



# OFICINA ESPAÑOLA DE PATENTES Y MARCAS

**ESPAÑA** 



11) Número de publicación: 2 770 092

51 Int. Cl.:

C07D 403/14 (2006.01) A01N 37/22 (2006.01)

(12)

## TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

**T3** 

(86) Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: 06.02.2017 PCT/EP2017/052497

(87) Fecha y número de publicación internacional: 17.08.2017 WO17137337

Fecha de presentación y número de la solicitud europea: 06.02.2017 E 17704423 (7)

(97) Fecha y número de publicación de la concesión europea: 25.12.2019 EP 3414240

(54) Título: Imidazolilcarboxamidas sustituidas como plaguicidas

(30) Prioridad:

#### 11.02.2016 WO PCT/EP2016/155136

Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente: **30.06.2020** 

(73) Titular/es:

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

(72) Inventor/es:

HEIL, MARKUS;
FISCHER, REINER;
JANSEN, JOHANNES-RUDOLF;
WILCKE, DAVID;
WILLOT, MATTHIEU;
KÜBBELER, SUSANNE;
ILG, KERSTIN;
EILMUS, SASCHA;
LÖSEL, PETER;
ANDERSCH, WOLFRAM y
GÖRGENS, ULRICH

(74) Agente/Representante:

CARPINTERO LÓPEZ, Mario

### **DESCRIPCIÓN**

Imidazolilcarboxamidas sustituidas como plaguicidas

La presente solicitud hace referencia a nuevos compuestos heterocíclicos, procedimientos y productos intermedios para su preparación y su uso para controlar plagas animales.

- 5 El documento WO 2011/009804 A2 describe compuestos heterocíclicos que incluyen, entre otros, imidazolilcarboxamidas que pueden utilizarse como insecticidas. Sin embargo, no se describen las imidazolilcarboxamidas que se sustituyen directamente en el anillo imidazolil por grupos amino. Las imidazolilcarboxamidas enumeradas en el documento WO 2011/009804 A2 tienen una debilidad considerable en su acción insecticida.
- Los insecticidas modernos tienen que cumplir ciertas demandas, por ejemplo en relación al grado, persistencia y espectro de su acción y posible uso. Las cuestiones de toxicidad, de moderación de especies y polinizadores beneficiosos, las propiedades ambientales, la frecuencia de aplicación, la combinación con otros ingredientes activos y auxiliares de formulación cumplen un rol, como también lo hace la cuestión del esfuerzo que se requiere para la síntesis de un ingrediente activo; además, pueden ocurrir resistencias, solo por mencionar algunos parámetros. Solo por todas estas razones, la búsqueda de nuevas composiciones para la protección de cultivos no pueden considerarse completas, y existe una necesidad constante de nuevos compuestos que tienen propiedades mejoradas en comparación con los compuestos conocidos, al menos en relación con los aspectos individuales.

Fue objeto de la presente invención proporcionar compuestos que amplíen el espectro de los plaguicidas en diversos aspectos.

Este objeto, y otros más que no se establecen de manera explícita, que pueden discernirse o derivar de las conexiones que se debaten en la presente, se logran con la condición de los compuestos de la Fórmula (I).

en donde (forma de realización (0))

- Q representa oxígeno o azufre,
- V representa un radical de la serie hidrógeno, halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi y ciano.
  - W representa un radical de la serie hidrógeno, halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi y ciano,
  - Y representa un radical de la serie hidrógeno, ciano, alquilo, alquenilo o alquinilo opcionalmente sustituidos, cicloalquilo opcionalmente sustituido y opcionalmente interrumpido por heteroátomos, cicloalquilalquilo opcionalmente sustituido, que se interrumpe opcionalmente por heteroátomos, arilalquilo o hetarilalquilo,
- 30 A representa un radical de la serie hidrógeno, alquilo, alquenilo o alquinilo opcionalmente sustituidos y cicloalquilo o cicloalquilalquilo opcionalmente sustituidos y opcionalmente interrumpidos por heteroátomos,
  - T representa oxígeno o un par de electrones,
- representa un radical de la serie hidrógeno, alquilo sustituido opcionalmente, alquenilo, alquinilo o cicloalquilo y representa los radicales C(O)R², C(O)N(R³)(R⁴), C(O)OR⁵ y SO₂R⁶,
  - L² representa un radical de la serie hidrógeno, N(R³a)(R⁴a), alquilo, alquenilo, alquinilo o alcoxi opcionalmente sustituidos, cicloalquilo opcionalmente sustituido o cicloalquilalquilo que se interrumpe opcionalmente por heteroátomos, y arilo, arilalquilo, hetarilo o hetarilalquilo opcionalmente sustituidos,

o

- L¹ y L² representan, junto con el átomo de nitrógeno al que se encuentran unidos, un heterociclo opcionalmente sustituido saturado, parcialmente saturado o aromático que tiene de 3 a 7 átomos de anillo que puede estar opcionalmente interrumpido por otros heteroátomos y/o por uno o dos grupos C=O,
- Ferrores representa un radical de la serie hidrógeno, alquilo, alquenilo o alquinilo opcionalmente sustituidos, cicloalquilo opcionalmente sustituido, arilo o hetarilo opcionalmente sustituidos y arilalquilo opcionalmente sustituidos,
  - R³ y R⁴ cada uno independientemente del otro representa un radical de la serie hidrógeno, alquilo, alquenilo o alquinilo opcionalmente sustituidos, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, arilo, hetarilo, arilalquilo o hetarilalquilo opcionalmente sustituidos saturados o insaturados,
  - R³ y R⁴ juntos forman un anillo alifático de tres a siete miembros opcionalmente sustituido, que opcionalmente contiene un átomo de nitrógeno, azufre u oxígeno,
- R<sup>3a</sup> representa un radical de la serie hidrógeno, alquilo opcionalmente sustituido, cicloalquilo, arilo, hetarilo, arilalquilo o hetarilalquilo opcionalmente sustituido,
  - $R^{4a}$  representa un radical de la serie hidrógeno, alquilo opcionalmente sustituido,  $C_3$ - $C_6$ -cicloalquilo opcionalmente sustituido y representa los radicales  $C(O)R^2$ ,  $C(O)OR^5$  y  $SO_2R^6$ ,
  - R<sup>5</sup> representa alquilo, alquenilo o alquinilo opcionalmente sustituidos, cicloalquilo o cicloalquilalquilo opcionalmente sustituidos,
- 20 R<sup>6</sup> representa un radical de la serie alquilo, alquenilo o alquinilo opcionalmente sustituidos, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, arilo, arilalquilo, hetarilo o hetarilalquilo opcionalmente sustituidos

y sus sales.

10

Se ilustran debajo sustituyentes o rangos preferidos para los radicales enumerados en los compuestos de la Fórmula (I). Su combinación forma el rango de preferencia (1-1).

- 25 Q representa oxígeno o azufre,
  - V representa un radical de la serie hidrógeno, halógeno,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_1$ - $C_4$ -haloalquilo,  $C_1$ - $C_4$ -haloalquilo,  $C_1$ - $C_4$ -haloalcoxi y ciano,
  - W representa un radical de la serie hidrógeno, halógeno,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_1$ - $C_4$ -haloalquilo,  $C_1$ - $C_4$ -haloalquilo,  $C_1$ - $C_4$ -haloalcoxi y ciano,
- Y representa un radical de la serie hidrógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-alquenilo o C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-alquinilo, opcionalmente de mono- a polisustituido de forma independiente entre sí por halógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquil-S(O)<sub>n</sub>- o ciano, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquilo opcionalmente de mono- a disustituido independientemente entre sí por halógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcoxi o ciano, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquil-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo de cadena recta o ramificado, opcionalmente interrumpido una o dos veces de manera independiente entre sí por O, S(O)<sub>n</sub>, CO o NR<sup>4a</sup> y opcionalmente de mono- a tetrasustituido de forma independiente entre sí por halógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcoxi o ciano, aril-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo o hetaril-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, opcionalmente de mono- a trisustituido de manera independiente entre sí por halógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo,
- 40 A representa un radical de la serie hidrógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-alquenilo o C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-alquinilo, opcionalmente de mono- a polisustituido de forma independiente entre sí por halógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquil-S(O)<sub>n</sub>- o ciano y C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cicloalquilo o C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquil-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, opcionalmente de mono- a disustituido de forma independiente entre sí por halógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo de forma independiente entre sí por halógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquil-S(O)<sub>n</sub>- o ciano, y C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquil-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo de cadena recta o ramificado, opcionalmente de mono- a disustituido de manera independiente entre sí por halógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alqui
  - T representa oxígeno o un par electrónico,
- L¹ representa un radical de la serie hidrógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-alquenilo o C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-alquinilo, opcionalmente de mono- a trisustituido de forma independiente entre sí por halógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquil-S(O)<sub>n</sub>- o ciano, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cicloalquilo opcionalmente de mono- a disustituido de manera independiente entre sí por halógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcoxi o ciano y representa los radicales

 $C(O)R^2$ ,  $C(O)N(R^3)(R^4)$ ,  $C(O)OR^5$  y  $SO_2R^6$ ,

representa un radical de la serie hidrógeno,  $-N(R^{3a})(R^{4a})$ ,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_3$ - $C_6$ -alquenilo,  $C_3$ - $C_6$ -alquinilo o  $C_1$ - $C_4$ -alcoxi, opcionalmente de mono- a trisustituido de forma independiente entre sí por halógeno,  $C_1$ - $C_4$ -alcoxi,  $C_1$ - $C_4$ -alquil- $S(O)_n$ - o ciano,  $C_3$ - $C_8$ -cicloalquilo o  $C_3$ - $C_8$ -cicloalquil- $C_1$ - $C_4$ -alquil de cadena recta o ramificado, interrumpida opcionalmente una o dos veces independientemente entre sí por O,  $S(O)_n$ , CO o  $NR^{4a}$  y opcionalmente de mono- a tetrasustituido independientemente entre sí por halógeno,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_1$ - $C_4$ -alcoxi o ciano, arilo, hetarilo, arilalquilo o hetarilalquilo, opcionalmente de mono- a trisustituido de forma independiente entre sí por halógeno,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_1$ - $C_4$ -haloalquilo,  $C_1$ 

10 o

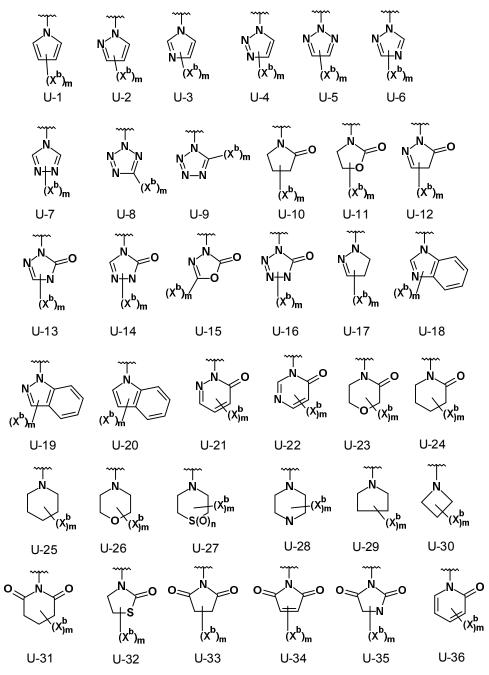
 $X^b$ 

15

5

 $L^2$ 

L<sup>1</sup> y L<sup>2</sup> junto con N representan un heterociclo de la serie U-1 a U-36,



representa un radical de la serie halógeno, ciano,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_3$ - $C_6$ -cicloalquilo,  $C_1$ - $C_5$ -halogenalquilo,  $C_1$ - $C_4$ -alcoxi,  $C_1$ - $C_4$ -haloalcoxi,  $C_3$ - $C_6$ -halocicloalquilo,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo, ciano- $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_3$ - $C_6$ -cicloalquil- $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_2$ - $C_6$ -alquenilo,  $C_3$ - $C_6$ -alquinilo,  $C_1$ - $C_4$ -alquil- $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_3$ - $C_6$ -alquinilo,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_1$ - $C_4$ - $C_4$ -alquilo,  $C_1$ - $C_4$ 

 $C_6$ -haloalquilcarbonilo,  $C_1$ - $C_6$ -alcoxicarbonilo,  $C_1$ - $C_6$ -alquilaminocarbonilo, di- $(C_1$ - $C_6$ )alquilaminocarbonilo,  $C_1$ - $C_6$ -alquilcarbonilamino, arilo y hetarilo, donde los sustituyentes arilo y hetarilo pueden ser opcionalmente mono- o polisustituidos por sustituyentes idénticos o distintos del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro,  $C_1$ - $C_6$ -alquilo,  $C_2$ - $C_6$ -alquinilo,  $C_2$ - $C_6$ -alquinilo,  $C_1$ - $C_4$ -alcoxi,  $C_1$ - $C_4$ -haloalquilo,  $C_1$ - $C_6$ -haloalcoxi y  $C_1$ - $C_4$ -alquiltio y donde los átomos de N de anillo en U-13, U-14, U-16, U-28 y U-35 no están sustituidos por halógeno, nitro, ciano,  $C_1$ - $C_4$ -alcoxi,  $C_1$ - $C_4$ -haloalcoxi,  $C_1$ - $C_4$ -alcoxi- $C_1$ - $C_4$ -alquiloxi,

- representa un radical de la serie hidrógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-alquenilo o C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-alquinilo, opcionalmente de mono- a polisustituido de manera independiente entre sí por halógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcoxi o C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquil-S(O)<sub>n</sub>-, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquilo opcionalmente de mono- a disustituido de manera independiente entre sí por halógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcoxi o ciano, arilo o hetarilo, opcionalmente de mono- a trisustituido de manera independiente entre sí por halógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo o hetaril-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo de cadena recta o ramificado, opcionalmente de mono- a trisustituido independientemente entre sí por halógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>
  - R³, R⁴ de forma independiente entre sí representan un radical de la serie hidrógeno, C₁-C8-alquilo, C₃-C8-alquenilo o C₃-C8-alquenilo, opcionalmente de mono- a polisustituido independientemente entre sí con halógeno, C₁-C4-alcoxi o C₁-C4-alquil-S(O)n-, C₃-C8-cicloalquilo opcionalmente de mono- a disustituido independientemente entre sí por halógeno, C₁-C4-alquilo, C₁-C4-haloalquilo, C₁-C4-alcoxi o ciano, arilo o hetarilo, opcionalmente de mono- a trisustituido de manera independiente entre sí por halógeno, C₁-C4-alquilo, C₁-C4-haloalquilo, C₁-C4-haloalquilo, C₁-C4-alquilo, C₁-C4-alquilo o ciano y aril-C₁-C4-alquilo o hetaril-C₁-C4-alquilo de cadena recta o ramificado, opcionalmente de mono- a trisustituido independientemente entre sí por halógeno, C₁-C4-alquilo, C₁-C4-haloalquilo, C₁-C4-alcoxi, C₁-C4-alquilo, C₁-C4-haloalquilo, C₁-C4-alquilo, C₁-C4-haloalquilo, C₁-C4-alquilo, C₁
- representa un radical de la serie hidrógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alquilo, opcionalmente de mono- a polisustituido independientemente entre sí por halógeno, ciano o C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcoxi, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquilo opcionalmente de mono- a disustituido de forma independiente entre sí por halógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalquilo o C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcoxi, arilo o hetarilo opcionalmente de mono- a trisustituido independientemente entre sí por halógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilos(O)<sub>n</sub>-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalcoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilos(O)<sub>n</sub>-, nitro o ciano y aril-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo o hetaril-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo de cadena recta o ramificado, opcionalmente de mono- a trisustituido independientemente entre sí por halógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo
  - R<sup>4a</sup> representa un radical de la serie hidrógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, opcionalmente de mono- a polisustituido independientemente entre sí por halógeno o C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcoxi, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cicloalquilo opcionalmente de mono- a disustituido independientemente entre sí por halógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalquilo o C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcoxi y representa los radicales C(O)R<sup>2</sup>, C(O)OR<sup>5</sup> y SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>,
    - $R^{5} \qquad \text{representa} \quad C_{1}\text{-}C_{8}\text{-alquilo}, \quad C_{3}\text{-}C_{8}\text{-alquenilo} \quad o \quad C_{3}\text{-}C_{8}\text{-alquinilo}, \quad \text{opcionalmente} \quad \text{de mono-} \quad \text{a polisustituido} \\ \text{independientemente} \quad \text{entre} \quad \text{si} \quad \text{por} \quad \text{halógeno}, \quad C_{1}\text{-}C_{4}\text{-alquil}\text{-}S(O)_{n^{-}}, \quad C_{3}\text{-}C_{8}\text{-cicloalquilo} \\ \text{opcionalmente} \quad \text{de mono-} \quad \text{a disustituido} \quad \text{independientemente} \quad \text{entre} \quad \text{si} \quad \text{por} \quad \text{halógeno}, \quad C_{1}\text{-}C_{4}\text{-alquilo}, \quad C_{1}\text{-}C_{4}\text{-alquilo}, \\ \text{haloalquilo}, \quad C_{1}\text{-}C_{4}\text{-alcoxi} \quad \text{o} \quad \text{ciano}, \\ \\ \text{haloalquilo}, \quad C_{1}\text{-}C_{4}\text{-alcoxi} \quad \text{o} \quad \text{ciano}, \\ \\ \text{haloalquilo}, \quad C_{1}\text{-}C_{4}\text{-alcoxi} \quad \text{o} \quad \text{ciano}, \\ \\ \text{haloalquilo}, \quad C_{1}\text{-}C_{4}\text{-alcoxi} \quad \text{o} \quad \text{ciano}, \\ \\ \text{haloalquilo}, \quad C_{1}\text{-}C_{4}\text{-alcoxi} \quad \text{o} \quad \text{ciano}, \\ \\ \text{haloalquilo}, \quad C_{1}\text{-}C_{4}\text{-alcoxi} \quad \text{o} \quad \text{ciano}, \\ \\ \text{haloalquilo}, \quad C_{1}\text{-}C_{4}\text{-alcoxi} \quad \text{o} \quad \text{ciano}, \\ \\ \text{haloalquilo}, \quad C_{1}\text{-}C_{4}\text{-alcoxi} \quad \text{o} \quad \text{ciano}, \\ \\ \text{haloalquilo}, \quad C_{1}\text{-}C_{4}\text{-alcoxi} \quad \text{o} \quad \text{ciano}, \\ \\ \text{haloalquilo}, \quad C_{1}\text{-}C_{4}\text{-alcoxi} \quad \text{o} \quad \text{ciano}, \\ \\ \text{haloalquilo}, \quad C_{1}\text{-}C_{4}\text{-alcoxi} \quad \text{o} \quad \text{ciano}, \\ \\ \text{haloalquilo}, \quad C_{1}\text{-}C_{4}\text{-alcoxi} \quad \text{o} \quad \text{ciano}, \\ \\ \text{haloalquilo}, \quad C_{1}\text{-}C_{4}\text{-alcoxi} \quad \text{o} \quad \text{ciano}, \\ \\ \text{haloalquilo}, \quad C_{1}\text{-}C_{4}\text{-alcoxi} \quad \text{o} \quad \text{ciano}, \\ \\ \text{haloalquilo}, \quad C_{1}\text{-}C_{4}\text{-alcoxi} \quad \text{o} \quad \text{ciano}, \\ \\ \text{haloalquilo}, \quad C_{1}\text{-}C_{4}\text{-alcoxi} \quad \text{o} \quad \text{ciano}, \\ \\ \text{haloalquilo}, \quad C_{1}\text{-}C_{4}\text{-alcoxi} \quad \text{o} \quad \text{ciano}, \\ \\ \text{haloalquilo}, \quad C_{1}\text{-}C_{4}\text{-alcoxi} \quad \text{ciano}, \\ \\ \text{haloalquilo}$
    - representa un radical de la serie C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-alquenilo o C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-alquinilo, opcionalmente de monoa polisustituido independientemente entre sí por halógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcoxi o C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquil-S(O)<sub>n</sub>-, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>cicloalquilo opcionalmente de mono- a disustituido independientemente entre sí por halógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcoxi o ciano, arilo o hetarilo, opcionalmente de mono- a trisustituido independientemente entre sí por halógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquil-S(O)<sub>n</sub>-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalcoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalquilo-S(O)<sub>n</sub>-, nitro o ciano,
    - m representa un número 0, 1, 2 o 3,
    - n representa un número 0, 1 o 2;

y sus sales.

5

20

35

40

45

Otros sustituyentes preferidos o rangos para los radicales enumerados en los compuestos de la Fórmula (I) se ilustran a continuación. La combinación forma el rango de preferencia (1-2), donde Q, V, W, Y, A, T, L¹, L², R², R³, R⁴, R³a, R⁴a, R⁵, R⁶, m y n son como se los define en el rango de preferencia (1-1) y X⁶ representa un radical de la serie halógeno, nitro, ciano, amino, C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alquilo, ciano-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-alquilo, C₃-C₆-alquilo, C₁-C₆-alquilo, C₁-Cȝ-cȝ-alquilo, C₁-cȝ-cȝ-cȝ-alquilo, C₁-cȝ-cȝ-alquilo, C₁-cȝ-

alquilo,  $C_2$ - $C_6$ -alquenilo,  $C_2$ - $C_6$ -alquinilo,  $C_1$ - $C_4$ -alcoxi,  $C_1$ - $C_4$ -haloalquilo,  $C_1$ - $C_6$ -haloalcoxi y  $C_1$ - $C_4$ -alquitio y donde los átomos de N de anillo en U-13, U-14, U-16 y U-28 no están sustituidos por halógeno, nitro, ciano,  $C_1$ - $C_4$ -alcoxi,  $C_1$ - $C_4$ -haloalcoxi,  $C_1$ - $C_4$ -alcoxi- $C_4$ -alquiloxi,

5 X<sup>b</sup> representa una cadena de carbono C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub> que contiene opcionalmente 1 heteroátomo de la serie N, S u O, que está unida a dos posiciones de anillo adyacentes y que forma un anillo alifático, aromático, heteroaromático o heterocíclico, en cuyo caso m es igual a 2.

Los sustituyentes o rangos particularmente preferidos de los radicales enumerados en los compuestos de la fórmula (I) se indican debajo. Su combinación forma el rango de preferencia (2-1).

10 Q representa oxígeno,

15

20

- V representa un radical de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo y etilo.
- W representa un radical de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano y metilo,
- Y representa un radical de la serie hidrógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-alquenilo o C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-alquinilo, opcionalmente de mono- a pentasustituido de forma independiente entre sí por flúor, cloro, bromo, metoxi o etoxi y C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cicloalquilo opcionalmente de mono- a disustituido de forma independiente entre sí por flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi o ciano,
  - A representa un radical de la serie hidrógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-alquenilo o C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-alquinilo, opcionalmente de mono- a pentasustituido independientemente entre sí por flúor, cloro, bromo, metoxi, etoxi o ciano, y C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cicloalquilo opcionalmente de mono- a disustituido de forma independiente entre sí por flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi o ciano,
  - T representa un par de electrones,
  - $L^1$  y  $L^2$  representan, junto con N, un heterociclo del grupo U-1, U-2, U-3, U-4, U-5, U-6, U-7, U-25, U-26, U-27, U-28, U-29 y U-30,
- representa un radical del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_3$ - $C_6$ -cicloalquilo,  $C_1$ - $C_2$ -haloalquilo,  $C_1$ - $C_4$ -haloalcoxi,  $C_3$ - $C_6$ -halocicloalquilo,  $C_1$ - $C_4$ -alcoxi- $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_1$ - $C_6$ -alquilio,  $C_1$ - $C_4$ -alcoxicarbonilo,  $C_1$ - $C_4$ -alquilaminocarbonilo,  $C_1$ - $C_6$ -alquilsulfonil,  $C_1$ - $C_6$ -alquilcarbonilamino y fenilo, donde fenilo puede estar opcionalmente de mono- a trisustituido por flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, Me-S(O)<sub>n</sub>-, Et-S(O)<sub>n</sub>-, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluorometil-S(O)<sub>n</sub>-, nitro o ciano,
- 30 m representa un número 0, 1 o 2,
  - n representa un número 0, 1 o 2,

y sus sales.

 $X^b$ 

 $X^{b}$ 

40

45

Otros sustituyentes preferidos o rangos para los radicales enumerados en los compuestos de la Fórmula (I) se ilustran a continuación. La combinación forma el rango de preferencia (2-2), donde

35 Q, V, W, Y, A, T, L<sup>1</sup>, L<sup>2</sup>, m y n son como se los define en el rango de preferencia (2-1) y

representa una cadena de carbono C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>, que está unida a dos posiciones adyacentes de anillo y forman un anillo alifático, en cuyo caso m es igual a 2.

Los sustituyentes o rangos muy particularmente preferidos de los radicales enumerados en los compuestos de la Fórmula (I) se ilustran a continuación. Al tener en cuenta la posición del grupo carboxamida en el radical imidazol, se obtiene la estructura (I-1) muy particularmente preferida. Su combinación forma el rango de preferencia (3-1).

$$\begin{array}{c|c}
 & L^{2} & L^{1} \\
 & N & Y \\
 & V & O \\
 & N & A \\
 & T & (I-1)
\end{array}$$

V representa un radical de la serie hidrógeno, flúor, cloro, metilo y ciano,

W representa un radical de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo y metilo,

Y representa un radical de la serie metilo, etilo, propilo, alilo o propargilo opcionalmente de mono- a trisustituido de forma independiente entre sí por flúor, metoxi, etoxi o ciano,

A representa un radical de la serie hidrógeno y metilo, etilo, propilo, alilo, propargilo o ciclopropilo opcionalmente de mono- a trisustituido de forma independiente entre sí por flúor, metoxi, etoxi o ciano,

T representa un par de electrones,

L¹ y L² representan, junto con N, un heterociclo de la serie U-1, U-2, U-3, U-4, U-5, U-6, U-7, U-25, U-26, U-27, U-29 y U-30,

x<sup>b</sup> representa un radical de la serie flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, n- e iso-propilo, ciclopropilo, trifluorometilo, difluorometilo, trifluoroetilo, metoxi, etoxi, n- e iso-propoxi, trifluorometoxi, metoximetilo, etoximetilo, metoxietilo, metil-S(O)<sub>n</sub>-, etil-S(O)<sub>n</sub>-, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, metilaminocarbonilo, metilcarbonilamino o fenilo, donde fenilo puede ser opcionalmente de mono- a trisustituido por flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, nitro o ciano,

m representa un número 0, 1 o 2,

n representa un número 0, 1 o 2,

y sus sales.

5

10

15

20

25

30

35

 $X^b$ 

 $X^b$ 

Al tener en cuenta la posición del grupo carboxamida en el radical imidazol, la fórmula (I) da la estructura muy particularmente preferida (I-1). Los sustituyentes o rangos muy particularmente preferidos de los radicales enumerados en los compuestos de la fórmula (I-1) se ilustran a continuación. Su combinación forma el rango de preferencia (3-2), donde

V, W, Y, A, T, L<sup>1</sup>, L<sup>2</sup>, m y n son como se los define en el rango de preferencia (3-1) y

representa un radical de la serie flúor, cloro, bromo, ciano, amino, metilo, etilo, n- e iso-propilo, ciclopropilo, trifluorometilo, difluorometilo, trifluoroetilo, metoxi, etoxi, n- e iso-propoxi, trifluorometoxi, metoximetilo, etoximetilo, metoxietilo, etoxietilo, metilos(O) $_{n-}$ , etilos(O) $_{n-}$ , metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, metilaminocarbonilo, metilcarbonilamino o fenilo, donde fenilo puede ser opcionalmente de mono- a trisustituido por flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, nitro o ciano, o

representa una cadena de carbono C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>, que está unida a dos posiciones adyacentes de anillo y forman un anillo alifático, en cuyo caso m es igual a 2.

Los sustituyentes o rangos especialmente preferidos para los radicales enumerados en los compuestos de la Fórmula (I-1) se indican debajo. Su combinación con los sustituyentes especialmente preferidos forma el rango preferido (4-1), donde

$$\begin{array}{c|c}
 & L^{2} & L^{1} \\
 & N & Y \\
 & V & O \\
 & N & A \\
 & T & (I-1)
\end{array}$$

V representa hidrógeno,

W representa hidrógeno,

Y representa un radical de la serie hidrógeno, metilo, etilo, alilo y propargilo,

5 A representa un radical de la serie hidrógeno, metilo y etilo,

T representa un par de electrones,

L<sup>1</sup> y L<sup>2</sup> representan, junto con N, un heterociclo de la serie U-1, U-2, U-3, U-6, U-25, U-26 y U-29,

X<sup>b</sup> representa un radical de la serie flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, n- e iso-propilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, metiltio o fenilo, donde fenilo puede ser opcionalmente de mono- a trisustituido por flúor, cloro, metilo o metoxi.

m representa un número 0, 1 o 2,

y sus sales.

10

15

20

Los sustituyentes o rangos especialmente preferidos para los radicales enumerados en los compuestos de la Fórmula (I-1) se indican debajo. Su combinación con los sustituyentes especialmente preferidos forman el rango preferido (4-2), donde

V, W, Y, T, L<sup>1</sup>, L<sup>2</sup> y m son como se los define en el rango de preferencia (4-1) y

A representa un radical de la serie hidrógeno, metilo, etilo o ciclopropilo, y

X<sup>b</sup> representa un radical de la serie flúor, cloro, bromo, ciano, amino, metilo, etilo, n- e isopropilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, metiltio o fenilo, donde fenilo puede ser de forma

opcional de mono- a trisustituido por flúor, cloro, metilo o metoxi, o

X<sup>b</sup> representa una cadena de carbono C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>, que está unida a dos posiciones adyacentes de anillo y forman un anillo alifático, en cuyo caso m es igual a 2.

Los sustituyentes o rangos muy particularmente preferidos de los radicales enumerados en los compuestos de la fórmula (I-1) se ilustran a continuación. Su combinación forma el rango de preferencia (5-1).

25

representa hidrógeno, W representa hidrógeno, Υ representa metilo, Α representa metilo o etilo,

T representa un par de electrones,

 $L^1 \ y \ L^2$ representan, junto con N, un heterociclo de la serie U-1, U-2, U-3, U-6, U-25, U-26 y U-29, Xb representa un radical de la serie cloro, ciano, metilo, trifluorometilo, metiltio, y fenilo,

representa un número 0, 1 o 2,

v sus sales.

5

35

40

45

50

10 Los sustituyentes o rangos muy particularmente preferidos de los radicales enumerados en los compuestos de la fórmula (I-1) se ilustran a continuación. Su combinación forma el rango de preferencia (5-2),

 $V, W, Y, T, L^{1}, L^{2} y m$ son como se los define en el rango de preferencia (5-1) y

representa metilo, etilo o ciclopropilo, y

15  $X^b$ representa un radical de la serie cloro, ciano, amino, metilo, isopropilo, trifluorometilo,

metiltio o fenilo, o

 $X^b$ representa -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-, que está unido a dos posiciones adyacentes de anillo y forma un anillo

alifático, en cuyo caso, es igual a 2.

En una forma de realización preferida, la invención hace referencia a los compuestos de la Fórmula (I) o de la fórmula (I-1), donde los radicales Q, V, W, Y, A, T y n son como se los define en el rango de preferencia (1-1) o en el 20 rango de preferencia (1-2) o en el rango de preferencia (2-1) o en el rango de preferencia (2-2) o en el rango de preferencia (3-1) o en el rango de preferencia (3-2) o en el rango de preferencia (4-1) o en el rango de preferencia (4-2) o en el rango de preferencia (5-1) o en el rango de preferencia (5-2) y L<sup>1</sup>, L<sup>2</sup>, X<sup>b</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>3a</sup>, R<sup>4a</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> y m tienen los significados descritos en la forma de realización (0).

