TX, quinoxifeno [124495-18-7] + TX, quitozeno [82-68-8] + TX, azufre [7704-34-9] + TX, tiadinilo [223580-51-6] + TX, triazóxido [72459-58-6] + TX, tricloclazol [41814-78-2] + TX, triforina [26644-46-2] + TX, validamicina [37248-47-8] + TX, zoxamida (RH7281) [156052-68-5] + TX, mandipropamida [374726-62-2] + TX, isopirazam [881685-58-1] + TX, sedaxano [874967-67-6] + TX, (9-diclorometileno-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il)amida del ácido 3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico (descrita en el documento WO 2007/048556) + TX, (3',4',5'-trifluorobifenil-2-il)amida del ácido 3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico (divulgada en el documento WO 2006/087343) + TX, [(3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bS)-3-[[ciclopropilcarbonil]oxil]-

1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-decahidro-6,12-dihidroxi-4,6a,12b-trimetil-11-oxo-9-(3-piridinil)-2H,11H-nafto[2,1-b]pirano[3,4-e]piran-4-il]metil-

ciclopropanocarboxilato [915972-17-7] + TX y 1,3,5-trimetil-N-(2-metil-1-oxopropil)-N-[3-(2-metilpropil)-4-[2,2,2-trifluoro-1-metoxi-1-(trifluorometil)etil]fenil]-1H-pirazol-4-carboxamida [926914-55-8] + TX; y

- 5 microbacterias, incluyendo *Acinetobacter lwoffii* + TX, *Acremonium alternatum* + TX + TX, *Acremonium cephalosporium* + TX + TX, *Acremonium diospyri* + TX, *Acremonium obclavatum* + TX, *Adoxophyes orana granulovirus* (AdoxGV) (Capex®) + TX, *Agrobacterium radiobacter* cepa K84 (Galltrol-A®) + TX, *Alternaria alternate* + TX, *Alternaria cassia* + TX, *Alternaria destruens* (Smolder®) + TX, *Ampelomyces quisqualis* (AQ10®) + TX, *Aspergillus flavus* AF36 (AF36®) + TX, *Aspergillus flavus* NRRL 21882 (Aflaguard®) + TX, *Aspergillus* spp. + TX, *Aureobasidium pullulans* + TX,
- 10 *Azospirillum* + TX, (MicroAZ® + TX, TAZO B®) + TX, *Azotobacter* + TX, *Azotobacter chroococcum* (Azotomeal®) + TX, *Azotobacter* quistes (Bionatural Blooming Blossoms®) + TX, *Bacillus amyloliquefaciens* + TX, *Bacillus cereus* + TX, *Bacillus chitinoporos* cepa CM-1 + TX, *Bacillus chitinoporos* cepa AQ746 + TX, *Bacillus licheniformis* cepa HB-2 (Biostart™ Rhizoboost®) + TX, *Bacillus licheniformis* cepa 3086 (EcoGuard® + TX, Green Releaf®) + TX, *Bacillus circulans* + TX, *Bacillus firmus* (BioSafe®, BioNem-WP®, VOTiVO®) + TX, *Bacillus firmus* cepa I-1582 + TX, *Bacillus macerans* + TX, *Bacillus marismortui* + TX, *Bacillus megaterium* + TX, *Bacillus mycoides* cepa AQ726 + TX, *Bacillus papillae* (Milky Spore Powder®) + TX, *Bacillus pumilus* spp. + TX, *Bacillus pumilus* cepa GB34 (Yield Shield®) + TX, *Bacillus pumilus* cepa AQ717 + TX, *Bacillus pumilus* cepa QST 2808 (Sonata® + TX, Ballad Plus®) + TX, *Bacillus spahericus* (VectoLex®) + TX, *Bacillus* spp. + TX, *Bacillus* spp. cepa AQ175 + TX, *Bacillus* spp. cepa AQ177 + TX, *Bacillus* spp. cepa AQ178 + TX, *Bacillus subtilis* cepa QST 713 (CEASE® + TX, Serenade® + TX, Rhapsody®) + TX,
- 20 *Bacillus subtilis* cepa QST 714 (JAZZ®) + TX, *Bacillus subtilis* cepa AQ153 + TX, *Bacillus subtilis* cepa AQ743 + TX, *Bacillus subtilis* cepa QST3002 + TX, *Bacillus subtilis* cepa QST3004 + TX, *Bacillus subtilis* var. *amyloliquefaciens* cepa FZB24 (Taegro® + TX, Rhizopro®) + TX, *Bacillus thuringiensis* Cry 2Ae + TX, *Bacillus thuringiensis* Cry1Ab + TX, *Bacillus thuringiensis aizawai* GC 91 (Agree®) + TX, *Bacillus thuringiensis israelensis* (BMP123® + TX, Aquabac® + TX, VectoBac®) + TX, *Bacillus thuringiensis kurstaki* (Javelin® + TX, Deliver® + TX, CryMax® + TX, Bonide® + TX, Scutella WP® + TX, Turilav WP® + TX, Astuto® + TX, Dipel WP® + TX, Biobit® + TX, Foray®) + TX, *Bacillus thuringiensis kurstaki* BMP 123 (Baritone®) + TX, *Bacillus thuringiensis kurstaki* HD-1 (Bioprotec-CAF / 3P®) + TX, *Bacillus thuringiensis* cepa BD#32 + TX, *Bacillus thuringiensis* cepa AQ52 + TX, *Bacillus thuringiensis* var. *aizawai* (XenTari® + TX, DiPel®) + TX, bacteria spp. (GROWMEND® + TX, GROWSWEET® + TX, Shootup®) + TX, bacteriófago de *Clavipacter michiganensis* (AgriPhage®) + TX, Bakflor® + TX, *Beauveria bassiana* (Beaugenic® + TX, Brocaril WP®) + TX, *Beauveria bassiana* GHA (Mycotrol ES® + TX, Mycotrol O® + TX, BotaniGuard® + TX, *Beauveria brongniartii* (Engerlingspilz®) + TX, Schweizer Beauveria® (Melocont®) + TX, *Beauveria* spp. + TX, *Botrytis cineria* + TX, *Bradyrhizobium japonicum* (TerraMax®) + TX, *Brevibacillus brevis* + TX, *Bacillus thuringiensis tenebrionis* (Novodor®) + TX, BtBooster + TX, *Burkholderia cepacia* (Deny® + TX, Intercept® + TX, Blue Circle®) + TX, *Burkholderia gladii* + TX, *Burkholderia gladioli* + TX, *Burkholderia* spp. + TX, hongo del cardo canadiense (CBH Canadian Bioherbicide®) + TX,
- 35 *Candida butyri* + TX, *Candida famata* + TX, *Candida fructus* + TX, *Candida glabrata* + TX, *Candida guilliermondii* + TX, *Candida melibiosica* + TX, *Candida oleophila* cepa O + TX, *Candida parapsilosis* + TX, *Candida pelliculosa* + TX, *Candida pulcherrima* + TX, *Candida reukaufii* + TX, *Candida saitoana* (Bio-Coat® + TX, Biocure®) + TX, *Candida sake* + TX, *Candida* spp. + TX, *Candida tenuis* + TX, *Cedecea dravisae* + TX, *Cellulomonas flavigena* + TX, *Chaetomium cochliodes* (Nova-Cide®) + TX, *Chaetomium globosum* (Nova-Cide®) + TX, *Chromobacterium subsugae* cepa PRAA4-1T (Grandevo®) + TX, *Cladosporium cladosporioides* + TX, *Cladosporium oxysporum* + TX, *Cladosporium chlorocephalum* + TX, *Cladosporium* spp. + TX, *Cladosporium tenuissimum* + TX, *Clonostachys rosea* (EndoFine®) + TX, *Colletotrichum acutatum* + TX, *Coniothyrium minitans* (Cotans WG®) + TX, *Coniothyrium* spp. + TX, *Cryptococcus albidus* (YIELDPLUS®) + TX, *Cryptococcus humicola* + TX, *Cryptococcus infirmo-miniatu* + TX, *Cryptococcus laurentii* + TX, *Cryptophlebia leucotreta granulovirus* (Cryptex®) + TX, *Cupriavidus campinensis* + TX, *Cydia pomonella granulovirus* (CYD-X®) + TX, *Cydia pomonella granulovirus* (Madex® + TX, Madex Plus® + TX, Madex Max/ Carpovirusine®) + TX, *Cylindrobasidium laeve* (Stumpout®) + TX, *Cylindrocladium* + TX, *Debaryomyces hansenii* + TX, *Drechslera hawaiiensis* + TX, *Enterobacter cloacae* + TX, *Enterobacteriaceae* + TX, *Entomophthora virulenta* (Vektor®) + TX, *Epicoccum nigrum* + TX, *Epicoccum purpurascens* + TX, *Epicoccum* spp. + TX, *Filobasidium floriforme* + TX, *Fusarium acuminatum* + TX, *Fusarium chlamydosporum* + TX, *Fusarium oxysporum* (Fusaclean® / Biofox C®) + TX, *Fusarium proliferatum* + TX, *Fusarium* spp. + TX, *Galactomyces geotrichum* + TX, *Gliocladium catenulatum* (Primastop® + TX, Prestop®) + TX, *Gliocladium roseum* + TX, *Gliocladium* spp. (SoilGard®) + TX, *Gliocladium virens* (Soilgard®) + TX, *Granulovirus* (Granupom®) + TX, *Halobacillus halophilus* + TX, *Halobacillus litoralis* + TX, *Halobacillus trueperi* + TX, *Halomonas* spp. + TX, *Halomonas subglaciescola* + TX, *Halovibrio variabilis* + TX, *Hanseniaspora uvarum* + TX, virus de la polihedrosis nuclear de *Helicoverpa armigera* (Helicovex®) + TX, virus de la polihedrosis nuclear de *Helicoverpa zea* (Gemstar®) + TX, Isoflavona - formononetina (Mycionate®) + TX, *Kloeckera apiculata* + TX, *Kloeckera* spp. + TX, *Lagenidium giganteum* (Laginex®) + TX, *Lecanicillium longisporum* (Vertiblast®) + TX, *Lecanicillium muscarium* (Vektikal®) + TX, virus de la polihedrosis nuclear de *Lymantria Dispar* (Disparvirus®) + TX, *Marinococcus halophilus* + TX, *Meira geulakonigii* + TX, *Metarhizium anisopliae* (Met52®) + TX, *Metarhizium anisopliae* (Destruxin WP®) + TX, *Metschnikowia fruticola* (Shemer®) + TX, *Metschnikowia pulcherrima* + TX, *Microdochium dimerum* (Antibot®) + TX,

