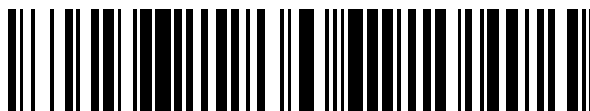


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 778 628**

51 Int. Cl.:

C07D 401/14 (2006.01)

C07D 401/04 (2006.01)

C07D 407/14 (2006.01)

A01N 43/56 (2006.01)

A01N 43/60 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **03.03.2016 PCT/US2016/020612**

87 Fecha y número de publicación internacional: **15.09.2016 WO16144678**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **03.03.2016 E 16718938 (0)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **18.12.2019 EP 3268359**

54 Título: **Pesticidas de azol bicíclico sustituido con heterociclo**

30 Prioridad:
12.03.2015 US 201562131949 P

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
11.08.2020

73 Titular/es:
**FMC CORPORATION (100.0%)
FMC Tower at Cira Center South, 2929 Walnut
Street
Philadelphia, PA 19104, US**

72 Inventor/es:
**ZHANG, WENMING;
ROSSI, MICHAEL ALAN y
SANA, KASINATH**

74 Agente/Representante:
DEL VALLE VALIENTE, Sonia

ES 2 778 628 T3

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

DESCRIPCIÓN

Pesticidas de azol bicíclico sustituido con heterociclo

5 **Campo de la invención**

Esta invención se refiere a determinados azoles bicíclicos sustituidos, sus *N*-óxidos, sales y composiciones adecuadas para usos agrónomos y no agrónomos, y métodos para su uso para controlar plagas de invertebrados, tales como artrópodos, tanto en entornos agrónomos como no agrónomos, con la condición de que estos métodos no sean métodos de tratamiento del cuerpo humano o animal mediante terapia.

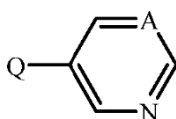
Antecedentes de la invención

El control de las plagas de invertebrados es extremadamente importante para lograr una alta eficiencia de cultivo. Los daños por plagas de invertebrados para cosechas agronómicas en cultivo y almacenadas pueden provocar una reducción significativa en la productividad y, por tanto, resultar en un aumento de los costes para el consumidor. También es importante el control de plagas de invertebrados en la forestación, cultivos de invernadero, plantas ornamentales, cultivos de viveros, productos alimenticios y de fibra almacenados, ganado, viviendas, césped, productos de madera y, la salud pública y animal. Existen muchos productos comercialmente disponibles para estos propósitos, pero persiste la necesidad de nuevos compuestos que sean más eficaces, menos costosos, menos tóxicos, más seguros para el medio ambiente o que tengan distintos sitios de acción.

En WO 2013/106254 se describen determinados compuestos de pirazol bicíclicos condensados como pesticidas.

25 **Resumen de la invención**

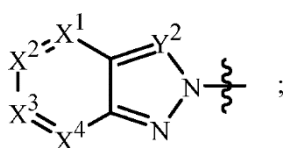
La invención se dirige a compuestos de Fórmula 1 (que incluyen todos los isómeros geométricos y estereoisómeros), *N*-óxidos y sales de los mismos, y composiciones que los contienen y su uso no terapéutico para controlar plagas de invertebrados:



1

en donde

Q es



Q-2

A es CH;

X¹ es CR², y X², X³ y X⁴ son cada uno CH; o X² es CR², y X¹, X³ y X⁴ son cada uno CH;

R² es C(=Z)R¹¹;

Z es O o S;

Y² es CR^{5a};

R^{5a} es H;

cada R^X es independientemente halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, C(=NR¹⁰)R¹¹, C(O)OR²¹, C(O)NR¹⁵R¹⁶, OC(O)R²², NR²⁵R²⁶, NR²⁴C(O)R²², C(O)R²², S(O)_nR²³, Si(R²⁸)₃, OSi(R²⁸)₃ o Q^b;

cada R¹⁰ es independientemente OR¹², S(O)_nR¹³ o NHR¹⁴;

cada R¹¹ es independientemente H; o alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₆ o alquino C₂-C₆, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un R^X; o alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, C(O)OR²¹, C(O)NR¹⁵R¹⁶, o C(O)R²²;

cada R¹² es independientemente alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, C(O)R²², S(O)_nR¹³ o Q^b;

cada R¹³ es independientemente alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄;

R¹⁴ es alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, C(O)R²² o C(O)OR²¹; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

- cada R¹⁵ es independientemente H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₄, C(O)R²⁷ o S(O)₂R²⁷; o fenilo, o un anillo aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;
- 5 cada R¹⁶ es independientemente H, alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₄; o R¹⁵ y R¹⁶ se toman junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos para formar un anillo de 3 a 7 miembros que contiene miembros anulares seleccionados de átomos de carbono, y hasta 2 heteroátomos independientemente seleccionados de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, y hasta 2 átomos de nitrógeno, en donde hasta 2 miembros anulares de átomo de carbono son independientemente seleccionados de C(=O) y
- 10 C(=S) y el miembro anular de átomo de azufre se selecciona de S, S(O) o S(O)₂, estando dicho anillo no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;
- cada R²¹ es independientemente alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ o halocicloalquilo C₃-C₆; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en
- 15 halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;
- cada R²² es independientemente alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ o halocicloalquilo C₃-C₆; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;
- 20 cada R²³ es independientemente alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilalquilo C₃-C₆ o halocicloalquilalquilo C₃-C₆; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;
- cada R²⁴ es independientemente alquilo C₁-C₄;
- 25 cada R²⁵ es independientemente H, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;
- cada R²⁶ es independientemente alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo
- 30 C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄; o R²⁵ y R²⁶ se toman independientemente junto con con el átomo de nitrógeno al que están unidos para formar un anillo de 3 a 7 miembros que contiene miembros anulares seleccionados de átomos de carbono, y hasta 2 heteroátomos independientemente seleccionados de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, y hasta 2 átomos de nitrógeno, en donde hasta 2 miembros anulares de átomo de carbono son independientemente seleccionados de C(=O) y C(=S) y el miembro anular de átomo de azufre se selecciona de S, S(O) o S(O)₂, siendo dicho anillo
- 35 no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;
- cada R²⁷ es independientemente alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆ o NR²⁹R³⁰; o fenilo, o un anillo aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄,
- 40 cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;
- cada R²⁸ es independientemente alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o fenilo;
- cada R²⁹ es independientemente H o Q^b; o alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₆ o alquino C₂-C₆, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;
- 45 cada R³⁰ es independientemente H o Q^b; o alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₆ o alquino C₂-C₆, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄; o R²⁹ y R³⁰ se toman junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos para formar un anillo de 3 a 10 miembros que contiene miembros anulares de átomo de carbono y hasta 2 heteroátomos independientemente
- 50 seleccionados de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, y hasta 2 átomos de nitrógeno, en donde hasta 2 miembros anulares de átomo de carbono son independientemente seleccionados de C(=O) y C(=S) y el miembro anular de átomo de azufre se selecciona de S, S(O) o S(O)₂, estando dicho anillo no sustituido o sustituido con hasta 4 sustituyentes independientemente seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;
- 55 cada Q^p es independientemente fenilo, un anillo aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros o un anillo no aromático heterocíclico de 3 a 6 miembros, conteniendo cada anillo miembros anulares seleccionados de átomos de carbono, y hasta 2 heteroátomos independientemente seleccionados de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, y hasta 2 átomos de nitrógeno, en donde hasta 2 miembros anulares de átomo de carbono son independientemente seleccionados de C(=O) y C(=S) y el miembro anular de átomo de azufre se selecciona de S, S(O) o S(O)₂, cada anillo
- 60 no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄; y cada n es independientemente 0, 1 o 2;
- con la condición de que el compuesto no sea éster metílico del ácido 2-(3-piridinil)-2H-indazol-5-carboxílico.
- 65 Esta invención también proporciona una composición que comprende un compuesto de Fórmula 1, un N-óxido o una sal del mismo, y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y

diluyentes líquidos. En una realización, esta invención proporciona, además, una composición para controlar una plaga de invertebrados que comprende un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo, y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en surfactantes, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, comprendiendo dicha composición, además, opcionalmente, al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional.

5 Esta invención proporciona un método no terapéutico para controlar una plaga de invertebrados, que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su entorno con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo (p. ej., como una composición que se describe en la presente descripción). Esta invención se refiere, además, a dicho método, en donde la plaga de invertebrados o su entorno se pone en
10 contacto con una composición que comprende una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo, y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en surfactantes, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, comprendiendo dicha composición, además, opcionalmente, una cantidad biológicamente efectiva de al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional.

15 Esta invención proporciona, además, un método para proteger una semilla de una plaga de invertebrados, que comprende poner en contacto la semilla con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo (p. ej., como una composición descrita en la presente descripción). Esta invención se refiere, además, a la semilla tratada. En la presente descripción se describe también un método para proteger un animal frente a una plaga de parásitos invertebrados, que comprende administrar al animal una cantidad eficaz
20 desde el punto de vista del pesticida de un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo (p. ej., como una composición descrita en la presente descripción). En la presente descripción se describe también el uso de un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo, (p. ej., como una composición descrita en la presente descripción) en la protección de un animal de una plaga de invertebrados.

25 El tratamiento proporciona también un método para aumentar el vigor de una planta cultivada que comprende poner en contacto la planta cultivada, la semilla de la que se cultiva la planta cultivada o el lugar (p. ej., un medio de cultivo) de la planta cultivada con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1 (p. ej., como una composición descrita en la presente descripción).

30 **Detalles de la invención**

Como se usa en la presente descripción, los términos “comprende”, “que comprende”, “incluye”, “que incluye”, “tiene”, “que tiene”, “contiene”, “que contiene”, “caracterizado por” o cualquier otra variación de los mismos, cubren una inclusión no exclusiva, sujeta a las limitaciones explícitamente indicadas. Por ejemplo, una composición, mezcla, proceso o método
35 que comprenda una lista de elementos, no se limita necesariamente a solo esos elementos, sino que puede incluir otros elementos no enumerados expresamente o inherentes a dicha composición, mezcla, proceso o método.

La expresión de transición “que consiste en” excluye cualquier elemento, etapa o ingrediente no especificados. Si está en la reivindicación, eso haría que la reivindicación se cierre a la inclusión de materiales distintos a los mencionados, excepto para las impurezas normalmente asociadas con los mismos. Cuando la expresión “que consiste en” aparezca
40 en una cláusula del cuerpo de una reivindicación, en lugar de seguir inmediatamente al preámbulo, limita solamente el elemento que se exponga en esa cláusula; otros elementos no se excluyen de la reivindicación en su totalidad.

La expresión de transición “que consiste esencialmente en” se usa para definir una composición o método que incluya materiales, etapas, características, componentes o elementos, además de los descritos literalmente, considerando que estos materiales adicionales, etapas, características, componentes o elementos no afectan materialmente a la(s) característica(s) básica(s) y novedosa(s) de la invención reivindicada. La expresión “que
45 consiste esencialmente en” ocupa un término medio entre “que comprende” y “que consiste en”.

50 Cuando los solicitantes hayan definido una invención, o una parte de la misma, con un término indefinido tal como “que comprende”, se debe entender que (a menos que se indique de otra forma) la descripción también debe interpretarse como descriptiva de esta invención utilizando los términos “que consiste esencialmente en” o “que consiste en.”

Además, a menos que se especifique expresamente lo contrario, “o” se refiere a un “o” inclusivo, y no a un “o” exclusivo. Por ejemplo, una condición A o B se satisface mediante cualquiera de lo siguiente: A es verdadero (o presente) y B es falso (o no presente), A es falso (o no presente) y B es verdadero (o presente), y tanto A como B son verdaderos (o presentes).
55

También, los artículos indeterminados “un” y “una” precediendo a un elemento o componente de la invención, no se deben considerar restrictivos con respecto al número de ejemplos (es decir, ocasiones en que aparecen) del elemento o componente. Por lo tanto, “un” o “una” deben interpretarse como incluyentes de uno o al menos uno, y la forma en singular de la palabra del elemento o componente también incluye el plural, a menos que el número se refiera obviamente al singular.
60

65 Como se menciona en esta descripción, el término “plaga de invertebrados” incluye artrópodos, gasterópodos, nematodos y helmintos de importancia económica como plagas. El término “artrópodo” incluye insectos, ácaros,

arañas, escorpiones, ciempiés, milpiés, chinches y sinfilos. El término “gasterópodo” incluye caracoles, babosas y otros estilomatóforos. El término “nematodo” incluye los filos de nematodos, tales como los nematodos fitófagos y los animales parasitarios nematodos helmintos. El término “helminto” incluye todos los gusanos parásitos, tales como lombrices intestinales (filo nematoda), gusanos del corazón (filo nematoda, clase secernentea), trematodos (filo platelmintos, clase tematoda), acantocéfalos (filo acantocéfalo) y tenias (filo platelmintos, clase cestoda).