25 En una forma de realización preferida, la invención hace referencia a los compuestos de la fórmula (I) o de la fórmula (I-1), donde los radicales Q, V, W, Y, A, T y n son como se los define en la forma de realización (0) o en el rango de preferencia (2-1) o en rango de preferencia (2-2) o en el rango de preferencia (3-1) o en el rango de preferencia (3-2) o en el rango de preferencia (4-1) o en el rango de preferencia (4-2) o en el rango de preferencia (5-1) o en el rango de preferencia (5-2) y

L<sup>1</sup>, L<sup>2</sup>, X<sup>b</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>3a</sup>, R<sup>4a</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> y m tienen los significados descritos en el rango de preferencia (1-1) o (1-2). 30

En una forma de realización preferida, la invención hace referencia a los compuestos de la fórmula (I) o de la fórmula (I-1), donde los radicales Q, V, W, Y, A, T y n son como se los define en la forma de realización (0-1) o en la forma de realización (0-2) o en el rango de preferencia (1-1) o en rango de preferencia (1-2) o en el rango de preferencia (3-1) o en el rango de preferencia (3-2) o en el rango de preferencia (4-1) o en el rango de preferencia (4-2) o en el rango de preferencia (5-1) o en el rango de preferencia (5-2) y

L<sup>1</sup>, L<sup>2</sup>, X<sup>b</sup> y m tienen los significados descritos en el rango de preferencia (2-1) o (2-2).

En una forma de realización preferida, la invención hace referencia a los compuestos de la fórmula (I) o de la fórmula (I-1), donde los radicales Q, V, W, Y, A, T y n son como se los define en la forma de realización (0-1) o en la forma de realización (0-2) o en el rango de preferencia (1-1) o en rango de preferencia (1-2) o en el rango de preferencia (2-1) o en el rango de preferencia (2-2) o en el rango de preferencia (4-1) o en el rango de preferencia (4-2) o en el rango de preferencia (5-1) o en el rango de preferencia (5-2) y

L<sup>1</sup>, L<sup>2</sup>, X<sup>b</sup> y m tienen los significados descritos en el rango de preferencia (3-1) o (3-2).

En una forma de realización preferida, la invención hace referencia a los compuestos de la fórmula (I) o de la fórmula (I-1), donde los radicales Q, V, W, Y, A, T y n son como se los define en la forma de realización (0-1) o en la forma de realización (0-2) o en el rango de preferencia (1-1) o en rango de preferencia (1-2) o en el rango de preferencia (2-1) o en el rango de preferencia (2-2) o en el rango de preferencia (3-1) o en el rango de preferencia (3-2) o en el rango de preferencia (5-1) o en el rango de preferencia (5-2) y

L<sup>1</sup>, L<sup>2</sup>, X<sup>b</sup> y m tienen los significados descritos en el rango de preferencia (4-1) o en el rango de preferencia (4-2).

En una forma de realización preferida, la invención hace referencia a los compuestos de la fórmula (I) o de la fórmula (I-1), donde los radicales Q, V, W, Y, A, T y n son como se los define en la forma de realización (0-1) o en la forma de realización (0-2) o en el rango de preferencia (1-1) o en rango de preferencia (1-2) o en el rango de preferencia (2-1) o en el rango de preferencia (2-2) o en el rango de preferencia (3-1) o en el rango de preferencia (3-2) o en el rango de preferencia (4-1) o en el rango de preferencia (4-2) y

L<sup>1</sup>, L<sup>2</sup>, X<sup>b</sup> y m tienen los significados descritos en el rango de preferencia (5-1) o en el rango de preferencia (5-2).

En un rango preferido (1-1) o (1-2), a menos que se establezca lo contrario,

Halógeno se selecciona del grupo de flúor, cloro, bromo y yodo, con preferencia en lugar del grupo de flúor, cloro y bromo.

Hetarilo (sinónimos con heteroarilo, incluye como parte de una unidad mayor, por ejemplo hetarilalquilo) se selecciona del grupo que consiste en furilo, tienilo, pirrolilo, pirracolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,2,3-triadiazolilo, 1,2,4-triadiazolilo, 1,3,4-triadiazolilo, 1,2,5-triadiazolilo, pirridilo, pirridilo, pirridilo, pirridilo, pirridilo, pirracinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, benzofurilo, benzoisofurilo, benzotienilo, benzoisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, benzoisotiazolilo, benzoisotiazolilo, benzoisotiazolilo, benzoisotiazolilo, duinolinilo, isoquinolinilo, cinnolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, fteridinilo e indolizinilo.

Heterociclilo representa un anillo saturado de 3-, 4-, 5-, o 6- miembros que contiene 1 o 2 átomos de nitrógeno y/o un átomo de oxígeno y/o un átomo de azufre, pero donde 2 átomos de nitrógeno no deben ser directamente vecinos, por ejemplo aziridinilo, azolidinilo, azinanilo, oxiranilo, oxetanilo, oxolanilo, oxanilo, dioxanilo, thiiranilo, tietanilo, tietanilo,

15 tiolanilo, tianilo y tetrahidrofurilo.

5

10

35

40

55

En un rango preferido (2-1) o (2-2), a menos que se establezca lo contrario,

Halógeno representa flúor, cloro, bromo, y yodo, con preferencia flúor, cloro y bromo,

Hetarilo (incluye como parte de una unidad mayor, como hetarilalquilo) representa piridilo, pirimidilo, tiazolilo, oxazolilo, pirazolilo, tienilo, furanilo, bencilo, piridinilmetilo y tiiazolilmetilo, y

heterociclilo (que incluye como parte de una unidad mayor, como un heterocicloalquilo) representa un anillo saturado o insaturado de 3-, 4- o 5-miembros que contiene 1 o 2 átomos de nitrógeno y/u oxígeno y/o un átomo de azufre, pero donde 2 átomos de nitrógeno no deben ser directamente vecinos, por ejemplo 1- o 2-aziridinilo, 2-oxiranilo, 2-tiiranilo, 1- o 2-azetidinilo, 2- o 3-oxetanilo, 2- o 3-tietanilo, 1,3-dioxetan-2-ilo, 1-, 2- o 3-pirrolidinilo.

En un rango preferido (3-1) o (3-2), a menos que se establezca lo contrario,

Halógeno representa flúor, cloro, bromo y yodo, con preferencia flúor, cloro y bromo, y heterociclilo (que incluye como parte de una unidad mayor, como heterociclilalquilo) representa un anillo saturado o insaturado de 3- o 4-miembros que contiene de 1 a 2 átomos de nitrógeno y/o un átomo de oxígeno y/o un átomo de azufre, pero donde 2 átomos de nitrógeno no deben ser directamente vecinos, por ejemplo 1- o 2-aziridinilo, 2-oxiranilo, 2-thiiranilo, 1- o 2-azetidinilo, 2- o 3-oxetanilo, 2- o 3-tietanilo o 1,3-dioxetan-2-ilo. Los radicales sustituidos con halógeno, por ejemplo haloalquilo son, a menos que se especifique lo contrario, monohalogenados o polihalogenados hasta la cantidad máxima de sustituyentes posibles. En el caso de la polihalogenación, los átomos de halógeno pueden ser idénticos o diferentes. En este caso, halógeno es flúor, cloro, bromo o yodo, en especial flúor, cloro o bromo.

Los radicales de hidrocarburo saturados o insaturados, como alquilo o alquenilo, pueden cada uno ser de cadena recta o ramificado si es posible, que incluya en combinación con heteroátomos como, por ejemplo, en alcoxi.

A menos que se establezca lo contrario, los radicales opcionalmente sustituidos pueden ser mono- o polisustituidos, donde los sustituyentes en el caso de polisustituciones pueden ser los mismos o diferentes.

Si, en los compuestos de la fórmula (I), T representa oxígeno, estos compuestos están presentes como N-óxidos.

Si, en los compuestos de la fórmula (I), T representa un par electrón, estos compuestos están presentes como piridinas.

Las definiciones o aclaraciones de radical que se dan en términos generales o enumerados dentro de las áreas de preferencia, aplican en consecuencia a productos finales o a materiales de inicio o productos intermedios. Estas definiciones de radical pueden combinarse entre sí, si se desea, es decir: al incluir combinaciones entre los rangos de preferencia respectivos.

45 Se le da preferencia según la invención al uso de compuestos de la fórmula (I) que contienen una combinación de los significados enumerados anteriormente como de preferencia (rango preferido (1-1) o (1-2)).

Se le da preferencia particular según la invención al uso de compuestos de la fórmula (I) que contienen una combinación de los significados enumerados anteriormente como de preferencia particular (rango preferido (2-1) o (2-2)).

Se le da preferencia muy particular según la invención al uso de compuestos de la fórmula (I) que contienen una combinación de las definiciones enumeradas anteriormente como de preferencia muy particular (rango preferido (3-1) o (3-2)).

Se le da especial preferencia según la invención al uso de compuestos de la fórmula (I) que contienen una combinación de las definiciones enumeradas anteriormente como de preferencia muy particular (rango de preferencia (4-1) o (4-2)).

Se le da aun más preferencia según la invención al uso de compuestos de la fórmula (I) que contienen una combinación de las definiciones enumeradas anteriormente como de preferencia muy particular (rango de preferencia (5-1) o (5-2)).

De ahora en más, los enunciados que se refieran a los compuestos de la fórmula (I), por supuesto, también aplican a los compuestos de las fórmulas (I-1) a las que abarca la fórmula (I):

#### Isómeros

5

10

15

25

30

35

Según la naturaleza de los sustituyentes, los compuestos de la fórmula (I) pueden hallarse en forma geométrica y/o isómera ópticamente activa o que corresponde a mezclas de isómeros en diferentes composiciones. Estos estereoisómeros son, por ejemplo, enantiómeros, diastereómeros, atropisómeros o isómeros geométricos. La invención entonces abarca tanto estereoisómeros puros y cualquier mezcla deseada de estos isómeros.

#### Procedimientos y usos

La invención también hace referencia a procedimientos para controlar plagas animales, en donde se permite que los compuestos de la fórmula (I) actúen en plagas animales y/o en su hábitat. El control de las plagas animales se lleva a cabo con preferencia en la agricultura o silvicultura, y en material de protección. Esto excluye preferentemente a los procedimientos para el tratamiento quirúrgico o terapéutico del cuerpo humano o animal y los procedimientos de diagnóstico llevados a cabo en el cuerpo humano o animal.

La invención además hace referencia al uso de los compuestos de la fórmula (I) como plaguicidas, en particular agentes de protección de cultivos.

En el contexto de la presente solicitud, el término "plaguicida" en cada caso también abarca siempre el término 20 "agente de protección de cultivo".

Los compuestos de la fórmula (I), dada la buena tolerancia de la planta, una toxicidad endotérmica favorable y la buena compatibilidad ambiental, son adecuadas para la protección de plantas y órganos de plantas contra factores de estrés bióticos y abióticos, para el rendimiento de los cultivos aumentados, para mejorar la calidad del material cultivado y para controlar las plagas animales, en especial insectos, arácnidos, helmintos, en especial nematodos y moluscos, que se hallan en la agricultura, horticultura, en ganadería, en cultivos acuáticos, en bosques, en jardines y zonas de esparcimiento, en la protección de productos y materiales almacenados, y en el sector de la higiene.

En el contexto de la presente solicitud de patente, el término "higiene" debe entenderse como cualquiera y todas las medidas, disposiciones y procedimientos que tengan el objetivo de evitar enfermedades, en especial enfermedades infecciosas, y que sirvan para proteger la salud de humanos y animales y/o proteger el medio ambiente y/o mantener la limpieza. Según la invención, esto incluye en especial medidas para la limpieza, desinfección y esterilización, por ejemplo de textiles o superficies duras, en especial superficies hechas de vidrio, madera, cemento, porcelana, cerámica, plástico u otro(s) metal(es), para asegurar de que estos se encuentran libres de plagas de higiene y/o sus secreciones. El alcance de protección de la invención en este sentido con preferencia excluye procedimientos de tratamiento quirúrgico o terapéutico para aplicarse al cuerpo humano o al cuerpo de animales, y los procedimientos de diagnóstico que se llevan a cabo en el cuerpo humano o en el cuerpo de animales.

El término "sector de la higiene" cubre todas las áreas, campos técnicos y aplicaciones industriales en donde estas medidas, disposiciones y procedimientos para la higiene son importantes, por ejemplo en relación con la higiene en las cocinas, pastelerías, aeropuertos, baños, piscinas, centros comerciales, hoteles, hospitales, establos, jaulas, etc.

El término "plaga de higiene" debe entonces entenderse como una o más plagas animales cuya presencia en el sector de la higiene es problemática, en especial por razones de salud. Un objetivo principal es evitar, o limitar a un grado mínimo, la presencia de plagas de higiene y/o la exposición de estas en el sector de la higiene. Esto puede lograrse en especial a través del uso de un plaguicida que puede utilizarse tanto para evitar la infestación como para evitar una infestación existente. También es posible utilizar formulaciones que evitan o reducen la exposición a las plagas. Las plagas de higiene incluyen, por ejemplo, los organismos mencionados a continuación.

45 El término "protección de higiene", por ende, abarca todos los actos por los que estas medidas, disposiciones y procedimientos de higiene se mantienen y/o se mejoran.

Los compuestos de la Fórmula (I) pueden utilizarse con preferencia como plaguicidas. Son activos contra especies por lo general sensibles y resistentes y también contra todas o etapas específicas del desarrollo. Las plagas antes mencionadas incluyen:

Plagas del filo de la Arthropoda, en especial de la clase de la Arachnida por ejemplo Acarus spp., por ejemplo Acarus siro, Aceria kuko, Aceria sheldoni, Aculops spp., Aculus spp., por ejemplo Aculus fockeui, Aculus schlechtendali, Amblyomma spp., Amphitetranychus viennensis, Argas spp., Boophilus spp., Brevipalpus spp., por ejemplo Brevipalpus phoenicis, Bryobia graminum, Bryobia praetiosa, Centruroides spp., Chorioptes spp., Dermanyssus gallinae, Dermatophagoides pteronyssinus, Dermatophagoides farinae, Dermacentor spp.,

Eotetranychus spp., por ejemplo Eotetranychus hicoriae, Epitrimerus pyri, Eutetranychus spp., por ejemplo Eutetranychus banksi, Eriophyes spp., por ejemplo Eriophyes pyri, Glycyphagus domesticus, Halotydeus destructor, Hemitarsonemus spp., por ejemplo Hemitarsonemus latus (=Polyphagotarsonemus latus), Hyalomma spp., Ixodes spp., Latrodectus spp., Loxosceles spp., Neutrombicula autumnalis, Nuphersa spp., Oligonychus spp., por ejemplo Oligonychus coffeae, Oligonychus coniferarum, Oligonychus ilicis, Oligonychus indicus, Oligonychus mangiferus, Oligonychus pratensis, Oligonychus punicae, Oligonychus yothersi, Ornithodorus spp., Ornithonyssus spp., Panonychus spp., por ejemplo Panonychus citri (=Metatetranychus citri), Panonychus ulmi (=Metatetranychus ulmi), Phyllocoptruta oleivora, Platytetranychus multidigituli, Polyphagotarsonemus latus, Psoroptes spp., Rhipicephalus spp., Rhizoglyphus spp., Sarcoptes spp., Scorpio maurus, Steneotarsonemus spp., Steneotarsonemus spinki, Tarsonemus spp., por ejemplo Tarsonemus confusus, Tarsonemus pallidus, Tetranychus spp., por ejemplo Tetranychus canadensis, Tetranychus cinnabarinus, Tetranychus turkestani, Tetranychus urticae, Trombicula alfreddugesi, Vaejovis spp., Vasates lycopersici;

de la clase de la Chilopoda por ejemplo Geophilus spp., Scutigera spp.;

del orden o de la clase de la Collembola por ejemplo Onychiurus armatus; Sminthurus viridis;

de la clase de la Diplopoda por ejemplo Blaniulus guttulatus;

5

10

15

de la clase de la Insecta, por ejemplo del orden de la Blattodea por ejemplo Blatta orientalis, Blattella asahinai, Blattella germanica, Leucophaea maderae, Loboptera decipiens, Neostylopyga rhombifolia, Panchlora spp., Parcoblatta spp., Periplaneta spp., por ejemplo Periplaneta americana, Periplaneta australasiae, Pycnoscelus surinamensis, Supella longipalpa;

20 del orden de la Coleoptera por ejemplo Acalymma vittatum, Acanthoscelides obtectus, Adoretus spp., Aethina tumida, Agelastica alni, Agriotes spp., por ejemplo Agriotes linneatus, Agriotes mancus, Alphitobius diaperinus, Amphimallon solstitialis, Anobium punctatum, Anoplophora spp., Anthonomus spp., por ejemplo Anthonomus grandis, Anthrenus spp., Apion spp., Apogonia spp., Atomaria spp., por ejemplo Atomaria linearis, Attagenus spp., Baris caerulescens, Bruchidius obtectus, Bruchus spp., por ejemplo Bruchus pisorum, Bruchus rufimanus, 25 Cassida spp., Cerotoma trifurcata, Ceutorrhynchus spp., por ejemplo Ceutorrhynchus assimilis, Ceutorrhynchus quadridens, Ceutorrhynchus rapae, Chaetocnema spp., por ejemplo Chaetocnema confinis, Chaetocnema denticulata, Chaetocnema ectypa, Cleonus mendicus, Conoderus spp., Cosmopolites spp., por ejemplo Cosmopolites sordidus, Costelytra zealandica, Ctenicera spp., Curculio spp., por ejemplo Curculio caryae, Curculio caryatrypes, Curculio obtusus, Curculio sayi, Cryptolestes ferrugineus, Cryptolestes pusillus, 30 Cryptorhynchus lapathi, Cryptorhynchus mangiferae, Cylindrocopturus spp., Cylindrocopturus adspersus, Cylindrocopturus furnissi, Dermestes spp., Diabrotica spp., por ejemplo Diabrotica balteata, Diabrotica barberi, Diabrotica undecimpunctata howardi, Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata, Diabrotica virgifera virgifera, Diabrotica virgifera zeae, Dichocrocis spp., Dicladispa armigera, Diloboderus spp., Epicaerus spp., Epilachna spp., por ejemplo Epilachna borealis, Epilachna varivestis, Epitrix spp., por ejemplo Epitrix cucumeris, Epitrix fuscula, Epitrix hirtipennis, Epitrix subcrinita, Epitrix tuberis, Faustinus spp., Gibbium psylloides, Gnathocerus 35 cornutus, Hellula undalis, Heteronychus arator, Heteronyx spp., Hylamorpha elegans, Hylotrupes bajulus, Hypera postica, Hypomeces squamosus, Hypothenemus spp., por ejemplo Hypothenemus hampei, Hypothenemus obscurus, Hypothenemus pubescens, Lachnosterna consanguinea, Lasioderma serricorne, Latheticus oryzae, Lathridius spp., Lema spp., Leptinotarsa decemlineata, Leucoptera spp., por ejemplo Leucoptera coffeella, Lissorhoptrus oryzophilus, Listronotus (=Hyperodes) spp., Lixus spp., Luperodes spp., Luperomorpha xanthodera, Lyctus spp., Megascelis spp., Melanotus spp., por ejemplo Melanotus longulus oregonensis, Meligethes aeneus, Melolontha spp., por ejemplo Melolontha, Migdolus spp., Monochamus spp., 40 Naupactus xanthographus, Necrobia spp., Neogalerucella spp., Niptus hololeucus, Oryctes rhinoceros, Oryzaephilus surinamensis, Oryzaphagus oryzae, Otiorhynchus spp., por ejemplo Otiorhynchus cribricollis, 45 Otiorhynchus ligustici, Otiorhynchus ovatus, Otiorhynchus rugosostriarus, Otiorhynchus sulcatus, Oulema spp., por ejemplo Oulema melanopus, Oulema oryzae, Oxycetonia jucunda, Phaedon cochleariae, Phyllophaga spp., Phyllophaga helleri, Phyllotreta spp., por ejemplo Phyllotreta armoraciae, Phyllotreta pusilla, Phyllotreta ramosa, Phyllotreta striolata, Popillia japonica, Premnotrypes spp., Prostephanus truncatus, Psylliodes spp., por ejemplo Psylliodes affinis, Psylliodes chrysocephala, Psylliodes punctulata, Ptinus spp., Rhizobius ventralis, Rhizopertha 50 dominica, Rhynchophorus spp., Rhynchophorus ferrugineus, Rhynchophorus palmarum, Sinoxylon perforans, Sitophilus spp., por ejemplo Sitophilus granarius, Sitophilus linearis, Sitophilus oryzae, Sitophilus zeamais, Sphenophorus spp., Stegobium paniceum, Sternechus spp., por ejemplo Sternechus paludatus, Symphyletes spp., Tanymecus spp., por ejemplo Tanymecus dilaticollis, Tanymecus indicus, Tanymecus palliatus, Tenebrio molitor, Tenebrioides mauretanicus, Tribolium spp., por ejemplo Tribolium audax, Tribolium castaneum, Tribolium 55 confusum, Trogoderma spp., Tychius spp., Xylotrechus spp., Zabrus spp., por ejemplo Zabrus tenebrioides;

del orden de la Dermaptera por ejemplo Anisolabis maritime, Forficula auricularia, Labidura riparia;

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

del orden de la Diptera por ejemplo Aedes spp., por ejemplo Aedes aegypti, Aedes albopictus, Aedes sticticus, Aedes vexans, Agromyza spp., por ejemplo Agromyza frontella, Agromyza parvicornis, Anastrepha spp., Anopheles spp., por ejemplo Anopheles quadrimaculatus, Anopheles gambiae, Asphondylia spp., Bactrocera spp., por ejemplo Bactrocera cucurbitae, Bactrocera dorsalis, Bactrocera oleae, Bibio hortulanus, Calliphora erythrocephala, Calliphora vicina, Ceratitis capitata, Chironomus spp., Chrysomya spp., Chrysops spp., Chrysozona pluvialis, Cochliomya spp., Contarinia spp., por ejemplo Contarinia johnsoni, Contarinia nasturtii, Contarinia pyrivora, Contarinia schulzi, Contarinia sorghicola, Contarinia tritici, Cordylobia anthropophaga, Cricotopus sylvestris, Culex spp., por ejemplo Culex pipiens, Culex quinquefasciatus, Culicoides spp., Culiseta spp., Cuterebra spp., Dacus oleae, Dasineura spp., por ejemplo Dasineura brassicae, Delia spp., por ejemplo Delia antiqua, Delia coarctata, Delia florilega, Delia platura, Delia radicum, Dermatobia hominis, Drosophila spp., por ejemplo Drosphila melanogaster, Drosophila suzukii, Echinocnemus spp., Euleia heraclei, Fannia spp., Gasterophilus spp., Glossina spp., Haematopota spp., Hydrellia spp., Hydrellia griseola, Hylemya spp., Hippobosca spp., Hypoderma spp., Liriomyza spp., por ejemplo Liriomyza brassicae, Liriomyza huidobrensis, Liriomyza sativae, Lucilia spp., por ejemplo Lucilia cuprina, Lutzomyja spp., Mansonia spp., Musca spp., por ejemplo Musca domestica, Musca domestica vicina, Oestrus spp., Oscinella frit, Paratanytarsus spp., Paralauterborniella subcincta, Pegomya o Pegomyia spp., por ejemplo Pegomya betae, Pegomya hyoscyami, Pegomya rubivora, Phlebotomus spp., Phorbia spp., Phormia spp., Piophila casei, Platyparea poeciloptera, Prodiplosis spp., Psila rosae, Rhagoletis spp., por ejemplo Rhagoletis cinqulata, Rhagoletis completa, Rhagoletis fausta, Rhagoletis indifferens, Rhagoletis mendax, Rhagoletis pomonella, Sarcophaga spp., Simulium spp., por ejemplo Simulium meridionale, Stomoxys spp., Tabanus spp., Tetanops spp., Tipula spp., por ejemplo Tipula paludosa, Tipula simplex, Toxotrypana curvicauda;

del orden de la Hemiptera por ejemplo Acizzia acaciaebailevanae, Acizzia dodonaeae, Acizzia uncatoides, Acrida turrita, Acyrthosipon spp., por ejemplo Acyrthosiphon pisum, Acrogonia spp., Aeneolamia spp., Agonoscena spp., Aleurocanthus spp., Aleyrodes proletella, Aleurolobus barodensis, Aleurothrixus floccosus, Allocaridara malayensis, Amrasca spp., por ejemplo Amrasca bigutulla, Amrasca devastans, Anuraphis cardui, Aonidiella spp., por ejemplo Aonidiella aurantii, Aonidiella citrina, Aonidiella inornata, Aphanostigma piri, Aphis spp., por ejemplo Aphis citricola, Aphis craccivora, Aphis fabae, Aphis forbesi, Aphis glycines, Aphis gossypii, Aphis hederae, Aphis illinoisensis, Aphis middletoni, Aphis nasturtii, Aphis nerii, Aphis pomi, Aphis spiraecola, Aphis viburniphila, Arboridia apicalis, Arytainilla spp., Aspidiella spp., Aspidiotus spp., por ejemplo Aspidiotus nerii, Atanus spp., Aulacorthum solani, Bemisia tabaci, Blastopsylla occidentalis, Boreioglycaspis melaleucae, Brachycaudus helichrysi, Brachycolus spp., Brevicoryne brassicae, Cacopsylla spp., por ejemplo Cacopsylla pyricola, Calligypona marginata, Capulinia spp., Carneocephala fulgida, Ceratovacuna lanigera, Cercopidae, Ceroplastes spp., Chaetosiphon fragaefolii, Chionaspis tegalensis, Chlorita onukii, Chondracris rosea, Chromaphis juglandicola, Chrysomphalus aonidum, Chrysomphalus ficus, Cicadulina mbila, Coccomytilus halli, Coccus spp., por ejemplo Coccus hesperidum, Coccus longulus, Coccus pseudomagnoliarum, Coccus viridis, Cryptomyzus ribis, Cryptoneossa spp., Ctenarytaina spp., Dalbulus spp., Dialeurodes chittendeni, Dialeurodes citri, Diaphorina citri, Diaspis spp., Diuraphis spp., Doralis spp., Drosicha spp., Dysaphis spp., por ejemplo Dysaphis apiifolia, Dysaphis plantaginea, Dysaphis tulipae, Dysmicoccus spp., Empoasca spp., por ejemplo Empoasca abrupta, Empoasca fabae, Empoasca maligna, Empoasca solana, Empoasca stevensi, Eriosoma spp., por ejemplo Eriosoma americanum, Eriosoma lanigerum, Eriosoma pyricola, Erythroneura spp., Eucalyptolyma spp., Euphyllura spp., Euscelis bilobatus, Ferrisia spp., Fiorinia spp., Furcaspis oceanica, Geococcus coffeae, Glycaspis spp., Heteropsylla cubana, Heteropsylla spinulosa, Homalodisca coagulata, Hyalopterus arundinis, Hyalopterus pruni, Icerya spp., por ejemplo Icerya purchasi, Idiocerus spp., Idioscopus spp., Laodelphax striatellus, Lecanium spp., por ejemplo Lecanium corni (=Parthenolecanium corni), Lepidosaphes spp., por ejemplo Lepidosaphes ulmi, Lipaphis erysimi, Lopholeucaspis japonica, Lycorma delicatula, Macrosiphum spp., por ejemplo Macrosiphum euphorbiae, Macrosiphum lilii, Macrosiphum rosae, Macrosteles facifrons, Mahanarva spp., Melanaphis sacchari, Metcalfiella spp., Metcalfa pruinosa, Metopolophium dirhodum, Monellia costalis, Monelliopsis pecanis, Myzus spp., por ejemplo Myzus ascalonicus, Myzus cerasi, Myzus ligustri, Myzus ornatus, Myzus persicae, Myzus nicotianae, Nasonovia ribisnigri, Neomaskellia spp., Nephotettix spp., por ejemplo Nephotettix cincticeps, Nephotettix nigropictus, Nettigoniclla spectra, Nilaparvata lugens, Oncometopia spp., Orthezia praelonga, Oxya chinensis, Pachypsylla spp., Parabemisia myricae, Paratrioza spp., por ejemplo Paratrioza cockerelli, Parlatoria spp., Pemphigus spp., por ejemplo Pemphigus bursarius, Pemphigus populivenae, Peregrinus maidis, Perkinsiella spp., Phenacoccus spp., por ejemplo Phenacoccus madeirensis, Phloeomyzus passerinii, Phorodon humuli, Phylloxera spp., por ejemplo Phylloxera devastatrix, Phylloxera notabilis, Pinnaspis aspidistrae, Planococcus spp., por ejemplo Planococcus citri, Prosopidopsylla flava, Protopulvinaria pyriformis, Pseudaulacaspis pentagona, Pseudococcus spp., por ejemplo Pseudococcus calceolariae, Pseudococcus comstocki, Pseudococcus longispinus, Pseudococcus maritimus, Pseudococcus viburni, Psyllopsis spp., Psylla spp., por ejemplo Psylla buxi, Psylla mali, Psylla pyri, Pteromalus spp., Pulvinaria spp., Pyrilla spp., Quadraspidiotus spp., por ejemplo Quadraspidiotus juglansregiae, Quadraspidiotus ostreaeformis, Quadraspidiotus perniciosus, Quesada gigas, Rastrococcus spp., Rhopalosiphum spp., por ejemplo Rhopalosiphum maidis, Rhopalosiphum oxyacanthae, Rhopalosiphum padi, Rhopalosiphum rufiabdominale, Saissetia spp., por ejemplo Saissetia coffeae, Saissetia miranda, Saissetia neglecta, Saissetia oleae, Scaphoideus titanus, Schizaphis graminum, Selenaspidus articulatus, Sipha flava, Sitobion avenae, Sogata spp., Sogatella furcifera, Sogatodes spp., Stictocephala festina, Siphoninus phillyreae, Tenalaphara

malayensis, Tetragonocephela spp., Tinocallis caryaefoliae, Tomaspis spp., Toxoptera spp., por ejemplo Toxoptera aurantii, Toxoptera citricidus, Trialeurodes vaporariorum, Trioza spp., por ejemplo Trioza diospyri, Typhlocyba spp., Unaspis spp., Viteus vitifolii, Zygina spp.;

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

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

del orden de la Isopoda por ejemplo Armadillidium vulgare, Oniscus asellus, Porcellio scaber;

25

30

35

40

45

50

55

del orden de la Isoptera por ejemplo Coptotermes spp., por ejemplo Coptotermes formosanus, Cornitermes cumulans, Cryptotermes spp., Incisitermes spp., Kalotermes spp., Microtermes obesi, Nasutitermis spp., Odontotermes spp., Porotermes spp., Reticulitermes spp., por ejemplo Reticulitermes flavipes, Reticulitermes hesperus;

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

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

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

del orden de la Psocoptera por ejemplo Lepinotus spp., Liposcelis spp.;

del orden de la Siphonaptera por ejemplo Ceratophyllus spp., Ctenocephalides spp., por ejemplo Ctenocephalides canis, Ctenocephalides felis, Pulex irritans, Tunga penetrans, Xenopsylla cheopis;

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

del orden de la Zygentoma (= Thysanura), por ejemplo Ctenolepisma spp., Lepisma saccharina, Lepismodes inquilinus, Thermobia domestica;

de la clase de la Symphyla por ejemplo Scutigerella spp., por ejemplo Scutigerella immaculata;

plagas del filo der Mollusca, por ejemplo de la clase de la Bivalvia, por ejemplo Dreissena spp.;

y también de la clase de la Gastropoda por ejemplo Arion spp., por ejemplo Arion ater rufus, Biomphalaria spp., Bulinus spp., Deroceras spp., por ejemplo Deroceras laeve, Galba spp., Lymnaea spp., Oncomelania spp., Pomacea spp., Succinea spp.;

plagas en plantas del filo de la Nematoda, d. h. pflanzenparasitäre Nematoden, en especial Aglenchus spp., por ejemplo Aglenchus agricola, Anguina spp., por ejemplo Anguina tritici, Aphelenchoides spp., por ejemplo Aphelenchoides arachidis, Aphelenchoides fragariae, Belonolaimus spp., por ejemplo Belonolaimus gracilis, Belonolaimus longicaudatus, Belonolaimus nortoni, Bursaphelenchus spp., por eiemplo Bursaphelenchus cocophilus, Bursaphelenchus eremus, Bursaphelenchus xylophilus, Cacopaurus spp., por ejemplo Cacopaurus pestis, Criconemella spp., por ejemplo Criconemella curvata, Criconemella onoensis, Criconemella ornata, Criconemella rusium. Criconemella xenoplax (= Mesocriconema xenoplax). Criconemoides spp., por ejemplo Criconemoides ferniae, Criconemoides onoense, Criconemoides ornatum, Ditylenchus spp., por ejemplo Ditylenchus dipsaci, Dolichodorus spp., Globodera spp., por ejemplo Globodera pallida, Globodera rostochiensis, Helicotylenchus spp., por ejemplo Helicotylenchus dihystera, Hemicriconemoides spp., Hemicycliophora spp., Heterodera spp., por ejemplo Heterodera avenae, Heterodera glycines, Heterodera schachtii, Hirschmaniella spp., Hoplolaimus spp., Longidorus spp., por ejemplo Longidorus africanus, Meloidogyne spp., por ejemplo Meloidogyne chitwoodi, Meloidogyne fallax, Meloidogyne hapla, Meloidogyne incognita, Meloinema spp., Nacobbus spp., Neotylenchus spp., Paralongidorus spp., Paraphelenchus spp., Paratrichodorus spp., por ejemplo Paratrichodorus minor, Paratylenchus spp., Pratylenchus spp., por ejemplo Pratylenchus penetrans, Pseudohalenchus spp., Psilenchus spp., Punctodera spp., Quinisulcius spp., Radopholus spp., por ejemplo Radopholus citrophilus, Radopholus similis, Rotylenchulus spp., Rotylenchus spp., Scutellonema spp., Subanguina spp., Trichodorus spp., por ejemplo Trichodorus obtusus, Trichodorus primitivus, Tylenchorhynchus spp., por ejemplo Tylenchorhynchus annulatus, Tylenchulus spp., por ejemplo Tylenchulus semipenetrans, Xiphinema spp., por ejemplo Xiphinema index.