Micromonospora coerulea + TX, *Microsphaeropsis ochracea* + TX, *Muscodor albus* 620 (Muscudor®) + TX, *Muscodor roseus* cepa A3-5 + TX, *Mycorrhizae* spp. (AMykor® + TX, Root Maximizer®) + TX, *Myrothecium verrucaria* cepa AARC-0255 (DiTera®) + TX, BROS PLUS® + TX, *Ophiostoma piliferum* cepa D97 (Sylvanex®) + TX, *Paecilomyces farinosus* + TX, *Paecilomyces fumosoroseus* (PFR-97® + TX, PreFeRa®) + TX, *Paecilomyces lilacinus* (Biostat WP®) + TX, *Paecilomyces lilacinus* cepa 251 (MeloCon WG®) + TX, *Paenibacillus polymyxa* + TX, *Pantoea agglomerans* (BlightBan C9-1®) + TX, *Pantoea* spp. + TX, *Pasteuria* spp. (Econem®) + TX, *Pasteuria nishizawae* + TX, *Penicillium aurantiogriseum* + TX, *Penicillium billai* (Jumpstart® + TX, TagTeam®) + TX, *Penicillium brevicompactum* + TX, *Penicillium frequentans* + TX, *Penicillium griseofulvum* + TX, *Penicillium purpurogenum* + TX, *Penicillium* spp. + TX, *Penicillium viridicatum* + TX, *Phlebiopsis gigantea* (Rotstop®) + TX, bacterias solubilizantes del fosfato (Phosphomeal®) + TX, *Phytophthora cryptogea* + TX, *Phytophthora palmivora* (Devine®) + TX, *Pichia anomala* + TX, *Pichia guillemontii* + TX, *Pichia membranaefaciens* + TX, *Pichia onychis* + TX, *Pichia stipites* + TX, *Pseudomonas aeruginosa* + TX, *Pseudomonas aureofaciens* (Spot-Less Biofungicide®) + TX, *Pseudomonas cepacia* + TX, *Pseudomonas chlororaphis* (AtEze®) + TX, *Pseudomonas corrugate* + TX, *Pseudomonas fluorescens* cepa A506 (BlightBan A506®) + TX, *Pseudomonas putida* + TX, *Pseudomonas reactans* + TX, *Pseudomonas* spp. + TX, *Pseudomonas syringae* (Bio-Save®) + TX, *Pseudomonas viridiflava* + TX, *Pseudomonas fluorescens* (Zequanox®) + TX, *Pseudozyma flocculosa* cepa PFA22 UL (Sporodex L®) + TX, *Puccinia canaliculata* + TX, *Puccinia thlaspeos* (Wood Warrior®) + TX, *Pythium paroecandrum* + TX, *Pythium oligandrum* (Polygandron® + TX, Polyversum®) + TX, *Pythium periplocum* + TX, *Rhanella aquatilis* + TX, *Rhanella* spp. + TX, *Rhizobia* (Dormal® + TX, Vault®) + TX, *Rhizoctonia* + TX, *Rhodococcus globerulus* cepa AQ719 + TX, *Rhodospiridium diobovatum* + TX, *Rhodospiridium toruloides* + TX, *Rhodotorula* spp. + TX, *Rhodotorula glutinis* + TX, *Rhodotorula graminis* + TX, *Rhodotorula mucilagnosa* + TX, *Rhodotorula rubra* + TX, *Saccharomyces cerevisiae* + TX, *Salinococcus roseus* + TX, *Sclerotinia minor* + TX, *Sclerotinia minor* (SARRITOR®) + TX, *Scytalidium* spp. + TX, *Scytalidium uredinicola* + TX, virus de la polihedrosis nuclear de *Spodoptera exigua* (Spod-X® + TX, Spexit®) + TX, *Serratia marcescens* + TX, *Serratia plymuthica* + TX, *Serratia* spp. + TX, *Sordaria fimicola* + TX, virus de la polihedrosis nuclear de *Spodoptera littoralis* (Littovir®) + TX, *Sporobolomyces roseus* + TX, *Stenotrophomonas maltophilia* + TX, *Streptomyces ahngroscopicus* + TX, *Streptomyces albaduncus* + TX, *Streptomyces exfoliates* + TX, *Streptomyces galbus* + TX, *Streptomyces griseoplanus* + TX, *Streptomyces griseoviridis* (Mycostop®) + TX, *Streptomyces lydicus* (Actinovate®) + TX, *Streptomyces lydicus* WYEC-108 (ActinoGrow®) + TX, *Streptomyces violaceus* + TX, *Tilletiopsis minor* + TX, *Tilletiopsis* spp. + TX, *Trichoderma asperellum* (T34 Biocontrol®) + TX, *Trichoderma gamsii* (Tenet®) + TX, *Trichoderma atroviride* (Plantmate®) + TX, *Trichoderma hamatum* TH 382 + TX, *Trichoderma harzianum rifai* (Mycostar®) + TX, *Trichoderma harzianum* T-22 (Trianum-P®) + TX, PlantShield HC® + TX, RootShield® + TX, Trianum-G® + TX, *Trichoderma harzianum* T-39 (Trichodex®) + TX, *Trichoderma inhamatum* + TX, *Trichoderma koningii* + TX, *Trichoderma* spp. LC 52 (Sentinel®) + TX, *Trichoderma lignorum* + TX, *Trichoderma longibrachiatum* + TX, *Trichoderma polysporum* (Binab T®) + TX, *Trichoderma taxi* + TX, *Trichoderma virens* + TX, *Trichoderma virens* (anteriormente Gliocladium virens GL-21) (SoilGuard®) + TX, *Trichoderma viride* + TX, *Trichoderma viride* cepa ICC 080 (Remedier®) + TX, *Trichosporon pullulans* + TX, *Trichosporon* spp. + TX, *Trichothecium* spp. + TX, *Trichothecium roseum* + TX, *Typhula phacorrhiza* cepa 94670 + TX, *Typhula phacorrhiza* cepa 94671 + TX, *Ulocladium atrum* + TX, *Ulocladium oudemansii* (Botry-Zen®) + TX, *Ustilago maydis* + TX, diversas bacterias y micronutrientes complementarios (Natural II®) + TX, diversos hongos (Millennium Microbes®) + TX, *Verticillium chlamydosporium* + TX, *Verticillium lecanii* (Mycotal® + TX, Vertalec®) + TX, Vip3Aa20 (VIPTera®) + TX, *Virgibacillus marismortui* + TX, *Xanthomonas campestris* pv. *Poa* (Camperico®) + TX, *Xenorhabdus bovienii* + TX, *Xenorhabdus nematophilus* y