En el contexto de esta descripción “control de plagas de invertebrados” quiere decir inhibición del desarrollo de invertebrados (incluidas mortalidad, reducción de la alimentación y/o alteración del apareamiento), y las expresiones relacionadas se definen de manera análoga.

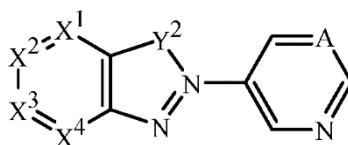
El término “agrónomo” se refiere a la producción de cultivos de campo, tales como para alimentación y fibra, e incluye el cultivo de maíz o trigo, Soja y otras legumbres, arroz, cereales (p. ej., trigo, avena, cebada, centeno y arroz), verduras de hojas (p. ej., lechuga, repollo y otros cultivos de col), hortalizas (p. ej., tomates, pimiento, berenjena, crucíferas y cucurbitáceas), patatas, batatas, uvas, algodón, frutas de árbol (p. ej., de pepitas, de hueso y cítricos), frutos pequeños (p. ej., bayas y cerezas) y otros cultivos especializados (p. ej., colza, girasol y aceitunas).

El término “no agrónomo” se refiere a cultivos distintos a los de campo, tales como cultivos hortícolas (p. ej., invernadero, semillero o plantas ornamentales que no crezcan en un campo), residenciales, agrícolas, estructuras comerciales e industriales, césped (p. ej., granja de césped, pastoreo, campo de golf, jardín, campos deportivos, etc.), productos de madera, productos almacenados, agro-silvicultura y cuidado de la vegetación, aplicaciones de salud pública (es decir, humana) y de salud animal (p. ej., animales domésticos, tales como mascotas, ganado y aves de corral, animales no domesticados, como la fauna).

El término “vigor de cultivo” se refiere a la velocidad de crecimiento o de acumulación de biomasa de una planta de cultivo. Un “aumento de vigor” se refiere a un aumento en el crecimiento o en la acumulación de biomasa en una planta de cultivo en relación a una planta de cultivo de control no tratada. El término “rendimiento del cultivo” se refiere a la rentabilidad del material cultivo, tanto en términos de cantidad como de calidad, obtenido tras recolectar una planta de cultivo. Un “aumento en el rendimiento del cultivo” se refiere a un aumento en el rendimiento del cultivo en relación a una planta de cultivo de control no tratada.

El término “cantidad biológicamente eficaz” se refiere a la cantidad de un compuesto biológicamente activo (p. ej., un compuesto de Fórmula 1) suficiente para producir el efecto biológico deseado cuando se aplica a (es decir, en contacto con) una plaga de invertebrados para controlar estos o su entorno, o a una planta, la semilla de la que crece la planta o la ubicación de la planta (p. ej., el medio de cultivo) para proteger la planta contra el daño de la plaga de invertebrados o para otro efecto deseado (p. ej., aumentar el vigor de la planta).

Una línea ondulada en un fragmento de estructura denota el punto de unión del fragmento al resto de la molécula. Por ejemplo, cuando la variable Q en la Fórmula 1 se define como Q-2 y la línea ondulada bisecta el enlace en Q-2, significa que Q-2 está unido al resto de la estructura de Fórmula 1 en dicha posición, como se muestra a continuación.



En lo expuesto anteriormente, el término “alquilo” ya sea usado solo o en palabras compuestas, tales como “haloalquilo” incluye alquilo de cadena lineal o ramificada, tales como metilo, etilo, *n*-propilo, *i*-propilo o los diferentes isómeros de butilo, pentilo o hexilo. “Alquenilo” incluye alquenos de cadena lineal o ramificada, tales como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo y los distintos isómeros de butenilo, pentenilo y hexenilo. “Alquenilo” también incluye polienos, tales como 1,2-propadienilo y 2,4-hexadienilo. “Alquinilo” incluye alquinos de cadena lineal o ramificada, tales como etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo y los distintos isómeros de butinilo, pentinilo y hexinilo. “Alquinilo” también puede incluir restos comprendidos de enlaces triples múltiples, tal como 2,5-hexadinilo.

“Alcoxi” incluye, por ejemplo, metoxi, etoxi, *n*-propiloxi, isopropiloxi y los distintos isómeros de butoxi, pentoxi y hexiloxi.

“Cicloalquilo” incluye, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo.

El término “halógeno”, ya sea solo o en palabras compuestas, tales como “haloalquilo”, o cuando se utiliza en descripciones tales como “alquilo sustituido con halógeno”, incluye flúor, cloro, bromo o yodo. Además, cuando se utiliza en palabras compuestas tales como “haloalquilo”, o cuando se utiliza en descripciones tales como “alquilo sustituido con halógeno”, dicho alquilo puede estar parcial, o totalmente, sustituido con átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes. Ejemplos de “haloalquilo” o de “alquilo sustituido con halógeno” incluyen F₃C-, ClCH₂-, CF₃CH₂- y CF₃CCl₂-. Los términos “halocicloalquilo”, “haloalcoxi”, y similares, se definen de manera análoga al término “haloalquilo”. Ejemplos de “haloalcoxi” incluyen CF₃O-, CCl₃CH₂O-, HCF₂CH₂CH₂O- y CF₃CH₂O-.

Las abreviaturas químicas S(O) y S(=O), como se usan en la presente memoria, representan un resto sulfínico. Las abreviaturas químicas SO₂, S(O)₂ y S(=O)₂, como se usan en la presente descripción, representan un resto sulfonilo. Las abreviaturas químicas C(O) y C(=O), como se usan en la presente memoria, representan un resto carbonilo. Las abreviaturas químicas CO₂, C(O)O y C(=O)O, como se usan en la presente memoria, representan un resto oxicarbonilo. “CHO” significa formilo.

El número total de átomos de carbono en un grupo sustituyente se indica con el prefijo “C_i-C_j”, donde i y j son números de 1 a 6.

10 Cuando un compuesto está sustituido con un sustituyente que tiene un subíndice que indica que el número de dichos sustituyentes puede superar 1, dichos sustituyentes (cuando superan 1) se seleccionan independientemente del grupo de sustituyentes definidos, p. ej., (R¹)_m, m es 0, 1, 2 o 3. Además, cuando el subíndice indica un intervalo, p. ej. (R)_{i-j}, entonces el número de sustituyentes puede seleccionarse de los números enteros entre i y j inclusive. Cuando un grupo contiene un sustituyente que puede ser hidrógeno, entonces, cuando este sustituyente se toma como hidrógeno, se reconoce que equivale a que dicho grupo que esté no sustituido. Cuando se muestra que un grupo variable está opcionalmente unido a una posición, por ejemplo (R¹)_m, en donde m puede ser 0, entonces el hidrógeno puede estar en la posición incluso si no se indica en la definición del grupo variable. Cuando se dice que una o más posiciones en un grupo están “sin sustituir” o “no sustituidas”, entonces los átomos de hidrógeno se unen ocupando cualquier valencia libre.

20 Salvo que se indique lo contrario, un “anillo” o “sistema de anillos”, como un componente de la Fórmula 1 es carbocíclico o heterocíclico. El término “sistema de anillos” significa dos o más anillos condensados. Los términos “sistema de anillos bicíclicos” y “sistema de anillos bicíclicos condensados” significan un sistema de anillos que consiste en dos anillos condensados, que pueden ser “orto-condensados”, “bicíclicos unidos mediante puente” o “espirobicíclicos”. Un “sistema de anillos bicíclicos orto-condensados” significa un sistema de anillos en donde los dos anillos constituyentes tienen dos átomos adyacentes en común. Un “sistema de anillos bicíclicos unidos con puente” está formado por la unión de un segmento de uno o más átomos miembros de anillo no adyacentes de un anillo. Un “sistema de anillos espirobicíclicos” está formado por la unión de un segmento de dos o más átomos al mismo miembro anular de un anillo. El término “sistema de anillos heterobicíclicos condensados” significa un sistema de anillos bicíclicos condensados en el cual al menos un átomo de anillo no es carbono. El término “miembro anular” se refiere a un átomo u otro resto (p. ej., C(=O), C(=S), S(O) o S(O)₂) que forma la cadena principal de un anillo o sistema de anillos.

Los términos “anillo carbocíclico”, “carbociclo” o “sistema de anillos carbocíclico” significan un anillo o un sistema de anillos en donde los átomos que forman la cadena principal de anillo se seleccionan solamente de carbono. Los términos “anillo heterocíclico”, “heterociclo” o “sistema de anillos heterocíclico” significan un anillo o sistema de anillos en el cual al menos un átomo que forma la cadena principal anular no es carbono, p. ej., nitrógeno, oxígeno o azufre. Típicamente, un anillo heterocíclico contiene no más de 4 nitrógenos, no más de 2 oxígenos y no más de 2 azufres. Salvo que se indique lo contrario, un anillo carbocíclico o un anillo heterocíclico puede ser un anillo saturado o insaturado. “Saturado” se refiere a un anillo que tenga una estructura que consiste en átomos enlazados entre sí mediante enlaces simples; salvo que se especifique de otra forma, el resto de valencias de átomo están ocupadas por átomos de hidrógeno. Salvo que se mencione de otra forma, un “anillo insaturado” puede estar parcialmente insaturado o insaturado totalmente. La expresión “anillo totalmente insaturado” significa un anillo de átomos en el que los enlaces entre átomos en el anillo son enlaces simples o dobles según la teoría del enlace de valencia y, además, los enlaces entre átomos en el anillo incluyen tantos enlaces dobles como sea posible, sin que los enlaces dobles sean acumulativos (es decir, no C≡C≡C o C≡C≡N). El término “anillo parcialmente insaturado” significa un anillo que comprenda al menos un miembro anular unido a un miembro anular adyacente a través de un enlace doble y que, conceptualmente, de manera potencial, aloje un número de enlaces dobles no acumulados entre miembros anulares adyacentes (es decir, en su forma de contrapartida totalmente insaturada) mayor que el número de enlaces dobles presentes (es decir, en su forma parcialmente insaturada).

Salvo que se indique lo contrario, los anillos heterocíclicos y los sistemas anulares pueden estar unidos a través de cualquier carbono o nitrógeno disponibles mediante la sustitución de un hidrógeno sobre dicho carbono o nitrógeno.