Los compuestos de la fórmula (I) pueden opcionalmente, a ciertas concentraciones o tasas de aplicación, también utilizarse como herbicidas, protectores, reguladores del crecimiento o agentes para mejorar las propiedades de las plantas, como microbiocidas y gametocidas, por ejemplo como fungicidas, antimicóticos, bactericidas, virucidas (que incluyen agentes contra viroides) o como agentes contra MLO (organismos de tipo micoplasma) y RLO (organismos de tipo rickettsia). Pueden según sea el caso, también utilizarse como productos intermedios o precursores para la síntesis de otros ingredientes activos.

### **Formulaciones**

5

15

20

25

30

35

40

45

50

La presente invención además hace referencia a las formulaciones y a las formas de uso preparadas a partir de ellas como los plaguicidas, por ejemplo: licores de empapado, goteo y pulverización, que comprenden al menos un compuesto de la fórmula (I). Opcionalmente, las formas de uso comprenden otros plaguicidas y/o adyuvantes que mejoran la acción, como los penetrantes, por ejemplo: aceites vegetales, por ejemplo: aceite de colza, aceite de

girasol, aceites minerales, por ejemplo: aceites de parafina, ésteres de alquilo de ácidos grasos vegetales, por ejemplo: éster de metilo de aceite de colza o éster de metilo de aceite de soja, o alcanol alcoxilatos y/o diseminadores, por ejemplo: alquilsiloxanos y/o sales, por ejemplo: sales de amonio o fosfonio orgánicos o inorgánicos, por ejemplo: sulfato de amonio o diamonio hidrogenfosfato y/o promotores de la retención, por ejemplo: polímeros y/o humectantes de dioctil sulfosuccinato o hidroxipropilguar, por ejemplo: glicerol y/o fertilizantes, por ejemplo: fertilizantes que contienen amonio, potasio o fósforo.

Las formulaciones habituales son, por ejemplo; líquidos solubles en agua (SL), concentrados de emulsión (EC), emulsiones en agua (EW), concentrados de suspensión (SC, SE, FS, OD), gránulos dispersables en agua (WG), concentrados de gránulos (GR) y cápsulas (CS); estas y otros tipos de formulaciones posibles se describen, por ejemplo, por *Crop Life International and in Pesticide Specifications, Manual on development and use of FAO and WHO specifications for pesticides, FAO Plant Production and Protection Papers – 173, prepared by the FAO/WHO Joint Meeting on Pesticide Specifications, 2004, ISBN:* 9251048576. Las formulaciones, además de uno o más compuestos de la fórmula (I), comprenden opcionalmente otros ingredientes activos agroquímicos.

10

15

25

30

35

50

55

Se le da preferencia a las formulaciones o formas de uso que comprenden auxiliares, por ejemplo: extensores, solventes, promotores de la espontaneidad, portadores, emulsionantes, dispersantes, agentes para la protección contra heladas, biocidas, espesantes y/u otros auxiliares, por ejemplo: adyuvantes. Un adyuvante en este contexto es un componente que mejora el efecto biológico de la formulación, sin el componente propio que tiene cualquier efecto biológico. Los ejemplos de adyuvantes son los agentes que promueven la retención, la expansión, la adhesión a la superficie de la hoja o penetración.

Estas formulaciones se producen de una forma conocida, por ejemplo: al mezclar los compuestos de la fórmula (I) con auxiliares, por ejemplo: extensores, solventes y/o portadores sólidos y/u otros auxiliares, por ejemplo: tensioactivos. Las formulaciones se producen ya sea en instalaciones adecuadas o antes o durante la aplicación.

Los auxiliares utilizados pueden ser sustancias adecuadas porque imparten propiedades especiales, como ciertas propiedades físicas, técnicas y/o biológicas, a la formulación de los compuestos de la fórmula (I), o a las formas de uso que se preparan a partir de estas formulaciones (por ejemplo: plaguicidas listos para usar como licores de pulverización o productos para recubrir semillas).

Los extensores adecuados son, por ejemplo: agua, líquidos químicos orgánicos polares o no polares, por ejemplo: de la clase de los hidrocarburos aromáticos o no aromáticos (como parafinas, alquilbencenos, alquilhaftalenos, clorobencenos), los alcholes y polioles (que, si es adecuado, también pueden sustituirse, eterificarse y/o esterificarse), las cetonas (como acetona, ciclohexanona), ésteres (que incluye grasas y aceites) y (poli)éteres, las aminas simples y sustituidas, amidas, lactamas (como N-alquilpirrolidonas) y lactonas, las sulfonas y sulfóxidos (como el dimetil sulfóxido).

Si el extensor que se utiliza es agua, también es posible utilizar, por ejemplo: solventes orgánicos como solventes auxiliares. Los solventes líquidos útiles son en esencia: aromáticos como el xileno, tolueno o alquilnaftalenos, hidrocarburos clorinados aromáticos o clorinados alifáticos como los clorobencenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos como ciclohexano o parafinas, por ejemplo: fracciones de aceite mineral, aceites minerales y vegetales, alcoholes como el butanol o glicol y sus éteres y ésteres, cetonas como la acetona, metiletilcetona, metil isobutil cetona o ciclohexanona, solventes fuertemente polares como dimetilformamida y dimetil sulfóxido, y también agua.

En principio, es posible utilizar todos los solventes adecuados. Son ejemplos de solventes adecuados los hidrocarburos aromáticos, por ejemplo: xileno, tolueno o alquilnaftalenos, hidrocarburos clorinados aromáticos o clorinados alifáticos como los clorobencenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos como ciclohexano o parafinas, fracciones de petroleo, aceites minerales y vegetales, alcoholes, por ejemplo: metanol, etanol, isopropanol, butanol o glicol y sus éteres y ésteres, cetonas como la acetona, metiletilcetona, metil isobutil cetona o ciclohexanona, solventes fuertemente polares como dimetil sulfóxido, y aqua.

En principio, es posible utilizar todos los portadores adecuados. Los portadores útiles incluyen en especial, por ejemplo: sales de amonio y rocas naturales, finamente molidas, como caolinas, alúminas, talco, tiza, cuarzo, atapulgita, montmorilonita o tierra diatomácea, y rocas sintéticas, finamente molidas, como sílice altamente disperso, óxido de aluminio o silicatos naturales o sintéticos, resinas, ceras y/o fertilizantes sólidos. También es posible usar mezclas de estos portadores. Los portadores útiles para gránulos incluyen, por ejemplo: rocas naturales rotas o fraccionadas como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita, y gránulos sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas, y también gránulos de material orgánico como aserrín, papel, cáscara de coco, mazorcas de maíz y tallos de tabaco.

También es posible utilizar extensores o solventes licuados gaseosos. Los extensores o portadores especialmente adecuados son aquellos que son gaseosos a temperaturas estándares y a presión atmosférica, por ejemplo: propulsores en aerosol como hidrocarburos halogenados, y también butano, propano, nitrógeno y dióxido de carbono.

Ejemplos de emulsionantes y/o formadores de espuma, dispersantes o agentes humectantes que tienen

propiedades iónicas o no iónicas o mezclas de estas sustancias de superficie activa son sales de ácido poliacrílico, sales de ácido lignosulfónico, sales de ácido fenolsulfónico o ácido nafitalensulfónico, policondensatos de óxido de etileno con alcoholes grasos o con ácidos grasos o con aminas grasas, con fenoles sustituidos (con preferencia alquilfenoles o arilfenoles), sales de ésteres sulfosuccínicos, derivados de taurina (con preferencia alquil tauratos), ésteres fosfóricos de alcoholes y fenoles polietoxilados, ésteres de ácido graso de polioles, y derivados de compuestos que contienen sulfatos, sulfonatos y fosfatos, por ejemplo alquilaril poliglicol ésteres, alquilsulfonatos, alquil sulfatos, arilsulfonatos, hidrosilatos de proteína, licores residuales de lignosulfito y metilcelulosa. Es ventajosa la presencia de un tensioactivo si uno de los compuestos de la fórmula (I) y/o uno de los portadores inertes es insoluble en agua y cuando la aplicación tiene lugar en agua.

- Otros auxiliares que pueden estar presentes en las formulaciones y las formas de uso que derivan de ellas incluyen tinturas como pigmentos inorgánicos, por ejemplo: óxido de hierro, óxido de titanio, y azul de prusia, y tinturas orgánicas como tintura alizarina, tintura azo y tintura de metal ftalocianina, y nutrientes y oligonutrientes como las sales de hierro, el manganeso, el boro, el cobre, el cobalto, el molibdeno y el zinc.
- Componentes adicionales que pueden estar presentes son los estabilizadores, como los estabilizadores de frío, conservantes, antioxidantes, estabilizador de luz, u otros agentes que mejoran la estabilidad química y/o física. Generadores de espuma o antiespumantes pueden también estar presentes.
  - Además, las formulaciones y las formas de uso que derivan de ellas también pueden comprender, como auxiliares adicionales, los aglutinantes como carboximetilcelulosa y polímeros naturales y sintéticos en la forma de polvos, gránulos o látices, como goma arábiga, alcohol de polivinilo y acetato de polivinilo, o de otra forma fosfolípidos naturales como cefalinas y lecitinas y fosfolípidos sintéticos. Otros auxiliares pueden ser aceites minerales y vegetales.
  - Es posible, si es adecuado, para aun otros auxiliares estar presentes en formulaciones y las formas de uso que derivan de ellas. Ejemplos de estos aditivos son las fragancias, los coloides protectores, los aglutinantes, adhesivos, espesantes, agentes tixotrópicos, penetrantes, promotores de retención, estabilizantes, secuestrantes, agentes complejantes, humectantes y diseminadores. En general, los compuestos de la fórmula (I) pueden combinarse con cualquier aditivo sólido o líquido que se utilice comúnmente para propósitos de formulación.
  - Los promotores de retención útiles incluyen todas aquellas sustancias que reducen la tensión superficial dinámica, por ejemplo: dioctil sulfosuccinato, o aumentan la viscoelasticidad, por ejemplo: polímeros de hidroxipropilguar.
- Los penetrantes útiles en el presente contexto son todas aquellas sustancias que se utilizan típicamente para mejorar la penetración de ingredientes agroquímicos activos en las plantas. Los penetrantes se definen en este contexto por su habilidad para penetrar desde el licor de aplicación (por lo general acuoso) y/o desde el recubrimiento pulverizador en la cutícula de la planta y, por lo tanto, aumentar la movilidad de los ingredientes activos en la cutícula. El procedimiento descrito en la bibliografía (Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152) puede utilizarse para determinar esta propiedad. Los ejemplos incluyen alcoxilatos de alcohol como el etoxilato graso de coco (10) o el isotridecil etoxilato (12), ésteres de ácido graso, por ejemplo: éster de metilo de aceite de colza o éster de metilo de aceite de soja, alcoxilatos de amina grasa, por ejemplo: etoxilato de tallowamina (15), o sales de amonio y/o fosfonio, por ejemplo: sulfato de amonio o diamonio hidrogenfosfato.
  - Las formulaciones con preferencia comprenden entre 0,00000001% y 98% en peso del compuesto de la fórmula (I), con mayor preferencia entre 0,01% y 95% en peso del compuesto de la fórmula (I), con mayor preferencia entre 0,5% y 90% en peso del compuesto de la fórmula (I), con respecto al peso de la formulación.
  - El contenido del compuesto de la fórmula (I) en las formas de uso preparadas a partir de las formulaciones (en particular plaguicidas) pueden variar entre amplios rangos. La concentración del compuesto de la fórmula (I) en las formas de uso pueden estar típicamente entre 0,00000001% y 95% en peso del compuesto de la fórmula (I), con preferencia entre 0,00001% y 1% en peso, con respecto al peso de la forma de uso. La aplicación se logra de la forma habitual apropiada para las formas de uso.

#### **Mezclas**

20

25

40

45

50

55

Los compuestos de la fórmula (I) también pueden utilizarse en una mezcla con uno o más fungicidas, bactericidas, acaricidas, molusquicidas, nematicidas, insecticidas, agentes microbiológicos, organismos beneficiosos, herbicidas, fertilizantes, repelentes de aves, fitotónicos, esterilizantes, protectores, semioquímicos y/o reguladores del crecimiento en plantes adecuados, para entonces, por ejemplo, ampliar el espectro de acción, prolongar el periodo de acción, mejorar la tasa de acción, evitar la repelencia o evitar la evolución de resistencia. Además, las combinaciones de ingredientes activos de este tipo pueden mejorar el crecimiento de plantas y/o la tolerancia a los factores abióticos, por ejemplo altas o bajas temperaturas, a la sequía o al elevado contenido de agua o a la salinidad del suelo. También es posible mejorar la capacidad de floración y fructificación, optimizar la capacidad de germinación y el desarrollo de raíces, facilitar el cultivo y mejorar los rendimientos, influenciar la maduración, mejorar la calidad y/o el valor nutricional de los productos cultivados, prolongar el tiempo de almacenamiento y/o mejorar la procesabilidad de los productos cultivados.

Además, los compuestos de la Fórmula (I) pueden estar presentes en una mezcla con otros compuestos o semiquímicos activos como atrayentes, y/o repelentes de aves y/o activadores de plantas y/o reguladores del crecimiento y/o fertilizantes. Asimismo, los compuestos de la Fórmula (I) pueden utilizarse para mejorar las propiedades de las plantas, por ejemplo el crecimiento, el rendimiento y la calidad del material cultivado.

En una forma de realización particular según la invención, los compuestos de la fórmula (I) están presentes en formulaciones o en las formas de uso preparadas a partir de estas formulaciones en una mezcla con otros compuestos, con preferencia aquellos que se describen debajo.

Si uno de los compuestos que se menciona debajo puede ocurrir en diferentes formas tautoméricas, estas formas también están incluidas aun si no se mencionan de manera específica en cada caso. Todos los componentes de mezcla que se mencionan, según sea el caso, también pueden formar sales con bases o ácidos adecuados si son capaces de hacerlo sobre la base de su grupo funcional.

#### Insecticidas/ acaricidas/ nematicidas

10

15

20

25

30

35

45

50

55

60

Los ingredientes activos especificados en la presente con sus nombres comunes se conocen y describen por ejemplo en *The Pesticide Manual: 16th ed., British Crop Protection Council 2012*, o pueden buscarse en la Internet (e.g. http://www.alanwood.net/pesticides). La clasificación se base en el *IRAC Mode of Action Classification Scheme* aplicable al momento de presnetar esta solicitud de patente.

- (1) Inhibidores de Acetilcolinesterasa (AChE), por ejemplo carbamatos, e.g. alanycarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxycarboxim, carbaryl, carbofuran, carbosulfan, ethiofencarb, fenobucarb, formetanate, furathiocarb, isoprocarb, methiocarb, methomyl, metolcarb, oxamyl, pirimicarb, propoxur, thiodicarb, thiofanox, triazamate, trimethacarb, XMC y xylylcarb; u organofosfatos, e.g. acephate, azamethiphos, azinphosethyl, azinphos-methyl, cadusafos, chlorethoxyfos, chlorfenvinphos, chlormephos, chlorpyrifos-methyl, coumaphos, cyanophos, demeton-S-methyl, diazinon, dichlorvos/DDVP, dicrotophos, dimethoate, dimethylvinphos, disulfoton, EPN, ethion, ethoprophos, famphur, fenamiphos, fenitrothion, fenthion, fosthiazate, heptenophos, imicyafos, isofenphos, isopropyl O-(methoxyaminothiophosphoryl) salicylate, isoxathion, malathion, mecarbam, methamidophos, methidathion, mevinphos, monocrotophos, naled, omethoate, oxydemeton-methyl, parathion-methyl, phenthoate, phorate, phosalone, phosmet, phosphamidon, phoxim, pirimiphos-methyl, profenofos, propetamphos, prothiofos, pyraclofos, pyridaphenthion, quinalphos, sulfotep, tebupirimfos, temephos, terbufos, tetrachlorvinphos, thiometon, triazophos, triclorfon y vamidothion.
- Bloqueadores del canal de cloruro regulado por GABA, por ejemplo: ciclodien-organoclorinas, e.g. chlordane y endosulfan o fenilpirazoles (fiproles), e.g. ethiprole and fipronil.
  - (3) Moduladores del canal de sodio, por ejemplo: piretroides, e.g. acrinathrin, allethrin, d-cis-trans allethrin, d-trans allethrin, bifenthrin, bioallethrin, isómero de bioallethrin S-cyclopentenyl, bioresmethrin, cycloprothrin, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, gamma-cyhalothrin, cypermethrin, alpha-cypermethrin, beta-cypermethrin, theta-cypermethrin, zeta-cypermethrin, cyphenothrin [(1R)-trans isómero], deltamethrin, empenthrin [(EZ)-(1R) isomer], esfenvalerate, etofenprox, fenpropathrin, fenvalerate, flucythrinate, flumethrin, tau-fluvalinate, halfenprox, imiprothrin, kadethrin, momfluorothrin, permethrin, phenothrin [(1R)-trans isómero], prallethrin, pyrethrins (pyrethrum), resmethrin, silafluofen, tefluthrin, tetramethrin, tetramethrin [(1R) isómero], tralomethrin y transfluthrin o DDT o methoxychlor.
- (4) Moduladores competitivos del receptor de acetilcolina nicotínico (nAChR), por ejemplo neonicotinoids, e.g. 40 acetamiprid, clothianidin, dinotefuran, imidacloprid, nitenpyram, thiacloprid y thiamethoxam o nicotine o sulfoxaflor o flupyradifurone.
  - (5) Moduladores alostéricos del receptor de acetilcolina nicotínico (nAChR), por ejemplo spinosyns, e.g. spinetoram and spinosad.
  - (6) Moduladores alostéricos del canal de cloruro regulado por glutamato (GluCl), por ejemplo avermectins/milbemycins, e.g. abamectin, emamectin benzoate, lepimectin and milbemectin.
  - (7) Imitadores de la hormona juvenil, por ejemplo: análogos de la hormona juvenil, e.g. hydroprene, kinoprene y methoprene o fenoxycarb o pyriproxyfen.
  - (8) Inhibidores (de múltiples sitios) no específicos misceláneos, por ejemplo haluros de alquilo, e.g. Metil bromuro y otros haluros de alquilo; o chloropicrin o sulfuril fluoruro o borax o tartar emetic o generador de metil isocianato, e.g. diazomet y metam.
  - (9) Moduladores del órgano cordonotal, e.g. pymetrozine o flonicamide.
  - (10) Inhibidores del crecimiento de los ácaros, por ejemplo, clofentezine, hexythiazox, diflovidazin o etoxazole;
  - (11) Disruptores microbianos de las membranas del intestino medio de los insectos, por ejemplo, *Bacillus thuringiensis* subspecies *israelensis*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* subespecies *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subspecies *kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* subespecies *tenebrionis* y *B.t.* Proteínas de plantas: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry1A.105, Cry2Ab, VIP3A, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Ab, Cry34Ab1/35Ab1.
  - (12) Inhibidores de ATP sintasa mitocondrial, como disruptores ATP, por ejemplo diafenthiuron o compuestos de organotin, e.g. azocyclotin, cyhexatin y óxido de fenbutatin o propargite o tetradifon.
  - (13) Desacopladores de la fosforilación oxidativa mediante la alteración del gradiente protónico, por ejemplo, chlorfenapyr, DNOC y sulfluramid;
  - (14) Bloqueadores del canal del receptor de acetilcolina nicotínico, por ejemplo, bensultap, cartap clorhidrato, thiocyclam y thiosultap sodio;

- (15) Inhibidores de la biosíntesis de quitina tipo 0, por ejemplo bistrifluron, chlorfluazuron, diflubenzuron, flucycloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron y triflumuron;
- (16) Inhibidores de la biosíntesis de quitina tipo 1, por ejemplo, buprofezin;
- (17) Disruptores de la muda (en especial en el caso de Diptera), por ejemplo cyromazine.
- (18) Agonistas del receptor de Ecdyson, por ejemplo chromafenozide, halofenozide, methoxyfenozide y tebufenozide.
  - (19) Agonistas del receptor de octopamina, por ejemplo, amitraz.

5

25

30

35

40

45

- (20) Inhibidores del transporte de electrones del complejo mitocondrial III, por ejemplo, hydramethylnon, o acequinocyl o fluacrypyrim.
- (21) Inhibidores del transporte de electrón del complejo mitocondrial I, por ejemplo: acaricidas METI, e.g. 10 fenazaquin, fenpyroximate, pyrimidifen, pyridaben, tebufenpyrad y tolfenpyrad, o rotenone (Derris).
  - (22) Bloqueadores del canal de sodio dependientes del voltaje: indoxacarb o metaflumizone.
  - (23) Inhibidores de acetil CoA carboxilasa, por ejemplo: derivados del ácido tetrónico y tetrámico, que incluyen spirodiclofen, spiromesifen v spirotetramat.
- (24) Inhibidores del transporte de electrones del complejo mitocondrial IV, por ejemplo: fosfinas, e.g. Fosfuro de 15 aluminio, fosfuro de calcio, fosfina y fosfuro de zinc, o cianidas, cianida de calcio, cianida de potasio y cianida de sodio.
  - (25) Inhibidores del transporte de electrones del complejo mitocondrial II: por ejemplo derivados de beta-queto nitrilos, e.g. cyenopyrafen y cyflumetofen y carboxanilides, por ejemplo pyflubumide.
- 20 (28) Moduladores del receptor de rianodina, por ejemplo diaminas, e.g. chlorantraniliprole, cyantraniliprole y flubendiamide,

otros ingredientes activos, por ejemplo: afidopyropen, afoxolaner, azadirachtin, benclothiaz, benzoximate, bifenazate, broflanilide, bromopropylate, chinomethionat, chloroprallethrin, cryolite, cyclaniliprole, cycloxaprid, cyhalodiamide, dicloromezotiaz, dicofol, epsilon metofluthrin, epsilon momfluthrin, flometoguin, fluazaindolizine, fluensulfone, flufenerim, flufenoxystrobin, flufiprole, fluhexafon, fluopyram, fluralaner, fluxametamide, fufenozide, quadipyr, heptafluthrin, imidaclothiz, iprodione, kappa bifenthrin, kappa tefluthrin, lotilaner, meperfluthrin, paichongding, pyridalyl, pyrifluquinazon, pyriminostrobin, spirobudiclofen, tetramethylfluthrin, tetraniliprole, tetrachlorantraniliprole, tioxazafen, thiofluoximate, triflumezopyrim e iodomethane; preparaciones adicionales con respecto a Bacillus firmus (I-1582, BioNeem, Votivo), y los siguientes compuestos: 1-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]-3-(trifluorometil)-1H-1.2.4-triazol-5-amina (conocido del documento WO2006/043635) (CAS 885026-50-6), {1'-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]-5-fluorospiro[indol-3,4'-piperidina]-1(2H)-il}(2-cloropiridin-4-il)metanona documento WO2003/106457) (CAS 637360-23-7), 2-cloro-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]piperidin-4-il}-4-(trifluorometil)fenil]isonicotinamida (conocido del documento WO2006/003494) (CAS 872999-66-1), 3-(4-cloro-2,6dimetilfenil)-4-hidroxi-8-metoxi-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-2-ona (conocido del documento WO 2010052161) (CAS 1225292-17-0), 3-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-4-ilo etilcarbonato (conocido del documento EP 2647626) (CAS-1440516-42-6), 4-(but-2-in-1-iloxi)-6-(3,5-dimetilpiperidin-1-il)-5-fluoropirimidina (conocido del documento WO2004/099160) (CAS 792914-58-0), PF1364 (conocido del documento JP2010/018586) Reg.No. 1204776-60-2), N-[(2E)-1-[(6-cloropiridin-3-yl)metil]piridin-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoroacetamida (conocido del documento WO2012/029672) (CAS 1363400-41-2), (3E)-3-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-1,1,1-trifluoropropan-2-ona (conocido del documento WO2013/144213) (CAS 1461743-15-6), N-[3-(bencilcarbamoil)-4-clorofenil]-1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido del documento WO2010/051926) (CAS 1226889-14-0), 5-bromo-4-cloro-N-[4-cloro-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-2-(3-cloro-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-2-(3-cloro-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-2-(3-cloro-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-2-(3-cloro-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-2-(3-cloro-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-2-(3-cloro-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-2-(3-cloro-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-2-(3-cloro-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-2-(3-cloro-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-2-(3-cloro-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-2-(3-cloro-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-2-(3-cloro-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-2-(3-cloro-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-2-(3-cloro-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-2-(3-cloro-2-metilcarbamoil)fenil piridil)pirazol-3-carboxamida (conocido del documento CN103232431) (CAS 1449220-44-3), 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-metil-N-(cis-1-oxido-3-tietanil)benzamida, 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-metil-N-(trans-1-oxido-3-thietanil)benzamida y 4-[(5S)-5-(3,5-diclorofenil)-4,5dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-metil-N-(cis-1-oxido-3-tietanil)benzamida (conocido del documento WO N-[3-cloro-1-(3-piridinil)-1H-pirazol-4-il]-N-etil-3-[(3,3,3-2013/050317 A1) (CAS 1332628-83-7), trifluoropropil)sulfinil]propanamida, (+)-N-[3-cloro-1-(3-piridinil)-1H-pirazol-4-il]-N-etil-3-[(3,3,3-(-)-N-[3-cloro-1-(3-piridinil)-1H-pirazol-4-il]-N-etil-3-[(3,3,3trifluoropropil)sulfinil]propanamida trifluoropropil)sulfinillpropanamida (conocido del documento WO 2013/162715 A2, WO 2013/162716 A2, US 2014/0213448 A1) (CAS 1477923-37-7), 5-[[(2E)-3-cloro-2-propen-1-il]amino]-1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-4-[(trifluorometil)sulfinil]-1H-pirazol-3-carbonitrilo (conocido del documento CN 101337937 A) (CAS 1105672-77-2), 3-

50 bromo-N-[4-cloro-2-metil-6-[(metilamino)tioxometil]fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-carboxamida, (Liudaibenjiaxuanan, conocido del documento CN 103109816 A) (CAS 1232543-85-9); N-[4-cloro-2-[[(1,1-55

dimetiletil)amino]carbonil]-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(fluorometoxi)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido del documento WO 2012/034403 A1) (CAS 1268277-22-0), N-[2-(5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-il)-4-cloro-6-metilfenil]-3bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido del documento WO 2011/085575 A1) (CAS 1233882-22-8), 4-[3-[2,6-dicloro-4-[(3,3-dicloro-2-propen-1-il)oxi]fenoxi]propoxi]-2-metoxi-6-(trifluorometil)pirimidina (conocido del documento CN 101337940 A) (CAS 1108184-52-6); (2E)- y 2(Z)-2-[2-(4-cianofenil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etiliden]-N-[4-(difluorometoxi)fenil]hidrazinecarboxamida (conocido del documento CN 101715774

60 3-(2,2-diclroroetenil)-2,2-dimetil-4-(1H-benzimidazol-2-il)fenil 1232543-85-9); ácido ciclopropancarboxílico (conocido del documento CN 103524422 A) (CAS 1542271-46-4); (4aS)-7-cloro-2,5-dihidro-2-[[(metoxicarbonil)[4-[(trifluorometil)tio]fenil]amino]carbonil]indeno[1,2-e][1,3,4]oxadiazina-4a(3H)-ácido carboxílico de éster de metilo (conocido del documento CN 102391261 A) (CAS 1370358-69-2); 6-deoxi-3-O-etil-2,4-di-O-metil-1-

[N-[4-[1-[4-(1,1,2,2,2-pentafluoroetoxi)fenil]-1H-1,2,4-triazol-3-il]fenil]carbamato]-α-Ĺ-mannopiranosa (conocido 65

documento US 2014/0275503 A1) (CAS 1181213-14-8); 8-(2-ciclopropilmetoxi-4-trifluorometilfenoxi)-3-(6-trifluorometilpiridazin-3-il)-3-azabiciclo[3.2.1]octano (CAS 1253850-56-4), (8-anti)-8-(2-ciclopropilmetoxi-4-trifluorometilfenoxi)-3-(6-trifluorometilpiridazin-3-il)-3-azabiciclo[3.2.1]octano (CAS 933798-27-7), (8-sin)-8-(2-ciclopropilmetoxi-4-trifluorometilfenoxi)-3-(6-trifluorometilpiridazin-3-il)-3-azabiciclo[3.2.1]octano (CAS 933798-27-7), (8-sin)-8-(2-ciclopropilmetoxi-4-trifluorometilfenoxi)-3-(6-trifluorometilpiridazin-3-il)-3-azabiciclo[3.2.1]octano (conocido del documento WO 2007040280 A1, WO 2007040282 A1) (CAS 934001-66-8) y N-[3-cloro-1-(3-piridinil)-1H-pirazol-4-il]-N-etil-3-[(3,3,3-trifluoropropil)tio]propanamida (conocido del documento WO 2015/058021 A1, WO 2015/058028 A1) (CAS 1477919-27-9).

#### **Fungicidas**

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

Los compuestos activos especificados por su nombre común se conocen y describen, por ejemplo, en "Pesticide Manual (16th Ed. British Crop Protection Council) o se puede buscar en la Internet (por ejemplo: http://www.alanwood.net/pesticides).

Todos los componentes de mezcla que se mencionan en las clases de (1) a (15), según sea el caso, pueden formar sales con bases o ácidos adecuados si son capaces de hacerlo sobre la base de sus grupos funcionales. Todos los componentes de mezcla fungicidas de las clases (1) a (15), según sea el caso, pueden incluir las formas tautoméricas.