extractos vegetales, incluyendo aceite de pino (Retenol®) + TX, azadiractina (Plasma Neem Oil® + TX, AzaGuard® + TX, MeemAza® + TX, Molt-X® + TX, IGR botánica (Neemazad® + TX, Neemix®) + TX, aceite de colza (Lilly Miller Vegol®) + TX, *Chenopodium ambrosioides near ambrosioides* (Requiem®) + TX, *Chrysanthemum* extracto (Crisant®) + TX, extracto de aceite de nim (Trilogy®) + TX, aceites esenciales de *Labiatae* (Botania®) + TX, extractos de aceite de clavo, romero, hierbabuena y tomillo (Garden insect killer®) + TX, Glicinbetaina (Greenstim®) + TX, ajo + TX, aceite de limoncillo (GreenMatch®) + TX, aceite de nim + TX, *Nepeta cataria* (aceite de hierba gatera) + TX, *Nepeta catarina* + TX, nicotina + TX, aceite de orégano (MossBuster®) + TX, aceite de *Pedaliaceae* (Nematon®) + TX, piretrum + TX, *Quillaja saponaria* (NemaQ®) + TX, *Reynoutria sachalinensis* (Regalia® + TX, Sakalia®) + TX, rotenona (Eco Roten®) + TX, extracto vegetal de *Rutaceae* (Soleo®) + TX, aceite de soja (Ortho ecosense®) + TX, aceite del árbol de té (Timorex Gold®) + TX, aceite de tomillo + TX, AGNIQUE® MMF + TX, BugOil® + TX, mezcla de extractos de romero, sésamo, hierbabuena, tomillo y canela (EF 300®) + TX, mezcla de extracto de clavo, romero y menta piperita (EF 400®) + TX, mezcla de clavo, hierbabuena, aceite de ajo y menta (Soil Shot®) + TX, caolín (Screen®) + TX, glucam de almacenamiento de algas pardas (Laminarin®); y

feromonas, incluyendo feromonas de la polilla hoja de acebo (Sprayable Blackheaded Fireworm Pheromone® de 3M) + TX, Feromona de la polilla del manzano (Paramount dispenser-(CM)/ Isomate C-Plus®) + TX, feromona de la polilla de la vid (3M MEC-GBM Sprayable Pheromone®) + TX, feromona del rodillo de hoja (MEC – LR Sprayable Pheromone® de 3M) + TX, muscamona (Snip7 Fly Bait® + TX, Starbar Premium Fly Bait®) + TX, feromona de la polilla oriental de la fruta (3M oriental fruit moth sprayable pheromone®) + TX, Feromona del barrenador del melocotonero (Isomate-P®) + TX, feromona del gusano alfiler del tomate (3M Sprayable pheromone®) + TX, polvo Entostat (extracto de palmera) (Exosex

CM®) + TX, acetato de tetradecatrienilo + TX, Hexadecatrienal + TX, Acetato de 9-dodecadien-1-ilo + TX, 2-metil-1-butanol + TX, Acetato de calcio + TX, Scenturion® + TX, Biolure® + TX, Check-Mate® + TX, Senecioato de lavandulilo; y