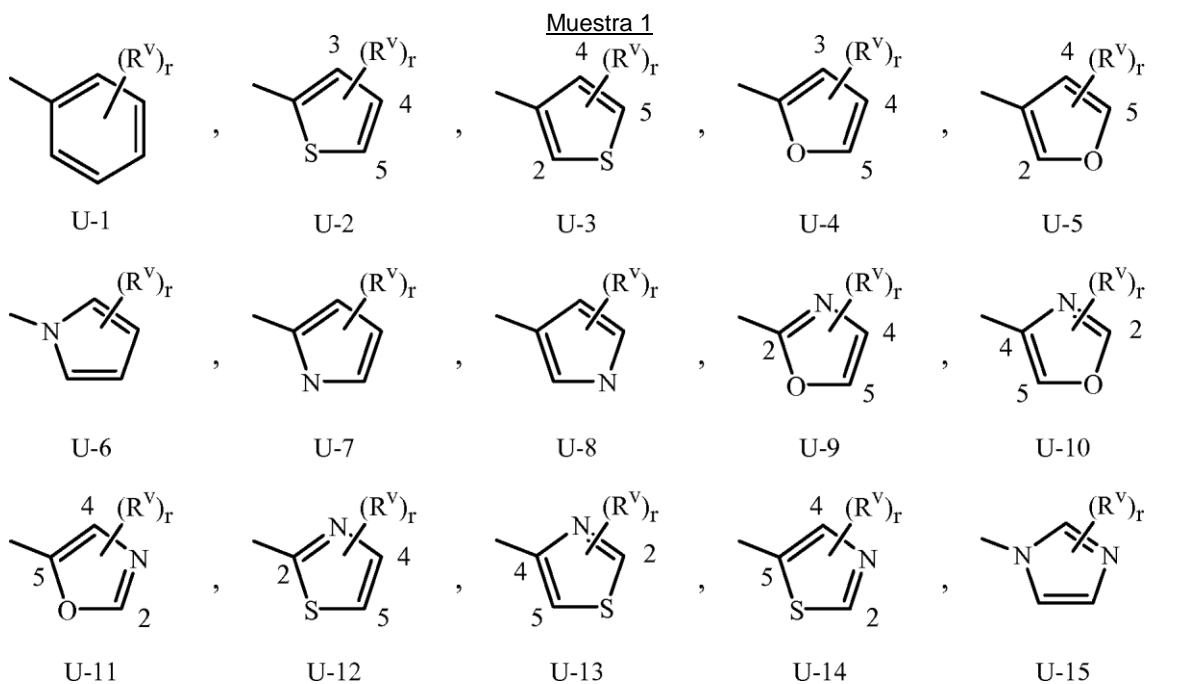
“Aromático” indica que cada uno de los átomos anulares están esencialmente en el mismo plano y tiene una *p*-orbital perpendicular al plano anular, y en el cual (4*n* + 2) π electrones, donde *n* es un número entero positivo, están asociados con el anillo para cumplir con la regla de Hückel. El término “sistema de anillos aromático” significa un sistema de anillos carbocíclico o heterocíclico en el que al menos un anillo del sistema de anillos es aromático. Cuando un anillo carbocíclico totalmente insaturado satisface la regla de Hückel, entonces dicho anillo también se denomina “anillo aromático” o “anillo carbocíclico aromático”. El término “sistema de anillos carbocíclico aromático” significa un sistema de anillos carbocíclico en el que al menos un anillo del sistema de anillos es aromático. Cuando un anillo heterocíclico totalmente insaturado satisface la regla de Hückel, entonces dicho anillo también se denomina “anillo heteroaromático”, “anillo heterocíclico aromático” o “anillo aromático heterocíclico”. El término “sistema de anillos heterocíclico aromático” significa un sistema de anillos heterocíclico en el que al menos un anillo del sistema de anillos es aromático. El término “sistema de anillos no aromático” significa un sistema de anillos carbocíclico o heterocíclico que puede ser totalmente saturado, así como parcialmente o totalmente insaturado, con la condición de que ninguno de los anillos del sistema de anillos sea aromático. El término “sistema de anillos carbocíclico no aromático” significa un sistema de anillos carbocíclico en

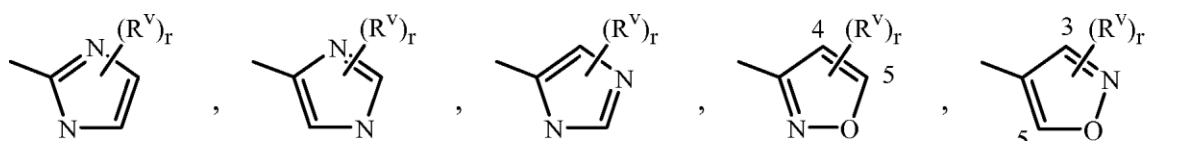
el que ningún anillo del sistema de anillos es aromático. El término “sistema de anillos heterocíclico no aromático” significa un sistema de anillos heterocíclico en el que ningún anillo del sistema de anillos es aromático.

El término “opcionalmente sustituido”, en relación con los anillos heterocíclicos, se refiere a grupos que estén sin sustituir o que tengan al menos un sustituyente distinto de hidrógeno que no extinga la actividad biológica que posee el análogo no sustituido. Como se utiliza en la presente memoria, las siguientes definiciones se deben aplicar, salvo que se indique lo contrario. El término “opcionalmente sustituido” se utiliza de forma intercambiable con la expresión “sustituido o no sustituido” o con el término “(no) sustituido.” Salvo que se indique lo contrario, un grupo opcionalmente sustituido puede tener un sustituyente en cada posición sustituible del grupo, y cada sustitución es independiente de la otra.

Cuando un sustituyente es un anillo heterocíclico que contiene nitrógeno de 5 o 6 miembros, puede estar unido al resto de la Fórmula 1 a través de cualquier átomo de anillo de carbono o de nitrógeno disponibles, salvo que se describa de otra forma. Un ejemplo de fenilo opcionalmente sustituido con uno a cinco sustituyentes, es el anillo que se ilustra como U-1 en la Muestra 1, en donde R^v es un sustituyente para el fenilo como se define en el resumen de la invención y r es un número entero de 0 a 5.

Como se mencionó anteriormente, Q^b puede ser (entre otros) un anillo aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de un grupo de sustituyentes, como se define en el resumen de la invención. Ejemplos de un anillo aromático heterocíclico insaturado de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes incluyen los anillos de U-2 a U-61 que se ilustran en la Muestra 1 en donde R^v es cualquier sustituyente, como se define en el Resumen de la invención, para Q, y r es un número entero de 0 a 4, limitado por el número de posiciones disponibles en cada grupo U. Como U-29, U-30, U-36, U-37, U-38, U-39, U-40, U-41, U-42 y U-43 tienen solamente una posición disponible, para estos grupos U r se limita a los números enteros 0 o 1, y que r sea 0 significa que el grupo U está no sustituido y un hidrógeno está presente en la posición indicada por (R^v)_r.





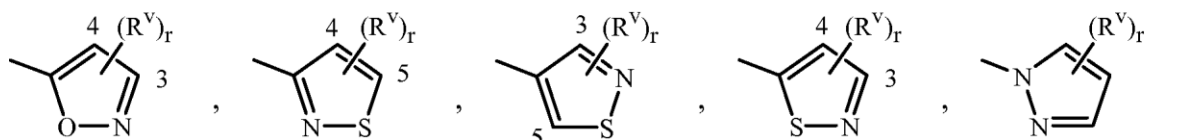
U-16

U-17

U-18

U-19

U-20



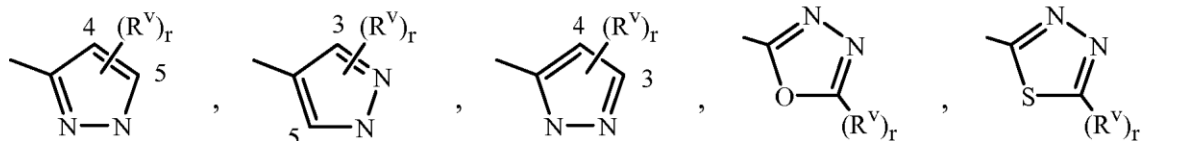
U-21

U-22

U-23

U-24

U-25



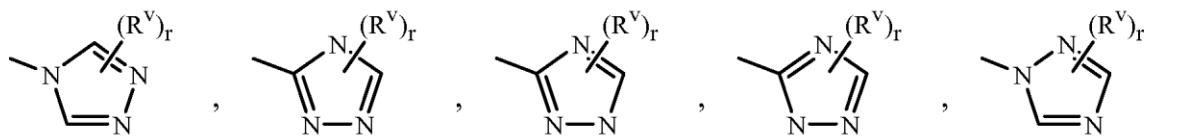
U-26

U-27

U-28

U-29

U-30



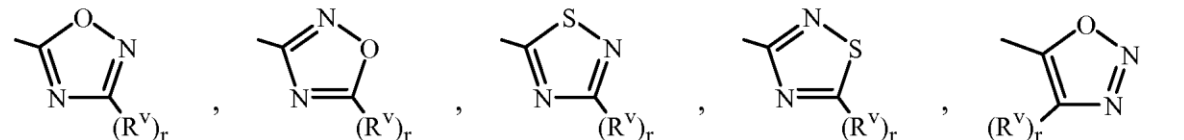
U-31

U-32

U-33

U-34

U-35



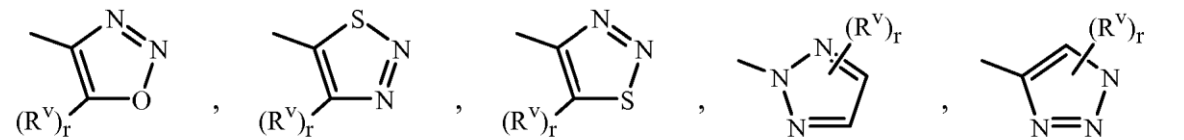
U-36

U-37

U-38

U-39

U-40



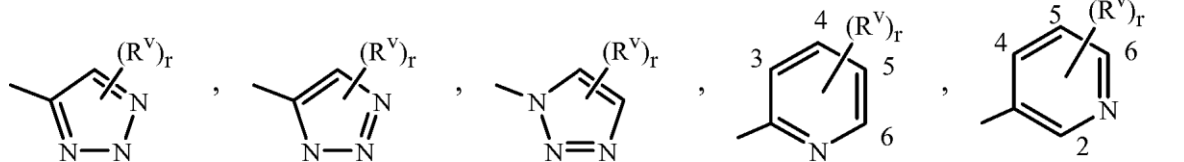
U-41

U-42

U-43

U-44

U-45



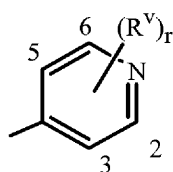
U-46

U-47

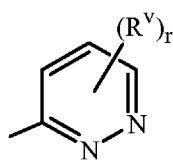
U-48

U-49

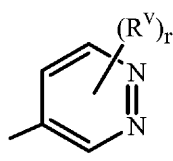
U-50



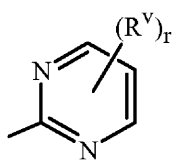
U-51



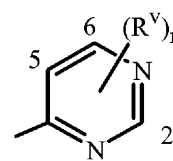
U-52



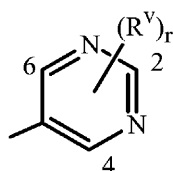
U-53



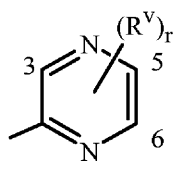
U-54



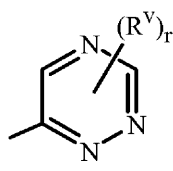
U-55



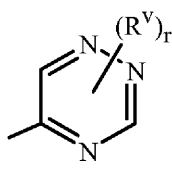
U-56



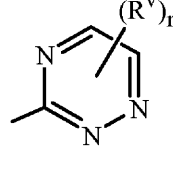
U-57



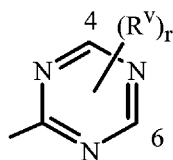
U-58



U-59



U-60



U-61

En la técnica se conocen una amplia variedad de métodos sintéticos para permitir la preparación de anillos y sistemas anulares heterocíclicos aromáticos y no aromáticos; para amplios análisis, véase el conjunto de ocho volúmenes de *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, A. R. Katritzky y C. W. Rees, jefes de redacción, Pergamon Press, Oxford, 1984 y el conjunto de doce volúmenes de *Comprehensive Heterocyclic Chemistry II*, A. R. Katritzky, C. W. Rees y E. F. Scriven, jefes de redacción, Pergamon Press, Oxford, 1996.

Los compuestos de esta invención pueden existir como uno o más estereoisómeros. Los estereoisómeros son isómeros de constitución idéntica pero que difieren en la disposición de sus átomos en el espacio, e incluyen enantiómeros, diastereómeros, isómeros cis-trans (también conocidos como isómeros geométricos) y atropisómeros. Los atropisómeros resultan de la rotación restringida alrededor de enlaces simples, en donde la barrera de rotación es lo suficientemente alta como para permitir el aislamiento de las especies isoméricas. Un experto en la técnica apreciará que un estereoisómero puede ser más activo y/o puede mostrar efectos beneficiosos cuando se enriquece con respecto al otro u otros estereoisómero(s) o cuando se separa del otro u otros estereoisómero(s). Además, el experto en la técnica sabe cómo separar, enriquecer y/o preparar selectivamente tales estereoisómeros. Para un análisis detallado de todos los aspectos del estereoisomerismo, ver Ernest L. Eliel y Samuel H. Wilen, *Stereochemistry of Organic Compounds*, John Wiley & Sons, 1994.

La presente invención comprende todos los estereoisómeros, isómeros conformacionales y mezclas de los mismos, en todas las proporciones, así como formas isotópicas, tales como los compuestos deuterados.