1) Inhibidores de la biosíntesis de ergosterol, por ejemplo (1.001) cyproconazole, (1.002) difenoconazole, (1.003) epoxiconazole, (1.004) fenhexamid, (1.005) fenpropidin, (1.006) fenpropimorph, (1.007) fenpyrazamine, (1.008) fluquinconazole, (1.009) flutriafol, (1.010) imazalil, (1.011) imazalil sulphate, (1.012) ipconazole, (1.013) metconazole, (1.014) myclobutanil, (1.015) paclobutrazol, (1.016) prochloraz, (1.017) propiconazole, (1.018) prothioconazole, (1.019) pyrisoxazole, (1.020) spiroxamine, (1.021) tebuconazole, (1.022) tetraconazole, (1.023) triadimenol, (1.024) tridemorph, (1.025) triticonazole, (1.026) (1R,2S,5S)-5-(4-clorobencil)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetil)ciclopentanol, (1.027) (1S,2R,5R)-5-(4-clorobencil)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetil)ciclopentanol, (1.027) triazol-1-ilmetil)ciclopentanol, (1.028) (2R)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1R)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol (1.029) (2R)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1S)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (2R)-2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1.031)(2S)-2-(1-(1.032)clorociclopropil)-4-[(1R)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (2S)-2-(1clorociclopropil)-4-[(1S)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.033) (2S)-2-[4-(4-clorofenoxi)-1-il)butan-2-ol, (1.033) (2S)-2-[4-(4-clorofenoxi)-1-il)butan-2-ol, (1.033) (2S)-2-[4-(4-clorofenoxi)-1-il)butan-2-ol, (1.033) (2S)-2-[4-(4-clorofenoxi)-1-il]butan-2-ol, (1.033) (2S)-2-[4-(4-clorofenoxi)-1-il]butan-2-[4-(4-clorofenoxi)-1-il]b 2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1.034) (R)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (1.035) (S)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (1.035) (S)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (1.035) (S)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(3-(4-cloro-2-fluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (1.035) (S)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (1.035) (S)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (1.035) (S)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-1,2-(4-cloro-2-fluorofenil)-1,2-(4-cloro-2-fluorofenil)-1,2-(4-cloro-2-fluorofenil)-1,2-(4-cloro-2-fluorofenil)-1,2-(4-cloro-2-3-il)metanol, (1.036) [3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (1.037) 1-({(2R,4S)-2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-4-metil-1,3-dioxolan-2-il}metil)-1H-1,2,4-triazol, (1.038) 1-({(2S,4S)-2-(2)-cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-4-metil-1,3-dioxolan-2-il}metil)-1H-1,2,4-triazol, (1.039) 1-{[3-(2-clorofenil)-2-(2,4difluorofenil)oxiran-2-il]metil}-1H-1,2,4-triazol-5-il (1.040)1-{[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4tiocianato. difluorofenil)oxiran-2-il]metil-1H-1,2,4-triazol-5-il tiocianato. (1.041)1-{[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4difluorofenii)oxiran-2-il]metil}-1H-1,2,4-triazol-5-il tiocianato, (1.042) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.043) 2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2.6.6-trimetilheptan-4-ill-2.4-dihidro-3H-1.2.4-triazol-3-tiona. (1.044)2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.045)2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.046)2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.047) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.048) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.049) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-(1.050)2-[1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-2.6.6-trimetilheptan-4-il]-2.4-dihidro-3H-1.2.4-triazol-3-tiona. trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.051) 2-[2-cloro-4-(2,4-diclorofenoxi)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.051) 2-[2-clorofenoxi)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-3-triazol-3-tiona, (1.051) 2-[2-clorofenoxi)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-3triazol-1-il)propan-2-ol, (1.052) 2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.053) 2-[4-(4clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.054)2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)pentan-2-ol, (1.055) 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)pentan-2-ol, 1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1.056) 2-{[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil}-2,4-dihidro-3H-1,2,4-2-{[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil}-2,4-dihidro-3H-1,2,4-2-{[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil}-2,4-dihidro-3H-1,2,4triazol-3-tiona. (1.057)triazol-3-tiona, (1.059) 5-(4-clorobencil)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetil)ciclopentanol, (1.060) 5-5-(alilsulfanil)-1- $(1.061)^{\cdot}$ (alilsulfanil)-1-{[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil}-1H-1,2,4-triazol, {[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil}-1H-1,2,4-triazol, (1.062)5-(alilsulfanil)-1-{[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil}-1H-1,2,4-triazol, N'-(2,5-dimetil-4-{[3-(1.063)(1.064) (1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil]sulfanil}fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, N'-(2,5-dimetil-4-{[3-(2,2,2trifluoroetoxi)fenillsulfanil}fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida. (1.065)N'-(2,5-dimetil-4-{[3-(2,2,3,3tetrafluoropropoxi)fenil]sulfanil)fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.066)N'-(2,5-dimetil-4-{[3-(pentafluoroetoxi)fenil]sulfanil}fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, N'-(2,5-dimetil-4-{3-[(1,1,2,2-(1.067)N'-(2,5-dimetil-4-{3-[(2,2,2tetrafluoroetil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.068)trifluoroetil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.069)N'-(2,5-dimetil-4-{3-[(2,2,3,3-(1.070)tetrafluoropropil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, N'-(2,5-dimetil-4-{3-[(pentafluoroetil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.071) N'-(2,5-dimetil-4-fenoxifenil)-N-etil-Nmetilimidoformamida, (1.072) N'-(4-{[3-(difluorometoxi)fenil]sulfanil}-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidoformamida,

(1.073) N'-(4-{3-[(difluorometil)sulfanil]fenoxi}-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.074) N'-[5-bromo-6-(2,3-dihidro-1H-inden-2-iloxi)-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.075) N'-{4-[(4,5-dicloro-1,3tiazol-2-l)oxi]-2,5-dimetilpenil}-N-etil-N-metilimidoformamida, N'-{5-bromo-6-[(1R)-1-(3,5-(1.076)difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il}-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.077)N'-{5-bromo-6-[(1S)-1-(3,5difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il}-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.078)N'-{5-bromo-6-[(cis-4isopropilciclohexil)oxi]-2-metilpiridin-3-il}-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.079)N'-{5-bromo-6-[(trans-4isopropilciclohexil)oxi]-2-metilpiridin-3-il}-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.080)N'-{5-bromo-6-[1-(3,5difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il}-N-etil-N-metilimidoformamida.

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

2) Inhibidores de la cadena respiratoria en el complejo I o II, por ejemplo (2.001) benzovindiflupyr, (2.002) bixafen, (2.003) boscalid, (2.004) carboxin, (2.005) fluopyram, (2.006) flutolanil, (2.007) fluxapyroxad, (2.008) furametpyr. (2.009) isofetamid. (2.010) isopyrazam (enantiómero anti-epimérico 1R.4S.9S). (2.011) isopyrazam (enantiómero anti-epimérico 1S,4R,9R), (2.012) isopyrazam (racemato anti-epimérico 1RS,4SR,9SR), (2.013) isopyrazam (mezcla del racemato sin-epimérico 1RS,4SR,9RS y el racemato anti-epimérico 1RS,4SR,9SR), (2.014) isopyrazam (enantiómero sin-epimérico 1R,4S,9R), (2.015) isopyrazam (enantiómero sin-epimérico 1S,4R,9S), (2.016) isopyrazam (racemato sin-epimérico 1RS,4SR,9RS), (2.017) penflufen, (2.018) penthiopyrad, (2.019) pydiflumetofen, (2.020) pyraziflumid, (2.021) sedaxane, (2.022) 1,3-dimetil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.023) 1,3-dimetil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1Hpirazol-4-carboxamida, (2.024)1,3-dimetil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4carboxamida, (2.025) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[2'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.026) 2fluoro-6-(trifluorometil)-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)benzamida, (2.027) 3-(difluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.028) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.028) 3-(difluorometil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.028) 3-(difluorometil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.028) 3-(difluorometil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.028) 3-(difluorometil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.028) 3-(difluorometil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.028) 3-(difluorometil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-inden-4-il)-1H-inden-4-il-1H-inde trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.029) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.030) 3-(difluorometil)-N-(7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.031)3-(difluorometil)-N-[(3R)-7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-3-(difluorometil)-N-[(3S)-7-fluoro-1,1,3-trimetildihidro-1H-inden-4-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.032)2.3-dihidro-1H-inden-4-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.033)5,8-difluoro-N-[2-(2-fluoro-4-{[4-(2.034)(trifluorometil)piridin-2-il]oxi}fenil)etil]quinazolin-4-amina, N-(2-ciclopentil-5-fluorobencil)-N-ciclopropil-3-(2.035)(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, N-(2-tert-butil-5-metilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.036)N-(2-tert-butilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida. (2.037)N-(5-cloro-2-etilbencil)-N-ciclopropil-3-N-(5-cloro-2-isopropilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.038)(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.039) N-[(1R,4S)-9-(diclorometilen)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.040) N-[(1S,4R)-9-(diclorometilen)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.041) N-[1-(2,4diclorofenil)-1-metoxipropan-2-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.042)(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.043) N-[3-cloro-2-fluoro-6-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, N-[5-cloro-2-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.045) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-N-[5-metil-2-(trifluorometil)bencil]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.046) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-fluoro-6-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.047) Nciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropil-5-metilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.048)ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carbotioamida, (2.049) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida. (2.050)N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(5-fluoro-2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.051)N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-4,5-dimetilbencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, N-ciclopropil-3-(2.052)(difluorometil)-N-(2-etil-5-fluorobencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.053)N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-5-metilbencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.054)N-ciclopropil-N-(2ciclopropil-5-fluorobencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.055) N-ciclopropil-N-(2ciclopropil-5-metilbencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.056) N-ciclopropil-N-(2ciclopropilbencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida.

3) Inhibidores de la cadena respiratoria en el complejo III por ejemplo (3.001) ametoctradin, (3.002) amisulbrom, (3.003) azoxystrobin, (3.004) coumethoxystrobin, (3.005) coumoxystrobin, (3.006) cyazofamid, (3.007) dimoxystrobin, (3.008) enoxastrobin, (3.009) famoxadon, (3.010) fenamidon, (3.011) flufenoxystrobin, (3.012) fluoxastrobin, (3.013) kresoxim-methyl, (3.014) metominostrobin, (3.015) orysastrobin, (3.016) picoxystrobin, (3.017) pyraclostrobin, (3.018) pyrametostrobin, (3.019) pyraoxystrobin, (3.020) trifloxystrobin (3.021) (2E)-2-{2-[({[(1E)-1-(3-{[(E)-1-fluoro-2-fenilvinil]oxi}fenil)etiliden]amino}oxi)metil]fenil}-2-(metoximino)-N-metilacetamida, (3.022) (2E,32)-5-{[1-(4-clorofenil)-1H-pirazol-3-il]oxi}-2-(metoxiimino)-N,3-dimetilpent-3-enamida, (3.023) (2R)-2-{2-[(2,5-dimetilfenoxi)metil]fenil}-2-metoxi-N-metilacetamida, (3.024) (2S)-2-{2-[(2,5-dimetilfenoxi)metil]fenil}-2metoxi-N-metilacetamida. (3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[({3-[(isobutiriloxi)metoxi]-4-metoxipiridin-2-(3.025)il}carbonil)amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-il 2-metilpropanoato, (3.026)N-(3-etil-3,5,5-trimetilciclohexil)-3-formamido-2dimetilfenoxi)metil]fenil}-2-metoxi-N-metilacetamida, (3.027)hidroxibenzamida, (3.028) (2E,3Z)-5-{[1-(4-cloro-2-fluorofenil)-1H-pirazol-3-il]oxi}-2-(metoxiimino)-N,3-dimetilpent-3-enamida.

- 4) Inhibidores de la mitosis y división celular, por ejemplo (4.001) carbendazim, (4.002) diethofencarb, (4.003) ethaboxam, (4.004) fluopicolid, (4.005) pencycuron, (4.006) thiabendazole, (4.007) tiofanato-metilo, (4.008) zoxamida, (4.009) 3-cloro-4-(2,6-difluorofenil)-6-metil-5-fenilpiridazina, (4.010) 3-cloro-5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-metilpiridazina, (4.011) 3-cloro-5-(6-cloropiridin-3-il)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)piridazina, (4.012) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.013) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-bromo-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.016) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-clorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.017) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.019) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.020) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2-clorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.021) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.023) N-(2-bromo-6-fluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.024) N-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.025) N-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.025) N-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.025) N-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.025) N-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina.
- 5) Compuestos que tienen la capacidad de actividad multisitio, por ejemplo (5.001) mezcla de Bordeaux, (5.002) captafol, (5.003) captan, (5.004) chlorthalonil, (5.005) hidróxido de cobre (5.006) naftaleno de cobre, (5.007) óxido de cobre, (5.008) oxicloruro de cobre, (5.009) sulfato de cobre(2+), (5.010) dithianon, (5.011) dodin, (5.012) folpet, (5.013) mancozeb, (5.014) maneb, (5.015) metiram, (5.016) zinc metiram, (5.017) óxido de cobre, (5.018) propineb, (5.019) azufre y preparaciones de azufre que incluyen polisulfuro de calcio, (5.020) thiram, (5.021) zineb, (5.022) ziram.
- 6) Compuestos capaces de desencadenar defensa del huésped, por ejemplo (6.001) acibenzolar-S-methyl, (6.002) isotianil, (6.003) probenazole, (6.004) tiadinil.
- 7) Aminoácido y/o inhibidores de la biosíntesis de proteína, por ejemplo: (7.001) cyprodinil, (7.002) kasugamycin, (7.003) hidrato de hidrocloruro de kasugamycin, (7.004) oxitetraciclina, (7.005) pirimetanil, (7.006) 3-(5-fluoro-3,3,4,4-tetrametil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina.
  - (8) Inhibidores de la producción de ATP, por ejemplo: (8.001) silthiofam.

5

10

15

20

25

30

35

45

50

55

- 9) Inhibidores de la síntesis de la pared celular, por ejemplo: (9.001) benthiavalicarb, (9.002) dimethomorph, (9.003) flumorph, (9.004) iprovalicarb, (9.005) mandipropamid, (9.006) pyrimorph, (9.007) valifenalate, (9.008) (2E)-3-(4-tert-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona, (9.009) (2Z)-3-(4-tert-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona.
- 10) Inhibidores de la síntesis de lípido y membrana, por ejemplo: (10.001) propamocarb, (10.002) hidrocloruro de propamocarb, (10.003) tolclofos-metilo.
- 11) Inhibidores de la biosíntesis de melanina, por ejemplo: (11.001) tricyclazole, (11.002) 2,2,2-trifluoroetil {3-metil-1-[(4-metilbenzoil)amino]butan-2-il}carbamato.
  - 12) Inhibidores de la síntesis de ácido nucleico, por ejemplo: (12.001) benalaxyl, (12.002) benalaxyl-M (kiralaxyl), (12.003) metalaxyl, (12.004) metalaxyl-M (mefenoxam).
  - 13) Inhibidores de la transducción de señal, por ejemplo: (13.001) fludioxonil, (13.002) iprodione, (13.003) procymidone, (13.004) proquinazid, (13.005) quinoxyfen, (13.006) vinclozolin.
- 40 14) Compuestos que pueden actuar como desacopladores, por ejemplo: (14.001) fluazinam, (14.002) meptyldinocap.
  - 15) Otros compuestos, por ejemplo (15.001) ácido abscísico, (15.002) benthiazole, (15.003) bethoxazin, (15.004) capsimycin, (15.005) carvone, (15.006) chinomethionat, (15.007) cufraneb, (15.008) cyflufenamid, (15.009) cymoxanil, (15.010) cyprosulfamide, (15.011) flutianil, (15.012) fosetil-aluminio, (15.013) fosetil-calcio, (15.014) fosetil-sodio, (15.015) metil isotiocianato, (15.016) metrafenon, (15.017) mildiomycin, (15.018) natamycin, (15.019) níquel dimetilditiocarbamato, (15.020) nitrotal-isopropilo, (15.021) oxamocarb, (15.022) oxathiapiprolin, (15.023) oxyfenthiin, (15.024) pentaclorofenol y sales, (15.025) ácido fosfónico y sus sales, (15.026) propamocarb-fosetilato, (15.027) pyriofenone (chlazafenone) (15.028) tebufloquin, (15.029) tecloftalam, (15.030) tolnifanide, (15.031) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il]etanone, (15.032) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-i.l)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, (15.033) 2-(6-bencilpiridin-2-il)quinazolina, (15.034) 2,6-dimetil-1H,5H-[1,4]ditiino[2,3-c:5,6-c']dipirrol-1,3,5,7(2H,6H)-tetrona, (15.035) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-cloro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il}-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15.036) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-cloro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il}-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15.036) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1,3-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1,3-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1,3-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1,3-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1,3-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1,3-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1,3-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1,3-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1,3-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1,3-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1,3-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1,3-bis(difluorometil
- pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-fluoro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il}-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15.038) 2-[6-(3-fluoro-4-metoxifenil)-5-metilpiridin-2-il]quinazolina, (15.039) 2-{(5R)-3-[2-(1-{[3,5-

bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il}-3-clorofenil metanesulfonato, (15.040) 2-{(5S)-3-[2-(1-{[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il}-3-clorofenil metanesulfonato, (15.041) 2-{2-[(7,8-difluoro-2-metilquinolin-3-il)oxi]-6fluorofenil}propan-2-ol, (15.042) 2-{2-fluoro-6-[(8-fluoro-2-metilquinolin-3-il)oxi]fenil}propan-2-ol, (15.043) 2-{3-[2-(1-{[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il}-3-clorofenil metanesulfonato, (15.044) 2-{3-[2-(1-{[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5dihidro-1,2-oxazol-5-il}fenil metanesulfonato, (15.045) 2-fenilfenol y sus sales, (15.046) 3-(4,4,5-trifluoro-3,3dimetil-3,4-dihidroisoguinolin-1-il)guinolina, (15.047)3-(4,4-difluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoguinolin-1il)quinolina, (15.048) 4-amino-5-fluoropirimidin-2-ol (forma tautomérica: 4-amino-5-fluoropirimidin-2(1H)-ona), (15.049) ácido 4-oxo-4-[(2-feniletil)amino]butírico, (15.050) 5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-tiol, (15.051) 5-cloro-N'-fenil-N'-(prop-2-in-1-il)tiofen 2-sulfonohidrazida, (15.052) 5-fluoro-2-[(4-fluorobencil)oxi]pirimidin-4-amina, (15.053) 5-9-fluoro-2,2-dimetil-5-(quinolin-3-il)-2,3-dihidro-1,4fluoro-2-[(4-metilbencil)oxi]pirimidin-4-amina, (15.054)benzoxazepina, (15.055) but-3-in-1-il {6-[({[(Z)-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]amino}oxi)metil]piridin-2il}carbamato, (15.056) etil (2Z)-3-amino-2-ciano-3-fenilacrilate, (15.057) ácido de fenazina-1-carboxílico, (15.058) propil 3,4,5-trihidroxibenzoato, (15.059) quinolin-8-ol, (15.060) quinolin-8-ol sulfato (2:1), (15.061) tert-butil (6-[({[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]amino}oxi)metil]piridin-2-il}carbamato.

### Plaguicidas biológicos como componentes de mezcla

5

10

15

20

45

50

55

Los compuestos de la Fórmula (I) pueden combinarse como plaguicidas biológicos.

Los plaguicidas biológicos incluyen especialmente bacterias, hongos, levaduras, extractos de plantas y productos formados por microorganismos, que incluyen proteínas y metabolitos secundarios.

Los plaguicidas biológicos incluyen bacterias como bacterias que forman esporas, bacterias colonizantes de raíces y bacterias que funcionan como insecticidas biológicos, fungicidas o nematicidas.

Los ejemplos de estas bacterias que se utilizan o que pueden utilizarse como plaguidas biológicos son:

Bacillus amyloliquefaciens, cepa FZB42 (DSM 231179), o Bacillus cereus, en especial B. cereus cepa CNCM I-1562
o Bacillus firmus, cepa I-1582 (número de acceso CNCM I-1582) o Bacillus pumilus, en especial la cepa GB34 (Número de acceso ATCC 700814) y la cepa QST2808 (Numero de acceso NRRL B-30087), o Bacillus subtilis, en especial la cepa GB03 (Número de acceso ATCC SD-1397), o Bacillus subtilis cepa QST713 (Número de acceso NRRL B-21661) o Bacillus subtilis cepa OST 30002 (Número de acceso NRRL B-50421) Bacillus thuringiensis, en especial B. thuringiensis subespecies israelensis (serotipo H-14), cepa AM65-52 (Número de acceso No. ATCC 1276), o B. thuringiensis subsp. aizawai, en especial la cepa ABTS-1857 (SD-1372), o B. thuringiensis subsp. kurstaki cepa HD-1, o B. thuringiensis subsp. tenebrionis cepa NB 176 (SD-5428), Pasteuria penetrans, Pasteuria spp. (Rotylenchulus reniformis nematode)-PR3 (Número de acceso ATCC SD-5834), Streptomyces microflavus cepa AQ6121 (= QRD 31.013, NRRL B-50550), Streptomyces galbus scepa AQ 6047 (Número de acceso: NRRL 30232).

Ejemplos de hongos o levaduras que se utilizan o que pueden utilizarse como plaguicidas biológicos son:

Beauveria bassiana, en particular la cepa ATCC 74040, Coniothyrium minitans, en particular la cepa CON/M/91-8 (Número de acceso DSM-9660), Lecanicillium spp., en particular la cepa HRO LEC 12, Lecanicillium lecanii, (antes conocida como Verticillium lecanii), en particular la cepa KV01, Metarhizium anisopliae, en particular la cepa F52 (DSM3884/ ATCC 90448), Metschnikowia fructicola, en particular la cepa NRRL Y-30752, Paecilomyces fumosoroseus (nueva: Isaria fumosorosea), en particular la cepa IFPC 200613, o la cepa Apopka 97 (Número de acceso ATCC 20874), Paecilomyces lilacinus, en particular P. lilacinus cepa 251 (AGAL 89/030550), Talaromyces flavus, en particular la cepa V117b, Trichoderma atroviride, en particular la cepa SC1 (Número de acceso CBS 122089), Trichoderma harzianum, en particular T. harzianum rifai T39 (Número de acceso CNCM I-952).

Ejemplos de virus que se utilizan o que pueden utilizarse como plaguicidas biológicos son:

Adoxophyes orana (polilla tórtrix de los frutos de verano) virus de la granulosis (GV), Cydia pomonella (polilla del manzano) virus de la granulosis (GV), Helicoverpa armigera (gusano cogollero) virus de la poliedrosis nuclear (NPV), Spodoptera exigua (gusano soldado) mNPV, Spodoptera frugiperda (cogollero del maíz) mNPV, Spodoptera littoralis (rosquilla negra) NPV.

También se incluyen bacterias y hongos que se agregan como "inoculantes" a las plantas o a las partes de plantas o a los órganos de plantas y que, en virtud de sus propiedades particulares, promueven el crecimiento y bienestar de las plantas. Los ejemplos incluyen:

Agrobacterium spp., Azorhizobium caulinodans, Azospirillum spp., Azotobacter spp., Bradyrhizobium spp., Burkholderia spp., en especial Burkholderia cepacia (antes conocido como Pseudomonas cepacia), Gigaspora spp., o Gigaspora monosporum, Glomus spp., Laccaria spp., Lactobacillus buchneri, Paraglomus spp., Pisolithus tinctorus, Pseudomonas spp., Rhizobium spp., en especial Rhizobium trifolii, Rhizopogon spp., Scleroderma spp., Suillus spp., Streptomyces spp.

Los ejemplos de extractos de plantas o de productos que se forman por microorganismos, que incluyen proteínas y metabolitos secundarios, que se utilizan o que pueden utilizarse como plaguicidas biológicos son:

Allium sativum, Artemisia absinthium, azadirachtin, Biokeeper WP, Cassia nigricans, Celastrus angulatus,

Chenopodium anthelminticum, chitin, Armour-Zen, Dryopteris filix-mas, Equisetum arvense, Fortune Aza, Fungastop, Heads Up (extracto de saponinas de Chenopodium quinoa), pyrethrum/pyrethrins, Quassia amara, Quercus, Quillaja, Regalia, "Requiem ™ Insecticide", rotenone, ryania/ryanodine, Symphytum officinale, Tanacetum vulgare, thymol, Triact 70, TriCon, Tropaeulum majus, Urtica dioica, Veratrin, Viscum album, extracto de Brassicaceae, en especial polvo de colza oleaginosa o polvo de mostaza.

#### Protectores como componentes de mezcla

Los compuestos de la fórmula (I) pueden combinarse como protectores, por ejemplo: benoxacor, cloquintocet (-mexilo), cyometrinil, cyprosulfamide, dichlormid, fenchlorazole (-etilo), fenclorim, flurazole, fluxofenim, furilazole, isoxadifen (-etilo), mefenpyr (-dietilo), anhídrido naftálico, oxabetrinil, 2-metoxi-N-({4-[(metilcarbamoil)amino]fenil}sulfonil)benzamida (CAS 129531-12-0), 4-(dicloroacetil)-1-oxa-4-azaspiro[4.5]decano (CAS 71526-07-3), 2,2,5-trimetil-3-(dicloroacetil)-1,3-oxazolidina (CAS 52836-31-4).

#### Plantas y partes de plantas

10

15

20

25

35

40

45

50

55

Todas las plantas y las partes de plantas pueden tratarse según la invención. Se entiende en la presente a las plantas como todas las plantas y poblaciones de plantas, como plantas salvajes o de cultivo deseables e indeseables (que incluyen plantas de cultivo que ocurren de forma natural), por ejemplo: cereales (trigo, arroz, triticale, cebada, centeno, avena), maíz, habas de soja, papas, remolacha azucarera, caña de azúcar, tomates, pimientos morrones, pepinos, melones, zanahorias, sandías, cebollas, lechuga, espinaca, puerros, habas, Brassica oleracea (e.g. repollo) y otras especies de vegetales, algodón, tabaco, colza oleaginosa, y también plantas frutales (las frutan son manzanas, peras, frutas cítricas y uvas). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que pueden obtenerse mediante reproducción convencional y optimización de procedimientos o mediante procedimientos de ingeniería biotecnológica y genética o combinaciones de estos procedimientos, que incluyen plantas transgénicas e incluyen los cultivares de plantas que son protegibles o no protegibles por los derechos de los obtentores. Se debe entender a las plantas como todas las etapas de desarrollo como la semilla, el plantón, las plantas jóvenes (inmaduras), hasta y que incluye a las plantas maduras. Las partes de plantas deben entenderse como todas las plantas y órganos de las plantas sobre y debajo del suelo, como el tallo, la hoja, la flor, la raiz, por ejemplo; hojas, acículas, tallos, vástagos, flores, carozos, frutas y semillas, y también raíces, tubérculos y rizomas. Las partes de plantas también incluyen plantas cultivadas o partes de plantas cultivadas y material de propagación vegetativa y generativa, por ejemplo: esquejes, tubérculos, rizomas, injertos y semillas.

El tratamiento según la invención de las plantas o partes de plantas con los compuestos de la fórmula (I) se efectúan en forma directa o al permitirle a los compuestos actuar en los alrededores, en el hábitat o en su espacio de almacenamiento mediante los procedimientos de tratamiento comunes, por ejemplo: al sumergir, rociar, evaporar, pulverizar, esparcir, pintar, inyectar y, en el caso del material de propagación, en especial en el caso de las semillas, también al aplicar una o más capas.

Como ya se mencionó anteriormente, es posible tratar todas las plantas y a sus partes según la invención. En una forma de realización preferida, se tratan a las especies de plantas salvajes y cultivares de plantas, y aquellos obtenidos por procedimientos de cultivo biológico convencional, como cruza o fusión de protoplasto, y sus partes. En otra forma de realización preferida, las plantas transgénicas y cultivares de planta obtenidos por procedimientos de ingeniería genética, se tratan si son adecuadas en combinación con procedimientos convencionales (organismos genéticamente modificados) y sus partes. El término "partes" o "partes de plantas" se explicaron anteriormente. Se le da particular preferencia de acuerdo con la invención al tratamiento de plantas de los respectivos cultivares de plantas comercialmente habituales o aquellos que están en uso. Se entiende a los cultivares de planta como plantas que tienen nuevas propiedades ("rasgos") y que se obtuvieron mediante cultivo convencional, por mutagénesis o técnicas de ADN recombinante. Pueden ser cultivares, variedades, biotipos o genotipos.

#### Plantas transgénicas, tratamiento de las semillas y eventos de integración

Las plantas transgénicas o cultivares de plantas preferidas (aquellas que se obtienen mediante ingeniería genética) que van a tratarse según la invención, incluyen a todas las plantas que, a través de la modificación genética, recibieron material genético que imparte propiedades útiles ventajosas particulares ("rasgos") a estas plantas. Los ejemplos de estas propiedades son el mejor crecimiento de las plantas, la tolerancia aumentada a las altas o bajas temperaturas, la tolerancia aumentada a la sequía o a los niveles de agua o de salinidad del suelo, al desempeño mejorado de la floración, al cultivo más sencillo, a la maduración acelerada, a los mayores rendimientos de cultivo, a la mayor calidad y/o mayor valor nutricional de los productos cultivados, al mejor periodo de conservación y/o procesabilidad de los productos cultivados. Los otros ejemplos particularmente enfatizados de estas propiedades son la resistencia aumentada de las plantas contra las plagas animales o microbiales, como insectos, arácnidos, nematodos, garrapatas, babosas y caracoles, debido a, por ejemplo, las toxinas que se forman en las plantas, en particular aquellas que se forman en las plantas por el material genético de Bacillus thuringiensis (por ejemplo: por los genes CrylA(a), CrylA(b), CrylA(c), CrylIA, CrylIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb y CrylF y también sus combinaciones), y también la resistencua aumentada de las plantas contra los hongos fitopatógenos, bacterias y/o virus causados, por ejemplo: por la resistencia sistémica adquirida (SAR), sistemina, fitoalexinas, elicitores y genes de resistencia y proteínas y toxinas que se expresan en consecuencia, y también la tolerancia aumentada de las

plantas a ciertos compuestos activos como herbicidas, por ejemplo: imidazolinonas, sulfonilureas, glifosato o fosfinotricina (por ejemplo. El gen "PAT"). Los genes que inparten las propiedades deseadas ("rasgos") en cuestión también pueden estar presentes en combinación entre sí en las plantas transgénicas. Los ejemplos de plantas transgénicas mencionadas incluyen las plantas de cultivo importantes, como cereales (trigo, arroz, triticale, cebada, centeno, avena) maíz, habas de soja, papas, remolacha azucarera, caña de azúcar, tomates, arvejas y otro tipo de vegetales, algodón, tabaco, colza oleaginosa y también plantas frutales (las frutas son: manzanas, peras, frutas cítricas y vides), se le da particular énfasis al maíz, a las habas de soja, al trigo, al arroz, a las papas, al algodón, a la caña de azúcar, al tabaco y a la colza oleaginosa. Las propiedades ("rasgos") que tienen un énfasis particular son la resistencia aumentada de las plantas a los insectos, arácnidos, nematodos y babosas y caracoles.

### 10 Protección de cultivo - tipos de tratamiento

Las plantas y partes de plantas se tratan con los compuestos de la fórmula (I) directamente o por acción de sus alrededores, hábitat o espacio de almacenamiento mediante el uso de procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo: al sumergir, rociar, atomizar, irrigar, evaporar, espolvorear, pulverizar, difundir, mediante la formación de espuma, pintar, esparcir, inyectar, regar (empapar), mediante irrigación por goteo y, en el caso del material de propagación, en particular en el caso de semillas, además de un tratamiento seco de semillas, tratamiento líquido de semillas, tratamiento en suspensión, por incrustación, al recubrir con una o más capas, etc. También es posible aplicar los compuestos de la fórmula (I) mediante el procedimiento de volumen ultrabajo o inyectar la forma de aplicación o el compuesto mismo de la fórmula (I) en el suelo.

Un tratamiento directo preferido de las plantas es la aplicación foliar, que significa que los compuestos de la fórmula (I) se aplican en el follaje, en cuyo caso la frecuencia de tratamiento y la frecuencia de aplicación deben ajustarse según el nivel de infestación con la plaga en cuestión.

En el caso de los compuestos sistémicamente activos, los compuestos de la fórmula (I) también acceden a las plantas a través del sistema de raiz. Entonces, las plantas se tratan por la acción de los compuestos de la fórmula (I) en el hábitat de la planta. Esto puede lograrse, por ejemplo, al empapar, o al mezclar en el suelo o la solución del nutriente, lo que significa que el lugar de la planta (por ejemplo: el suelo o los sistemas hidropónicos) se impregna con una forma líquida de los compuestos de la fórmula (I), o por aplicación en el suelo, lo que significa que los compuestos de la fórmula (I) según la invención se introducen en forma sólida (por ejemplo: en forma de gránulos) en el lugar de la planta. En el caso de los arrozales, esto puede lograrse al medir el compuesto de la fórmula (I) en una forma de aplicación sólida (por ejemplo como gránulos) en un arrozal inundado.