5 macrobacterias, incluyendo: *Aphelinus abdominalis* + TX, *Aphidius ervi* (Aphelinus-System®) + TX, *Acerophagus papaya* + TX, *Adalia bipunctata* (Adalia-System®) + TX, *Adalia bipunctata* (Adaline®) + TX, *Adalia bipunctata* (Aphidalia®) + TX, *Ageniaspis citricola* + TX, *Ageniaspis fuscicollis* + TX, *Amblyseius andersoni* (Anderline®) + TX, *Andersoni-System*®) + TX, *Amblyseius californicus* (Amblyline® + TX, Spical®) + TX, *Amblyseius cucumeris* (Thripex® + TX, Bugline cucumeris®) + TX, *Amblyseius fallacis* (Fallacis®) + TX, *Amblyseius swirskii* (Bugline swirskii® + TX, Swirskii-Mite®) + TX, *Amblyseius womersleyi* (WomerMite®) + TX, *Amitus hesperidum* + TX, *Anagrus atomus* + TX, *Anagrus fusciventris* + TX, *Anagrus kamali* + TX, *Anagrus loecki* + TX, *Anagrus pseudococci* (Citripar®) + TX, *Anicetus benefices* + TX, *Anisopteromalus calandrae* + TX, *Anthocoris nemoralis* (Anthocoris-System®) + TX, *Aphelinus abdominalis* (Apheline® + TX, Aphiline®) + TX, *Aphelinus asychis* + TX, *Aphidius colemani* (Aphipar®) + TX, *Aphidius ervi* (Ervipar®) + TX, *Aphidius gifuensis* + TX, *Aphidius matricariae* (Aphipar-M®) + TX, *Aphidoletes aphidimyza* (Aphidend®) + TX, *Aphidoletes aphidimyza* (Aphidoline®) + TX, *Aphytis lingnanensis* + TX, *Aphytis melinus* + TX, *Aprostocetus hagenowii* + TX, *Atheta coriaria* (Staphyline®) + TX, *Bombus* spp. + TX, *Bombus terrestris* (Natupol Beehive®) + TX, *Bombus terrestris* (Beeline® + TX, Tripol®) + TX, *Cephalonomia stephanoderis* + TX, *Chilocorus nigrus* + TX, *Chrysoperla carnea* (Chrysoline®) + TX, *Chrysoperla carnea* (Chrysopa®) + TX, *Chrysoperla rufilabris* + TX, *Cirrospilus ingenuus* + TX, *Cirrospilus quadristriatus* + TX, *Citrostichus phyllocnistoides* + TX, *Closterocerus chamaeleon* + TX, *Closterocerus* spp. + TX, *Coccidoxenoides perminutus* (Planopar®) + TX, *Coccophagus cowperi* + TX, *Coccophagus lycimnia* + TX, *Cotesia flavipes* + TX, *Cotesia plutellae* + TX, *Cryptolaemus montrouzieri* (Cryptobug® + TX, Cryptoline®) + TX, *Cybocephalus nipponicus* + TX, *Dacnusa sibirica* + TX, *Dacnusa sibirica* (Minusa®) + TX, *Diglyphus isaea* (Diminex®) + TX, *Delphastus catalinae* (Delphastus®) + TX, *Delphastus pusillus* + TX, *Diachasmimorpha krausii* + TX, *Diachasmimorpha longicaudata* + TX, *Diaparsis jucunda* + TX, *Diaphorencyrtus aligarhensis* + TX, *Diglyphus isaea* + TX, *Diglyphus isaea* (Miglyphus® + TX, Digline®) + TX, *Dacnusa sibirica* (DacDigline® + TX, Minex®) + TX, *Diversinervus* spp. + TX, *Encarsia citrina* + TX, *Encarsia formosa* (Encarsia max® + TX, Encarine® + TX, En-Strip®) + TX, *Eretmocerus eremicus* (Erenmix®) + TX, *Encarsia guadeloupa* + TX, *Encarsia haitiensis* + TX, *Episyphus balteatus* (Syrphidend®) + TX, *Eretmocerus siphonini* + TX, *Eretmocerus californicus* + TX, *Eretmocerus eremicus* (Ercal® + TX, Eretline e®) + TX, *Eretmocerus eremicus* (Bemimix®) + TX, *Eretmocerus hayati* + TX, *Eretmocerus mundus* (Bemipar® + TX, Eretline m®) + TX, *Eretmocerus siphonini* + TX, *Exochomus quadripustulatus* + TX, *Feltiella acarisuga* (Spidend®) + TX, *Feltiella acarisuga* (Feltiline®) + TX, *Fopius arisanus* + TX, *Fopius ceratitivorius* + TX, *Formononetina* (Wireless Beehome®) + TX, *Franklinothrips vespiformis* (Vespop®) + TX, *Galendromus occidentalis* + TX, *Goniozus legneri* + TX, *Habrobracon hebetor* + TX, *Harmonia axyridis* (HarmoBeetle®) + TX, *Heterorhabditis* spp. (Lawn Patrol®) + TX, *Heterorhabditis bacteriophora* (NemaShield HB® + TX, Nemaseek® + TX, Terranem-Nam® + TX, Terranem® + TX, Larvanem® + TX, B-Green® + TX, NemAttack® + TX, Nematop®) + TX, *Heterorhabditis megidis* (Nemasys H® + TX, BioNem H®) + TX, *Exhibitline hm*® + TX, *Larvanem-M*®) + TX, *Hippodamia convergens* + TX, *Hypoaspis aculeifer* (Aculeifer-System® + TX, Entomite-A®) + TX, *Hypoaspis miles* (Hypoline m® + TX, Entomite-M®) + TX, *Lbalia leucospoides* + TX, *Lecanoideus floccissimus* + TX, *Lemophagus errabundus* + TX, *Leptomastix abnormis* + TX, *Leptomastix dactylopii* (Leptopar®) + TX, *Leptomastix epona* + TX, *Lindorus lophanthae* + TX, *Lipolexis oregmae* + TX, *Lucilia caesar* (NatuFly®) + TX, *Lysiphlebus testaceipes* + TX, *Macrolophus caliginosus* (Mirical-N® + TX, Macroline c® + TX, Mirical®) + TX, *Mesoseiulus longipes* + TX, *Metaphycus flavus* + TX, *Metaphycus lounsburyi* + TX, *Micromus angulatus* (Milacewing®) + TX, *Microterys flavus* + TX, *Muscidifurax raptorellus* y *Spalangia cameroni* (Biopar®) + TX, *Neodryinus typhlocybae* + TX, *Neoseiulus californicus* + TX, *Neoseiulus cucumeris* (THRYPEX®) + TX, *Neoseiulus fallacis* + TX, *Nesideocoris tenuis* (NesidioBug® + TX, Nesibug®) + TX, *Ophyra aenescens* (Biofly®) + TX, *Orius insidiosus* (Thripor-l® + TX, Oriline i®) + TX, *Orius laevigatus* (Thripor-L® + TX, Oriline l®) + TX, *Orius majusculus* (Oriline m®) + TX, *Orius strigicollis* (Thripor-S®) + TX, *Pauesia juniperorum* + TX, *Pediobius foveolatus* + TX, *Phasmarhabditis hermaphrodita* (Nemaslug®) + TX, *Phymastichus coffea* + TX, *Phytoseiulus macropilus* + TX, *Phytoseiulus persimilis* (Spidex® + TX, Phytoline p®) + TX, *Podisus maculiventris* (Podisus®) + TX, *Pseudacteon curvatus* + TX, *Pseudacteon obtusus* + TX, *Pseudacteon tricuspis* + TX, *Pseudaphycus maculipennis* + TX, *Pseudleptomastix mexicana* + TX, *Psyllaepagus pilosus* + TX, *Psytalia concolor* (complejo) + TX, *Quadrastichus* spp. + TX, *Rhyzobius lophanthae* + TX, *Rodolia cardinalis* + TX, *Rumina decollate* + TX, *Semiela cher petiolatus* + TX, *Sitobion avenae* (Ervibank®) + TX, *Steinernema carpocapsae* (Nematac C® + TX, Millenium® + TX, BioNem C® + TX, NemAttack® + TX, Nemastar® + TX, Capsanem®) + TX, *Steinernema feltiae* (NemaShield® + TX, Nemasys F® + TX, BioNem F®) + TX, *Steinernema-System*® + TX, *NemAttack*® + TX, *Nemaplus*® + TX, *Exhibitline sf*® + TX, *Scia-rid*® + TX, *Entonem*®) + TX, *Steinernema kraussei* (Nemasys L® + TX, BioNem L® + TX, Exhibitline srb®) + TX, *Steinernema riobrave* (BioVector® + TX, BioVektor®) + TX, *Steinernema scapterisci* (Nematac S®) + TX, *Steinernema* spp. + TX, *Steinernematid* spp. (Guardian Nematodes®) + TX, *Stethorus punctillum* (Stethorus®) + TX, *Tamarixia radiata* + TX, *Tetrastichus setifer* + TX, *Thripobius semiluteus* + TX, *Torymus sinensis* + TX, *Trichogramma brassicae* (Tricholine b®) + TX, *Trichogramma brassicae* (Tricho-Strip®) + TX, *Trichogramma evanescens* + TX, *Trichogramma minutum* + TX, *Trichogramma ostrinae* + TX, *Trichogramma platneri* + TX, *Trichogramma pretiosum* + TX, *Xanthopimpla stemmator*; y