Un experto en la técnica apreciará que no todos los heterociclos que contengan nitrógeno pueden formar *N*-óxidos, ya que el nitrógeno precisa un par aislado disponible para la oxidación al óxido; un experto en la técnica reconocerá aquellos heterociclos que contengan nitrógeno que pueden formar *N*-óxidos. Un experto en la técnica también reconocerá que las aminas terciarias pueden formar *N*-óxidos. Los métodos sintéticos para la preparación de *N*-óxidos de heterociclos y aminas terciarias son muy conocidos para un experto en la técnica, incluida la oxidación de heterociclos y aminas terciarias con peroxiácidos, tales como ácido peracético y ácido 3-cloroperbenzoico (MCPBA), peróxido de hidrógeno, alquilhidroperóxidos, tales como *t*-butilhidroperóxido, perborato de sodio y dioxiranos, tales como dimetildioxirano. Estos métodos para la preparación de *N*-óxidos han sido ampliamente descritos y analizados en la literatura, ver, por ejemplo: T. L. Gilchrist en *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, págs. 748-750, S. V. Ley, ed., Pergamon Press; M. Tisler y B. Stanovnik en *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, vol. 3, págs. 18-20, A. J. Boulton y A. McKillop, editores, Pergamon Press; M. R. Grimmett y B. R. T. Keene en *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 43, págs. 149-161, A. R. Katritzky, ed., Academic Press; M. Tisler y B. Stanovnik en *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 9, págs. 285-291, A. R. Katritzky y A. J. Boulton, editores, Academic Press; y G. W. H. Cheeseman y E. S. G. Werstiuk en *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 22, págs. 390-392, A. R. Katritzky y A. J. Boulton, editores, Academic Press.

Un experto en la técnica reconoce que debido a que en el entorno y bajo condiciones fisiológicas, las sales de los compuestos químicos están en equilibrio con sus formas no salinas correspondientes, las sales comparten la utilidad biológica de las formas no salinas. Por lo tanto, una amplia variedad de sales de los compuestos de Fórmula 1 son útiles para el control de plagas de invertebrados. Las sales de los compuestos de Fórmula 1 incluyen sales de adición

de ácido con ácidos inorgánicos u orgánicos, tales como los ácidos bromhídrico, clorhídrico, nítrico, fosfórico, sulfúrico, acético, butírico, fumárico, láctico, maleico, malónico, oxálico, propiónico, salicílico, tartárico, 4-toluenosulfónico o valérico. Cuando un compuesto de Fórmula 1 contenga un resto ácido, tal como un ácido carboxílico o fenol, las sales también incluyen aquellas formadas con bases orgánicas o inorgánicas, tales como piridina, trietilamina o amoníaco, o amidas, hidruros, hidróxidos o carbonatos de sodio, potasio, litio, calcio, magnesio o bario. En consecuencia, la presente invención comprende compuestos seleccionados de Fórmula 1, *N*-óxidos y sales adecuadas de los mismos.

Existen, típicamente, compuestos seleccionados de Fórmula 1, estereoisómeros, tautómeros, *N*-óxidos, y sales de los mismos, en más de una forma, y la Fórmula 1 por tanto incluye todas las formas cristalinas y no cristalinas de los compuestos que la Fórmula 1 representa. Las formas no cristalinas incluyen realizaciones que son sólidos, tales como ceras y gomas, así como realizaciones que son líquidos, tales como soluciones y fusiones. Las formas cristalinas incluyen realizaciones que representan, esencialmente, un solo tipo de cristal y realizaciones que representan una mezcla de polimorfos (es decir, diferentes tipos cristalinos). El término "polimorfo" se refiere a una forma cristalina particular de un compuesto químico que puede cristalizar en diferentes formas cristalinas, teniendo estas formas diferentes disposiciones y/o conformaciones de las moléculas en la red cristalina. Aunque los polimorfos pueden tener la misma composición química, también pueden diferir en la composición debido a la presencia o ausencia de agua cocrystalizada u otras moléculas, que pueden estar unidas de manera débil o de manera fuerte en la red. Los polimorfos pueden diferir en dichas propiedades químicas, físicas y biológicas como en la forma de cristal, densidad, dureza, color, estabilidad química, punto de fusión, higroscopicidad, suspensibilidad, velocidad de disolución y disponibilidad biológica. Un experto en la técnica apreciará que un polimorfo de un compuesto representado por la Fórmula 1 puede mostrar efectos beneficiosos (p. ej., adecuación para la preparación de formulaciones útiles, rendimiento biológico mejorado) con relación a otro polimorfo o una mezcla de polimorfos del mismo compuesto representado por la Fórmula 1. La preparación y aislamiento de un polimorfo particular de un compuesto representado por la Fórmula 1 puede realizarse mediante métodos conocidos por los expertos en la técnica, incluida, por ejemplo, la cristalización utilizando disolventes y temperaturas seleccionados. Los compuestos de esta invención pueden existir como uno o más polimorfos cristalinos. Esta invención comprende tanto polimorfos individuales como mezclas de polimorfos, incluidas mezclas enriquecidas en un polimorfo con relación a otros. Para un análisis detallado de polimorfismos, ver R. Hilfiker, editor, *Polymorphism In the Pharmaceutical Industry*, Wiley-VCH, Weinheim, 2006.

Las realizaciones de la presente invención, como se describe en el Resumen de la invención, incluyen las que se describen a continuación. En las siguientes realizaciones, la referencia a "un compuesto de Fórmula 1" incluye las definiciones de sustituyentes especificadas en el Resumen de la invención, salvo que se defina posteriormente en la Realizaciones.

Realización 1. Un compuesto de Fórmula 1 en donde X^1 es CR^2 , y X^2 , X^3 y X^4 son cada uno independientemente CH.

Realización 2. Un compuesto de Fórmula 1 en donde X^2 es CR^2 , y X^1 , X^3 y X^4 son cada uno independientemente CH.

Realización 3. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las realizaciones 1 o 2, en donde R^2 es $C(=O)R^{11}$.

Las realizaciones de esta invención, incluidas las anteriores realizaciones 1-3, así como cualquier otra realización descrita en la presente descripción, pueden combinarse de cualquier manera, y las descripciones de las variables en las realizaciones se refieren no solamente a los compuestos de Fórmula 1, sino también a los compuestos de partida y los compuestos intermedios útiles para preparar los compuestos de Fórmula 1. Además, las realizaciones de esta invención, incluidas las anteriores realizaciones 1-3, así como también cualquier otra realización descrita en la presente descripción, y cualquier combinación de estas, se refieren a las composiciones y métodos de la presente invención.

Las realizaciones específicas incluyen compuestos de Fórmula 1 seleccionados del grupo de que consiste en (los números de compuestos se refieren a la Tabla de índice A):

3-(metiltio)-1-[2-(3-piridinil)-2*H*-indazol-4-il]-1-propanona (compuesto 2); y
 α -oxo-2-(3-piridinil)-*N*-(2,2,2-trifluoroetil)-2*H*-indazol-5-acetamida (compuesto 48).

Es de destacar que los compuestos de esta invención se caracterizan por patrones residuales metabólicos y/o de suelo favorables, y muestran actividad que controla un espectro de plagas agronómicas y no agronómicas de invertebrados.

Es de destacar, particularmente, que por motivos del espectro de control de plagas de invertebrados y la importancia económica, son realizaciones de la invención la protección de cultivos agronómicos del daño o perjuicios causados por las plagas de invertebrados mediante el control de plagas de invertebrados. Los compuestos de esta invención, debido a sus propiedades favorables de translocación o sistematicidad en las plantas, también protegen el área foliar u otras partes de la planta que no estén directamente en contacto con un compuesto de Fórmula 1 o una composición que comprenda el compuesto.

Cabe destacar también, como realizaciones de la presente invención, composiciones que comprenden un compuesto de cualquiera de las realizaciones anteriores, así como también cualquier otra realización descrita en la presente memoria, y cualquier combinación de las mismas, y al menos un componente adicional seleccionado del

grupo que consiste en un surfactante, un diluyente sólido y un diluyente líquido, comprendiendo dichas composiciones, además, opcionalmente, al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional.

5 Cabe destacar, adicionalmente, como realizaciones de la presente invención, composiciones que comprenden para controlar una plaga de invertebrados un compuesto de cualquiera de las realizaciones anteriores, así como cualquier otra realización descrita en la presente memoria, y cualquier combinación de las mismas, y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en un surfactante, un diluyente sólido y un diluyente líquido, comprendiendo dichas composiciones, además, opcionalmente, al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional. Las realizaciones de la invención incluyen además métodos para controlar una plaga de invertebrados, poner en contacto la plaga de invertebrados o su entorno con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de cualquiera de las realizaciones anteriores (p. ej., como una composición descrita en la presente descripción), con la condición de que el método no sea un método de tratamiento del cuerpo humano o animal mediante terapia.

15 Las realizaciones de la invención incluyen, además, una composición que comprende un compuesto de cualquiera de las realizaciones anteriores, en la forma de una formulación líquida para empapar el terreno. Las realizaciones de la invención incluyen, además, métodos que comprenden, para controlar una plaga de invertebrados, poner en contacto el terreno con una composición líquida, como empapadora del terreno, que comprende una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de cualquiera de las realizaciones anteriores.

20 Las realizaciones de la invención incluyen, además, una composición de pulverizador, para controlar una plaga de invertebrados, que comprende una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de cualquiera de las realizaciones anteriores y un propulsor. Las realizaciones de la invención incluyen, además, una composición de cebo que comprende, para controlar una plaga de invertebrados, una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de cualquiera de las realizaciones anteriores, uno o más materiales alimenticios, opcionalmente un agente atrayente y, opcionalmente, un humectante. Las realizaciones de la invención incluyen además un dispositivo que comprende, para controlar una plaga de invertebrados, dicha composición de cebo y una carcasa adaptada para recibir dicha composición de cebo, en donde la carcasa tiene al menos una abertura de un tamaño que permita que la plaga de invertebrados pase a través la abertura para que la plaga de invertebrados puede acceder a dicha composición de cebo desde una ubicación fuera del recipiente, y en donde la carcasa se adapta, además, para colocarse en, o cerca de, una ubicación de actividad potencial o conocida para la plaga de invertebrados.

35 Las realizaciones de la invención incluyen, además, métodos que comprenden, para proteger una semilla de una plaga de invertebrados, poner en contacto la semilla con una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de cualquiera de las realizaciones anteriores.

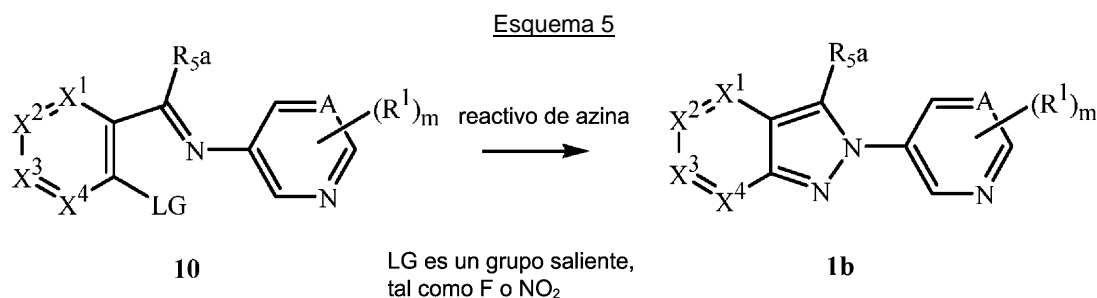
En la presente descripción también se describen métodos que comprenden, para proteger a un animal contra una plaga parasítica de invertebrados, administrar al animal una cantidad parasitariamente eficaz de un compuesto de cualquiera de las realizaciones anteriores.

40 Las realizaciones de la invención incluyen, además, métodos que comprenden, para controlar una plaga de invertebrados, poner en contacto la plaga de invertebrados o su entorno con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal de los mismos, (p. ej., como una composición descrita en la presente descripción), siempre que los métodos no sean métodos de tratamiento médico de un cuerpo humano o animal mediante terapia.

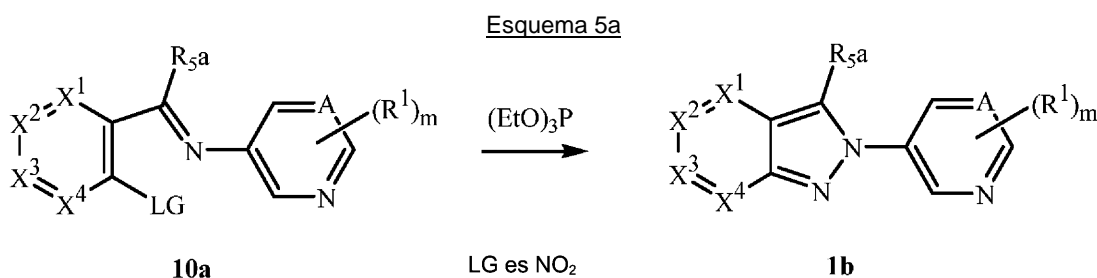
45 Esta invención también se refiere a dichos métodos en donde la plaga de invertebrados o su entorno se pone en contacto con una composición que comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal de los mismos, y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, comprendiendo, además, dicha composición, opcionalmente, una cantidad biológicamente eficaz de al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional, siempre que los métodos no sean métodos de tratamiento médico de un cuerpo humano o animal mediante terapia.