### 30 Tratamiento de las semillas

15

20

25

35

40

45

50

55

El control de las plagas animales por el tratamiento de las semillas de las plantas se conoce hace mucho tiempo y es el motivo de mejoras constantes. Aun así, el tratamiento de semillas conlleva una serie de problemas que no siempre pueden resolverse de manera satisfactoria. Por ende, es deseable desarrollar procedimientos para proteger a las semillas y que la planta germinadora que distribuye, o al menos reduce de forma considerable, la aplicación adicional de plaguicidas durante el almacenamiento, luego de la siembra o luego de la germinación de las plantas. También es deseable optimizar la cantidad de ingrediente activo utilizado a modo de proveer una protección óptima para la semilla y la planta germinadores del ataque de las plagas animales, pero sin dañar a la planta en sí misma por el ingrediente activo utilizado. En particular, los procedimientos para el tratamiento de plantas también debe tener en cuenta las propiedades insecticidas o nematicidas intrínsecas de la resistencia a las plagas o las plantas transgénicas tolerantes, para poder lograr la protección óptima de la semilla y también de la planta germinadora con un mínimo gasto en plaguicidas.

La presente invención entonces, en particular, también se relaciona con un procedimiento para la protección de semillas y de plantas germinadoras del ataque de las plagas, mediante el tratamiento de las semillas con uno de los compuestos de la fórmula (I): El procedimiento según la invención para proteger a la semilla y a las plantas germinadoras contra el ataque de las plagas además comprende un procedimiento en el que las semilla se trata en forma simultánea en una operación o de manera secuencial con un compuesto de la fórmula (I) y un componente de mezcla. También comprende un procedimiento en el que la semilla se trata en distintos momentos con un compuesto de la fórmula (I) y un componente de mezclado.

Asimismo la invención se relaciona con el uso de los compuestos de la fórmula (I) para el tratamiento de la semilla para proteger a la semilla y a la planta resultante de las plagas animales.

La invención además se relaciona con la semilla que se trató con un compuesto de la fórmula (I) según la invención para la protección de plagas animales. La invención también se relaciona con la semilla que fue tratada de manera simultánea con un compuesto de la fórmula (I) y un componente de mezclado. La invención también se relaciona con la semilla que se trató en distintos momentos con un compuesto de la fórmula (I) y un componente de mezclado. En el caso de la semilla que se trató en distintos momentos con un compuesto de la fórmula (I) y un componente de mezclado, las sustancias individuales pueden estar presentes en la semilla en las diferentes capas. En este caso, las capas comprenden un compuesto de la fórmula (I) y componentes de mezclado pueden estar separados, opcionalmente, por una capa intermedia. La invención también se relaciona con la semilla en la que un compuesto

de la fórmula (I) y un componente de mezclado se aplicaron como parte de un recubrimiento o como otra capa u otras capas además de un recubrimiento.

La invención además se relaciona con una semilla que, luego del tratamiento con un compuesto de la fórmula (I), está sujeta a un procedimiento de recubrimiento con película para evitar la abrasión del polvo en la semilla.

Una de las ventajas que ocurre cuando un compuesto de la fórmula (I) actúa sistémicamente es que el tratamiento de la semilla protege no solo a la semilla en sí misma, sino también a las plantas que resultan de ella, luego de la germinación, a partir de las plagas animales. De esta manera, el tratamiento inmediato del cultivo al momento de la siembra o poco después, puede distribuirse.

Otra ventaja es que el tratamiento de la semilla con un compuesto de la fórmula (I) puede mejorar la germinación y la germinación de la semilla tratada.

También se considera ventajoso que los compuestos de la fórmula (I) pueden también utilizarse especialmente para semillas transgénicas.

Además, los compuestos de la fórmula (I) pueden emplearse en combinación con composiciones de tecnología de señalización, lo que conlleva a una mejor colonización por simbionetes, por ejemplo: rizobia, micorrizias y/o bacterias endofíticas u hongos y/o para optimizar la fijación del nitrógeno.

15

20

35

40

45

55

Los compuestos de la fórmula (I) son adecuados para la protección de semillas de cualquier variedad de plantas que se utiliza en la agricultura, en el invernadero, en bosques o en horticultura, más particularmente, es la semilla de los cereales (por ejemplo trigo, centeno, cebada, mijo y avena), maíz, algodón, habas de soja, arroz, papas, girasol, café, tabaco, canola, colza oleaginosa, remolacha (por ejemplo remolacha azucarera y remolacha forrajera), maní, vegetales (por ejemplo: tomates, pepinos, habas, vegetales crucíferos, cebollas y lechuga), plantas frutales, césped y plantas ornamentales. El tratamiento de la semilla de los cereales (como el trigo, el centeno, la cebada y la avena), el maíz, las habas de soja, el algodón, la canola, la colza oleaginosa, los vegetales y el arroz es de particular importancia.

Como ya se mencionó anteriormente, el tratamiento de semilla transgénica con un compuesto de la fórmula (I) también es de importancia particular. Esto involucra a la semilla de las plantas que por lo general contiene al menos un gen heterólogo que controla la expresión de un polipéptido que tiene propiedades insecticidas y/o nematicidas en particular. Los genes heterólogos en la semilla transgénica pueden originarse a partir de microorganismos como Bacillus, Rhizobium, Pseudomonas, Serratia, Trichoderma, Clavibacter, Glomus o Gliocladium. La presente invención es particularmente adecuada para el tratamiento de la semilla transgénica, que comprende al menos un gen heterólolo que se origina de Bacillus sp. El gen heterólogo deriva con mayor preferencia de Bacillus thuringiensis.

En el contexto de la presente inevención, el compuesto de la fórmula (I) se aplica a la semilla. La semilla se trata, con preferencia, en un estado en el que es suficientemente estable para que no ocurran daños durante el tratamiento. En general, la semilla puede tratarse en cualquier momento entre el cultivo y la siembra. Es común utilizar semilla que se separó de la planta y se liberó de la mazorca, de las cáscaras, de los tallos, de las capas, los cabellos o la carne de las frutas. Por ejemplo, es posible utilizar una semilla que fue cultivada, limpiada y secada en un contenido hidratado que permite el almacenamiento. De manera alternativa, también es posible utilizar una semilla que, luego del secado, haya sido tratada con, por ejemplo: agua y luego vuelta a secar, por ejemplo: imprimación. En el caso de las semillas de arroz, es posible utiliziar simillas que se haya empapado, por ejemplo en agua, hasta que alcanza cierta etapa del embrión de arroz ("etapa pecho de paloma") que resulta en la estimulación de la germinación y la germinación más uniforme.

Cuando se trata a la semilla, se debe tener cuidado en que la cantidad del compuesto de la fórmula (I) que se aplica a la semilla y/o la cantidad de otros aditivos se elige de manera que la germinación de la semilla no se vea afectada en forma adversa, o que la planta resultante no esté dañanda. Esto debe asegurarse en particular en el caso de los ingredientes activos que pueden exhibir efectos fitotóxicos con ciertas frecuencias de aplicación.

En general, los compuestos de la fórmula (I) se aplican a la semilla en forma de formulación adecuada. Las formulaciones adecuadas y los procedimientos para el tratamiento de la semilla se conocen por la persona versada en la materia.

Los compuestos de la fórmula (I) pueden convertirse en formulaciones de recubrimiento de semillas habituales como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, espumas, lechadas u otras composciones de recubrimiento para semillas, y también formulaciones ULV.

Estas fromualciones están preparadas de forma conocida, al mezclar los compuestos de la fórmula (I) con aditivos habituales, por ejemplo: extensores habituales y solventes o diluyentes, tinturas, agentes humectantes, dispersantes, emulsificantes, antiespumantes, conservantes, espesantes secundarios, adhesivos, giberelinas, y también agua.

Las tinturas que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semillas usables según la invención son todas las tinturas que son habituales para estos propósitos. Es posible utilizar ya sea pigmentos, que son escasamente solubles en agua, o tinturas, que son solubles en agua. Los ejemplos incluyen a las tinturas conocidas por los nombres Rodamina B, C.I. Pigmento rojo 112 y C.I. Solvente Rojo 1.

Los agentes humectantes útiles que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semillas utilizables según la invención son todas las sustancias que promueven la humectación y que son habituales para la formulación de ingredientes agroquímicos activos. Se utilizan con preferencia los alquil naftalensulfonatos, como el diisopropil o diisobutil naftalensulfonatos.

Los dispersantes y/o emulsificantes adecuados que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semillas usables según la invención son todos los dispersantes noiónicos, aniónicos y catiónicos habituales para la formulación de ingredientes agroquímicos activos. Los dispersantes noiónicos o aniónicos o las mezclas de dispersantes noiónicos o aniónicos pueden utilizarse con preferencia. Los dispersantes noiónicos adecuados, incluyen en especial polímeros en bloque de óxido de etileno/ óxido de propileno, éteres de alquilfenol poliglicol y éteres de tristirilfenol poliglicol, y sus derivados fosfatados o sulfatados. Los dispersantes aniónicos adecuados son, en especial, lignosulfonatos, sales de ácido poliacrílico y condensados de arilsulfonato-formaldehído.

Los antiespumantes que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semillas utilizables según la invención son todas las sustancias que inhiben la espuma habitual para la formulación de ingredientes agroquímicos activos. Los antiespumantes de silicona y estearato de magnesio pueden utilizarse con preferencia.

Los conservantes que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semillas utilizables según la invención son todas las sustancias utilizables para estos propósitos en las composiciones agroquímicas. Los ejemplos incluyen diclorofeno y alcohol bencílico hemiformal.

Los espesantes secundarios que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semillas adecuadas según la invención son todas las sustancias que pueden utilizarse para estos propósitos en composiciones agroquímicas. Los ejemplos preferidos incluyen derivados de celulosa, derivados de ácido acrílico, xantano, arcillas modificadas y sílice finamente dividido.

Los aglutinantes útiles pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semillas utilizables según la invención son todos los aglutinantes habituales utilizables en los productos para recubrir semillas. Los ejemplos de preferencia incluyen polivinilpirrolidona, acetato de polivinilo, alcohol de polivinilo y tilosa.

Las giberilinas que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semillas utilizables según la invención son con preferencia las giberilinas A1, A3 (= ácido giberélico), A4 y A7; se le da preferencia particular al uso de ácido giberélico. Las giberilinas se conocen de (cf. R. Wegler "Chemie der Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmittel", vol. 2, Springer Verlag, 1970, pp. 401-412).

Las formulaciones para el recubrimiento de semillas utilizables según la invención pueden utilizarse para tratar una variedad de distintos tipos de semillas, ya sea de manera directa o después de la dilución anterior con agua. Por ejemplo, los concentrados o las preparaciones obtenibles de ellas mediante la dilución con agua pueden utilizarse para cubrir a las semillas con cereales como trigo, centeno, cebada, avena y triticale, y también semilla de maíz, arroz, colza oleaginoso, arvejas, habas, algodón, girasol, habas de soja y remolacha, o también una amplia variedad de distintas semillas de vegetales. Las formulaciones para el recubrimiento de semillas utilizable según la invención, o el uso de las formas de dilución, también pueden utilizarse para cubrir a las semillas de las plantas transgénicas.

Para el tratamiento de semillas con las formulaciones para el recubrimiento de semillas utilizable según la invención, o las formas de uso preparadas a partir de estas a través de la adición de agua, son útiles todas las unidades de mezclado usadas habitualmente para el recubrimiento de semillas. Específicamente, el procedimiento para el recubrimiento de semillas es ubicar la semilla en una mezcladora operada por lotes o de operación continua, agregar la cantidad deseada en particular de formulaciones para el recubrimiento de semillas, ya sea como está o luego de una dilución previa con agua, y mezclar hasta que la formulación se distribuya de manera homogénea en la semilla. En caso de ser apropiado, luego sigue una etapa de secado.

La frecuencia de aplicación de las formulaciones de recubrimiento de semilla utilizable según la invención puede variar dentro de un rango relativamente amplio. Se guía por el contenido particular de los compuestos de la Fórmula (I) en las formulaciones y por la semilla. Las frecuencias de aplicación del compuesto de la fórmula (I) se encuentran por lo general entre 0,001 y 50 g por kilogramo de semilla, con preferencia entre 0,01 y 15 g por kilogramo de semilla.

#### Salud animal

20

25

30

35

50

55

En el campo de la salud animal, es decir: en el campo de la medicina veterinaria, los compuestos de la fórmula (I) son activos contra los parásitos animales, en particular ectoparásitos o endoparásitos. El término "endoparásito" incluye en especial helmintos y protozoos, como coccidiasina. Los ectoparásitos son por lo general y con preferencia artrópodos, en especial insectos o acáridos.

En el campo de la medicina veterinaria, los compuestos de la fórmula (I) al tener una toxicidad endotérmica favorable son adecuados para controlar parásitos que tienen lugar con la crianza de los animales y la ganadería en ganado, en animales reproductores, en animales de zoológico, en animales de laboratorio, en animales experimentales y en animales domésticos Son activos contra todas las etapas específicas de desarrollo de los parásitos.

La ganadería agrícola incluye, por ejemplo, mamíferos, como ovejas, cabras, monos, camellos, búfalos, renos, gamos y en especial ganado y chanchos; o aves de corral como pavos, patos, gansos y en especial pollos; o pescados o crustáceos, por ejemplo en acuicultura; o, dependiendo del caso, insectos como abejas.

Los animales domésticos incluyen, por ejemplo: mamíferos, como hámsteres, conejillos de indias, ratas, ratones, chinchillas, hurones, y en particular perros, gatos, aves de cautiverio; reptiles, anfibios o peces de acuario.

En una forma de realización específica, los compuestos de la fórmula (I) se les administran a los mamíferos.

En otra forma de realización específica, los compuestos de la fórmula (I) se les administran a aves, llamadas aves de cautiverio o en particular aves de corral.

El uso de compuestos de la fórmula (I) para el control de parásitos animales trata de reducir o evitar enfermedad, casos de muerte y reducciones en el desempeño (en el caso de la carne, leche, lana, pieles, huevos, miel y similares), de manera que se permita la cría de animales más económica y simple y se logre el mejor bienestar animal.

En relación al campo de la salud animal, el término "control" o "controlar" en el presente contexto quieren decir que los compuestos de la fórmula (I) son eficaces para reducir las incidencias de los parásitos particulares en un animal infectado con estos parásitos a un grado inocuo. Más específicamente, "controlar" en el presente contexto quiere decir que los compuestos de la fórmula (I) matan el respectivo parásito, inhiben su crecimiento, o inhiben su proliferación.

Los artrópodos incluyen, por ejemplo, entre otros:

10

20

25

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

Del orden de Mallophagida y de los subórdenes de Amblycerina e Ischnocerina, por ejemplo, Bovicola spp., Damalina spp., Felicola spp.; Lepikentron spp., Menopon spp., Trichodectes spp., Trimenopon spp., Trinoton spp., Werneckiella spp;

Del orden de Diptera y de los subórdenes de Nematocerina y Brachycerina, por ejemplo, Aedes spp., Anopheles spp., Atylotus spp., Braula spp., Calliphora spp., Chrysomyia spp., Chrysops spp., Culex spp., Culicoides spp., Eusimulium spp., Fannia spp., Gasterophilus spp., Glossina spp., Haematobia spp., Haematopota spp., Hippobosca spp., Hybomitra spp., Hydrotaea spp., Hypoderma spp., Lipoptena spp., Lucilia spp., Lutzomyia spp., Melophagus spp., Morellia spp., Musca spp., Odagmia spp., Oestrus spp., Philipomyia spp., Philebotomus spp., Rhinoestrus spp., Sarcophaga spp., Simulium spp., Stomoxys spp., Tabanus spp., Tipula spp., Wilhelmia spp., Wohlfahrtia spp.;

Del orden de los sifonapteros, por ejemplo, Ceratophyllus spp., Ctenocephalides spp., Pulex spp., Tunga spp., Xenopsylla spp.;

Del orden de los heteropteros, por ejemplo, Cimex spp., Panstrongylus spp., Rhodnius spp., Triatoma spp.; y también molestias y plagas higiénicas del orden de los blatodeos.

Además, en el caso de los artrópodos, se debe mencionar a modo de ejemplo, entre otros, a los siguientes Acari:

De la subclase de los Acari (Acarina) y del orden de Metastigmata, por ejemplo de la familia de los argásidos como Argas spp., Ornithodorus spp., Otobius spp., de la familia de Ixodidae como Amblyomma spp., Dermacentor spp., Haemaphysalis spp., Hyalomma spp., Ixodes spp., Rhipicephalus (Boophilus) spp., Rhipicephalus spp. (el género original de las garrapatas multihuésped); del orden de Mesostigmata como Dermanyssus spp., Ornithonyssus spp., Pneumonyssus spp., Raillietia spp., Sternostoma spp., Tropilaelaps spp., Varroa spp.; del orden de la Actinedida (Prostigmata), por ejemplo, Acarapis spp., Cheyletiella spp., Demodex spp., Listrophorus spp., Myobia spp., Neotrombicula spp., Ornithocheyletia spp., Psorergates spp., Trombicula spp.; y del orden de la Acaridida (Astigmata), por ejemplo, Acarus spp., Caloglyphus spp., Chorioptes spp., Cytodites spp., Hypodectes spp.,

(Astigmata), por ejemplo, Acarus spp., Caloglyphus spp., Chorioptes spp., Cytodites spp., Hypodectes spp., Knemidocoptes spp., Laminosioptes spp., Notoedres spp., Otodectes spp., Psoroptes spp., Pterolichus spp., Sarcoptes spp., Trixacarus spp., Tyrophagus spp.

Los ejemplos de protozoos parasíticos incluyen, entre otros: Mastigóforos (Flagellata), como:

Metamonada: del orden de los diplomonádidos, por ejemplo, Giardia spp., Spironucleus spp.

Parabasalia: del orden de la Trichomonadida, por ejemplo, Histomonas spp., Pentatrichomonas spp., Tetratrichomonas spp., Tritrichomonas spp.

55 Euglenozoa: del orden de Trypanosomatida, por ejemplo, Leishmania spp., Trypanosoma spp.

Sarcomastigóforos: (Rhizopoda) como Entamoebidae, por ejemplo, Entamoeba spp., Centramoebidae, por ejemplo Acanthamoeba sp., Euamoebidae, e.g. Hartmanella sp.

Alveolata como Apicomplexa (Sporozoa): e.g. Cryptosporidium spp.; del orden de Eimeriida, por ejemplo, Besnoitia spp., Cystoisospora spp., Eimeria spp., Hammondia spp., Isospora spp., Neospora spp., Sarcocystis spp., Toxoplasma spp.; del orden de Adeleida, por ejemplo, Hepatozoon spp., Klossiella spp.; del orden de Haemosporida, por ejemplo, Leucocytozoon spp., Plasmodium spp.; del orden de Piroplasmida, por ejemplo, Babesia spp., Ciliophora spp., Echinozoon spp., Theileria spp.; del orden de Vesibuliferida, por ejemplo, Balantidium spp., Buxtonella spp.

Micróspora como Encephalitozoon spp., Enterocytozoon spp., Globidium spp., Nosema spp., y también, por ejemplo, Myxozoa spp.

Los helmintos que son patógenos para los humanos o animales, incluyen, por ejemplo, Acanthocephala, Nematoden, Pentastoma y Platyhelminthes (por ejemplo: Monogeneos, cestodos y trematodos).

Los helmintos ilustrativos incluyen, entre otros:

5

15

20

25

30

Monogeneos: por ejemplo: Dactylogyrus spp., Gyrodactylus spp., Microbothrium spp., Polystoma spp., Troglecephalus spp.;

Cestodos: del orden de Pseudophyllidea, por ejemplo Bothridium spp., Diphyllobothrium spp., Diplogonoporus spp., Ichthyobothrium spp., Ligula spp., Schistocephalus spp., Spirometra spp.

Del orden de Cyclophyllida, por ejemplo: Andyra spp., Anoplocephala spp., Avitellina spp., Bertiella spp., Cittotaenia spp., Davainea spp., Diorchis spp., Diplopylidium spp., Dipylidium spp., Echinococcus spp., Echinocotyle spp., Echinolepis spp., Hydatigera spp., Hymenolepis spp., Joyeuxiella spp., Mesocestoides spp., Moniezia spp., Paranoplocephala spp., Raillietina spp., Stilesia spp., Taenia spp., Thysaniezia spp., Thysanosoma spp.

Trematodos: del orden de Digenea, por ejemplo: Austrobilharzia spp., Brachylaima spp., Calicophoron spp., Catatropis spp., Clonorchis spp. Collyriclum spp., Cotylophoron spp., Cyclocoelum spp., Dicrocoelium spp., Diplostomum spp., Echinochasmus spp., Echinoparyphium spp., Echinostoma spp., Eurytrema spp., Fasciola spp., Fasciolides spp., Fasciolopsis spp., Fischoederius spp., Gastrothylacus spp., Gigantobilharzia spp., Gigantocotyle spp., Heterophyes spp., Hypoderaeum spp., Leucochloridium spp., Metagonimus spp., Metorchis spp., Nanophyetus spp., Notocotylus spp., Opisthorchis spp., Ornithobilharzia spp., Paragonimus spp., Paramphistomum spp., Plagiorchis spp., Posthodiplostomum spp., Prosthogonimus spp., Schistosoma spp., Trichobilharzia spp., Troglotrema spp., Typhlocoelum spp.

Nematodos: del orden de Trichinellida, por ejemplo: Capillaria spp., Trichinella spp., Trichomosoides spp., Trichuris spp.

Del orden de Tylenchida, por ejemplo: Micronema spp., Parastrangyloides spp., Strongyloides spp.

Del orden de Rhabditina, por ejemplo: Aelurostrongylus spp., Amidostomum spp., Ancylostoma spp., Angiostrongylus spp., Bronchonema spp., Bunostomum spp., Chabertia spp., Cooperia spp., Cooperioides spp., Crenosoma spp., Cyathostomum spp., Cyclococercus spp., Cyclodontostomum spp., Cylicocyclus spp., Cylicostephanus spp., Cylindropharynx spp., Cystocaulus spp., Dictyocaulus spp., Elaphostrongylus spp., Filaroides spp., Globocephalus spp., Graphidium spp., Gyalocephalus spp., Haemonchus spp., Heligmosomoides spp., Hyostrongylus spp., Marshallagia spp., Metastrongylus spp., Muellerius spp., Necator spp., Nematodirus spp., Neostrongylus spp., Nippostrongylus spp., Obeliscoides spp., Oesophagodontus spp., Oesophagostomum spp., Ollulanus spp.; Ornithostrongylus spp., Oslerus spp., Ostertagia spp., Paracooperia spp., Paracrenosoma spp., Parafilaroides spp., Parelaphostrongylus spp., Pneumocaulus spp., Pneumostrongylus spp., Poteriostomum spp., Protostrongylus spp., Spicocaulus spp., Stephanurus spp., Strongylus spp., Syngamus spp., Teladorsagia spp., Trichonema spp., Trichostrongylus spp., Triodontophorus spp., Troglostrongylus spp., Uncinaria spp.

Del orden de los espirúridos, por ejemplo: Acanthocheilonema spp., Anisakis spp., Ascaridia spp.; Ascaris spp., Ascarops spp., Aspiculuris spp., Baylisascaris spp., Brugia spp., Cercopithifilaria spp., Crassicauda spp., Dipetalonema spp., Dirofilaria spp., Dracunculus spp.; Draschia spp., Enterobius spp., Filaria spp., Gnathostoma spp., Gongylonema spp., Habronema spp., Heterakis spp.; Litomosoides spp., Loa spp., Onchocerca spp., Oxyuris spp., Parabronema spp., Parafilaria spp., Parascaris spp., Passalurus spp., Physaloptera spp., Probstmayria spp., Pseudofilaria spp., Setaria spp., Skjrabinema spp., Spirocerca spp., Stephanofilaria spp., Strongyluris spp., Syphacia spp., Thelazia spp., Toxascaris spp., Toxocara spp., Wuchereria spp.

Los acantocéfalos: del orden de Oligacanthorhynchida, por ejemplo: Macracanthorhynchus spp., Prosthenorchis spp.; del orden de Moniliformida, por ejemplo: Moniliformis spp. Moniliformis spp.

Del orden de Polymorphida, por ejemplo: Filicollis spp.; del orden de Echinorhynchida, por ejemplo

Acanthocephalus spp., Echinorhynchus spp., Leptorhynchoides spp.

15

20

25

30

35

50

Pentastómidos: del orden de Porocephalida, por ejemplo, Linguatula spp.

En el campo de la veterinaria y de la ganadería, los compuestos de la fórmula (I) se administran por medio de procedimientos que por lo general se conocen en la técnica, por medio de vía enteral, parenteral, dermal o nasal en forma de preparaciones adecuadas. La administración puede ser profiláctica, metafiláctica o terapéutica.

Por lo tanto, una forma de realización de la presente invención hace referencia a los compuestos de la fórmula (I) para uso como un medicamento.

Otro aspecto que se relaciona con los compuestos de la fórmula (I) para el uso de un agente antiendoparasítico.

Otro aspecto específico de la invención hace referencia a los compuestos de la fórmula (I) para el uso como un agente antihelmíntico, en especial para el uso como un nematicida, platixelminticida, acantocefalicida o pentastomicida.

Otro aspecto específico de la invención hace referencia a los compuestos de la fórmula (I) parta el uso como agente antroprotozoico.

Otro aspecto hace referencia a los compuestos de la fórmula (I) para el uso como un agente antiectoparasítico, en especial como artropodicida, muy en particular como un insecticida o un acaricida.

Otros aspectos de la invención son las formulaciones medicinales veterinarias que comprenden una cantidad eficaz de al menos un compuesto de la fórmula (I) y al menos uno de los siguientes: un excipiente farmacéuticamente aceptable (por ejemplo: diluyentes sólidos o líquidos), un auxiliar farmacéuticamente aceptable (por ejemplo: tensioactivos), en especial un excipiente farmacéuticamente aceptable utilizado en forma convencional en formulaciones medicinales veterinarias y/o auxiliar farmacéuticamente aceptable utilizado en formulaciones medicinales veterinarias.

Un aspecto relacionado de la invención es un procedimiento para la producción de una formulación medicinal veterinaria como se describe en la presente que comprende la etapa de mezclar al menos un compuesto de la fórmula (I) con excipientes farmacéuticamente aceptables y/o auxiliares, en especial excipientes farmacéuticamente aceptables utilizados de manera convencional en formulaciones medicinales veterinarias y/o auxiliares utilizados en forma convencional en formulaciones medicinales veterinarias.

Otro aspecto específico de la invención son las formulaciones medicinales veterinarias seleccionadas del grupo de las formulaciones ectoparasiticidas y endoparasiticidas, en especial seleccionadas del grupo de las formulaciones antelmínticas, antiprotozóicas y artropodicidas, muy particularmente seleccionadas del grupo de las formulaciones nematicidas, platihelminticidas, acantocefalicidas, pentastomicidas, insenticidas y acaricidas, según los aspectos mencionadas, y sus procedimientos de producción.

Otro aspecto se relaciona con un procedimiento para el tratamiento de una infección parasitaria, en especial una infección causada por un parásito seleccionado del grupo de los ectoparásitos y endoparásitos mencionados en la presente, por el uso de una cantidad eficaz de un compuesto de la fórmula (I) en un animal, en especial un animal no humano, que tenga una necesidad para ello.

Otro aspecto relacionado con un procedimiento para el tratamiento de una infección parasitaria, en especial una infección causada por un parásito seleccionado del grupo de los ectoparásitos y endoparásitos mencionados en la presente, mediante el uso de una formulación medicinal veterinaria como se define en la presente en un animal, en especial un animal no humano, que tiene una necesidad de ello.

40 Otro aspecto se relaciona con el uso de los compuestos de la fórmula (I) en el tratamiento de una infección parasitaria, en especial una infección causada por un parásito seleccionado del grupo de los ectoparásitos y endoparásitos mencionados en la presente, en especial un animal no humano.

En el presente contexto de salud animal o de medicina veterinaria, el término "tratamiento" incluye tratamiento profiláctico, metafiláctivos y terapéutico.

45 En una forma de realización particular, mezclas de al menos un compuesto de la fórmula (I) con otros compuestos activos, en especial con endo- y ectoparáticidas, se proporcionan para el campo de la medicina veterinaria.

En el campo de la salud animal, "mezcla" no solo significa que dos (o más) ingredientes activos diferentes se formulan en una formulación común y que se emplean juntas en consecuencia, sino que también se relacionan con productos que comprenden formulaciones separadas para cada ingrediente activo. En consecuencia, cuando más de dos ingredientes activos van a emplearse, todos los ingredientes activos pueden formularse en una formulación en común o todos los ingredientes activos pueden formularse en formulaciones separadas; son posibles, de la misma forma, las formas mezcladas en las que algunos de los ingredientes activos se formulan juntos y algunos de los ingredientes activos se formulan por separado. Las formulaciones por separado permiten la aplicación separada

o sucesiva de los ingredientes activos en cuestión.

Los compuestos activos que se especifican por sus "nombres comunes" se conocen y se describen, por ejemplo, en "Pesticide Manual" (véase supra) o pueden seleccionarse de la Internet (por ejemplo: http://www.alanwood.net/pesticides).

- Los ingredientes activos ilustrativos del grupo de los ectoparasiticidas como componentes de mezcla, sin ninguna intención de que esto constituya una restricción, incluye a los insecticidas y acaricidas enumerados en detalle anteriormente. Otros ingredientes activos utilizables se enumeran debajo según la clasificación antes mencionada con respecto al Esquema de Clasificación por Modos de acción IRAC: (1) inhibidores de acetyicolinesterasa (AChE); (2) bloqueadores del canal de cloruro regulado por GABA; (3) moduladores del canal de sodio; (4) moduladores competitivos del receptor nicotínico deacetilcolina (nAChR); (5) moduladores alostéricos del receptor nicotínico
- competitivos del receptor nicotínico deacetilcolina (nAChR); (5) moduladores alostéricos del receptor nicotínico deacetilcolina (nAChR) (6) moduladores alostéricos del canal de cloruro regulado por glutamato (GluCl); (7) imitadores de la hormona juvenil; (8) inhibidores (multisitio) miceláneos no específicos; (9) moduladores de órgano cordotonal; (10) inhibidores del crecimiento de ácaros; (12) inhibidores de sintasa mitocondrial ATP, como disruptores ATP; (13) Desacopladores de la fosforilación oxidativa mediante la alteración del gradiente protónico;
- (14) Bloqueadores del canal del receptor de acetilcolina nicotínico; (15)Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipe 0; (16) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipe 1; (17) disruptores de la muda (en especial en Diptera); (18) agonistas del receptor de ecdyson; (19) agonistas del receptor de octopamina; (21) Inhibidores del transporte de electrones del complejo mitocondrial II; (20) Inhibidores del transporte de electrones del complejo mitocondrial III; (22) Bloqueadores del canal de sodio dependiente del voltaje; (23) inhibidores de acetil CoA carboxilasa; (28) moduladores del receptor de rianodina;
- dependiente del voltaje; (23) inhibidores de acetil CoA carboxilasa; (28) moduladores del receptor de rianodina; Los ingredientes activos que tienen mecanismos de acción desconocidos o inespecíficos, por ejemplo: fentrifanil, fenoxacrim, cycloprene, clorobencilato, chlordimeform, flubenzimin, dicyclanil, amidoflumet, quinomethionat, triarathene, clothiazoben, tetrasul, oleato de potasio, petroleo, metoxadiazona, gossyplur, flutenzine, brompropylate, criolita;
- Compuestos de otras clases, por ejemplo: butacarb, dimetilan, cloethocarb, phosphocarb, pirimiphos(-etilo), parathion(-etilo), methacrifos, isopropil o-salicilato, trichlorfon, sulprofos, propaphos, sebufos, pyridathion, prothoate, dichlofenthion, demeton-S-metil sulfona, isazofos, cyanofenphos, dialifos, carbophenothion, autathiofos, aromfenvinfos(-metilo), azinphos(-etilo), chlorpyrifos(-etilo), fosmethilan, iodofenphos, dioxabenzofos, formothion, fonofos, flupyrazofos, fensulfothion, etrimfos;
- 30 Compuestos de órganoclorina, por ejemplo: camphechlor, lindane, heptaclor; o fenilpirazoles, por ejemplo: acetoprole, pyrafluprole, pyriprole, vaniliprole, sisapronil; o isoxazolinas, por ejemplo: sarolaner, afoxolaner, lotilaner, fluralaner:
  - pyrethroids, e.g. (cis-, trans-)metofluthrin, profluthrin, flufenprox, flubrocythrinate, fubfenprox, fenfluthrin, protrifenbut, pyresmethrin, RU15525, terallethrin, cis-resmethrin, heptafluthrin, bioethanomethrin, biopermethrin, fenpyrithrin, cis-cypermethrin, cis-permethrin, clocythrin, cyhalothrin (lambda-), chlovaporthrin, o compuestos de hidrocarburo halogenado (HCHs),

Neonicotinoides, e.g. nithiazine

35

40

55

dicloromezotiaz, triflumezopyrim

Lactonas macrocíclicas, por ejemplo: nemadectin, ivermectin, latidectin, moxidectin, selamectin, eprinomectin, doramectin, emamectin benzoato: milbemycin oxime

triprene, epofenonane, diofenolan;

Biológicas, hormonas o feromonas, por ejemplo: productos naturales: thuringiensin, codlemone o componentes nim dinitrofenoles, e.g. dinocap, dinobuton, binapacryl;

benzoilureas, e.g. fluazuron, penfluron,

45 Derivados de amidina, e.g. chlormebuform, cymiazole, demiditraz

Acaricidas varroa destructores, por ejemplo: ácidos orgánicos, e.g. ácido fórmico, ácido oxálico.