5 otros compuestos biológicos, incluyendo: ácido abscísico + TX, bioSea® + TX, *Chondrostereum purpureum* (Chontrol Paste®) + TX, *Colletotrichum gloeosporioides* (Collego®) + TX, octanoato de cobre (Cueva®) + TX, trampas delta (Trapline d®) + TX, *Erwinia amylovora* (Harpin) (ProAct® + TX, Ni-HIBIT Gold CST®) + TX, ferri-fosfato (Ferramol®) + TX, trampas embudo (Trapline y®) + TX, Gallex® + TX, Grower's Secret® + TX, Homo-brasonolida + TX, fosfato de hierro (Lilly Miller Worry Free Ferramol Slug & Snail Bait®) + TX, MCP trampa granizo (Trapline f®) + TX, *Microctonus hyperodae* + TX, *Mycoleptodiscus terrestris* (Des-X®) + TX, BioGain® + TX, Aminomite® + TX, Zenox® + TX, trampa de feromonas (Thripline ams®) + TX, bicarbonato de potasio (MilStop®) + TX, sales de potasio de ácidos grasos (Sanova®) + TX, solución de silicato de potasio (Sil-Matrix®) + TX, yoduro de potasio + tiocianato de potasio (Enzicur®) + TX, SuffOil-X® + TX, veneno de araña + TX, *Nosema locustae* (Semaspore Organic Grasshopper Control®) + TX, trampas pegajosas (Trapline YF® + TX, Rebell Amarillo®) + TX y trampas (Takitrapline y + b®) + TX.

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

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

30 La mezcla de principios activos de los compuestos de fórmula I seleccionados de las Tablas 1, 2 y B con principios activos descritos anteriormente comprende un compuesto seleccionado de las Tablas 1, 2 y B y un principio activo como se describe anteriormente, preferentemente en una relación de mezcla de 100:1 a 1:6000, especialmente de 50:1 a 1:50, más especialmente en una relación de 20:1 a 1:20, incluso más especialmente de 10:1 a 1:10, muy especialmente de 5:1 y 1:5, dándose preferencia especial a una relación de 2:1 a 1:2, y siendo asimismo preferida una relación de 4:1 a 2:1, por encima de todo en una relación de 1:1, o 5:1, o 5:2, o 5:3, o 5:4, o 4:1, o 4:2, o 4:3, o 3:1, o 3:2, o 2:1, o 1:5, o 2:5, o 3:5, o 4:5, o 1:4, o 2:4, o 3:4, o 1:3, o 2:3, o 1:2, o 1:600, o 1:300, o 1:150, o 1:35, o 2:35, o 4:35, o 1:75, o 2:75, o 4:75, o 1:6000, o 1:3000, o 1:1500, o 1:350, o 2:350, o 4:350, o 1:750, o 2:750, o 4:750 Estas relaciones de mezcla están en peso.

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

40 Las mezclas que comprenden un compuesto de fórmula I seleccionado de la Tablas 1, 2 y B, y uno o más principios activos como se describe anteriormente pueden aplicarse, por ejemplo, en una única forma "de mezcla preparada", en una mezcla de pulverización combinada compuesta de formulaciones diferentes de los componentes de principio activo individuales, tal como una "mezcla en depósito", y en un uso combinado de los principios activos individuales cuando se aplican de una manera secuencial, es decir, uno detrás del otro con un periodo razonablemente corto, tal como unas pocas horas o días. El orden de aplicación de los compuestos de fórmula I seleccionados de las Tablas 1, 2 y B y los principios activos como se describe anteriormente no es esencial para que funcione la presente invención.

50 Las composiciones de acuerdo con la invención también pueden comprender otros auxiliares sólidos o líquidos tales como estabilizantes, por ejemplo, aceites vegetales epoxidados o no epoxidados (por ejemplo, aceite de coco, aceite de colza o aceite de soja epoxidados), antiespumantes, por ejemplo, aceite de silicona, conservantes, reguladores de la viscosidad, aglutinantes y/o adherentes, fertilizantes u otros principios activos para obtener efectos específicos, por ejemplo, bactericidas, fungicidas, nematocidas, activadores de plantas, molusquicidas o herbicidas.

Las composiciones de acuerdo con la invención se preparan de forma conocida per se, en ausencia de agentes auxiliares, por ejemplo, moliendo, tamizando y/o comprimiendo un principio activo sólido y, en presencia de al menos un agente auxiliar, por ejemplo, mezclando íntimamente y/o moliendo el principio activo con el agente auxiliar (agentes

auxiliares). Estos procedimientos para la preparación de las composiciones y el uso de los compuestos I para la preparación de estas composiciones también son un objeto de la invención.

5 Los métodos de aplicación para las composiciones, es decir, los métodos para controlar las plagas del tipo mencionado anteriormente, por ejemplo, mediante pulverización, atomización, espolvoreación, con cepillo, revestimiento, dispersión o vertido, que deben seleccionarse para adecuarse a los fines deseados de las circunstancias predominantes, y el uso de las composiciones para controlar las plagas del tipo mencionado anteriormente son otros objetos de la invención. Las tasas habituales de concentración se encuentran entre 0.1 y 1000 ppm, preferentemente entre 0.1 y 500 ppm, de principio activo. La tasa de aplicación por hectárea es generalmente de 1 a 2000 g de principio activo por hectárea, en particular de 10 a 1000 g/ha, preferentemente de 10 a 600 g/ha.