50 Los compuestos de Fórmula 1 pueden prepararse mediante uno o más de los siguientes métodos y variantes, tal como se describe en los Esquemas 5 y 5a. Las definiciones de sustituyentes en los compuestos de Fórmulas 1b, 10 y 10a, indicadas más adelante, son como se definieron anteriormente en el Resumen de la invención, salvo que se indique de otra forma. Los compuestos de Fórmulas 1b son compuestos de Fórmula 1, y todos los sustituyentes de las Fórmulas 1b son como se ha definido anteriormente para la Fórmula 1. Se usan las siguientes abreviaturas: THF es tetrahidrofurano, DMF es *N,N*-dimetilformamida, NMP es *N*-metilpirrolidinona, Ac es acetato, MS es mesilato, Tf es triflato y Nf es nonaflato.

60 Los compuestos de Fórmula 1b pueden prepararse a partir de compuestos de Fórmula 10 mediante el método que se muestra en el Esquema 5, en el que un compuesto de Fórmula 10 se trata con un reactivo de azida (por ejemplo, azida de sodio o azida de tetrabutilamonio). Las condiciones típicas de reacción incluyen DMF o NMP como disolvente, y temperaturas de reacción que varían de 80 °C al punto de ebullición del disolvente.



5 Los compuestos de Fórmula **1b** también se pueden preparar a partir de compuestos de Fórmula **10a** por el método que se muestra en el Esquema 5a, en el que un compuesto de Fórmula **10a** se trata con fosfito de trietilo.



10 Los compuestos de Fórmulas **10** y **10a** son bases de Schiff y se pueden preparar mediante métodos conocidos en la técnica (ver, por ejemplo, March, J., *Advanced Organic Chemistry*, Wiley, **1992**, páginas 896-898.

15 Los compuestos de Fórmula **1**, y los intermedios utilizados en la preparación de los compuestos de Fórmula **1**, en donde Z es S, se pueden preparar mediante tiónación de los correspondientes compuestos en donde Z es O con, por ejemplo, reactivo de Lawesson (CAS n.º 19172-47-5), reactivo de Belleau (CAS n.º 88816-02-8) o P₂S₅. Las reacciones de tiónación se llevan a cabo, típicamente, en disolventes tales como tolueno, xilenos o dioxano y a una temperatura elevada de 80 °C al punto de ebullición del solvente.

20 Se reconoce que algunos reactivos y condiciones de reacción descritos anteriormente para preparar compuestos de Fórmula **1** pueden no ser compatibles con ciertas funcionalidades presentes en los intermedios. En estos casos, la incorporación de secuencias de protección/desprotección o de interconversiones de grupo funcional en la síntesis facilitarán la obtención de los productos deseados. El uso y la elección de los grupos protectores será evidente para un experto en síntesis química (véase, por ejemplo, Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2ª ed.; Wiley: New York, 1991). Un experto en la técnica reconocerá que, en algunos casos, después de la introducción

25 de los reactivos representados en los esquemas individuales, pueden necesitarse etapas sintéticas rutinarias adicionales, no descritas en detalle, para completar la síntesis de compuestos de Fórmula **1**. Un experto en la técnica también reconocerá que puede ser necesario combinar las etapas ilustradas en los esquemas anteriores en un orden distinto al implícito en la secuencia determinada presentada para preparar los compuestos de Fórmula **1**.

30 Un experto en la técnica también reconocerá que los compuestos de Fórmula **1** y los productos intermedios que se describen en la presente descripción pueden someterse a varias reacciones electrofílicas, nucleofílicas, radicales, organometálicas, de oxidación y de reducción para agregar sustituyentes o modificar los sustituyentes existentes.

35 Sin entrar en más detalle, se cree que un experto en la técnica que use la descripción anterior puede utilizar la presente invención en su máxima medida. Por lo tanto, los siguientes Ejemplos de síntesis deben interpretarse como meramente ilustrativos, sin limitar la descripción en ningún sentido en absoluto. Las etapas en los siguientes Ejemplos de síntesis ilustran un procedimiento para cada etapa en una transformación sintética total, y la materia prima para cada etapa puede no haberse preparado necesariamente mediante un proceso de preparación particular, cuyo procedimiento se describe en otros Ejemplos o Etapas. Los porcentajes son en peso, salvo para mezclas de

40 solventes cromatográficos o donde se indique de otra forma. Las partes y porcentajes para las mezclas de solventes cromatográficos son en volumen, salvo que se indique lo contrario. Los espectros ¹H NMR se reflejan en ppm campo abajo desde el tetrametilsilano; "s" significa singulete, "d" significa doblete, "t" significa triplete, "q" significa cuartete, "m" significa multiplete, "dd" significa doblete de dobletes, "dt" significa doblete de tripletes, "br s" significa singlete amplio. DMF significa *N,N*-dimetilformamida. Los números compuestos se refieren a la Tabla de índice A.

45 Ejemplo de síntesis 1

Preparación de 1-[2-(3-piridinil)-2*H*-indazol-4-il]etanona (compuesto 5)

Etapa A: Preparación de 1-[2-(3-piridinil)-2*H*-indazol-4-il]etanona

Una solución de 4-bromo-2-(3-piridinil)-2*H*-indazol (2 g, 7,3 mmol), *n*-butilvinil éter (1,8 ml, 14,6 mmol), acetato de paladio (163 mg, 0,73 mmol), DPPP (601 mg, 1,46 mmol), y K₂CO₃ (1,2 g, 8,7 mmol) en DMF desgasificado (40 ml) y agua (10 ml) y se calentó a 100 °C durante 2 horas bajo una atmósfera de nitrógeno. Después de enfriar hasta temperatura ambiente, la mezcla de reacción se trató con HCl 1N (20 ml) y se agitó durante 15 minutos. A continuación, la mezcla de reacción se diluyó con EtOAc (100 ml) y las capas se separaron. La capa acuosa se extrajo con EtOAc (2 x 100 ml), y las capas orgánicas combinadas se lavaron con agua (3 x 50 ml), seguido de salmuera (50 ml). La fase orgánica se secó con sulfato de sodio, se filtró y se concentró al vacío. El producto bruto se purificó por cromatografía de columna de fase normal (gel de sílice, 0-100 % EtOAc en hexano) proporcionando el compuesto del título (0,98g) como un sólido blanquecino. ¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 9,28 (m, 1H), 9,23 (d, *J*=0,95 Hz, 1H), 8,69 (m, 1H), 8,31 (m, 1H), 8,05 (m, 1H), 7,84 (m, 1H), 7,51 (m, 1H), 7,44 (m, 1H), 2,72 (s, 3H).

Ejemplo de síntesis 2 (Referencia)

Preparación de *N*-(1-metiletil)-2-(3-piridinil)-2*H*-indazol-5-acetamida:Etapa A: Preparación de 2-[2-(3-piridinil)-2*H*-indazol-5-il]propanodiato de dimetilo

Se disolieron malonato de dimetilo (0,83 ml, 7,3 mmol), 5-bromo-2-(3-piridinil)-2*H*-indazol (1,0 mg, 3,65 mmol) y fosfato de potasio (1,9 mg, 9,12 mmol) en dioxano seco (20 ml) en atmósfera de nitrógeno, y la mezcla de reacción se desgasificó durante 10 minutos. Se añadieron acetato de paladio (II) (33 mg, 0,146 mmol) y 9,9-dimetil-4,5-bis(difenilfosfino)-xanteno (170 mg, 0,292 mmol), y la mezcla de reacción se calentó a reflujo durante la noche. A continuación, la mezcla de reacción se enfrió, se filtró a través de Celite®, y los sólidos filtrados se lavaron con EtOAc. Los productos filtrados orgánicos combinados se concentraron a presión reducida, y el producto bruto se purificó por cromatografía de columna de fase normal (gel de sílice con elución de EtOAc 20-60 % en hexano) proporcionando el compuesto del título (0,78 g) como un sólido blanco. ¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 9,17 (d, *J*=2,45 Hz, 1H), 8,67 (s, 1H), 8,45 (s, 1H), 8,23-8,31 (m, 1H), 7,73-7,85 (m, 2H), 7,46-7,55 (m, 1H), 7,37-7,44 (m, 1H), 4,75 (s, 1H), 3,79 (s, 6H).

Etapa B: Preparación de ácido 2-(3-piridinil)-2*H*-indazol-5-acético

Una suspensión de 2-[2-(3-piridinil)-2*H*-indazol-5-il]propanodioato de dimetilo (0,7 g, 2,15 mmol) en una mezcla de NaOH acuoso 1N (20 ml) y MeOH (20 ml) se calentó a reflujo durante 3 horas. La reacción se enfrió, el metanol se evaporó y la mezcla de reacción se acidificó con HCl 3 M a pH 3-4. A continuación, la mezcla de reacción se calentó a reflujo durante 3 horas. Después del enfriamiento, el producto precipitado se aisló por filtración, se lavó con agua, y se secó proporcionando el compuesto del título (0,37 g) como un sólido blanco. ¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 9,28-9,36 (m, 1H), 9,10-9,17 (m, 1H), 8,61-8,68 (m, 1H), 8,43-8,51 (m, 1H), 7,59-7,72 (m, 3H), 7,21-7,29 (m, 1H), 3,64 (d, *J*=12,72 Hz, 2H).

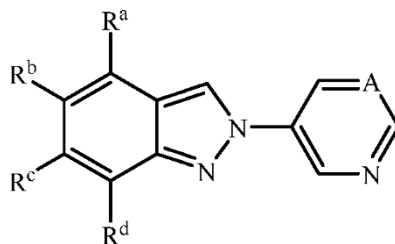
Etapa C: Preparación de *N*-(1-metiletil)-2-(3-piridinil)-2*H*-indazol-5-acetamida

Se añadió anhídrido propilfosfónico (T₃P®) (1,7 ml, 2,84 mmol, 50 % en peso en EtOAc) a una solución agitada de 2-(3-piridinil)-2*H*-indazol-5-acético (360 mg, 1,42 mmol), isopropilamina (250 µl, 2,84 mmol) y trietilamina (395 µl, 2,84 mmol) en diclorometano seco (10 ml) en una atmósfera de nitrógeno. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante la noche. Se añadió diclorometano (20 ml), la mezcla de reacción se lavó con agua, y la fase orgánica se secó sobre sulfato de sodio. La fase orgánica se evaporó a presión reducida obteniéndose un sólido que a continuación se trituró con éter/hexano 1:1. El sólido se aisló por filtración y se lavó adicionalmente con éter/hexano 1:1 obteniéndose el compuesto del título (0,37 g) como un sólido blanco. ¹H NMR (500 MHz, CD₃OD) δ 9,21 (d, *J*=2,45 Hz, 1H), 8,81 (s, 1H), 8,59 (dd, *J*=4,65, 1,22 Hz, 1H), 8,40 (d, *J*=1,47 Hz, 1H), 7,93-8,04 (m, 1H), 7,58-7,68 (m, 3H), 7,25-7,32 (m, 1H), 3,91-4,04 (m, 1H), 3,54 (s, 2H), 1,15 (d, *J*=6,36 Hz, 6H).

Los compuestos específicos de Fórmula 1, preparados mediante los métodos y variaciones que se describen en los anteriores Esquemas 5 y 5a y los Ejemplos de síntesis 1 y 2, se muestran en la Tabla de índice siguiente.

Las abreviaturas utilizadas en las Tablas de índice pueden incluir: Comp significa compuesto, *t* es terciario, *c* es ciclo, Me es metilo, y Et es etilo, Pr es propilo, *i*-Pr es isopropilo, Bu es butilo, *c*-Pr es ciclopropilo, *c*-Pn es ciclopentilo, *c*-Hx es ciclohexilo, *t*-Bu es butilo *terciario*, Ph es fenilo, OMe es metoxi, SME es metilitio y SO₂Me significa metilsulfonilo. Una línea ondulada o “-” en un fragmento de estructura, representa el punto de unión del fragmento al resto de la molécula.