Ingredientes activos ilustrativos del grupo de los endoparasiticidas, como componentes de mezcla, incluyen, entre otros, ingredientes activos antelmínticos e ingredientes antiprotozóicos activos.

Los compuestos antelminticamente activos incluyen, entre otros, los siguientes compuestos activos como nematicidas, trematicidas y/o cestocidas:

de la clase de las lactonas macrocíclicas, por ejemplo: eprinomectina, abamectina, nemadectina, moxidectina, doramectina, selamectina, lepimectina, latidectina, milbemectina, ivermectina, emamectina, milbemicina;

de la clase de los benzamidazoles y probenzimidazoles, por ejemplo: oxibendazol, mebendazol, triclabendazol, tiofanato, parbendazol, oxfendazol, netobimin, fenbendazol, febantel, tiabendazol, ciclobendazol, cambendazol, albendazol, sulfóxido, albendazol, flubendazol;

de la clase de los depsipéptidos, con preferencia depsipéptidos cíclicos, en especial desipéptodos cíclicos de 24 miembros, por ejemplo: emodepsida, PF1022A;

de la clase de las tetrahidropirimidinas, por ejemplo: morantel, pirantel, oxantel;

de la clase de los imidazotiazoles, por ejemplo: butamisol, levamisol, tetramisol;

de la clase de las aminofenilamidinas, por ejemplo: amidantel, amidantel deacilado (dAMD), tribendimidina;

de la clase de las aminocetonitrilos, por ejemplo: monopantel;

de la clase de las parahercuamidas, por ejemplo: parahercuamida, dercuantel;

de la clase de las salicilanilidas, por ejemplo: tribromsalan, bromoxanida, brotianida, clioxanida, closantel, niclosamida, oxiclozanida, rafoxanida;

de la clase de los fenoles sustituidos, por ejemplo: nitroxinil, bitionol, disofenol, hexaclorofeno, niclofolan, meniclofolan;

de la clase de los órganofosfatos, por ejemplo: triclorfon, naftalofos, diclorvos/DDVP, crufomato, coumafos, haloxon:

de la clase de las piperazinonas / quinolinas, por ejemplo: praziquantel, epsiprantel;

de la clase de las pipericinas, por ejemplo: piperazina, hidroxicina;

de la clase de las tetraciclinas, por ejemplo: tetraciclina, clorotetraciclina, doxiciclina, oxitetraciclina, rolitetraciclina;

De diversas otras clases, por ejemplo: bunamidina, niridazol, resorantel, omfalotina, oltipraz, nitroscanato, nitroxinil, oxamniquina, mirasan, miracil, lucanthone, hicantona, hetolin, emetina, dietilcarbamazina, diclorofeno, diamfenetida, clonazepam, befenium, amoscanato, clorsulón.

Los ingredientes antirpotozoicos activos incluyen, entre otros, los siguientes ingredientes activos:

de la clase de las triazinas, por ejemplo: diclazuril, ponazuril, letrazuril, toltrazuril;

de la clase de los poliéter ionoforos, por ejemplo: monensina, salinomicina, maduramicina, narasina;

de la clase de las lactonas macrocíclicas, por ejemplo: milbemicina, eritromicina;

de la clase de las guinolonas, por ejemplo: enrofloxacina, pradofloxacina;

de la clase de las quininas, por ejemplo: cloroquina;

de la clase de las pirimidinas, por ejemplo: pirimetamina;

de la clase de las sulfonamidas, por ejemplo: sulfaquinoxalina, trimetoprima, sulfaclozine;

de la clase de las tiaminas, por ejemplo: amprolium;

de la clase de las lincosamidas, por ejemplo: clindamicina;

de la clase de las carbanilidas, por ejemplo: imidocarb;

de la clase de los nitrofuranos, por ejemplo: nifurtimox;

de la clase de las guinazolinonas alcaloides, por ejemplo: halofuginona;

de diversas otras clases, por ejemplo: oxamniquina, paromomicina;

de la clase de las vacunas o antígenos de mocroorganismos, por ejemplo: Babesia canis rossi, Eimeria tenella, Eimeria praecox, Eimeria necatrix, Eimeria mitis, Eimeria maxima, Eimeria brunetti, Eimeria acervulina, Babesia canis vogeli, Leishmania infantum, Babesia canis canis, Dictyocaulus viviparus.

Todos los componentes de mezcla que se mencionan, según sea el caso, también pueden formar sales con bases o ácidos adecuados si son capaces de hacerlo sobre la base de su grupo funcional.

#### Control de vector

40

5

Los compuestos de la formula (I) también pueden utilizarse en control de vector. En el contexto de la presente invención, un vector es un antrópodo, en especial un insecto o arácnido, capaz de transmitir patógenos, por ejemplo: virus, gusanos, organismos o bacterias de una sola célula, de un reservorio (planta, animal, humano, etc.) a un huésped. Los patógenos pueden transmitirse ya sea de forma mecánica (por ejemplo tracoma por moscas que no pican) a un huésped o luego de una inyección a un huésped (por ejemplo parásitos de malaria por mosquitos)

Los ejemplos de vectores y las enfermedades o patógenos que transmiten son:

- 1) mosquitos
- Anopheles: malaria, filariasis;
- Culex: Encefalitis japonesa, filariasis, otras enfermedades virales, transmisión de otros gusanos;
- Aedes: fiebre amarilla, fiebre de dengue, otro trastorno viral; filariasis;
- Simúmidos: transmission de gusanos, en especial de Onchocerca volvulus;
  - Psicódidos: transmisiónde leishmaniasis
  - 2) Piojos: infección en la piel, tifus exantemático epidémico;
  - 3) Pulgas: plaga, tifus exantemático epidémico, tenias;
  - 4) Moscas: enfermedad del sueño (tripanosomiasis); cólera, otras enfermedades bacterianas;
- 5) Ácaros: acariosis, tifus exantemático epidémico, rickettsialpox, tularaemia, encefalitis de San Luis, encefalitis transmitida por garrapatas (TBE), fiebre hemorrágica de Crimean-Congo, enfermedad de lyme;
  - 6) Garrapatas: enfermedad de lyme como Borrelia bungdorferi sensu lato., Borrelia duttoni, encefalitis transmitida por garrapatas, fiebre Q (Coxiella burnetii), babesiosis (Babesia canis canis), erliquiosis.

Los ejemplos de vectores en el contexto de la presente invención, por ejemplo: álfidos, moscas, saltahojas o tisanópteros, que puede transmitir virus de plantas a las plantas. Otros vectores capaces de transmitir virus de plantas son los ácaros araña, los escarabajos y nematodos.

Otros ejemplos de vectores en el contexto de la presente invención son los insectos y arácnidos como mosquitos, en especial del género Aedes, Anopheles, por ejemplo A. gambiae, A. arabiensis, A. funestus, A. dirus (malaria) y Culex, Psychodidae como Phlebotomus, Lutzomyia, piojos, pulgas, moscas, ácaros y garrapatas, que pueden transmitir patógenos a los animales y/o humanos.

El control de vector es posible si los compuestos de la fórmula (I) son resistentes al quiebre.

Los compuestos de la formula (I) son adecuados para el uso en la prevención de enfermedades y/o patógenos transmitidos por vectores. Entonces, otro aspecto de la presente invención es el uso de compuestos de la fórmula (I) para el control de vector, por ejemplo en agricultura, en horticultura, en bosques, en jardines y en zonas de esparcimiento, y también en la protección de materiales y productos almacenados.

### Protección de materiales industriales

20

25

40

45

Los compuestos de la formula (I) son adecuados para proteger materiales industriales contra el ataque o destrucción de insectos, por ejemplo de los órdenes de of Coleoptera, Hymenoptera, Isoptera, Lepidoptera, Psocoptera y Zygentoma.

Los materiales industriales en el presente contexto se entienden como materiales inanimados, como, con preferencia, plásticos, adhesivos, tallas, papeles y tarjetas, cuero, lana, productos de lana procesados y composiciones de recubrimiento. Es particularmente preferido el uso de la invención para protección de lana.

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

En otra forma de realización, los compuestos de la fórmula (I) toman la forma de un plaguicida listo para usar, lo que significa que pueden aplicarse al material en cuestión sin otras modificaciones. Otros insecticidas o fungicidas útiles incluyen, en especial, aquellos mencionados anteriormente.

Sorprendentemente, también se halló que los compuestos de la fórmula (I) pueden emplearse para proteger objetos que entran en contacto con agua salada o aguas salobres, en particular: cáscaras, pantallas, mosquiteros, edificios, amarres y sistemas de señalización, contra la suciedad. Es posible de igual manera utilizar los compuestos de la fórmula (I), solos o en combinación con otros compuestos activos, como agentes antisuciedad.

### Control de plagas animales en el sector de la higiene

Los compuestos de la formula (I) son adecuados para el control de plagas animales en el sector de la higiene. Mas particularmente, la invención puede utilizarse en el sector de la protección doméstica, en el sector de protección de la higiene y la protección de productos almacenados, en particular para el control de insectos, arácnidos, garrapatas y ácaros que se encuentran en espacios cerrados, por ejemplo viviendas, naves industriales, oficinas, vehículos de cabina, instalaciones para la crianza de animales. Para controlar las plagas animales, los compuestos de la fórmula (I) se utilizan solos o en combinación con otros compuestos activos y/o auxiliares. Se utilizan con preferencia en

productos insecticidas domésticos. Los compuestos de la formula (I) son eficaces contra especies sensibles y resistentes, y contra todas lase tapas de desarrollo.

Estas plagas incluyen, por ejemplo, plagas de la clase de los arácnidos, del orden de los escorpiones, arañas y opiliones, de las clases de Chilopoda y Diplopoda, de la clase Insecta el orden de los blatodeos, del orden de los Coleopteros, Dermaptera, Diptera, Heteroptera, himenopteros, Isoptera, Lepidoptera, ftirápteros, Psocopteros, Saltatoria u Ortópteros, sifonápteros y Zygentoma y de la clase de los malacostráceos del orden Isopoda.

La solicitud se efectúa, por ejemplo, en aerosoles, productos en spray sin presurizar, por ejemplo spray con bomba o atomizador, sistemas de pulverización automática, pulverizadores, espumas, geles, productos de evaporación con pastillas de evaporación hechas de celulosa o plástico, evaporadores líquidos, evaporadores en gel y membrana, evaporadores activados por propulsores, sistemas de evaporación libres de energía o pasivos, papeles anti polillas, bolsas anti polillas y geles anti polillas, y gránulos o polvos, en cebos para propagar o estaciones de cebo.

#### Descripción de los procedimientos y productos intermedios

Los compuestos de la formula (I-A) en donde Q representa oxígeno puede sintetizarse, por ejemplo, por el procedimiento que se muestra en el Esquema 1. Los compuestos de la formula (I-B) en donde Q representa azufre pueden obtenerse a partir de los compuestos de la fórmula (I-A), por ejemplo según el Esquema 2. En los procedimientos que se muestran en la Esquemas 1 y 2, los radicales W, Y, V, A, L1 y L2 utilizados en las formulaciones en cada caso tienen, a menos que se indique lo contrario, el significado dado en los rangos de preferencia (1) para (5).

Los compuestos de la formula (I-A) pueden sintetizarse como se muestra en el Esquema 1 al hacer reaccionar al principio ácidos imidazolcarboxílicos de la fórmula (II) con aminopiridinas de la fórmula (III) para obtener compuestos de la fórmula (IV) (cf. Procedimiento de amidación). Los compuestos de la fórmula (IV) luego se desprotonan en analogía con los procedimientos conocidos con una base fuerte como, por ejemplo, n-butilitio, litio diisopropilamina o litio tert-butóxido a bajas temperaturas (-75 a -100°C) en solventes como, por ejemplo: tetrahidrofurano o dietil éter, y luego se hacen reaccionar con agentes de clorinación como, por ejemplo: hexacloroetano de la fórmula (V) para obtener cloroimidazoles de la fórmula (VI) ) (cf. EP1988081; US20050250948). Los cloroimidazoles de la fórmula (VI) pueden luego hacerse reaccionar con un nucleófilo de nitrógeno de la fórmula (VII) para obtener compuestos de la fórmula (I-1). En la presente, los compuestos de la fórmula (VII) tiene que desprotonarse, opcionalmente, por medio del uso de una base. Las bases que pueden mencionarse a modo de ejemplo son: hidróxido de potasio, tertbutóxido de potaso, trietilaminea, de manera similar todas las bases inorgánicas u orgánicas habituales, por ejemplo aminas organicas como diisopropiletilamina, N-metilmorfolina, piridina o N,N-dimetilaminopiridina, carbonatos de metal álcali y carbonatos de metal alcalinotérreo como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio o cesio; bicarbonatos de metal álcali como bicarbonato de sodio o bicarbonato de potasio. Se describieron numerosas condiciones de reacción para la sustitución de átomos de cloro en la posición 2 de imidazoles para diversos compuestos amino [cf., por ejemplo, US2005250948; WO2010144338; Jablonski, J.A. et al., Bioorg. Med. Chem. Lett. 2009, 19, 903-907; US2009186879].

### Esquema 1

5

10

15

20

25

30

35

Los ácidos imidazolilcarboxílicos de la fórmula (II) requeridos para el procedimiento son asequibles en comercios o pueden prepararse, por ejemplo, por medio de procedimientos conocidos de la bibliografía, g. H. Rapoport et.al.;

Síntesis 1988, 10, 767-771, patente de BASF Aktiengesellschaft: US4864030 A1, 1989, patente deTakeda Pharmaceutical Company Limited: EP2530078 A1, 2012, patente de TAISHO PHARMACEUTICAL CO., LTD.: US2012/10414 A1, 2012, Subrayan, Ramachandran P.; Thurber, Ernest L.; Rasmussen, Paul G. Tetrahedron, 1994, 50, 2641 – 2656.

- Las 3-aminopiridinas de la fórmula (III) requeridas para el procedimiento son asequibles en comercios o pueden prepararse, por ejemplo, por procedimientos conocidos de la bibliografía, e.g. Liu, Zhen-Jiang; Vors, Jean-Pierre; Gesing, Ernst R. F.; Bolm, Carsten, Advanced Synthesis and Catalysis, 2010, 352, 3158 3162, patentes BAYER CROPSCIENCE AG: US2010/305124 A1, 2010, Shafir, Alexandr; Buchwald, Stephen L., Journal of the American Chemical Society, 2006, 128, 8742 8743.
- Los compuestos NH (por ejemplo alquilaminas, dialquilaminas, aminas cíclicas, hidracinas, pirazoles, imidazoles, triazoles, etc.) de la fórmula (VII) requeridas para el procedimiento son asequibles en comercios o pueden prepararse por procedimientos generales conocidos para la química orgánica.
- Las tioamidas de la formula (I-B) pueden sintetizarse como se muestra en el Esquema 2 al hacer reaccionar compuestos de la fórmula (I-A) con un agente sulfurado como, por ejemplo, pentasulfuro de difósforo o un reactivo Lawesson (cf., por ejemplo, C. P. Dell in Comprehensive Organic Functional Group Transformations, Vol. 5, Ed.: A. R. Katrizky, O. Meth-Cohn, C. W. Rees, Pergamon, Oxford, 1995, S. 565-628; M. Jesberger, T. P. Davis, L. Barner, Síntesis 2003, 13, 1929) de forma análoga a los procedimientos generalmente conocidos.

#### Esquema 2

### 20 Procedimiento de amidación

35

40

Los compuestos de la fórmula (IV) en el procedimiento según la invención pueden sintetizarse mediante el uso de reacciones de amidación conocidos de la bibliografía o de forma análoga con los ejemplos mencionados explícitamente.

- Una cantidad de condiciones de reacción se describieron para la etapa de amidación, por ejemplo G. Benz en Comprehensive Organic Synthesis, 1st Ed., Pergamon Press, Oxford, 1991, Vol. 6, pp. 381-417; P.D. Bailey et al. en Comprehensive Organic Functional Group Transformation, 1st Ed., Elsevier Science Ltd., Oxford, 1995, Vol. 5, pp. 257-308 y R.C. Larock en Comprehensive Organic Transformations, 2nd Ed., Wiley-VCH, New York, Weinheim, 1999, pp. 1929-1994. Algunas de estas reacciones proceden a través de cloruros de carbonilo intermedios, que pueden emplearse de forma aislada o en forma generada in situ.
- Las reacciones de amidación, por lo general, se llevan a cabo en presencia de un agente de condensación, opcionalmente en presencia de un selector ácido y opcionalmente en presencia de un solvente.
  - Los agentes de condensación útiles son todos los agentes de condensación utilizados en forma típica para estas reacciones de amidación. Los ejemplos incluyen activadores como fosgeno, tricloruro de fósforo, oxicloruro de fósforo, cloruro de oxalilo, bromuro de oxalilo o cloruro de tionilo; carbodiimidas como N.N'-diciclohexilcarbodiimida (DCC) y 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (EDCI), u otros agentes de condensación habituales como pentóxido de fósforo, ácido polifosfórico, N,N'-carbonildiimidazol, 2-cloropiridina 1-metoiodida (reactivo Mukaiyama's, 2-etoxi-N-etoxicarbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), trifenilfosfina/tetracloruro de carbono, bromotripirrolidinofosfonio hexafluorofosfato (BROP), O-(1H-benzotriazol-1-iloxi)tris(dimetilamino)fosfonio hexafluorofosfato (BOP), N,N,N',N'bis(tetrametilen)clorouronio tetrafluoroborato, O-(1H-benzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio hexafluorofosfato O-(1H-benzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-bis(tetrametilen)uronio hexafluorofosfato, O-(1H-benzotriazol-1-il)-O-(1H-benzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-bis(tetrametilen)uronio N.N.N'.N'-tetrametiluronio tetrafluoroborato (TBTU), O-(7-azabenzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio tetrafluoroborato. hexafluorofosfato (HATU), hidroxibenzotriazol (HOBt) y sal de 4-(4,6-dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il)-4-metilmorfolinio (DMT.MM), por lo general disponible como un cloruro. Estos reactivos pueden utilizarse por separado o en combinación
- 45 Los aceptores ácidos adecuados son bases inorgánicas u orgánicas habituales, por ejemplo aminas orgánicas como

trietilamina, diisopropiletilamina, n-metilmorfolina, piridina o N,N-dimetilaminopiridina, carbonatos de metal álcali o metal alcalino térreo como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio o carbonato de cesio; bicarbonatos de metal álcali como bicarbonato de sodio o bicarbonato de potasio. La reacción de amidación en los procedimientos según la invención se lleva a cabo opcionalmente en presencia de un auxiliar de reacción adecuado como, por ejemplo, N,N-dimetilformamida o N,N-dimetilaminopiridina. Los solventes o diluyentes adecuados son todos solventes orgánicos inertes, por ejemplo, hidrocarburos alifáticos o aromáticos (como éter de petroleo, tolueno, ciclohexano), hidrocarburos halogenados (como clorotolueno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, 1,2-dicloroetano), éteres (como dietil éter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano), ésteres (como acetato de etilo o metilo), nitrohidrocarburos (como un nitrometano, nitrobenceno), nitrilos (como acetonitrilo, propionitrilo, butironitrilo, benzonitrilo), amidas (como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilformamida), y también dimetil sulfóxido o aqua o mezclas de los solventes mencionados.

También es posible utilizar anhídridos para la preparación de compuestos de la fórmula (III) (cf. J. Am. Chem Soc. 1967, 5012). En este procedimiento, es posible utilizar ésteres clorofórmicos, por ejemplo metil cloroformato, etil cloroformato, isobutil cloroformato e isopropil cloroformato. De igual manera, es posible para este propósito, el uso de cloruro de dietilacetilo, cloruro de trimetilacetilo y compuestos similares.

La invención también proporciona productos intermedios de la fórmula (VI)

Donde los radicales tienen el significado según uno de los rangos de preferencia (1-1) a (5-1) o (1-2) a (5-2) y con especial preferencia el significado según el rango de preferencia (5-1) a (5-2).

### 20 Ejemplos de preparación:

5

10

15

30

35

La preparación y los ejemplos de uso que siguen ilustran la invención sin limitarla.

#### Ejemplo de síntesis N° 1

**N,1-dimetil-N-(piridin-3-il)-2-[3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1H-imidazol-5-carboxamida** (Compuesto N° I-1-007)

25 Etapa 1: N,1-Dimetil-N-(piridin-3-il)-1H-imidazol-5-carboxamida

Se agregaron 12,71 g (104,7 mmol) de cloruro de tionilo a una suspensión de 12 g (95,2 mmol) de ácido 1-metilimidazol-5-carboxílico en 72 ml de tolueno, y la mezcla se agitó a 130°C durante la noche. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida. Se agregó una solución de 10,3 g (95,2 mmol) de 3-metilaminopiridina en 72 ml de piridina al residuo, y la mezcla de reacción resultante se calentó a 115°C durante 4h. La mezcla se concentró una vez más a presión reducida y el residuo se purificó mediante cromatografía en columna en gel de sílice al utilizar la fase móvil acetonitrilo/metanol 3:1. Esto dio como resultado 8,1 g (39,3% de teoría) del compuesto del título y 9,5 g (37,1% de teoría) de la sal de HCI del compuesto del título.

HPLC-MS:  $\log \bar{P}[n] = 0.44$ ; masa (m/z): 217,1; <sup>1</sup>H-NMR (CD<sub>3</sub>CN, 400MHz);  $\delta = 3,39$  (s, 3H); 3,81 (s, 3H); 6,17 (s, 1H); 7,36-7,40 (m, 2H); 7,67-7,70 (m, 1H); 8,41 (m, 1 H) 8,47 (m, 1H) ppm.

Etapa 2: 2-Cloro-N,1-dimetil-N-(piridin-3-il)-1H-imidazol-5-carboxamida

Se disolvieron 10,0 g (46,2 mmol) de N,1-dimetil-N-(piridin-3-il)-1H-imidazol-5-carboxamida en 150 ml de THF seco y enfriado a -78°C. Se agregaron gota a gota 20,34 ml (50,8 mmol) de una solución molar 2,5 de *n*-BuLi en *n*-hexano durante un periodo de 5 minutos, y la mezcla se agitó durante otros 30 minutos a -78°C. 12,0 g (50,8 mmol) de hexacloroetano, disuelto en 100 ml de THF, se agregaron luego gota a gota durante 5 minutos. La mezcla se agitó a -78°C durante otros 45 minutos, y luego se calentó a temperatura ambiente durante 60 horas. La mezcla se vertió en 400 ml de solución de cloruro de amonio saturado y se extrajo en forma repetida con diclorometano. Las fases orgánicas se combinaron, se lavaron con un poco de agua y se secaron con sulfato de magnesio. El solvente de destiló y el residuo se purificó por una fase inversa preparativa HPLC mediante el uso de una fase móvil agua/ acetonitrilo. Esto dio como resultado 7,27 g (62% de teoría) de 2-cloro-N,1-dimetil-N-(piridin-3-il)-1H-imidazol-5-carboxamida.

HPLC-MS: logP[n] = 0.88; masa (m/z): 251,1; <sup>1</sup>H-NMR (D<sup>6</sup>-DMSO, 400 MHz);  $\delta = 3.37$  (s, 3H); 3,75 (s, 3H); 6,20 (s, 1H); 7,45 (m, 1H); 7,86 (m, 1H); 8,49 (m, 1 H) 8,53 (m, 1H) ppm.

Etapa 3: N,1-dimetil-N-(piridin-3-il)-2-[3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1H-imidazol-5-carboxamida (Compuesto N° l-1-007)

Se cargaron de forma inicial 2-Cloro-N,1-dimetil-N-(pridin-3-il)-1H-imidazol-5-carboxamida (150 mg, 0,59 mmol) en dimetilformamida (5,0 ml), y se agregó carbonato de cesio (389,9 mg, 1,19 mmol). La mezcla de reacción se agitó a 120°C durante la noche y el solvente luego se destiló por completo a presión reducida. El residuo se sometió a cromatografía en gel de sílice mediante el uso de fase móvil etil acetato / metanol (80:20). Esto dio como resultado 61 mg (29,1% de teoría) de N,1-dimetil-N-(piridin-3-il)-2-[3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1H-imidazol-5-carboxamida. HPLC-MS: logP[n] = 1,87; masa (m/z): 351,1; logP[n] = 1,87

### Ejemplo de síntesis N° 2

5

10

15

20

25

30

N,1-Dimetil-2-(morfolin-4-il)-N-(piridin-3-il)-1H-imidazol-5-carboxamida (Compuesto N° I-1-009)

Se agitaron 2-Cloro-N,1-dimetil-N-(piridin-3-il)-1H-imidazol-5-carboxamida (150 mg, 0,59 mmol) y morfolina (216 mg, 2,48 mmol) a 100°C durante la noche. La mezcla se vertió en agua y se extrajo repetidamente con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio, el solvente se diluyó a presión reducida y el residuo se purificó por fase inversa preparativa HPLC mediante el uso de fase móvil agua / acetonitrilo. Esto dio como resultado 135 mg (75,8% de teoría) de N,1-dimetil-2-(morfolin-4-il)-N-(piridin-3-il)-1H-imidazol-5-carboxamida. HPLC-MS: logP[n] = 0,85; masa (m/z): 302,1; logP[n] = 0,85; masa (m/z): 302,1; logP[n] = 0,85; masa (m/z): 3,93 (m, 2H); 5,90 (s, 1H); 7,6-8,0 (m, 2H); 8,38-8,47 (m, 1H); 8,59-8,67 (m, 1 H) ppm.

Otros compuestos de la fórmula (I) preparados de forma análoga a los ejemplos dados anteriormente se enumeran en la Tabla 1.

# Tabla 1

Compuestos de la fórmula -1:

En donde T representa un par de electrones libres y los otros sustituyentes tienen los significados dados en la tabla:

Ej. N.°	L <sup>1</sup> -N-L <sup>2</sup>	Y	Α	٧	W	Logp [n] <sup>a)</sup>
I-1-001	<b>\$</b> -N	CH₃	CH₃	Н	Н	1,27
I-1-002	<b>*</b> -N_N	CH <sub>3</sub>	CH₃	Н	Н	1,01
I-1-003	<b>₽</b> NN CN	CH <sub>3</sub>	CH₃	Н	Н	1,31
I-1-004	<b>₽</b> NNCI	CH₃	CH₃	Н	Н	1,48
I-1-005	₽-N <sup>N</sup> CI	CH <sub>3</sub>	CH₃	Н	Н	1,49
I-1-006	<b>♣</b> NN F F	CH₃	CH₃	Н	Н	1,82
I-1-007	F F F F F F F F F F F F F F F F F F F	CH₃	CH₃	Н	Н	1,87
I-1-008	<b>♣</b> N CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	1,14
I-1-009	<b>\$</b> -N_0	CH <sub>3</sub>	CH₃	Н	Н	0,85
I-1-010	F F F	CH₃	CH₃	Н	Н	1,38
I-1-011	N S S S S S S S S S S S S S S S S S S S	CH₃	CH₃	Н	Н	1,27

Ej. N.°	L <sup>1</sup> -N-L <sup>2</sup>	continuación) <b>Y</b>	Α	V	W	Logp [n] <sup>a)</sup>
I-1-012		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	1,57
	, N,					
	N					
I-1-013	<b>5</b>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	1,53
	<b>\$</b> -N					
I-1-014	£,,, <sup>N</sup>	CH <sub>3</sub>	C₂H₅	Н	Н	2,09
	F 1					
	F <b>^ </b> F					
I-1-015	<b>L</b> N, N	CH₃	$C_2H_5$	Н	Н	1,42
	CN					
I-1-016	<b>£</b> _N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	1,87
	<b>F</b> "\					
I-1-017	<b>≸</b> N →CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	1,16
	\$ \\					
I-1-018	£_\/\\	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	2,38
	F \					
I-1-019	<b>≸</b> −N	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	1,19
I-1-020	` \	CH <sub>3</sub>	CH₃	Н	Н	2,21
1 1 020	<b> ≸</b> −√		<b>3.13</b>			_,
	· \					
I-1-021	\$ <sup>N</sup>	CH₃	CH <sub>3</sub>	Н	Н	1,29
	}_N_					
	CH <sub>3</sub>					
I-1-022	<b>\$</b> _N, N <b>&gt;</b>	CH₃	<b>}</b> <	Н	Н	1,4
	CN					
I-1-023	N-CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	1,42
	<b>\$</b> -N					
	CH <sub>3</sub>					
I-1-024	N <sub>L</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	1,18
	<b>_</b> N," <b>~</b>					
1.4.00=	* 🖳	0	0	ļ		0.70
I-1-025	<b>\$</b> _N^	CH₃	CH₃	Н	Н	0,56
	* N					
I-1-026	,N⇒CI	CH <sub>3</sub>	CH₃	Н	Н	1,17
					]	

Ej. N.°	L <sup>1</sup> -N-L <sup>2</sup>	Υ	Α	٧	W	Logp [n] <sup>a)</sup>
I-1-027		CH₃	CH₃	Н	Н	1,5
I-1-028	H <sub>2</sub> N CN	CH₃	CH₃	Н	Н	0,78
I-1-029	<b>♣</b> N CN	CH₃	C₂H₅	Н	Н	1,53
I-1-030		CH₃	CH₃	Н	Н	1,84
I-1-031	CC N	CH₃	CH₃	Н	Н	1,22

Tabla 2: 1H NMR datos de ejemplos seleccionados de la Tabla 1 b)

Ejemplo I-1-001:  $^{1}$ H-NMR(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):  $\delta$ = 8,313(1,1);7,941(1,1);7,921(1,3);7,887(0,4);7,871(0,4);7,140(3,4);6,290(5,7);6,240(0,4);3,938(2,9);3,670(16,0);3,403(17,1);3,315(45,9);3,225(0,4);2,891(0,5);2,731(0,5);2,675(1,7);2,671(2,3);2,666(1,7);2,576(0,7);2,558(1,0);2,510(135,7);2,506(266,3);2,502(355,6);2,497(274,4);2,493(144,5);2,456(0,4);2,333(1,5);2,328(2,1);2,324(1,6);2,117(0,3);1,140(0,7);0,146(2,0);0,033(0,7);0,028(0,7);0,008(17,1);0,000(428,7);-0,008(18,8);-0,150(2,0)

Ejemplo I-1-002:  $^1$ H-NMR(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):  $\bar{\delta}=8,578(0,8);8,510(1,1);8,312(4,7);8,192(2,1);8,185(2,1);7,918(0,8);7,897(1,0);7,866(2,3);7,862(2,5);7,840(0,7);7,489(0,8);7,478(0,8);7,469(0,9);7,455(1,0);7,443(0,7);7,433(0,6);7,421(0,5);6,561(1,5);6,556(1,9);6,550(1,5);6,484(1,4);6,274(2,3);3,936(8,9);3,795(16,0);3,469(0,4);3,433(0,5);3,427(0,5);3,410(14,5);3,402(9,1);3,382(1,0);3,363(2,6);3,355(2,0);3,343(2,8);3,314(1369,0);3,278(1,0);3,270(0,5);3,253(0,4);3,243(0,4);2,895(0,6);2,885(0,3);2,784(0,4);2,772(0,3);2,740(0,3);2,675(7,9);2,670(11,0);2,666(8,4);2,637(0,8);2,621(0,7);2,593(1,0);2,523(27,6);2,519(41,7);2,510(558,5);2,506(1165,3);2,501(1606,2);2,496(1235,8);2,492(633,2);2,447(0,8);2,432(0,5);2,407(0,9);2,332(7,6);2,328(10,8);2,323(8,1);0,146(1,5);0,008(9,5);0,000(316,0);-0,008(12,1);-0,150(1,4)$ 