10 Un método preferido de aplicación en el campo de la protección de cultivos es la aplicación al follaje de las plantas (aplicación foliar), siendo posible seleccionar la frecuencia y la tasa de aplicación para que coincida con el peligro de infestación con la plaga en cuestión. Como alternativa, el principio activo puede llegar a las plantas mediante el sistema radicular (acción sistémica), empapando la ubicación de las plantas con una composición líquida o incorporando el principio activo en forma sólida en la ubicación de las plantas, por ejemplo, en la tierra, por ejemplo, en forma de gránulos (aplicación a la tierra). En el caso de los cultivos de arrozales, dichos gránulos pueden introducirse en forma dosificada en el arrozal anegado.

20 Los compuestos de la invención y sus composiciones también son adecuados para la protección del material de propagación de plantas, por ejemplo, semillas, tales como frutos, tubérculos o granos, o plantas de vivero, contra plagas del tipo mencionado anteriormente. El material de propagación puede tratarse con el compuesto antes de la siembra, por ejemplo, la semilla puede tratarse antes de la siembra. Como alternativa, el compuesto puede aplicarse a los granos de las semillas (recubrimiento), ya sea empapando los granos en una composición líquida o aplicando una capa de una composición sólida. También es posible aplicar las composiciones cuando el material de propagación se planta en el sitio de aplicación, por ejemplo, en el surco para la semilla durante la perforación. Estos métodos de tratamiento para material de propagación vegetal y el material de propagación vegetal así tratado son objetos adicionales de la invención. Tasas de tratamiento típicas dependerán de la planta y las plagas/los hongos a controlar y generalmente están entre 1 y 200 gramos por 100 kg de semillas, preferentemente entre 5 y 150 gramos por 100 kg de semillas, tal como entre 10 y 100 gramos por 100 kg de semillas.

30 El término semilla abarca semillas y propágulos vegetales de todo tipo, que incluyen, sin carácter limitante, semillas propiamente dichas, trozos de semillas, brotes nuevos, mies, bulbos, frutos, tubérculos, granos, rizomas, esquejes, brotes cortados y similares, y en una realización preferida se refiere a las semillas propiamente dichas.

35 La presente invención también comprende semillas recubiertas o tratadas con o que contienen un compuesto de fórmula I. El término "recubierto o tratado con y/o que contiene" generalmente significa que el principio activo está en su mayor parte en la superficie de la semilla en el momento de aplicación, aunque una parte mayor o menor del ingrediente puede penetrar en el material de semilla, dependiendo del método de aplicación. Cuando dicho producto de semilla se (re)planta, puede absorber el principio activo. En una realización, la presente invención pone a disposición un material de propagación vegetal adherido al mismo con un compuesto de fórmula I. Además, se pone a disposición de esta manera una composición que comprende un material de propagación vegetal tratado con un compuesto de fórmula I.

40 El tratamiento de semillas comprende todas las técnicas adecuadas de tratamiento de semillas conocidas en la técnica, tales como la desinfección de semillas, el recubrimiento de semillas, el espolvoreado de semillas, el remojo de semillas y la granulación de semillas. La aplicación de tratamiento de semillas del compuesto de fórmula I puede llevarse a cabo mediante cualquier método conocido, tal como pulverización o espolvoreo de las semillas antes de la siembra o durante la siembra / plantación de las semillas.

Ejemplos Biológicos:

Ejemplo B1: *Bemisia tabaci* (mosca blanca del algodón): Actividad de alimentación/contacto

45 Se colocaron discos de hojas de algodón sobre agar en placas de microtitulación de 24 pocillos y se pulverizaron con soluciones de ensayo acuosas preparadas a partir de soluciones madre de DMSO de 10.000 ppm. Después de secarlos, los discos de hojas se infestaron con moscas blancas adultas. Las muestras se verificaron en cuanto a la mortalidad 6 días después de la incubación.

El siguiente compuesto dio como resultado en al menos un 80% de mortalidad a una tasa de aplicación de 200 ppm: A4.

50 **Ejemplo B2: *Diabrotica balteata*** (gusano de la raíz del maíz):

Brotos de maíz colocados en una capa de agar en placas de microtitulación de 24 pocillos se trataron con soluciones de ensayo acuosas preparadas a partir de soluciones madre de 10.000 ppm de DMSO mediante pulverización. Después de secarlas, las placas se infestaron con larvas L2 (de 6 a 10 por pocillo). Las muestras se evaluaron en cuanto a la mortalidad y la inhibición del crecimiento en comparación con muestras no tratadas 4 días después de la infestación.

- 5 Los siguientes compuestos dieron un efecto de al menos 80% en al menos una de las dos categorías (mortalidad o inhibición del crecimiento) a una tasa de aplicación de 200 ppm:

A1, A2, A3, A4, A5 y A6.

Ejemplo B3: *Euschistus heros* (chinche hedionda marrón neotropical):

- 10 Se pulverizaron hojas de soja en placas de microtitulación de 24 pocillos con disoluciones acuosas de prueba preparadas a partir de disoluciones madre de 10.000 ppm en DMSO. Después de secarse, las hojas se infestaron con ninfas N2. Las muestras se evaluaron en cuanto a la mortalidad y la inhibición del crecimiento en comparación con muestras no tratadas 5 días después de la infestación.

Los siguientes compuestos dieron un efecto de al menos 80% en al menos una de las dos categorías (mortalidad o inhibición del crecimiento) a una tasa de aplicación de 200 ppm:

- 15 A1, A2, A3, A4, A5 y A6.

Ejemplo B4: *Myzus persicae* (pulgón verde del melocotonero): Actividad de alimentación/contacto

- 20 Discos foliares de girasol se colocaron en un agar en una placa de microtitulación de 24 pocillos y se pulverizaron con soluciones de ensayo acuosas preparadas a partir de soluciones madre de 10.000 ppm de DMSO. Después de secarlos, los discos de hojas se infestaron con una población de pulgón de edades variadas. Las muestras se evaluaron en cuanto a la mortalidad 6 días después de la infestación.

Los siguientes compuestos dieron como resultado una mortalidad de al menos un 80% con una tasa de aplicación de 200 ppm:

A1, A2, A4 y A6.

Ejemplo B5: *Plutella xylostella* (palomilla dorso de diamante):

- 25 Placas de microtitulación de 24 pocillos se trataron con dieta artificial con soluciones de ensayo acuosas preparadas a partir de soluciones madre de DMSO de 10.000 ppm mediante pipeteo. Después del secado, las placas se infestaron con larvas L2 (de 10 a 15 por pocillo). Las muestras se evaluaron en cuanto a la mortalidad y la inhibición del crecimiento en comparación con muestras no tratadas 5 días después de la infestación.

- 30 Los siguientes compuestos dieron un efecto de al menos 80% en al menos una de las dos categorías (mortalidad o inhibición del crecimiento) a una tasa de aplicación de 200 ppm:

A1, A2, A3, A4, A5 y A6.