Tabla de índice A



5 R^b, R^c y R^d son H

| <u>Comp. N.º</u> | <u>R^a</u> | <u>A</u> | <u>Datos de espect. de masas</u> | <u>Datos de punto de fusión</u> |
|------------------|---|----------|----------------------------------|---------------------------------|
| 2 | -C(O)CH ₂ CH ₂ SMe | CH | 298,2 | |
| 3 | -C(O)CH ₂ CH ₂ S(O)Me | CH | 314,2 | |
| 4 | -C(O)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me | CH | 330,2 | |
| 5 | -C(O)Me | CH | 238,2 | |

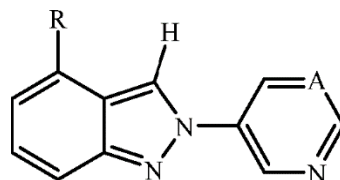
R^a, R^c y R^d son H

| <u>Comp. N.º</u> | <u>R^b</u> | <u>A</u> | <u>Datos de espect. de masas</u> | <u>Datos de punto de fusión</u> |
|------------------|---|----------|----------------------------------|---------------------------------|
| 30 | -C(O)Me | CH | 238,5 | |
| 31 | -C(O)CH ₂ CH ₂ SMe | CH | 298,2 | |
| 32* | -C(O)CH ₂ CH ₂ N(Me)OMe | CH | 311,2 | |
| 33 | -C(O)CH ₂ CH ₂ S(O)Me | CH | 314,2 | |
| 34- | C(O)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me | CH | 330,1 | |
| 37 | -C(O)CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CF ₃ | CH | | |
| 42* | 2-pirimidiniloxi | CH | | 200-203 |
| 47 | -C(O)C(O)NH(isopropilo) | CH | 309,3 | |
| 48 | -C(O)C(O)NHCH ₂ CF ₃ | CH | 349,3 | |
| 54* | -OCH ₂ CH(Me) ₂ | CH | | 110-114 |
| 59* | -CH(Me)C(O)NHCH ₂ (2-pirimidinilo) | CH | 359,4 | |
| 84* | -CH ₂ C(O)NHCH ₂ (2-pirimidinilo) | CF | 363,4 | |
| 85* | -CH(Me)C(O)NHC(Me) ₂ CN | CH | 334,4 | |

10 * Estos compuestos son ejemplos de referencia

Los ejemplos de intermedios útiles en la preparación de los compuestos de esta invención se muestran en las Tablas I-1 a I-16. Las siguientes abreviaturas se usan en las tablas siguientes: Me significa metilo, Et significa etilo, Ph significa fenilo, C(O) significa carbonilo y CHO significa formilo.

15 Tabla I-1

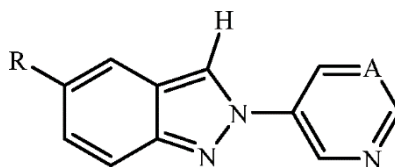


20 A es CH

| <u>R</u> | <u>R</u> |
|-----------------------|----------|
| -COOH | -C(O)OMe |
| -C(O)OEt | ciano |
| -C(O)Cl | -C(O)OPh |
| -C(O)O(4-nitrofenilo) | -C(O)Me |
| -CHO | Cl |

| | |
|-------------------------------------|-----------------|
| Br | I |
| -OS(O) ₂ CF ₃ | NH ₂ |
| nitro | OH |

Tabla I-2



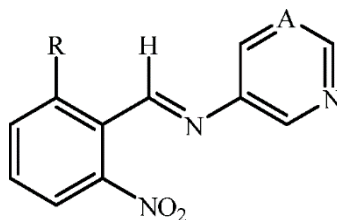
5

A es CH

| <u>R</u> | <u>R</u> |
|-------------------------------------|-----------------|
| -COOH | -C(O)OMe |
| -C(O)OEt | ciano |
| -C(O)Cl | -C(O)OPh |
| -C(O)O(4-nitrofenilo) | -C(O)Me |
| -CHO | Cl |
| Br | I |
| -OS(O) ₂ CF ₃ | NH ₂ |
| nitro | OH |

Tabla I-13

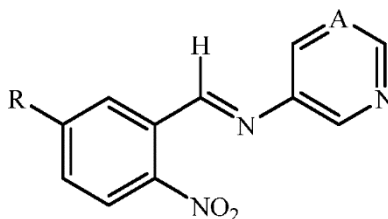
10



La Tabla I-13 es idéntica a la Tabla I-1, salvo que la estructura mostrada bajo el título “Tabla I-1” se reemplaza con la estructura mostrada anteriormente.

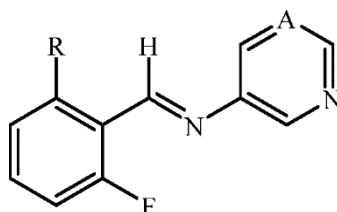
15

Tabla I-14



La Tabla I-14 es idéntica a la Tabla I-1, salvo que la estructura mostrada bajo el título “Tabla I-1” se reemplaza con la estructura mostrada anteriormente.

Tabla I-15

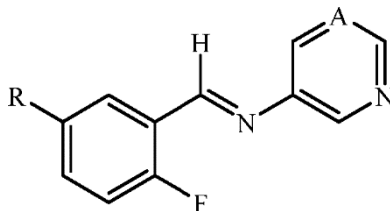


25

La Tabla I-15 es idéntica a la Tabla I-1, salvo que la estructura mostrada bajo el título “Tabla I-1” se reemplaza con la estructura mostrada anteriormente.

Tabla I-16

5



La Tabla I-16 es idéntica a la Tabla I-1, salvo que la estructura mostrada bajo el título “Tabla I-1” se reemplaza con la estructura mostrada anteriormente.

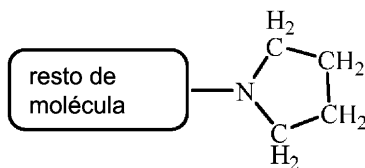
10

Mediante los procedimientos descritos en la presente descripción junto con métodos conocidos en la técnica, se pueden preparar los siguientes compuestos de las Tablas 1a y 7a. Las siguientes abreviaturas se pueden usar en las tablas siguientes: *t* significa terciario, *s* significa secundario, *i* significa iso, *c* significa ciclo, Me significa metilo, Et significa etilo, Pr significa propilo, Bu significa butilo, Ph significa fenilo, OMe significa metoxi, OEt significa etoxi, SMe significa metiltio, SEt significa etiltio, -CN significa ciano, Ph significa fenilo, Py significa piridinilo, -NO₂ significa nitro, S(O)Me significa metilsulfinilo, y S(O)₂Me significa metilsulfonilo.

15

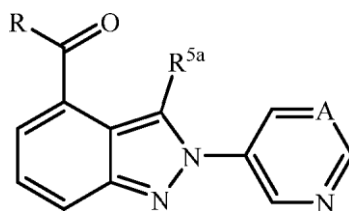
20

Un “-” al comienzo de una definición de fragmento significa el punto de unión de dicho fragmento al resto de la molécula; por ejemplo, “-CH₂CH₂OMe” significa el fragmento 2-metoxietilo. Los fragmentos cíclicos se representan mediante el uso de dos “-” entre paréntesis; por ejemplo, el fragmento 1-pirrolidinilo se representa mediante “N(-CH₂CH₂CH₂CH₂-)”, en donde un átomo de nitrógeno está unido a dos átomos de carbono terminales de las cuatro cadenas de carbono, como se ilustra a continuación.



25

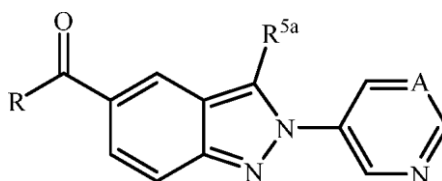
Tabla 1a

30 A es CH; R^{5a} es H

| <u>R</u> | <u>R</u> | <u>R</u> |
|--|---|---|
| Me | Et | Pr |
| i-Pr | -CH ₂ (c-Pr) | -CH(Me)(c-Pr) |
| Bu | s-Bu | i-Bu |
| t-Bu | -CH ₂ Ph | -CH ₂ CH=CH ₂ |
| -CH ₂ C=CH | -C(Me) ₂ C=CH | -CH ₂ CH ₂ F |
| -CH ₂ CHF ₂ | -CH ₂ CF ₃ | -CH(Me)CF ₃ |
| -CH ₂ CH ₂ CF ₃ | -CH ₂ CF ₂ CF ₃ | -CH ₂ CF ₂ CH ₃ |
| -CH ₂ CH ₂ CF ₂ CF ₃ | -CH(i-Pr)CF ₃ | -CH ₂ CH ₂ OMe |
| -CH ₂ OEt | -CH ₂ CH ₂ O(i-Pr) | -CH ₂ CH ₂ OEt |
| -CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe | -CH ₂ CH(Me)OMe | -CH(Et)CH ₂ OMe |
| -CH(Me)CH ₂ OMe | -CH ₂ CH ₂ S(O)Me | -CH ₂ CH ₂ SMe |
| -CH ₂ CH ₂ Set | -CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me | -CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et |
| -CH ₂ CH ₂ S(O)Et | -CH ₂ CH ₂ S(O)(t-Bu) | -CH ₂ CH ₂ S(t-Bu) |

| | | |
|--|--|---|
| -CH(Me)CH ₂ SMe | -CH ₂ CH ₂ SO ₂ (t-Bu) | -CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me |
| -CH(Me)CH ₂ S(O)Me | -CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CF ₃ | -CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CF ₃ |
| -CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CF ₃ | -CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃ | -CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ CF ₃ |
| -CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃ | -CH ₂ CN | -CH ₂ CH ₂ CN |
| -C(Me) ₂ CN | -CH ₂ CH ₂ N(i-Pr) ₂ | -CH ₂ CH ₂ N(Me) ₂ |
| -CH ₂ CH(OMe) ₂ | c-Pr | c-Bu |
| 1-metilciclopropilo | 3-metoxiciclobutilo | -CH(Ph)(c-Pr) |
| -CH(Me)(c-Pr) | | 3,3-difluorociclobutilo |
| | -CH ₂ (oxirani) | |
| | -CH ₂ (CH(-OC(Me) ₂ OCH ₂ -)) | -CH ₂ (tetrahidro-2-furani) |
| -CH ₂ (2-furani) | | -CH ₂ (2-tienilo) |
| -CH ₂ (CH(-OCH ₂ CH ₂ O-)) | -CH ₂ CO ₂ Me | |
| -C(-CH ₂ CH ₂ -)CO ₂ Me | -CH(Me)CO ₂ Et | -CH(i-Pr)CO ₂ Me |
| -CH ₂ C(O)NHMe | -CH ₂ C(O)NMe ₂ | -CH(Me)C(O)NHMe |
| -CH(Me)C(O)NH(t-Bu) | -CH ₂ (6-CF ₃ -2-piridinilo) | -CH(Me)C(O)NMe ₂ |
| -CH ₂ (3-CF ₃ -2-piridinilo) | -CH ₂ (5-CF ₃ -2-pirimidinilo) | -CH ₂ (4-CF ₃ -2-piridinilo) |
| -CH ₂ (4-CF ₃ -2-pirimidinilo) | -CH ₂ (6-metil-2-piridinilo) | -CH ₂ (5-CF ₃ -2-piridinilo) |
| -CH ₂ (3-metil-2-piridinilo) | -CH ₂ (5-metil-2-pirimidinilo) | -CH ₂ (4-metil-2-piridinilo) |
| -CH ₂ (4-metil-2-pirimidinilo) | -CH ₂ (6-metoxi-2-piridinilo) | -CH ₂ (5-metil-2-piridinilo) |
| -CH ₂ (3-metoxi-2-piridinilo) | -CH ₂ (5-metoxi-2-pirimidinilo) | -CH ₂ (4-metoxi-2-piridinilo) |
| -CH ₂ (4-metoxi-2-pirimidinilo) | -CH ₂ (5-pirimidinilo) | -CH ₂ (5-metoxi-2-piridinilo) |
| -CH ₂ (2-pirimidinilo) | -CH ₂ (3-(OCF ₃)fenilo) | -CH ₂ (6-bromo-2-piridinilo) |
| -CH ₂ (5-metil-2-pirazinilo) | -CH ₂ (4-piridinilo) | -CH ₂ (2-thiazolil) |
| | | -CH ₂ (2-piridinilo) |
| | | -CH ₂ (3-piridinilo) |
| | | -CH ₂ CH ₂ (2-piridinilo) |
| | | -CH ₂ CH ₂ CH ₂ (2-piridinilo) |
| -CH ₂ CH ₂ N(-C(O)CH ₂ CH ₂ C(O)-) | -CH ₂ CH ₂ CH ₂ (1-imidazolilo) | |