Ejemplo I-1-003:  $^{1}$ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN):  $\delta$ = 8,483(2,0);8,127(2,6);8,121(2,6);7,744(1,2);7,724(1,3);7,410(1,0);7,398(1,1);7,390(1,0);7,378(0,9);6,976(2,6);6,970(2,5);6,293(2,9);5,447(16,0);3,827(14,2);3,429(14,1);2,174(2,6);1,952(2,6);1,951(2,6);1,946(4,4);1,941(5,8);1,935(4,2);1,929(2,2);0,000(24,6)

Ejemplo I-1-004:  $^{1}$ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN):  $\delta$ = 8,491(1,3);8,488(1,4);8,479(1,7);8,475(2,8);8,467(2,0);7,950(2,8);7,943(2,8);7,741(0,7);7,737(0,9);7,734(0,9);7,730(0,7);7,720(0,8);7,716(1,0);7,714(1,0);7,710(0,8);7,404(1,1);7,392(1,1);7,383(1,0);7,371(1,0);6,481(2,7);6,475(2,7);6,244(2,9);5,447(3,2);3,817(16,0);3,756(0,6);3,421(15,9);3,387(0,6);3,260(0,5);2,156(17,7);1,958(0,6);1,952(3,6);1,946(6,7);1,940(9,0);1,933(6,1);1,927(3,1);0,008(0,7);0,000(1,2,3);0,009(0,7);0,009(0

Ejemplo I-1-005:  $^{1}$ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN):  $\delta$ = 8,492(1,1);8,488(1,2);8,480(1,2);8,476(1,5);8,472(1,8);8,466(1,7);8,051(3,8);7,756(3,2);7,744(0,7);7,740(0,8);7,737(0,8);7,734(0,7);7,723(0,8);7,720(0,9);7,717(0,9);7,713(0,8);7,406(1,0);7,394(1,0);7,386(0,9);7,374(0,8);6,249(2,7);5,446(12,0);3,814(16,0);3,420(15,6);2,155(6,6);1,964(0,3);1,958(0,8);1,952(4,7);1,946(8,7);1,939(11,9);1,933(8,3);1,927(4,3);0,008(0,8);0,000(23,7);-0,009(1,0)

Ejemplo I-1-006:  ${}^{1}$ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN):  $\delta$ = 8,496(1,3);8,481(2,2);8,474(1,8);8,407(2,8);8,061(3,1);7,755(0,8);7,751(1,0);7,748(1,0);7,745(0,8);7,734(0,9);7,730(1,1);7,728(1,1);7,724(0,8);7,414(1,1);7,402(1,1);7,393(1,0);7,381(0,9);6,282(2,8);5,448(2,8);3,823(16,0);3,428(15,7);2,889(0,5);2,772(0,4);2,188(7,1);1,964(0,4);1,958(0,9);1,952(4,6);1,946(8,2);1,940(10,9);1,934(7,3);1,928(3,7);1,100(0,5);1,084(0,5);0,000(21,1);-0,008(0,7)

Ejemplo I-1-007:  $^{1}$ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN):  $\delta$ = 8,498(1,6);8,495(1,7);8,483(3,7);8,477(2,5);8,098(2,0);8,094(2,0);7,751(0,9);7,747(1,1);7,745(1,1);7,741(0,9);7,731(1,0);7,727(1,2);7,724(1,2);7,721(1,0);7,411(1,2);7,410(1,1);7,99(1,3);7,391(1,2);7,379(1,1);6,842(2,3);6,836(2,3);6,284(3,0);3,817(16,0);3,429(15,9);2,145(5,5);1,963(0,4);1,952(4,4);1,945(7,9);1,939(10,3);1,933(7,2);1,927(3,7);0,008(2,2);0,000(23,1)

Ejemplo I-1-008:  $^1$ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN):  $\bar{\delta}$ = 8,533(0,4);8,525(4,0);8,497(1,3);8,494(1,3);8,485(1,4);8,482(1,6);8,473(1,9);8,468(1,8);8,124(3,5);7,960(0,5);7,952(0,5);7,750(0,7);7,746(0,8);7,744(0,8);7,740(0,7);7,730(0,8);7,726(0,9);7,723(0,9);7,720(0,7);7,412(1,0);7,400(1,0);7,392(0,9);7,380(0,9);6,283(2,3);3,815(16,0);3,426(15,4);3,336(0,4);3,261(2,2);2,763(0,8);2,468(0,4);2,173(192,4);2,120(0,5);2,114(0,6);2,107(0,7);2,101(0,5);1,964(2,4);1,958(5,9);1,952(34,5);1,946(62,9);1,940(84,8);1,934(57,6);1,928(29,2);1,774(0,4);1,768(0,5);1,271(0,6);0,146(0,8);0,008(7,4);0,000(170,6);-0,009(6,3);-0,150(0,8)

Ejemplo I-1-009:  $^{1}$ H-NMR(601,6 MHz, CD3CN): = 19,985(0,6);9,485(0,7);8,922(1,3);8,845(1,0);8,676(1,1);8,609(0,8);8,463(0,9);8,405(0,7);8,000(1,8);7,952(0,8);7,894(0,8);7,621(0,8);6,998(1,2);6,714(1,0);3,925(6,5);3,815(5,5);3,798(5,1);3,678(6,6);3,646(2,6);3,595(2,7);3,531(9,1);3,454(5,1);3,382(2,3);3,307(5,2);3,303(8,2);3,168(6,7);2,926(4,9);2,859(9,1);2,692(16,0);1,976(9,8);1,972(10,9);1,968(9,3);1,087(0,5)

Ejemplo I-1-011:  $^{1}$ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN):  $\overline{o}$ = 8,545(3,8);8,498(1,1);8,494(1,1);8,486(1,1);8,482(1,2);8,473(1,4);8,468(1,5);7,753(0,6);7,749(0,7);7,747(0,7);7,743(0,6);7,733(0,7);7,729(0,8);7,726(0,8);7,722(0,7);7,415(0,8);7,413(0,8);7,403(0,8);7,401(0,8);7,394(0,8);7,393(0,7);7,382(0,7);7,381(0,7);6,282(2,0);5,447(2,9);3,814(15,4);3,756(0,5);3,426(14,9);3,388(0,5);2,611(16,0);2,523(0,4);2,170(160,1);2,107(0,4);1,964(1,5);1,958(2,9);1,952(21,7);1,946(40,4);1,940(55,7);1,934(37,8);1,928(19,1);0,008(1,9);0,000(64,7);-0,009(2,1)

Ejemplo I-1-012:  $^1$ H-NMR(400,0 MHz, CD3CN):  $\bar{\delta}$ = 8,487(1,1);8,483(1,2);8,475(2,6);8,468(1,7);7,939(2,5);7,933(2,6);7,742(0,6);7,739(0,7);7,736(0,7);7,732(0,7);7,718(0,8);7,716(0,8);7,712(0,7);7,470(0,6);7,405(0,8);7,404(0,9);7,394(0,8);7,392(0,9);7,385(0,8);7,384(0,8);7,372(0,8);6,403(2,5);6,397(2,5);6,306(0,4);6,302(0,4);6,234(2,8);5,218(1,0);5,094(0,5);3,852(15,1);3,420(14,8);3,121(0,4);2,758(0,4);2,541(16,0);2,416(0,8);2,404(0,5);2,381(2,6);2,379(2,9);2,372(0,9);2,355(0,5);2,350(0,5);2,196(13,3);1,959(0,5);1,953(3,5);1,947(6,5);1,940(9,0);1,934(6,2);1,928(3,1);1,269(0,4);0,000(8,8)

Ejemplo I-1-013:  $^{1}$ H-NMR(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):  $\delta$ = 8,497(2,7);8,490(2,7);8,477(1,6);8,474(1,9);8,465(1,7);8,462(1,9);7,837(0,9);7,833(1,1);7,831(1,2);7,827(1,0);7,816(1,0);7,813(1,2);7,810(1,3);7,806(1,0);7,457(1,4);7,445(1,4);7,436(1,3);7,424(1,2);5,915(5,4);5,756(2,3);3,522(16,0);3,338(15,8);3,321(27,8);2,923(3,1);2,911(4,3);2,897(3,5);2,506(15,6);2,501(22,0);2,497(17,4);1,617(0,7);1,589(3,2);1,578(2,6);1,512(1,5);1,501(1,4);0,781(0,3);0,008(0,4);0,000(9,6);-0,008(0,5)

$$\begin{split} & \text{Ejemplo I-1-014: }^1\text{H-NMR}(400,0\text{ MHz},\ d_6\text{-DMSO});\ \delta=8,926(3,2);8,539(2,6);8,526(1,4);8,343(4,0);7,916(0,9);7,912(1,1);7,906(0,9);7,895(1,0);7,891(1,2);7,889(1,2);7,505(1,2);7,493(1,2);7,485(1,1);7,473(1,0);6,274(2,7);3,915(0,9);3,897(3,0);3,879(3,0);3,862(1,0);3,837(0,6);3,763(16,0);3,317(72,3);3,283(0,4);2,671(0,6);2,506(71,2);2,501(95,3);2,497(73,5);2,328(0,6);1,147(3,4);1,129(7,3);1,112(3,3);0,008(2,5);0,000(53,7) \end{split}$$

Ejemplo I-1-015: 1 H-NMR(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):

 $\begin{array}{l} \delta = 9,09(4,9); 8,546(2,24); 8,538(2,81); 8,533(1,75); 8,525(1,69); 8,521(1,63); 8,465(4,85); 7,916(0,78); 7,912(0,96); 7,912(0,9$ 

Ejemplo I-1-016:  $^1$ H-NMR(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):  $\bar{o}$ = 8,495(2,2);8,489(2,3);8,476(1,5);8,472(1,7);8,464(1,6);8,461(1,7);7,834(0,8);7,831(1,0);7,828(1,0);7,824(0,9);7,814(0,9);7,810(1,1);7,808(1,1);7,804(0,9);7,456(1,2);7,444(1,2);7,435(1,1);7,423(1,1);5,912(5,3);5,753(0,5);3,518(16,0);3,337(15,6);3,317(32,1);3,192(1,3);3,161(1,5);2,712(0,9);2,707(1,0);2,682(1,8);2,676(1,9);2,652(0,9);2,646(0,8);2,524(0,8);2,510(17,1);2,506(36,3);2,501(51,1);2,497(39,3);2,493(19,8);1,646(1,1);1,619(1,2);1,614(1,2);1,490(0,3);1,480(0,4);1,472(0,4);1,463(0,5);1,454(0,4);1,291(0,5);1,282(0,5);1,260(1,0);1,251(1,1);1,230(0,9);1,222(0,9);1,201(0,3);0,933(5,9);0,916(5,6);0,008(1,0);0,000(30,1);-0,008(1,3)

Ejemplo I-1-018:  $^1$ H-NMR(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):  $\bar{o}$ = 8,512(2,4);8,506(2,4);8,485(1,7);8,482(1,8);8,473(1,8);8,470(1,8);8,314(0,4);8,025(2,5);7,850(0,9);7,846(1,1);7,843(1,0);7,839(0,9);7,829(1,1);7,825(1,1);7,823(1,2);7,819(1,0);7,466(1,3);7,455(1,3);7,446(1,2);7,434(1,1);7,326(1,0);7,318(1,0);7,307(3,1);7,300(2,5);7,290(3,8);7,279(4,2);7,274(4,8);7,253(2,8);7,249(3,0);7,232(1,4);7,223(0,7);7,216(1,2);7,212(1,8);7,208(1,1);7,195(2,8);7,189(0,7);7,178(1,1);5,947(5,7);4,330(0,4);4,325(0,4);4,319(0,4);4,298(0,4);4,293(0,4);4,288(0,4);3,800(0,4);3,794(0,4);3,789(0,4);3,767(0,4);3,762(0,5);3,756(0,4);3,575(16,0);3,350(16,6);3,317(113,0);3,173(0,5);3,165(0,4);3,141(0,8);3,134(0,8);3,101(0,4);2,881(0,7);2,850(1,0);2,844(1,1);2,828(0,9);2,814(0,7);2,805(0,5);2,796(0,7);2,788(0,4);2,766(0,4);2,710(0,4);2,702(0,6);2,675(1,7);2,670(2,3);2,666(1,4);2,661(1,1);2,645(1,0);2,638(1,0);2,622(0,3);2,524(3,1);2,519(5,0);2,510(67,0);2,506(141,1);2,501(197,5);2,497(147,5);2,492(70,8);2,332(0,8);2,328(1,1);2,323(0,8);1,841(0,5);1,834(0,5);1,817(2,0);1,810(2,5);1,798(3,3);1,790(2,7);1,771(1,1);1,762(1,0);1,550(0,7);7,539(0,6);1,519(0,6);1,507(0,5);1,477(0,3);1,445(0,6);1,434(0,6);1,414(0,5);1,403(0,5);0,146(0,5);0,008(3,7);0,000(109,9);-0,009(3,8);-0,150(0,5)

$$\begin{split} & \text{Ejemplo I-1-019: }^1\text{H-NMR}(400,0 \text{ MHz}, \text{ $d_6\text{-}DMSO$}); \ \overline{\delta} = 8,486(2,0); 8,480(2,0); 8,460(1,5); 8,456(1,6); 8,448(1,6); 8,444(1,6); 8,313(0,5); 7,821(0,8); 7,817(0,9); 7,811(0,9); 7,811(0,8); 7,800(0,9); 7,797(1,0); 7,794(1,0); 7,790(0,9); 7,448(1,1); 7,436(1,1); 7,428(1,0); 7,416(1,0); 5,895(5,8); 3,547(16,0); 3,332(15,8); 3,316(32,2); 3,303(2,6); 3,292(2,0); 3,286(5,8); 3,269(2,1); 2,675(0,6); 2,670(0,6); 2,666(0,4); 2,524(1,5); 2,519(2,2); 2,510(31,6); 2,506(67,0); 2,501(94,5); 2,496(70,6); 2,492(33,9); 2,332(0,4); 2,328(0,6); 2,323(0,4); 1,832(2,1); 1,823(2,1); 1,815(5,7); 1,807(2,1); 1,798(2,0); 1,561(0,4); 0,008(1,5); 0,000(47,5); -0,009(1,6) \end{split}$$

Ejemplo I-1-020:  $^1$ H-NMR(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):  $\bar{\delta}$ = 8,497(0,6);8,490(2,8);8,484(2,4);8,474(2,0);8,471(1,9);8,463(2,0);8,459(1,8);8,313(0,4);7,832(1,0);7,828(1,2);7,826(1,0);7,822(0,9);7,812(1,2);7,808(1,2);7,805(1,1);7,802(0,9);7,456(1,3);7,444(1,4);7,435(1,3);7,424(1,2);5,913(5,5);5,906(1,2);3,549(2,9);3,518(16,0);3,339(19,0);3,317(77,1);3,155(1,2);3,128(1,3);2,675(0,6);2,670(0,8);2,666(0,6);2,610(0,3);2,524(2,1);2,510(40,6);2,506(83,5);2,501(115,5);2,497(86,2);2,492(41,4);2,332(0,5);2,328(0,7);2,324(0,5);2,247(1,3);2,219(2,3);2,189(1,5);1,756(1,0);1,749(1,1);1,726(1,5);1,718(1,2);1,700(0,6);1,363(0,3);1,349(0,5);0,980(2,0);0,963(2,0);0,870(0,4);0,853(0,5);0,836(10,4);0,820(10,3);0,764(1,6);0,747(1,5);0,654(0,8);0,624(0,7);0,008(2,1);0,000(60,4);-0,009(2,2)

Ejemplo I-1-021: 1H-NMR(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):

 $\delta = 8.572(2,06); 8.566(2,11); 8.505(1,45); 8.502(1,53); 8.493(1,55); 8.49(1,49); 7.94(3,22); 7.913(0,84); 7.91(1,02); 7.90(0,82); 7.893(0,94); 7.889(1,08); 7.887(1,06); 7.883(0,88); 7.679(3,82); 7.625(0,66); 7.485(1,15); 7.473(1,16); 7.464(1.1); 7.453(1,04); 7.188(0,57); 7.185(0,58); 6.847(0,61); 6.844(0,6); 6.247(3,04); 5.756(10,05); 3.798(16); 3.662(3,33); 3.403(14,59); 3.321(41,24); 2.67(0,74); 2.506(97,87); 2.501(127,31); 2.497(94,18); 2.333(0,55); 2.328(0,73); 2.324(0,55); 2.094(2,3); 2.074(10,47); 0.146(0,61); 0.008(5,91); 0(135,75); -0.008(6,47); -0.15(0,6)$ 

Ejemplo I-1-022: 1H-NMR(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):

 $\begin{array}{l} 5 = 9,138(5,04);8,576(2,35);8,57(2,38);8,514(1,66);8,511(1,72);8,502(1,82);8,499(1,81);8,48(4,97);8,141(0,63);7,8\\ 73(0,94);7,869(1,19);7,867(1,16);7,863(0,93);7,853(1,07);7,849(1,28);7,847(1,29);7,843(0,99);7,496(1,29);7,484(1,28);7,476(1,26);7,464(1,19);6,938(2,34);5,755(15,9);3,744(16);3,732(1,3);3,424(0,64);3,416(0,85);3,407(1,23);3,389(0,88);3,389(0,67);3,379(0,42);3,321(1,59);2,506(20,92);2,502(27,82);2,498(21,37);2,074(2,06);0,89(0,53);0,87\\ 2(2,32);0,858(2,38);0,854(2,06);0,841(0,68);0,608(0,7);0,595(2,09);0,589(2,34);0,586(2,16);0,581(2,03);0,568(0,59);0,008(0,84);0(19,56);-0,008(0,97) \end{array}$ 

Ejemplo I-1-023: 1H-NMR(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):

 $\begin{array}{l} \delta = 8,562(2,48); 8,556(2,53); 8,5(1,69); 8,497(1,88); 8,488(1,75); 8,485(1,82); 7,897(1,18); 7,893(1,01); 7,882(1,01); 7,876(1,29); 7,873(1,05); 7,834(3,4); 7,479(1,35); 7,467(1,36); 7,458(1,31); 7,446(1,19); 6,212(3,64); 4,098(0,51); 4,085(0.53); 3,817(16); 3,579(0,33); 3,411(0,62); 3,396(14,94); 3,375(0,43); 3,321(24,41); 3,175(2,52); 3,162(2,48); 2,671(0,34); 2,506(39,91); 2,501(52,02); 2,497(40,53); 2,328(0,33); 2,18(14,65); 2,09(0,49); 1,99(12); 1,914(0,58); 0(21,58) \end{array}$ 

Ejemplo I-1-024: 1H-NMR(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):

 $\begin{array}{l} \overline{\delta} = 8,57(1,63); 8,564(1,67); 8,53(0,44); 8,524(0,47); 8,504(1,18); 8,5(1,36); 8,492(1,3); 8,489(1,32); 8,047(1,87); 8,041(1,94); 7,911(0,64); 7,908(0,79); 7,905(0,79); 7,901(0,72); 7,891(0,73); 7,887(0,82); 7,885(0,87); 7,881(0,73); 7,483(0,89); 7,47(0,98); 7,463(0,91); 7,45(0,88); 6,348(1,95); 6,342(2); 6,235(2,41); 6,208(0,54); 5,756(16); 3,811(12,36); 3,755(0,58); 3,749(3,73); 3,415(0,65); 3,402(11,54); 3,375(3,56); 3,32(25,51); 2,67(0,4); 2,51(25,65); 2,506(51,18); 2,501(67,9); 2,497(51,03); 2,328(0,39); 2,269(10,65); 0,008(1,84); 0(44,91); -0,008(2,59) \end{array}$ 

Ejemplo I-1-025: 1H-NMR(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):

 $\begin{array}{l} 5 = 8,576(1,94); 8,57(1,98); 8,523(1,38); 8,52(1,48); 8,512(1,45); 8,508(1,44); 8,062(2,36); 7,928(0,83); 7,924(0,99); 7,922(1); 7,918(0,89); 7,908(0,95); 7,904(1,07); 7,901(1,12); 7,898(0,93); 7,609(2,44); 7,5(1,17); 7,488(1,18); 7,48(1,11); 7,468(1,05); 7,136(2,23); 6,276(2,27); 5,756(3,47); 3,666(16); 3,409(14,91); 3,33(47,46); 2,511(11,43); 2,506(22,93); 2,502(30,49); 2,497(22,91); 2,493(11,75); 0,008(0,56); 0(14,89); -0,008(0,68) \\ \end{array}$ 

Ejemplo I-1-026: 1H-NMR(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):

 $\begin{array}{l} 5 = 9,182(0,34); 9,159(6,04); 9,134(0,38); 8,585(2,05); 8,579(2,06); 8,515(1,46); 8,512(1,66); 8,504(1,59); 8,5(1,63); 7,9\\ 33(0,8); 7,929(0,95); 7,926(0,96); 7,922(0,87); 7,912(0,93); 7,908(1,03); 7,906(1,06); 7,902(0,91); 7,49(1,16); 7,478(1,16); 7,47(1,09); 7,458(1,02); 6,37(1,46); 3,818(2,05); 3,755(16); 3,639(1,15); 3,426(0,67); 3,415(14,38); 3,319(35,08); 3,174(0,6); 3,162(0,58); 2,675(0,62); 2,67(0,84); 2,666(0,64); 2,524(2,77); 2,51(52,45); 2,506(107,24); 2,501(143,05); 2,497(105,63); 2,492(52,77); 2,333(0,62); 2,328(0,86); 2,324(0,63); 0,008(1,65); 0(46,68); -0,008(1,76) \end{array}$ 

Ejemplo I-1-027: 1H-NMR(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):

 $\begin{array}{l} \overline{\delta} = 8,568(3,96); 8,562(4,1); 8,503(2,85); 8,491(2,91); 7,909(1,44); 7,904(1,84); 7,899(1,56); 7,888(1,65); 7,883(2,05); 7.879(1,67); 7,733(2,65); 7,522(4,63); 7,484(2,11); 7,472(2,16); 7,464(2,09); 7,452(1,91); 6,264(3,13); 6,219(2,65); 3,855(16); 3,814(12,54); 3,401(21,22); 3,324(62,51); 3,175(0,92); 3,162(0,91); 2,763(1,32); 2,746(2,44); 2,727(1,71); 2,708(1.64); 2,69(2,81); 2,671(2,42); 2,646(1,37); 2,628(2,5); 2,61(2,47); 2,592(2,23); 2,574(1,9); 2,506(53,39); 2,502(69,77); 2,498(51,89); 2,468(1,27); 2,45(0,43); 2,405(0,62); 2,387(1,62); 2,369(2); 2,351(1,24); 2,333(0,65); 0(57,19) \end{array}$ 

Ejemplo I-1-028: 1H-NMR(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):

 $\begin{array}{l} \delta = 8,627(5,21); 8,56(3,59); 8,554(2,67); 8,528(0,44); 8,523(0,41); 8,5(2,4); 8,497(2,48); 8,488(2,28); 7,898(1,68); 7,881(1,61); 7,878(1,69); 7,477(1,6); 7,464(1,9); 7,456(1,51); 7,445(1,28); 6,242(3,41); 6,208(0,32); 6,084(5,36); 5,756(0,58); 3.807(16); 3,748(1,56); 3,694(0,38); 3,446(0,51); 3,394(15,21); 3,375(2,46); 3,328(29,27); 3,321(64,19); 2,67(0,66); 2,505(105,11); 2,501(111,87); 2,328(0,64); 1,237(0,38); 0,146(0,32); 0,006(27,04); 0(66,97); -0,15(0,36) \end{array}$ 

Ejemplo I-1-029: 1H-NMR(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):

 $\begin{array}{l} 5=8,556(0,32); 8,544(2,61); 8,537(2,76); 8,53(2,16); 8,522(4,8); 8,516(3,81); 7,913(0,88); 7,909(1,09); 7,907(1,09); 7,904(0,95); 7,893(1,03); 7,887(1,19); 7,883(0,95); 7,5(1,33); 7,488(1,33); 7,48(1,24); 7,468(1,12); 7,29(3,16); 7,284(3,14); 6,296(2,49); 3,917(1); 3,899(3,01); 3,881(3,02); 3,863(1); 3,809(0,36); 3,778(16); 3,754(1,13); 3,732(0,37); 3,704(0,66); 3,32(42,95); 3,174(0,68); 3,162(0,68); 2,67(0,62); 2,666(0,47); 2,506(81,79); 2,502(106,33); 2,497(79,85); 2,328(0,62); 1,146(3,44); 1,128(7,54); 1,11(3,52); 0,008(0,9); 0(19,74) \end{array}$ 

Ejemplo I-1-030: 1H-NMR(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):

 $\begin{array}{l} \delta = 8,574(2,04); 8,568(2,06); 8,504(1,4); 8,501(1,5); 8,492(1,47); 8,489(1,46); 8,043(2,66); 8,036(2,66); 7,916(0,77); 7,9\\ 12(0,95); 7,91(0,92); 7,906(0,8); 7,896(0,88); 7,892(1); 7,89(0,99); 7,886(0,8); 7,485(1,09); 7,473(1,08); 7,464(1,02); 7,453(0,95); 6,414(2,69); 6,408(2,67); 6,234(2,96); 3,815(14,68); 3,404(13,75); 3,32(97,79); 3,008(0,37); 2,991(0,94); 2,974(1,27); 2,956(0,99); 2,939(0,4); 2,675(0,66); 2,67(0,89); 2,666(0,68); 2,506(121,42); 2,501(158,45); 2,497(116,77); 2,332(0,7); 2,328(0,93); 2,324(0,69); 1,252(16); 1,234(15,75); 0,008(0,78); 0(21,82); -0,008(0,96) \end{array}$ 

Ejemplo I-1-031: 1H-NMR(601,6 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):

 $\begin{array}{l} \delta = 9,506(0,41); 9,465(5,89); 8,589(2,13); 8,586(2,18); 8,514(1,63); 8,512(1,69); 8,506(1,68); 8,504(1,62); 7,931(0,92); 7,929(1,12); 7,927(1,09); 7,925(0,97); 7,918(1,02); 7,915(1,15); 7,914(1,15); 7,911(0,96); 7,486(1,22); 7,485(1,2); 7,478(1,21); 7,472(1,22); 7,471(1,18); 7,464(1,12); 6,43(0,8); 3,85(1,32); 3,818(0,49); 3,781(16); 3,433(0,6); 3,424(14,14); 3,314(1,82); 2,508(4,44); 2,505(8,94); 2,502(12,04); 2,499(9,08); 2,496(4,57) \end{array}$ 

a) Los valores logP en las tablas y los ejemplos de preparación anteriores se determinaron según la directiva EEC 79/831 Anexo V. A8 por HPLC (cromatografía de líquidos de alta resolución) mediante el uso de columna de fase inversa (C18). Temperatura a 43°C. La calibración se lleva a cabo con alcan-2-onas sin ramificar (que tienen de 3 a 16 átomos de carbono), para los que se conocen los valores logP.

La determinación de M<sup>+</sup> por LC-MS en el rango ácido se llevó a cabo a pH 2,7 al utilizar las fases móviles 0,1% de ácido fórmico acuoso y acetonitrilo (contiene 0,1% de ácido fórmico); gradiente lineal de 10% de acetonitrilo a 95% de acetonitrilo, instrumento: Sistema Agilent 1100 LC, Sistema Agilent MSD, HTS PAL.

La determinación de M<sup>+</sup> por LC-MS en el rango neutro se llevó a cabo a un pH 7,8 al utilizar las fases móviles 0,001 solución molar de bicarbonato de amonio acuoso y acetonitrilo; gradiente lineal de 10% de acetonitrilo a 95% de acetonitrilo.

Los valores logP para el rango ácido (como logP [a]) y/o para el rango neutral (como logP [n]) se establecieron en las tablas y los ejemplos de preparación anteriores.

b) la determinación de los datos  $^1H$  NMR se vio afectada con un Bruker Avance 400 equipado con un cabezal de flujo de muestra (capacidad 60  $\mu$ I), con tetrametilsilano como referencia (0,0) y los solventes CD<sub>3</sub>CN, CDCl<sub>3</sub> o D<sub>6</sub>-DMSO.

Los datos NMR de los ejemplos seleccionados se enumeraron ya sea de manera convencional (δ valores, división múltiple, cantidad de átomos de hidrógeno) o como listas de picos NMR.

## Procedimiento de lista de pico NMR

5

10

15

20 Los datos ¹H NMR de los ejemplos seleccionados se establecen en forma de listas de picos ¹H NMR Para cada pico de señal, primero se enumeran el valor δ en ppm y luego la intensidad de la señal en paréntesis. El valor δ - los pares de número de intensidad de señal para distintos picos de señal se enumeran al separar unos de otros con punto y coma.

La lista de pico para cada ejemplo entonces tiene el formato:

25  $\delta_1$  (intensidad<sub>1</sub>);  $\delta_2$  (intensidad<sub>2</sub>);......;  $\delta_i$  (intensidad<sub>i</sub>);.....;  $\delta_n$  (intensidad<sub>n</sub>)

La intensidad de las señales bruscas tiene correlación con la altura de las señales en un ejemplo impreso de un espectro NMR en cm y muestra las relaciones verdaderas de las intensidades de señal. En caso de señales amplias, muchos picos o el medio de la señal y su relativa intensidad pueden mostrarse en comparación con la señal más intensa en el espectro.

30 La calibración del cambio químico de los espectros <sup>1</sup>H NMR se logra al utilizar tetrametilsilano y/o el cambio químico del solvente, en particular en el caso de los espectros que se miden en DMSO. Por lo tanto, el pico de tetrametilsilano puede, pero no necesita que ocurran listas de pico NMR.

Las listas de los picos <sup>1</sup>H NMR son similares a las impresiones <sup>1</sup>H NMR y, entonces, por lo general contiene todos los picos enumerados en una interpretación convencional NMR.

Además, como las impresiones <sup>1</sup>H NMR convencionales, pueden mostrar señales de solvente, señales de esteroisómeros de los compuestos diana que se proporcionan de la misma forma por la invención, y/o picos o impurezas.

En el informe de las señales de compuesto dentro del rango delta de solventes y/o agua, nuestras listas de picos <sup>1</sup>H NMR muestran los picos de solvente estándares, por ejemplo picos de DMSO en DMSO-D<sub>6</sub> y el pico de agua, que por lo general tiene una mayor intensidad en promedio.

Los picos de esteroisómeros en los compuestos diana y/o los picos de impurezas por lo general tienen una intensidad menor en promedio que los picos de los compuestos diana (por ejemplo con una pureza de > 90%).

Estos esteroisómeros y/o impurezas pueden ser típicas del procedimiento de preparación particular. Estos picos pueden entonces ayudar en este caso para identificar la reproducción de nuestro procedimiento de preparación con referencia a "huellas de un subproducto".

Un experto que calcula los picos de los compuestos diana por los procedimientos conocidos (MestreC, simulación ACD, pero también con valores esperados empíricamente evaluados) pueden, si se requiere, aislar los picos de los compuestos diana, de manera opcional mediante el uso de filtros de intensidad adicionales. La aislación sería similar al pico elegido en cuestión para interpretación <sup>1</sup>H NMR convencional.

Otros detalles de las listas de pico <sup>1</sup>H NMR pueden encontrarse en el Número de la Base de datos de la divulgación de la investigación 564025.

#### Ejemplos de uso

20

25

30

35

45

50

Los ejemplos que siguen demuestran la acción insecticida y acaricida de los compuestos según la invención. En estos ejemplos, los compuestos según la invención hacen referencia a los compuestos enumerados en la tabla 1 con los correspondientes numerales de referencia (N°):

## Boophilus microplus - prueba de inyección

Solvente: dimetil sulfóxido

Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, se mezclan 10 mg de compuesto activo con 0,5 ml de solvente y el concentrado se diluye con solvente a la concentración deseada.