Ejemplo B6: *Spodoptera littoralis* (gusanos de las hojas de algodón egipcio):

- 35 Se colocaron discos foliares de algodón en agar en placas de microtitulación de 24 pocillos y se pulverizaron con soluciones de prueba acuosas preparadas a partir de soluciones madre de 10.000 ppm en DMSO. Después de secarlos, los discos de hojas se infestaron con cinco larvas L1. Las muestras se evaluaron en cuanto a la mortalidad, el efecto contra la alimentación y la inhibición del crecimiento en comparación con muestras no tratadas 3 días después de la infestación. El control de *Spodoptera littoralis* mediante una muestra de ensayo se da cuando al menos una de las categorías de mortalidad, efecto anti-alimentador e inhibición del crecimiento es mayor que la muestra no tratada.

Los siguientes compuestos dieron como resultado un control de al menos 80% a una tasa de aplicación de 200 ppm:

- 40 A2, A3, A4, A5 y A6.

Ejemplo B7: *Spodoptera littoralis* (gusanos de las hojas de algodón egipcio):

- 45 Se aplicaron los compuestos de prueba con una pipeta a partir de soluciones madre de 10.000 ppm en DMSO en placas de 24 pocillos y se mezclaron con agar. Se colocaron semillas de lechuga en el agar y la placa de múltiples pocillos se cerró con otra placa que contenía también agar. Después de 7 días, el compuesto se había absorbido por las raíces y la lechuga creció en la placa que hace de tapa. Las hojas de lechuga entonces se separaron en la placa que hace de tapa.

Huevos de Spodoptera se pipetearon a través de una plantilla de plástico en un papel de transferencia de gel húmedo y la placa de la tapa se cerró con él. Las muestras se evaluaron para determinar la mortalidad, el efecto anti-alimentario y la inhibición del crecimiento en comparación con las muestras no tratadas 6 días después de la infestación.

5 Los siguientes compuestos dieron un efecto de al menos el 80% en al menos una de las tres categorías (mortalidad, anti-alimentación o inhibición del crecimiento) a una tasa de ensayo de 12.5 ppm:

A2, A4 y A6.

Ejemplo B8: *Aedes aegypti* (Mosquito de la fiebre amarilla):

10 Se aplicaron soluciones de ensayo, a una tasa de aplicación de 200 ppm en etanol, a placas de cultivo tisular de 12 pocillos. Una vez que los depósitos estuvieron secos, se añadieron cinco *Aedes aegypti* hembra adultos de dos a cinco días de edad a cada pocillo, y se mantuvieron con una solución de sacarosa al 10 % en un tapón de lana de algodón. Se evaluó la paralización una hora después de la introducción, y se evaluó la mortalidad 24 y 48 horas después de la introducción.

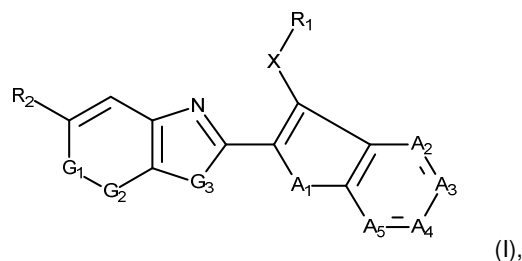
Los siguientes compuestos dieron al menos un 80% de control de *Aedes aegypti* después de 48 h y/o 24 h.

A2 y A6.

15

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula I,



5 en donde

A₁ representa S, O o NCH₃;

A₂, A₃, A₄ y A₅, independientemente entre sí, representan CR₃ o N;

X es S, SO o SO₂;

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

15 R₂ es hidrógeno, halógeno, haloalquil C₁-C₄sulfanilo, haloalquil C₁-C₄sulfinilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, haloalcoxi C₁-C₄, -SF₅, haloalquilcarbonilo C₁-C₄, ciano, haloalquilo C₁-C₆; o es haloalquilo C₁-C₆ sustituido por uno o dos sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en hidroxilo, metoxi y ciano; o es cicloalquilo C₃-C₆ que puede estar mono- o polisustituido por sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano, haloalquilo C₁-C₄ y alquilo C₁-C₄;

20 cada R₃ es, independientemente entre sí, hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, -SF₅, hidroxilo, amino, -NR₉R₁₀, C(O)NR₉R₁₀, haloalquilo C₁-C₆, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, haloalquil C₁-C₄sulfanilo, haloalquil C₁-C₄sulfinilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfanilo, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, haloalcoxi C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆,

alquilcarbonilo C₁-C₄, alcocicarbonilo C₁-C₆, o es cicloalquilo C₃-C₆ que puede estar mono- o polisustituido con R₇, o es cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ que puede estar mono- o polisustituido con R₈;

G₁ es NR₄ y G₂ es C(Y); o

G₂ es NR₅ y G₁ es C(Y);

25 Y es O o S;

G₃ es NR₆;

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

30 R₄ y R₅ son, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, o son cicloalquilo C₃-C₆, que puede estar mono- o poli-sustituido con R₇; o son cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, que puede estar mono- o poli-sustituido con R₈; o

R₄ y R₅ son, independientemente entre sí, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆sulfanilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₆sulfinilo, haloalquil C₁-C₆sulfanilo, haloalquil C₁-C₆sulfonilo, haloalquil C₁-C₆sulfinilo, amino o hidroxilo;

35 R₄ y R₅ son, independientemente entre sí, alquilo C₁-C₄ sustituido por R₁₁; o

R₄ y R₅ son, independientemente entre sí, alquenilo C₂-C₆ sustituido por R₁₁; o

R₄ y R₅ son, independientemente entre sí, alquino C₂-C₆ sustituido por R₁₁;

R₇ y R₈, independientemente entre sí, son halógeno, nitro, ciano, haloalcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄;

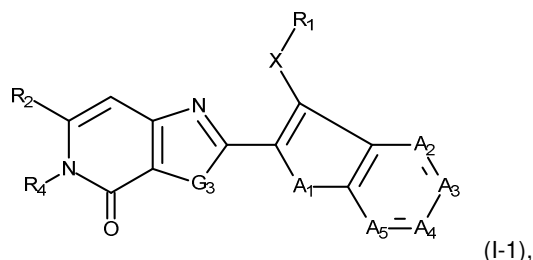
R₉ y R₁₀, independientemente entre sí, are hidrógeno, ciano, alcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆,

5 alquil C₁-C₂-cicloalquilo C₃-C₆, -C(O)Oalquilo C₁-C₃ o alquilo C₁-C₆;

R₁₁ es ciano, alquil C₁-C₆sulfanilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfinilo, haloalquil C₁-C₄sulfanilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, haloalquil C₁-C₆sulfinilo, alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ o fenilo, dicho fenilo y dicho cicloalquilo C₃-C₆ pueden estar mono- o poli-sustituidos por sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alquilo C₁-C₄, ciano, haloalquilo C₁-C₄ y alcoxi C₁-C₄; y sales agroquímicamente aceptables, estereoisómeros, enantiómeros, tautómeros y N-óxidos de estos compuestos.