Tabla 7a



5

A es CH: R^{5a} es H

| <u>R</u> | <u>R</u> | <u>R</u> |
|--|--|---|
| Me | Et | Pr |
| i-Pr | -CH ₂ (c-Pr) | -CH(Me)(c-Pr) |
| Bu | s-Bu | i-Bu |
| t-Bu | -CH ₂ Ph | -CH ₂ CH=CH ₂ |
| -CH ₂ C=CH | -C(Me) ₂ C=CH | -CH ₂ CH ₂ F |
| -CH ₂ CHF ₂ | -CH ₂ CF ₃ | -CH(Me)CF ₃ |
| -CH ₂ CH ₂ CF ₃ | -CH ₂ CF ₂ CF ₃ | -CH ₂ CF ₂ CH ₃ |
| -CH ₂ CH ₂ CF ₂ CF ₃ | -CH(i-Pr)CF ₃ | -CH ₂ CH ₂ OMe |
| -CH ₂ OEt | -CH ₂ CH ₂ O(i-Pr) | -CH ₂ CH ₂ OEt |
| -CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe | -CH ₂ CH(Me)OMe | -CH(Et)CH ₂ OMe |
| -CH(Me)CH ₂ OMe | -CH ₂ CH ₂ S(O)Me | -CH ₂ CH ₂ SMe |
| -CH ₂ CH ₂ Set | -CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me | -CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et |
| -CH ₂ CH ₂ S(O)Et | -CH ₂ CH ₂ S(O)(t-Bu) | -CH ₂ CH ₂ S(t-Bu) |
| -CH(Me)CH ₂ SMe | -CH ₂ CH ₂ SO ₂ (t-Bu) | -CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me |
| -CH(Me)CH ₂ S(O)Me | -CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CF ₃ | -CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CF ₃ |

| | | |
|--|--|---|
| -CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CF ₃ | -CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃ | -CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ CF ₃ |
| -CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃ | -CH ₂ CN | -CH ₂ CH ₂ CN |
| -C(Me) ₂ CN | -CH ₂ CH ₂ N(i-Pr) ₂ | -CH ₂ CH ₂ N(Me) ₂ |
| -CH ₂ CH(OMe) ₂ | c-Pr | c-Bu |
| 1-metilciclopropilo | 3-metoxiciclobutilo | -CH(Ph)(c-Pr) |
| -CH(Me)(c-Pr) | | 3,3-difluorociclobutilo |
| | -CH ₂ (oxiranilo) | |
| | -CH ₂ (CH(-OC(Me) ₂ OCH ₂ -)) | -CH ₂ (tetrahidro-2-furanilo) |
| -CH ₂ (2-furanilo) | | -CH ₂ (2-tienilo) |
| -CH ₂ (CH(-OCH ₂ CH ₂ O-)) | -CH ₂ CO ₂ Me | |
| -C(-CH ₂ CH ₂ -)CO ₂ Me | -CH(Me)CO ₂ Et | -CH(i-Pr)CO ₂ Me |
| -CH ₂ C(O)NHMe | -CH ₂ C(O)NMe ₂ | -CH(Me)C(O)NHMe |
| -CH(Me)C(O)NH(t-Bu) | -CH ₂ (6-CF ₃ -2-piridinilo) | -CH(Me)C(O)NMe ₂ |
| -CH ₂ (3-CF ₃ -2-piridinilo) | -CH ₂ (5-CF ₃ -2-pirimidinilo) | -CH ₂ (4-CF ₃ -2-piridinilo) |
| -CH ₂ (4-CF ₃ -2-pirimidinilo) | -CH ₂ (6-metil-2-piridinilo) | -CH ₂ (5-CF ₃ -2-piridinilo) |
| -CH ₂ (3-metil-2-piridinilo) | -CH ₂ (5-metil-2-pirimidinilo) | -CH ₂ (4-metil-2-piridinilo) |
| -CH ₂ (4-metil-2-pirimidinilo) | -CH ₂ (6-metoxi-2-piridinilo) | -CH ₂ (5-metil-2-piridinilo) |
| -CH ₂ (3-metoxi-2-piridinilo) | -CH ₂ (5-metoxi-2-pirimidinilo) | -CH ₂ (4-metoxi-2-piridinilo) |
| -CH ₂ (4-metoxi-2-pirimidinilo) | -CH ₂ (5-pirimidinilo) | -CH ₂ (5-metoxi-2-piridinilo) |
| -CH ₂ (2-pirimidinilo) | -CH ₂ (3-(OCF ₃)fenilo) | -CH ₂ (6-bromo-2-piridinilo) |
| -CH ₂ (5-metil-2-pirazinilo) | -CH ₂ (4-piridinilo) | -CH ₂ (2-thiazolilo) |
| | | -CH ₂ (2-piridinilo) |
| | | -CH ₂ (3-piridinilo) |
| | | -CH ₂ CH ₂ (2-piridinilo) |
| | | -CH ₂ CH ₂ CH ₂ (2-piridinilo) |
| | | |
| -CH ₂ CH ₂ N(-C(O)CH ₂ CH ₂ C(O)-) | -CH ₂ CH ₂ CH ₂ (1-imidazolilo) | |

Un compuesto de esta invención se usará, generalmente, en una composición como un ingrediente activo para el control de plagas de invertebrados, es decir, una formulación, con al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en surfactantes, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, que sirve como portador. Los ingredientes de la formulación o composición se seleccionan de acuerdo con las propiedades físicas del ingrediente activo, el modo de aplicación y los factores ambientales, tales como tipo de terreno, humedad y temperatura.

Las formulaciones útiles incluyen composiciones líquidas y sólidas. Las composiciones líquidas incluyen soluciones (que incluyen concentrados emulsionables), suspensiones, emulsiones (que incluyen microemulsiones, emulsiones de aceite en agua, concentrados fluidos y/o suspoemulsiones) y similares, que, opcionalmente, pueden espesarse para formar geles. Los tipos generales de composiciones líquidas acuosas son de concentrado soluble, concentrado en suspensión, suspensión en cápsula, emulsión concentrada, microemulsión, emulsión de aceite en agua, concentrado fluido y suspoemulsión. Los tipos generales de composiciones líquidas no acuosas son de concentrado emulsionable, concentrado microemulsionable, concentrado dispersable y dispersión en aceite.

Los tipos generales de composiciones sólidas son de polvos, gránulos, pellets, grumos, pastillas, comprimidos, películas rellenas (que incluyen recubrimientos de semillas) y similares, que pueden ser dispersables en agua ("humectables") o solubles en agua. Las películas y recubrimientos conformados a partir de soluciones formadoras de película o suspensiones fluidas, son particularmente útiles para el tratamiento de semillas. El ingrediente activo puede estar (micro)encapsulado y adicionalmente conformado en una suspensión o formulación sólida; alternativamente, la formulación completa del ingrediente activo puede ser encapsulada (o "totalmente recubierta"). La encapsulación puede controlar o retrasar la liberación del ingrediente activo. Un gránulo emulsionable combina las ventajas tanto de una formulación de concentrado emulsionable como de una formulación granular seca. Las composiciones de alta resistencia se usan principalmente como productos intermedios para una formulación adicional.

Las formulaciones pulverizables se extienden, típicamente, en un medio adecuado antes de la pulverización. Estas formulaciones líquidas y sólidas se formulan para diluirse fácilmente en el medio de pulverización, generalmente agua, pero, ocasionalmente, en otro medio adecuado como un hidrocarburo aromático o parafínico o un aceite vegetal. Los volúmenes de pulverización pueden variar desde aproximadamente uno hasta varios miles de litros por hectárea, pero, más típicamente, están en el intervalo desde aproximadamente diez hasta varios cientos de litros por hectárea. Las formulaciones pulverizables pueden en un depósito mezclarse con agua u otro medio adecuado para el tratamiento foliar, mediante la aplicación aérea o terrestre, o para la aplicación al medio de cultivo de la planta. Las formulaciones líquidas y secas pueden dosificarse directamente en sistemas de riego por goteo o dosificarse en

el surco durante la siembra. Las formulaciones líquidas y sólidas pueden aplicarse sobre semillas de cultivos y otra vegetación que se desee como tratamientos de semillas, antes de la siembra, para proteger las raíces en desarrollo y otras partes subterráneas de la planta y/o el follaje mediante absorción sistémica.

- 5 Por lo general, las formulaciones contienen cantidades efectivas de un ingrediente activo, diluyente y tensioactivo dentro de los siguientes intervalos aproximados que equivalen al 100 por ciento en peso.

| | Porcentaje en peso | | |
|--|---------------------------|------------------|--------------------|
| | <u>Ingrediente activo</u> | <u>Diluyente</u> | <u>Surfactante</u> |
| Gránulos, tabletas y polvos dispersables en agua y solubles en agua | 0,001-90 | 0-99,999 | 0-15 |
| Dispersiones en aceite, suspensiones, emulsiones, soluciones (que incluyen concentrados emulsionables) | 1-50 | 40-99 | 0-50 |
| Polvos | 1-25 | 70-99 | 0-5 |
| Gránulos y pellets | 0,001-99 | 5-99,999 | 0-15 |
| Composiciones de alta resistencia | 90-99 | 0-10 | 0-2 |

- 10 Los diluyentes sólidos incluyen, por ejemplo, arcillas, tales como bentonita, montmorillonita, atapulguita y caolín, yeso, celulosa, dióxido de titanio, óxido de zinc, almidón, dextrina, azúcares (p. ej., lactosa, sacarosa), sílice, talco, mica, tierra de diatomeas, urea, carbonato de calcio, carbonato y bicarbonato de sodio, y sulfato de sodio. Los diluyentes sólidos típicos se describen en Watkins y col., *Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers*, 2ª ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey.

- 15 Los diluyentes líquidos incluyen, por ejemplo, agua, *N,N*-dimetilalcanamidas (p. ej., *N,N*-dimetilformamida), limoneno, sulfóxido de dimetilo, *N*-alquilpirrolidonas (p. ej., *N*-metilpirrolidinona), fosfatos de alquilo (p. ej., tetrilfosfato), etilenglicol, trietilenglicol, propilenglicol, dipropilenglicol, polipropilenglicol, carbonato de propileno, carbonato de butileno, parafinas (p. ej., aceites minerales blancos, parafinas normales, isoparafinas), alquilbencenos, alquilnaftalenos, glicerina, triacetato de glicerol, sorbitol, hidrocarburos aromáticos, alifáticos desaromatizados, alquilbencenos, alquilnaftalenos, cetonas tales como ciclohexanona, 2-heptanona, isoforona y 4-hidroxi-4-metil-2-pentanona, acetatos tales como acetato de isoamilo, acetato de hexilo, acetato de heptilo, acetato de octilo, acetato de nonilo, acetato de tridecilo y acetato de isobornilo, otros ésteres tales como ésteres de lactato alquilados, alquil ésteres dibásicos y arilo benzoatos, γ -butirolactona, y alcoholes, que pueden ser lineales, ramificados, saturados o insaturados, tales como metanol, etanol, *n*-propanol, alcohol isopropílico, *n*-butanol, alcohol isobutílico, *n*-hexanol, 2-etilhexanol, *n*-octanol, decanol, alcohol isodecílico, isooctadecanol, alcohol cetílico, alcohol laurílico, alcohol tridecílico, alcohol oleílico, ciclohexanol, alcohol tetrahidrofurfurílico, diacetona-alcohol, cresol y alcohol bencílico. Los diluyentes líquidos también incluyen ésteres de glicerol de ácidos grasos saturados e insaturados (típicamente, C₆-C₂₂), tales como aceites de semilla de planta y de fruta (p. ej., aceites de oliva, ricino, linaza, sésamo, maíz, cacahuete, girasol, semilla de uva, cártamo, semilla de algodón, Soja, colza, coco y palmiste), grasas de origen animal (p. ej., sebo de res, sebo de cerdo, manteca de cerdo, aceite de hígado de bacalao, aceite de pescado) y mezclas de los mismos. Los diluyentes líquidos también incluyen ácidos grasos alquilados (p. ej., metilados, etilados, butilados), en donde los ácidos grasos pueden obtenerse por hidrólisis de ésteres de glicerol de fuentes vegetales y animales, y pueden purificarse mediante destilación. Los diluyentes líquidos típicos se describen en Marsden, *Solvents Guide*, 2ª ed., Interscience, New York, 1950.