1 μl de la solución del compuesto activo se inyecta en el abdomen de 5 garrapatas de ganado adultas hembras ingurgitadas (*Boophilus microplus*). Los animales se transfieren a los platos y se las deja en una habitación con el clima controlado.

Se logra la eficacia luego de 7 días al poner huevos fértiles. Los huevos que son visiblemente fértiles se almacenan en un gabinete con el clima controlado hasta que las larvas se incuban luego de aproximadamente 42 días. Una eficacia del 100% significa que ninguna de las garrapatas puso ningún huevo fértil; el 0% significa que todos los huevos son fértiles.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación: muestran una eficacia del 80% a una frecuencia de aplicación de 20 µg/animal: I-1-031

# Myzus persicae – prueba oral

Solvente: 100 partes en peso de acetona.

Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, 1 parte en peso de compuesto activo se disuelve al utilizar las partes especificadas en peso de solvente y se conforman con agua hasta que se logra la concentración deseada.

Se transfieren 50 µl de una preparación de compuesto activo a platos de microtitulación y se conforman a un volumen final de 200 µl con 150 µl de un medio IPL41 para insecto (33% + 15% azúcar). Luego, los platos se sellan con parafilm, que una población mezclada de álfidos verdes del durazno (Myzus persicae) dentro de un segundo plato de microtitulación es capaz de perforar y beber la solución a través de este.

Luego de 5 días, se determina la eficacia en %. 100% quiere decir que todos los álfidos se murieron; el 0% quiero decir que los álfidos sobrevivieron.

En esta prueba, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100% a una frecuencia de aplicación de 20 ppm. I-1-001, I-1-002, I-1-003, I-1-004, I-1-005, I-1-006, I-1-007, I-1-008, I-1-009, I-1-

010, I-1-011, I-1-012, I-1-013, I-1-014, I-1-015, I-1-016, I-1-017, I-1-018, I-1-019, I-1-020, I-1-021, I-1-022

## Myzus persicae - prueba de pulverización

Solventes: 78 partes en peso de acetona.

1,5 partes en peso de dimetilformamida.

Emulsionante: Alquilaril poliglicol éter

Para producir una formulación de ingrediente activo adecuada, 1 parte en peso de compuesto activo se disuelve con las partes establecidas en peso de solvente y se conforman con agua que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm hasta que se logra la concentración deseada. Para producir otras concentraciones de prueba, la formulación se diluye con el agua que contiene emulsionante.

Discos de hojas de col china (*Brassica pekinensis*) infestadas por todas las etapas de álfido verde del durazno (Myzus persicae) se pulverizan con una formulación de compuesto activo de la concentración deseada.

Luego de 5 a 6 días, se determina la eficacia en %. 100% quiere decir que todos los álfidos se murieron; el 0% quiero decir que los álfidos sobrevivieron.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación: muestran una eficacia del 100% a una frecuencia de aplicación de 500 g/ha: I-1-004, I-1-006, I-1-007, I-1-008, I-1-009, I-1-010, I-1-011, I-1-013, I-1-017, I-1-018, I-1-019, I-1-020, I-1-021

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación: muestran una eficacia del 90% a una frecuencia de aplicación de 500 g/ha: I-1-001, I-1-002, I-1-003, I-1-005, I-1-012, I-1-014, I-1-015, I-1-016, I-1-022

# Tetranychus urticae – prueba de pulverización, resistente a OP

Solventes: 78,0 partes en peso de acetona.

1,5 partes en peso de dimetilformamida.

Emulsionante: Alquilaril poliglicol éter

Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, se disuelve 1 parte en peso de compuesto activo mediante el uso de partes especificadas en peso de solvente y se conforman con agua que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm hasta que se logra la concentración deseada. Para producir otras concentraciones de prueba, la formulación se diluye con el agua que contiene emulsionante.

Discos de hojas de frijoles (*Phaseolus vulgaris*) infestadas con todas las etapas de la arañuela roja común de invernadero (*Tetranychus urticae*) se pulverizan con una formulación de compuesto activo de la concentración deseada.

Luego de 6 días, se determina la eficacia en %. 100% significa que todas las arañuelas se murieron; 0% que las arañuelas sobrevivieron.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación: muestran una eficacia del 90% a una frecuencia de aplicación de 500 g/ha: I-1-009, I-1-015.

# 35 Ejemplos de deposición

5

20

30

45

# Myzus persicae - prueba de pulverización (MYZUPE)

Solventes: 78,0 partes en peso de acetona.

1,5 partes en peso de dimetilformamida.

Emulsionante: Alquilaril poliglicol éter

Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, se disuelve 1 parte en peso de compuesto activo mediante el uso de partes especificadas en peso de solvente y se conforman con agua que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm hasta que se logra la concentración deseada. Para producir otras concentraciones de prueba, la formulación se diluye con el agua que contiene emulsionante.

Discos de hojas de col china (*Brassica pekinensis*) infestada por todas las etapas de álfido verde del durazno (Myzus persicae) se pulverizan con una preparación de compuesto activo de la concentración deseada.

Luego del periodo deseado de tiempo (dat), se determina la eficacia en %. 100% quiere decir que todos los álfidos se murieron; el 0% quiero decir que los álfidos sobrevivieron.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los Ejemplos de Preparación muestran una eficacia superior a la técnica anterior: véase Tabla 3.

## Myzus persicae – prueba oral (MYZUPE O)

Solvente: 100 partes en peso de acetona.

Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, 1 parte en peso de compuesto activo se disuelve al utilizar las partes especificadas en peso de solvente y se conforman con agua hasta que se logra la concentración deseada.

Se transfieren 50  $\mu$ l de una preparación de compuesto activo a platos de microtitulación y se conforman a un volumen final de 200  $\mu$ l con 150  $\mu$ l de un medio IPL41 para insecto (33% + 15% azúcar). Luego, los platos se sellan con parafilm, que una población mezclada de álfidos verdes del durazno (Myzus persicae) dentro de un segundo plato de microtitulación es capaz de perforar y beber la solución a través de este.

Luego del periodo deseado de tiempo (dat), se determina la eficacia en %. 100% quiere decir que todos los álfidos se murieron; el 0% quiero decir que los álfidos sobrevivieron.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los Ejemplos de Preparación muestran una eficacia superior a la técnica anterior: véase Tabla 3.

### Tetranychus urticae - prueba de pulverización; resistente a OP (TETRUR)

Solventes: 78,0 partes en peso de acetona

1,5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: alquilaril poliglicol éter

Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, se disuelve 1 parte en peso de compuesto activo mediante el uso de partes especificadas en peso de solvente y se conforman con agua que contiene una concentración emulsionante de 1000 ppm hasta que se alcanza la concentración deseada. Para producir otras concentraciones de prueba, la formulación se diluye con el agua que contiene emulsionante.

Discos de hojas de frijoles (*Phaseolus vulgaris*) que están infestadas por todas las etapas de arañuela roja común de invernadero (*Tetranychus urticae*) se pulverizan con una preparación de compuesto activo de la concentración deseada.

Luego del periodo deseado de tiempo (dat), se determina la eficacia en %. 100% significa que todas las arañuelas murieron: 0% significa que las arañuelas sobrevivieron.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los Ejemplos de Preparación muestran una eficacia superior a la técnica anterior: véase Tabla 3.

Tabla 3:

Sustancia	Estructura	Especies de animal	Concentración		Datos de % de eficacia	
Ej. N.° 14 WO2011/009804 arte previo		MYZUPE MYZUPE O	100 g ai/ha 4 ppm 0,8 ppm	0 0	5/6 dat 5 dat 5 dat	
·		TETRUR	500 g/ha	0	6 dat	
Ej. N.° 13	0	MYZUPE	100 g ai/ha	0	6 dat	
WO2011/009804	N N	MYZUPE O	4 ppm	0	5 dat	
arte previo			0,8 ppm	0	5 dat	
	N N	TETRUR	500 g/ha	0	6 dat	
Ej. N.º I-1-001		MYZUPE	100 g ai/ha	90	6 dat	
de acuerdo con la	N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	MYZUPE O	4 ppm	100	5 dat	
invención			0,8 ppm	100	5 dat	
Ej. N.º I-1-004		MYZUPE	100 g ai/ha	90	6 dat	
de acuerdo con la		MYZUPE O	4 ppm	100	5 dat	
invención	N O I N CI		0,8 ppm	100	5 dat	
Ej. N.º I-1-006	N	MYZUPE	100 g ai/ha	100	6 dat	
de acuerdo con la invención	N N N N F	MYZUPE O	0,8 ppm	100	5 dat	

5

15

20

# ES 2 770 092 T3

(continuación)

Sustancia	Estructura	Especies de animal	Concentración	Datos de % de eficacia	
Ej. N.º I-1-009		MYZUPE	100 g ai/ha	70	6 dat
de acuerdo con la		MYZUPE O	0,8 ppm	70	5 dat
invención		TETRUR	500 g/ha	90	6 dat
Ej. N.º I-1-010		MYZUPE	100 g ai/ha	70	6 dat
de acuerdo con la	N N N N	MYZUPE O	4 ppm	100	5 dat
invención	N O   F		0,8 ppm	100	5 dat
Ej. N.º I-1-011		MYZUPE	100 g ai/ha	70	5 dat
de acuerdo con la		MYZUPE O	4 ppm	90	5 dat
invención	, N O   N		0,8 ppm	90	5 dat
Ej. N.º I-1-015	)N/N	MYZUPE O	4 ppm	100	5 dat
de acuerdo con la			0,8 ppm	100	5 dat
invención		TETRUR	500 g/ha	90	6 dat
Ej. N.º I-1-017		MYZUPE	100 g ai/ha	90	5 dat
de acuerdo con la		MYZUPE O	4 ppm	100	5 dat
invención			0,8 ppm	100	5 dat

#### REIVINDICACIONES

## 1. Compuestos de la Fórmula (I)

$$\begin{array}{c|c}
 & L^2 & L^1 \\
 & N & Y \\
 & V & Q \\
 & V & A \\
 & T & (I)
\end{array}$$

en la que

5 Q representa oxígeno o azufre,

V representa un radical de la serie de hidrógeno, halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi y ciano,

W representa un radical de la serie de hidrógeno, halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi y ciano,

Y representa un radical de la serie de hidrógeno, ciano y alquillo, alquenillo o alquinillo dado el caso sustituidos, cicloalquillo dado el caso sustituido y dado el caso interrumpido por heteroátomos, cicloalquillalquillo arillalquillo o hetarillalquillo dado el caso sustituidos y dado el caso interrumpido por heteroátomos,

A representa un radical de la serie de hidrógeno y alquilo, alquenilo o alquinilo dado el caso sustituidos y cicloalquilo o cicloalquilalquilo dado el caso sustituidos y dado el caso interrumpidos por heteroátomos,

T representa oxígeno o un par de electrones,

 $L^1$  representa un radical de la serie de hidrógeno y alquillo, alquinillo o cicloalquillo dado el caso sustituidos y representa los radicales  $C(O)R^2$ ,  $C(O)N(R^3)(R^4)$ ,  $C(O)OR^5$  y  $SO_2R^6$ ,

L² representa un radical de la serie de hidrógeno, N(R³a)(R⁴a) y alquilo, alquenilo, alquinilo o alcoxi dado el caso sustituidos, cicloalquilo o cicloalquilalquilo dado el caso sustituidos y dado el caso interrumpidos por heteroátomos, y arilo, arilalquilo, hetarilo o hetarilalquilo dado el caso sustituidos,

0

10

15

25

30

35

20 L¹ y L² representan, junto con el átomo de nitrógeno al que se encuentran unidos, un heterociclo dado el caso sustituido saturado, parcialmente saturado o aromático que tiene de 3 a 7 átomos de anillo que puede estar dado el caso interrumpido por otros heteroátomos y/o por uno o dos grupos C=O,

R² representa un radical de la serie de hidrógeno, alquilo, alquenilo o alquinilo dado el caso sustituidos, cicloalquilo dado el caso sustituido, arilo o hetarilo dado el caso sustituidos y arilalquilo o hetarilalquilo dado el caso sustituidos.

R³ y R⁴ cada uno de forma independiente entre sí representa un radical de la serie de hidrógeno, alquilo, alquenilo o alquinilo dado el caso sustituidos, clicloalquilo, cicloalquilalquilo, arilo, hetarilo, arilalquilo o hetarilalquilo saturados o insaturados dado el caso sustituidos,

0

R³ y R⁴ juntos forman un anillo alifático de tres a siete miembros dado el caso sustituido que contiene dado el caso un átomo de nitrógeno, azufre u oxígeno,

R<sup>3a</sup> representa un radical de la serie de hidrógeno y alquilo dado el caso sustituido, cicloalquilo, arilo, hetarilo, arilalquilo o hetarilalquilo dado el caso sustituidos,

 $R^{4a} \ representa \ un \ radical \ de \ la \ serie \ de \ hidrógeno, \ alquilo \ dado \ el \ caso \ sustituido, \ C_3-C_6-cicloalquilo \ dado \ el \ caso \ sustituido, \ C_3-C_6-cicloalquilo \ dado \ el \ caso \ sustituido \ y \ representa \ los \ radicales \ C(O)R^2, \ C(O)OR^5 \ y \ SO_2R^6,$ 

 $R^5$  representa alquilo, alquenilo o alquinilo dado el caso sustituidos, cicloalquilo o cicloalquilalquilo dado el caso sustituidos,

R<sup>6</sup> representa un radical de la serie de alquilo, alquenilo o alquinilo dado el caso sustituidos, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, arilo, arilalquilo, hetarilo o hetarilalquilo dado el caso sustituidos,

- 40 y sus sales.
  - 2. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, en los que

Q representa oxígeno o azufre,

V representa un radical de la serie de hidrógeno, halógeno,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_1$ - $C_4$ -haloalquilo,  $C_1$ - $C_4$ -

W representa un radical de la serie de hidrógeno, halógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalcoxi y ciano,

Y representa un radical de la serie de hidrógeno y  $C_1$ - $C_6$ -alquilo,  $C_3$ - $C_6$ -alquenilo o  $C_3$ - $C_6$ -alquinilo, dado el caso mono- a polisustituidos de forma independiente entre sí con halógeno,  $C_1$ - $C_4$ -alcoxi,  $C_1$ - $C_4$ -alquil- $S(O)_n$ - o ciano,  $C_3$ - $C_8$ -cicloalquilo dado el caso mono- a disustituido independientemente entre sí con halógeno,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_1$ - $C_4$ -haloalquilo,  $C_1$ - $C_4$ -alcoxi o ciano,  $C_3$ - $C_8$ -cicloalquil- $C_1$ - $C_4$ -alquilo de cadena recta o ramificada, dado el caso interrumpido una o dos veces de manera independiente entre sí por O,  $S(O)_n$ , CO o  $NR^{4a}$  y dado el caso de mono- a tetrasustituido de forma independiente entre sí con halógeno,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo, dado el caso de mono- a trisustituido de manera independiente entre sí con halógeno,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_1$ - $C_4$ -a

A representa un radical de la serie de hidrógeno y  $C_1$ - $C_6$ -alquilo,  $C_3$ - $C_6$ -alquenilo o  $C_3$ - $C_6$ -alquinilo, dado el caso de mono- a polisustituidos de forma independiente entre sí con halógeno,  $C_1$ - $C_4$ -alkoxi,  $C_1$ - $C_4$ -alquil- $S(O)_n$ - o ciano y  $C_3$ - $C_6$ -cicloalquilo, dado el caso de mono- o disustituido de forma independiente entre sí con halógeno,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_1$ - $C_4$ -haloalquilo,  $C_1$ - $C_4$ -alcoxi o ciano y  $C_1$ - $C_6$ -alquilo,  $C_3$ - $C_6$ -alquenilo o  $C_3$ - $C_6$ -alquinilo dado el caso de mono- a polisustituido de manera independiente entre sí con halógeno,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo de cadena recta o ramificada, dado el caso de mono- a disustituido de manera independiente entre sí con halógeno,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_1$ -C

 $L^1$  representa un radical de la serie de hidrógeno y  $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_3$ - $C_6$ -alquenilo o  $C_3$ - $C_6$ -alquinilo dado el caso de mono- a trisustituidos de forma independiente entre sí con halógeno,  $C_1$ - $C_4$ -alcoxi,  $C_1$ - $C_4$ -alquil- $S(O)_n$ - o ciano, y  $C_3$ - $C_6$ -cicloalquilo dado el caso de mono- a disustituido de manera independiente entre sí con halógeno,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_1$ - $C_4$ -haloalquilo,  $C_1$ - $C_4$ -alcoxi o ciano y representa los radicales  $C(O)R^2$ ,  $C(O)N(R^3)(R^4)$ ,  $C(O)OR^5$  y  $SO_2R^6$ ,

 $L^2$  representa un radical de la serie de hidrógeno, -N(R<sup>3a</sup>)(R<sup>4a</sup>) y C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-alquenilo, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-alquinilo o C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcoxi, dado el caso de mono- a trisustituido de forma independiente entre sí con halógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquil-S(O)<sub>n</sub>- o ciano, y C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquilo o C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquil-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo de cadena recta o ramificada, interrumpida dado el caso una o dos veces independientemente entre sí por O, S(O)<sub>n</sub>, CO o NR<sup>4a</sup> y dado el caso de mono- a tetrasustituido independientemente entre sí con halógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcoxi o ciano, y arilo, hetarilo, arilalquilo o hetarilalquilo, dado el caso de mono- a trisustituidos de forma independiente entre sí con halógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilos, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo

L<sup>1</sup> y L<sup>2</sup> junto con N representan un heterociclo de la serie U-1 a U-36

5

10

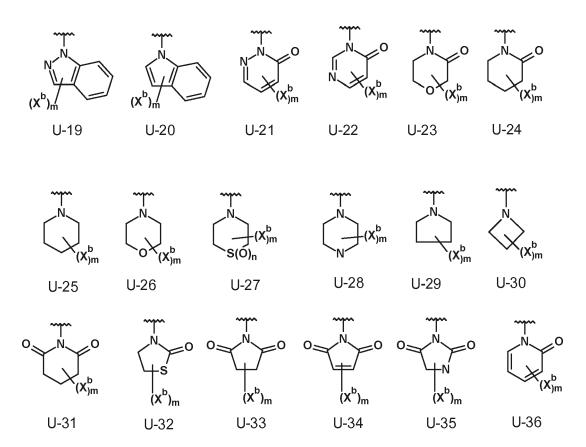
15

20

25

30

35



 $X^b$  representa un radical de la serie de halógeno, nitro, ciano, amino,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_3$ - $C_6$ -cicloalquilo,  $C_1$ - $C_4$ -haloalcoxi,  $C_3$ - $C_6$ -halocicloalquilo,  $C_1$ - $C_4$ -alcoxi- $C_1$ - $C_4$ -alquilo, ciano- $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_3$ - $C_6$ -cicloalquil- $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_3$ - $C_6$ -alquinilo,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_1$ - $C_6$ -haloalquilcarbonilo,  $C_1$ - $C_6$ -alquilaminocarbonilo, di- $(C_1$ - $C_6)$ -alquilaminocarbonilo,  $C_1$ - $C_6$ -alquilamino, arilo y hetarilo, donde los sustituyentes arilo y hetarilo pueden ser dado el caso mono- o polisustituidos con sustituyentes idénticos o diferentes del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro,  $C_1$ - $C_6$ -alquilo,  $C_2$ - $C_6$ -alquinilo,  $C_2$ - $C_6$ -alquinilo,  $C_1$ - $C_4$ -alcoxi,  $C_1$ - $C_4$ -haloalquilo,  $C_1$ - $C_6$ -haloalcoxi o  $C_1$ - $C_4$ -alquitio y donde los átomos de N de anillo en U-13, U-14, U-16, U-28 y U-35 no están sustituidos con halógeno, nitro, ciano,  $C_1$ - $C_4$ -alcoxi,  $C_1$ - $C_4$ -alquiloxi,

0

5

10

15

20

25

30

 $X^b$  representa una cadena de carbono  $C_2$ - $C_5$  que contiene dado el caso 1 heteroátomo de la serie de N, S u O, que está unida a dos posiciones de anillo adyacentes y que forma un anillo alifático, aromático, heteroaromático o heterocíclico, en donde m es entonces igual a 2,

 $R^2$  representa un radical de la serie de hidrógeno, y  $C_1$ - $C_8$ -alquilo,  $C_3$ - $C_8$ -alquenilo o  $C_3$ - $C_8$ -alquinilo, dado el caso de mono- a polisustituidos de manera independiente entre sí con halógeno,  $C_1$ - $C_4$ -alcoxi o  $C_1$ - $C_4$ -alquil- $S(O)_n$ -, y  $C_3$ - $C_8$ -cicloalquilo dado el caso de mono- a disustituido de manera independiente entre sí con halógeno,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_1$ - $C_4$ -haloalquilo,  $C_1$ - $C_4$ -alcoxi o ciano, y arilo o hetarilo, dado el caso de mono- a trisustituido de manera independiente entre sí con halógeno,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_1$ - $C_4$ -haloalquilo,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_1$ - $C_4$ -haloalquilo,  $C_1$ - $C_4$ -haloalquilo,

 $R^3$ ,  $R^4$  de forma independiente entre sí representan un radical de la serie de hidrógeno y  $C_1$ - $C_8$ -alquilo,  $C_3$ - $C_8$ -alquinilo, dado el caso de mono- a polisustituidos independientemente entre sí con halógeno,  $C_1$ - $C_4$ -alquil- $S(O)_n$ -,  $C_3$ - $C_8$ -cicloalquilo dado el caso de mono- a disustituido independientemente entre sí con halógeno,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_1$ - $C_4$ -haloalquilo,  $C_1$ - $C_4$ -alcoxi o ciano, y arilo o hetarilo, dado el caso de mono- a trisustituidos de manera independiente entre sí con halógeno,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_1$ - $C_4$ -haloalquilo,  $C_1$ - $C_4$ -haloalquilo,  $C_1$ - $C_4$ -haloalquilo,  $C_1$ - $C_4$ -haloalquilo,  $C_1$ - $C_4$ -haloalquilo de cadena recta o ramificada, dado el caso de mono- a trisustituidos independientemente entre sí con halógeno,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_1$ - $C_4$ -haloalquilo,  $C_1$ -C

R<sup>3a</sup> representa un radical de la serie de hidrógeno, C₁-C₃-alquilo dado el caso de mono- a polisustituido independientemente entre sí con halógeno, ciano o C₁-C₄-alcoxi, y C₃-C₃-cicloalquilo dado el caso de mono- a

# ES 2 770 092 T3

disustituido de forma independiente entre sí con halógeno,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_1$ - $C_4$ -haloalquilo o  $C_1$ - $C_4$ -alcoxi, y arilo o hetarilo dado el caso de mono- a trisustituidos independientemente entre sí con halógeno,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_1$ - $C_4$ -haloalquilo,  $C_1$ - $C_4$ -haloalquilo,  $C_1$ - $C_4$ -haloalquilo,  $C_1$ - $C_4$ -haloalquilo,  $C_1$ - $C_4$ -haloalquilo o hetaril- $C_1$ - $C_4$ -alquilo de cadena recta o ramificada, dado el caso de mono- a trisustituido independientemente entre sí con halógeno,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_1$ - $C_4$ -haloalquilo,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_1$ - $C_4$ -alquil

 $R^{4a}$  representa un radical de la serie de hidrógeno,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo dado el caso de mono- a polisustituido independientemente entre sí con halógeno o  $C_1$ - $C_4$ -alcoxi, y  $C_3$ - $C_6$ -cicloalquilo dado el caso de mono- a disustituido independientemente entre sí con halógeno,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_1$ - $C_4$ -haloalquilo o  $C_1$ - $C_4$ -alcoxi y representa los radicales  $C(O)R^2$ ,  $C(O)OR^5$  y  $SO_2R^6$ ,

 $R^5$  representa  $C_1$ - $C_8$ -alquillo,  $C_3$ - $C_8$ -alquenilo o  $C_3$ - $C_8$ -alquinilo, dado el caso de mono- a polisustituidos independientemente entre sí con halógeno,  $C_1$ - $C_4$ -alquil- $S(O)_n$ -, y  $C_3$ - $C_8$ -cicloalquilo dado el caso de mono- a disustituido independientemente entre sí con halógeno,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_1$ - $C_4$ -haloalquilo,  $C_1$ - $C_4$ -alcoxi o ciano,

R<sup>6</sup> representa un radical de la serie de C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-alquenilo o C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-alquinilo, dado el caso de mono- a polisustituidos independientemente entre sí con halógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcoxi o C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquil-S(O)<sub>n</sub>-, y C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquilo dado el caso de mono- a disustituido independientemente entre sí con halógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcoxi o ciano, y arilo o hetarilo, dado el caso de mono- a trisustituidos independientemente entre sí con halógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquil-S(O)<sub>n</sub>-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalcoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalquilo-S(O)<sub>n</sub>-, nitro o ciano,

m representa un número 0, 1, 2 o 3, n representa un número 0, 1 o 2,

y sus sales.

5

10

3. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 2, en los que

25 Q representa oxígeno,

V representa un radical de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo y etilo,

W representa un radical de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano y metilo,

Y representa un radical de la serie de hidrógeno y C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquillo, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-alquenillo o C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-alquinillo, dado el caso de mono- a pentasustituidos de forma independiente entre sí con flúor, cloro, bromo, metoxi o etoxi y C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cicloalquillo dado el caso de mono- a disustituido de forma independiente entre sí con flúor, cloro, bromo, metillo, etillo, trifluorometillo, metoxi, etoxi o ciano,

A representa un radical de la serie de hidrógeno y  $C_1$ - $C_6$ -alquilo,  $C_3$ - $C_6$ -alquenilo o  $C_3$ - $C_6$ -alquinilo, dado el caso de mono- a pentasustituidos independientemente entre sí con flúor, cloro, bromo, metoxi, etoxi o ciano, y  $C_3$ - $C_6$ -cicloalquilo dado el caso de mono- a disustituido de forma independiente entre sí con flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi o ciano,

T representa un par de electrones,

 $L^1$  y  $L^2$  representan, junto con N, un heterociclo de la serie U-1, U-2, U-3, U-4, U-5, U-6, U-7, U-25, U-26, U-27, U-28, U-29 y U-30.

 $X^b$  representa un radical de la serie de halógeno, nitro, ciano, amino,  $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_3$ - $C_6$ -cicloalquilo,  $C_1$ - $C_2$ -haloalquilo,  $C_1$ - $C_4$ -alcoxi,  $C_1$ - $C_4$ -haloalcoxi,  $C_3$ - $C_6$ -halocicloalquilo,  $C_1$ - $C_4$ -alcoxi- $C_1$ - $C_4$ -alquilo,  $C_1$ - $C_6$ -alquiltio,  $C_1$ - $C_4$ -alcoxicarbonilo,  $C_1$ - $C_4$ -alquilaminocarbonilo,  $C_1$ - $C_6$ -alquilsulfonilo,  $C_1$ - $C_6$ -alquilcarbonilamino o fenilo, donde fenilo puede estar dado el caso de mono- a trisustituido con flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, Me- $S(O)_n$ -, Et- $S(O)_n$ -, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluorometil- $S(O)_n$ -, nitro o ciano,

45 o

30

35

40

 $X^b$  representa una cadena de carbono  $C_3$ - $C_5$ , que se encuentra unida a dos posiciones de anillo adyacentes y forma un anillo alifático, en donde m es entonces igual a 2, m representa un número 0, 1 o 2, n representa un número 0, 1 o 2,

- 50 y sus sales.
  - 4. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 2 de acuerdo con la Fórmula (I-1)

en la que

V representa un radical de la serie de hidrógeno, flúor, cloro, metilo y ciano,

W representa un radical de la serie de hidrógeno, flúor, cloro, bromo y metilo,

Y representa un radical de la serie de metilo, etilo, propilo, alilo o propargilo dado el caso de mono- a trisustituidos de forma independiente entre sí con flúor, metoxi, etoxi o ciano,

A representa un radical de la serie de hidrógeno y metilo, etilo, propilo, alilo, propargilo o ciclopropilo dado el caso de mono- a trisustituidos de forma independiente entre sí con flúor, metoxi, etoxi o ciano, T representa un par de electrones,

10  $L^1$  y  $L^2$  representan, junto con N, un heterociclo de la serie de U-1, U-2, U-3, U-4, U-5, U-6, U-7, U-25, U-26, U-27, U-29 y U-30.

 $X^b$  representa un radical de la serie de flúor, cloro, bromo, ciano, amino, metilo, etilo, n- e iso-propilo, ciclopropilo, trifluorometilo, difluorometilo, trifluoroetilo, metoxi, etoxi, n- e iso-propoxi, trifluorometoxi, metoximetilo, etoximetilo, metoxietilo, etoxietilo, metil- $S(O)_{n^-}$ , etil- $S(O)_{n^-}$ , metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, metilaminocarbonilo, metilcarbonilamino o fenilo, donde fenilo puede estar dado el caso de mono- a trisustituido con flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, nitro o ciano,

0

15

20

25

30

35

40

 $X^b$  representa una cadena de carbono  $C_3$ - $C_4$ , que se encuentra unida a dos posiciones de anillo adyacentes y forma un anillo alifático, en donde m es entonces igual a 2,

m representa un número 0, 1 o 2,

n representa un número 0, 1 o 2,

y sus sales.

5. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 4, en los que

V representa hidrógeno,

W representa hidrógeno,

Y representa un radical de la serie de hidrógeno, metilo, etilo, alilo y propargilo.

A representa un radical de la serie de hidrógeno, metilo, etilo o ciclopropilo,

T representa un par de electrones,

L<sup>1</sup> y L<sup>2</sup> representan, junto con N, un heterociclo de la serie de U-1, U-2, U-3, U-6, U-25, U-26 y U-29,

X<sup>b</sup> representa un radical de la serie de flúor, cloro, bromo, ciano, amino, metilo, etilo, n- e iso-propilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, metiltio o fenilo, donde fenilo puede estar dado el caso de mono- a trisustituido con flúor, cloro, metilo o metoxi,

0

 $X^b$  representa una cadena de carbono  $C_3$ - $C_4$ , que se encuentra unida a dos posiciones de anillo adyacentes y forma un anillo alifático, en donde m es entonces igual a 2, m representa un número 0, 1 o 2,

y sus sales.

6. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 4, en los que

V representa hidrógeno,

W representa hidrógeno,

Y representa metilo,

A representa metilo, etilo o ciclopropilo,

T representa un par de electrones,

L<sup>1</sup> y L<sup>2</sup> representan, junto con N, un heterociclo de la serie de U-1, U-2, U-3, U-6, U-25, U-26 y U-29,

X<sup>b</sup> representa un radical de la serie de cloro, ciano, amino, metilo, isopropilo, trifluorometilo, metiltio o fenilo,

5 o

 $X^b$  representa -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-, que está unido a dos posiciones de anillo adyacentes y forma un anillo alifático, en donde m es entonces igual a 2, m representa un número 0, 1 o 2,

y sus sales.

- 10 7. Agente, con un contenido de al menos un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 6 y diluyentes habituales y/o tensioactivos en particular para combatir plagas animales.
  - 8. Procedimiento para combatir plagas animales, en el que se permite que al menos un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 6 o un agente según la reivindicación 7 actúen sobre la plaga animal y/o en su hábitat, en el que se excluyen los tratamientos quirúrgico, terapéutico y de diagnóstico del cuerpo humano o animal.
- 15 9. Uso de al menos un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 6 o de un agente según la reivindicación 7 para combatir plagas animales, en el que se excluyen los tratamientos quirúrgico, terapéutico y de diagnóstico del cuerpo humano o animal.
  - 10. Uso de al menos un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 6 para proteger el material de propagación de plantas.
- 20 11. Formulación agroquímica que contiene al menos un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 6 en contenidos biológicamente eficaces de entre el 0,00000001 y el 98 % en peso con respecto al peso de la formulación agroquímica, y también diluyentes y/o tensioactivos.
  - 12. Formulación agroquímica según la reivindicación 11, que contiene adicionalmente otro principio activo agroquímico.
- 25 13. Productos intermedios de la fórmula (VI)

en la que los radicales tienen los significados según una de las reivindicaciones 1 a 6 y en especial con preferencia el significado según la reivindicación 6.