10

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



en donde los sustituyentes X, R₁, R₂, R₄, G₃, A₁, A₂, A₃, A₄ y A₅ son como se definen en la fórmula I en la reivindicación 1.

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

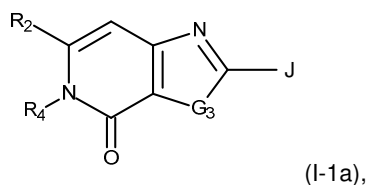
A₁ representa S, O o NCH₃;

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

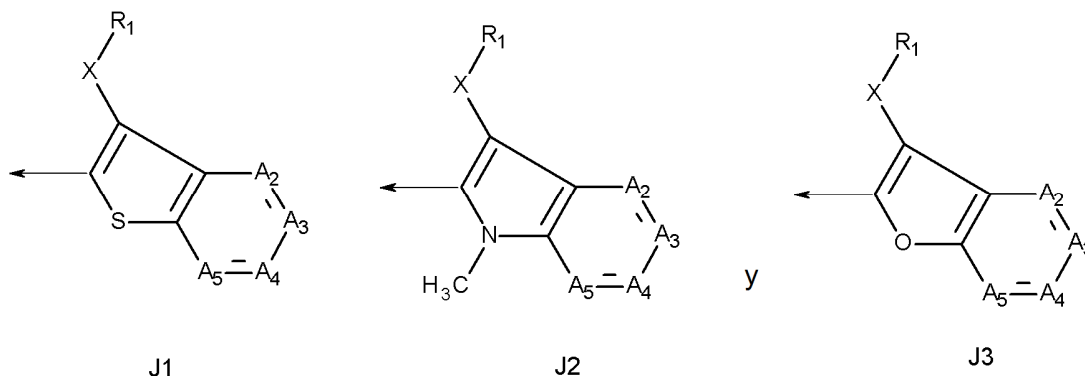
R₂ es halógeno, haloalquil C₁-C₄sulfanilo, haloalquil C₁-C₄sulfinilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, haloalcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, ciano o es cicloalquilo C₃-C₆, que puede estar mono- o polisustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano y alquilo C₁-C₄.

20

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



en donde J se selecciona del grupo que consiste en

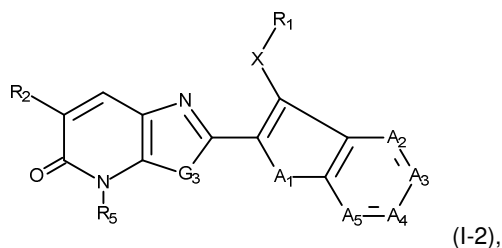


R₁ es alquilo C₁-C₄, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆;

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

X, R₄, G₃, A₂, A₃, A₄ y A₅ son como se definen en la fórmula I en la reivindicación 1.

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



10 en donde los sustituyentes X, R₁, R₂, R₅, G₃, A₁, A₂, A₃, A₄ y A₅ son como se definen en la fórmula I en la reivindicación 1.

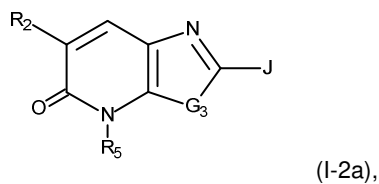
6. Un compuesto de fórmula I-2 de acuerdo con la reivindicación 5, en donde

A₁ representa S, O o NCH₃;

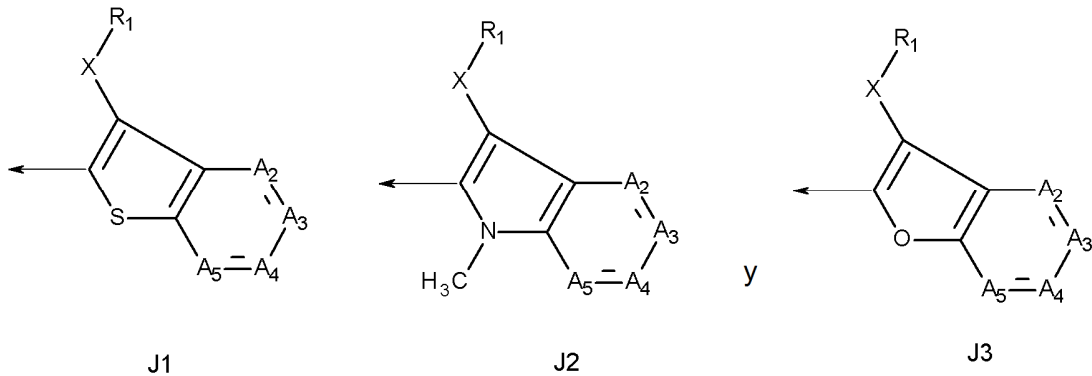
R₁ es alquilo C₁-C₄, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆; y

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

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



en donde J se selecciona del grupo que consiste en

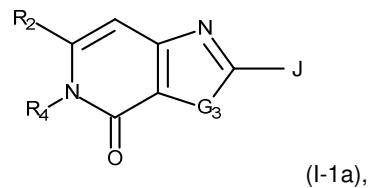


R₁ es alquilo C₁-C₄, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆;

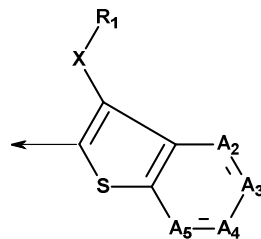
5 R₂ es halógeno, haloalquil C₁-C₄sulfanilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, haloalcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, ciano o es cicloalquilo C₃-C₆, que puede estar mono- o polisustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano y alquilo C₁-C₄; y

X, R₅, G₃, A₂, A₃, A₄ y A₅ son como se definen en la fórmula I en la reivindicación 1.

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



en donde J es J1



10

R₁ es alquilo C₁-C₂;

R₂ es haloalquilo C₁-C₂;

X es S, S(O) o SO₂;

G₃ es N-R₆, en donde R₆ es alquilo C₁-C₂;

15 R₄ es alquilo C₁-C₂ o ciclopropilo;

A₂, A₃, A₄ y A₅, independientemente entre sí, son CR₃ en donde R₃ es hidrógeno, halógeno, haloalquilo C₁-C₂, ciclopropilo, ciano, amino o N-C(O)Oalquilo C₁-C₃.

9. Una composición plaguicida, que comprende al menos un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1 o, cuando proceda, un tautómero del mismo, en cada caso en forma libre o en forma salina que se pueda utilizar agroquímicamente, como principio activo y al menos un auxiliar.
- 5 10. Un método para controlar plagas, que comprende aplicar una composición de acuerdo con la reivindicación 9 a las plagas o a su entorno, con la excepción de un método para el tratamiento de un cuerpo humano o animal mediante cirugía o terapia y métodos de diagnóstico practicados en el cuerpo humano o animal.
11. Un método para la protección de semillas frente al ataque por plagas, que comprende tratar las semillas o el sitio en el que se plantan las semillas con una composición de acuerdo con la reivindicación 9.