- 35 Las composiciones sólidas y líquidas de la presente invención con frecuencia incluyen uno o más surfactantes. Cuando se añaden a un líquido, los tensioactivos (también conocidos como “agentes activadores de superficie”) generalmente modifican, más a menudo reducen, la tensión superficial del líquido. Dependiendo de la naturaleza de los grupos hidrófilo y lipófilo en una molécula surfactante, los surfactantes pueden ser útiles como agentes humectantes, dispersantes, emulsionantes o agentes desespumantes.

- 40 Los surfactantes pueden clasificarse como no iónicos, aniónicos o catiónicos. Los surfactantes no iónicos útiles para las presentes composiciones incluyen, pero no se limitan a: alcoxilatos de alcohol, tales como alcoxilatos de alcohol basados en alcoholes naturales y sintéticos (que pueden ser ramificados o lineales) y preparados a partir de los alcoholes y óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos; etoxilatos de amina, alcanolamidas y alcanolamidas etoxiladas; triglicéridos alcoxilados, tales como aceites etoxilados de soja, de ricino y de colza; alcoxilatos de alquilfenol, tales como etoxilatos de octilfenol, etoxilatos de nonilfenol, etoxilatos de dinonil fenol y etoxilatos de dodecilfenol (preparados a partir de fenoles y óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos); polímeros de bloques preparados a partir de óxido de etileno u óxido de propileno, y polímeros de bloque inverso donde los bloques terminales se preparen a partir de óxido de propileno; ácidos grasos etoxilados; ésteres y aceites grasos etoxilados; ésteres de metilo etoxilados; tristirilfenol etoxilado (incluidos los preparados a partir de óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos); ésteres de ácido graso, ésteres de glicerol, derivados a base de lanolina, ésteres de polietoxilato, tales como ésteres de ácido graso de sorbitán polietoxilados, ésteres de ácido graso de sorbitol polietoxilados y ésteres de ácido graso de glicerol polietoxilados; otros derivados de sorbitán, tales como ésteres de sorbitán; surfactantes poliméricos, tales como copolímeros aleatorios,

copolímeros de bloque, resinas de peg (polietilenglicol) de alquido, polímeros de injerto o tipo peine y polímeros de estrella; polietilenglicoles (pegs); ésteres de ácido graso de polietilenglicol; surfactantes basados en silicona; y derivados de azúcar, tales como ésteres de sacarosa, poliglicósidos de alquilo y polisacáridos de alquilo.

5 Los surfactantes aniónicos útiles incluyen, pero no se limitan a: ácidos sulfónicos de alquilarilo y sus sales; alcohol carboxilado o etoxilatos de alquilfenol; derivados de sulfonato de difenilo; lignina y derivados de lignina, tales como lignosulfonatos; ácido maleico o succínico, o sus anhídridos; sulfonatos de olefina; ésteres de fosfato, tales como ésteres de fosfato de alcoxilatos de alcohol, ésteres de fosfato de alcoxilatos de alquilfenol y ésteres de fosfato de etoxilatos de estirilfenol; surfactantes basados en proteínas; derivados de sarcosina; éter sulfato de estirilfenol; sulfatos y sulfonatos de aceites y ácidos grasos; sulfatos y sulfonatos de alquilfenoles etoxilados; sulfatos de alcoholes; sulfatos de alcoholes etoxilados; sulfonatos de aminas y amidas, tales como *N,N*-alquiltauratos; sulfonatos de benceno, cumeno, tolueno, xileno y dodecil y tridecibenceno; sulfonatos de naftalenos condensados; sulfonatos de naftaleno y alquilnaftaleno; sulfonatos de petróleo fraccionado; sulfosuccinamatos; y sulfosuccinatos y sus derivados, tales como sales de sulfosuccinato de dialquilo.

15 Los surfactantes catiónicos útiles incluyen, pero no se limitan a: amidas y amidas etoxiladas; aminas, tales como *N*-alquil propanodiaminas, tripropilentriaminas y dipropilentetraminas, y aminas etoxiladas, diaminas etoxiladas y aminas propoxiladas (preparadas a partir de las aminas y óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos); sales de aminas, tales como acetatos de aminas y sales de diaminas; sales de amonio cuaternario, tales como sales cuaternarias, sales cuaternarias etoxiladas y sales dicuaternarias; y óxidos de amina, tales como óxidos de alquildimetilamina y óxidos de bis-(2-hidroxitil)-alquilamina.

25 También son útiles para las presentes composiciones mezclas de surfactantes no iónicos y aniónicos, o mezclas de surfactantes no iónicos y catiónicos. Los tensioactivos no iónicos, aniónicos y catiónicos, y sus usos recomendados, se describen en una variedad de referencias publicadas, que incluyen *McCutcheon's Emulsifiers and Detergents*, ediciones anuales norteamericanas e internacionales publicadas por McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely y Wood, *Encyclopedia of Surface Active Agents*, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964; y A. S. Davidson y B. Milwidsky, *Synthetic Detergents*, séptima edición, John Wiley and Sons, New York, 1987.

30 Las composiciones de esta invención también pueden contener auxiliares y aditivos de formulaciones, conocidos por los expertos en la técnica como auxiliares de formulación (algunos de los cuales pueden considerarse, además, como diluyentes sólidos, diluyentes líquidos o surfactantes). Dichos auxiliares y aditivos de formulaciones pueden controlar: el pH (tampones), la formación de espuma durante el procesado (antiespumantes tales como poliorganosiloxanos), la sedimentación de ingredientes activos (agentes de suspensión), el crecimiento microbiano en recipientes (antimicrobianos), la congelación del producto (anticongelantes), el color (tintes/dispersiones de pigmento), la eliminación por lavado (formadores de película o adhesivos), la evaporación (retardantes de la evaporación) y otros atributos de la formulación. Los formadores de película incluyen, por ejemplo, acetatos de polivinilo, copolímeros de acetato de polivinilo, copolímero de polivinilpirrolidona-acetato de vinilo, alcoholes polivinílicos, copolímeros de alcohol polivinílico y ceras. Ejemplos de auxiliares y aditivos de formulación incluyen los enumerados en *McCutcheon's Volume 2: Functional Materials*, ediciones anuales norteamericanas e internacionales publicadas por McCutcheon 's División, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; y la publicación PCT WO 03/024222.

45 El compuesto de Fórmula 1 y otros ingrediente activos cualesquiera se incorporan, típicamente, en las presentes composiciones al disolver el ingrediente activo en un solvente, o al molerlo en un diluyente líquido o seco. Las soluciones, incluidos los concentrados emulsionables, se pueden preparar mezclando simplemente los ingredientes. Si el solvente de una composición líquida destinada para usarse como concentrado emulsionable es inmiscible en agua, se añade, típicamente, un emulsionante para emulsionar el solvente que contiene el activo tras diluirlo con agua. Los lodos de ingredientes activos, con diámetros de partícula de hasta 2000 µm, se pueden moler en húmedo utilizando molinos de medios para obtener partículas con diámetros promedio menores de 3 µm. Los lodos acuosos pueden transformarse en concentrados de suspensión terminados (ver, por ejemplo, US-3.060.084) o procesarse adicionalmente mediante secado por aspersión para formar gránulos dispersables en agua. Habitualmente, las formulaciones secas requieren procesos de molienda en seco, que producen diámetros promedio de partícula en el intervalo de 2 a 10 µm. Los polvos pueden prepararse mediante mezclado y, generalmente, triturado (tal como con un molino de martillo o un molino de energía fluida). Los gránulos y pellets pueden prepararse por medio del pulverizado del material activo sobre portadores granulares preformados o mediante técnicas de aglomeración. Ver Browning, "Agglomeration", *Chemical Engineering*, 4 de diciembre de 1967, págs. 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4.^a ed., McGraw-Hill, New York, 1963, páginas 8-57 y siguientes, y el documento WO 91/13546. Los pellets pueden prepararse como se describe en US-4.172.714. Los gránulos dispersables-en agua y solubles en agua pueden prepararse como se instruye en US-4.144.050, US-3.920.442 y DE-3.246.493. Los comprimidos se pueden preparar como se instruye en US-5.180.587, US-5.232.701 y US-5.208.030. Las películas se pueden preparar como se instruye en GB -2.095.558 y US-3.299.566.

65 Para obtener más información sobre la técnica de formulación, ver T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture" en *Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge*, T. Brooks y T. R. Roberts, editores, Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, págs. 120-133. Ver también US-3.235.361, col. 6,

línea 16 a col. 7, línea 19 y Ejemplos 10-41; US-3.309.192, col. 5, línea 43 a col. 7, línea 62 y los Ejemplos 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162-164, 166, 167 y 169-182; US-2.891.855, col. 3, línea 66 a col. 5, línea 17 y Ejemplos 1-4; Klingman, *Weed Control as a Science*, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, págs. 81-96; Hance y col., *Weed Control Handbook*, 8.^a ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; y
 5 *Developments in formulation technology*, PJB publicaciones, Richmond, Reino Unido, 2000.

En los siguientes Ejemplos, todas las formulaciones se preparan de maneras convencionales. Los números compuestos se refieren a compuestos de la Tabla de índice A. Sin entrar en más detalle, se cree que un experto en la técnica que use la descripción anterior puede utilizar la presente invención en su máxima medida. Los
 10 siguientes Ejemplos se deben, por lo tanto, interpretar como meramente ilustrativos, y no limitativos de la descripción en ningún sentido en absoluto. Los porcentajes son en peso, salvo que se indique de otra manera.

Ejemplo A

Concentrado de alta resistencia

| | |
|--------------------------------------|--------|
| Compuesto 2 | 98,5 % |
| aerogel de sílice | 0,5 % |
| 15 sílice fina sintética amorfa fina | 1,0 % |

Ejemplo B

Polvo humectable

| | |
|-----------------------------------|--------|
| Compuesto 32 (Referencia) | 65,0 % |
| dodecifenol polietilenglicol éter | 2,0 % |
| ligninsulfonato sódico | 4,0 % |
| silicoaluminato sódico | 6,0 % |
| 20 montmorillonita (calcinada) | 23,0 % |

Ejemplo C

Gránulo

| | |
|--|--------|
| Compuesto 42 (Referencia) | 10,0 % |
| 20 gránulos de atapulgita (baja materia volátil, 0,71/0,30 mm; tamices U.S.S. n.º 25-50) | 90,0 % |

Ejemplo D

Pellet extruido

| | |
|---------------------------------|--------|
| Compuesto 48 | 25,0 % |
| sulfato sódico anhidro | 10,0 % |
| ligninsulfonato de calcio crudo | 5,0 % |
| alquilnaftalenosulfonato sódico | 1,0 % |
| 25 bentonita de calcio/magnesio | 59,0 % |

Ejemplo E

Concentrado emulsionable

| | |
|--|--------|
| Compuesto 54 (Referencia) | 10,0 % |
| hexolato polioxietileno sorbitol | 20,0 % |
| éster metílico de ácido graso de C ₆ -C ₁₀ | 70,0 % |

Ejemplo F

Microemulsión

| | |
|--|--------|
| Compuesto 59 (Referencia) | 5,0 % |
| copolímero de polivinilpirrolidona-acetato de vinilo | 30,0 % |
| alquilpoliglicósido | 30,0 % |
| monooleato de glicerilo | 15,0 % |
| 30 agua | 20,0 % |

Ejemplo G

Tratamiento de semilla

| | |
|--|---------|
| Compuesto 84 (Referencia) | 20,00 % |
| copolímero de polivinilpirrolidona-acetato de vinilo | 5,00 % |
| cera de ácido montánico | 5,00 % |
| ligninsulfonato de calcio | 1,00 % |
| copolímeros de bloque de polioxietileno/polioxipropileno | 1,00 % |
| alcohol estearílico (POE 20) | 2,00 % |
| poliorganosilano | 0,20 % |
| tinte colorante rojo | 0,05 % |
| agua | 65,75 % |

Ejemplo H

5

Barra fertilizante

| | |
|------------------------------------|--------|
| Compuesto 85 (Referencia) | 2,5 % |
| copolímero de pirrolidona-estireno | 4,8 % |
| 16-etoxilato de triestirilfenilo | 2,3 % |
| talco | 0,8 % |
| almidón de maíz | 5,0 % |
| fertilizante de liberación lenta | 36,0 % |
| caolina | 38,0 % |
| agua | 10,6 % |

Ejemplo I

Concentrado en suspensión

| | |
|--|--------|
| compuesto 2 | 35 % |
| copolímero de bloque de butil polioxietileno/polipropileno | 4,0 % |
| copolímero de ácido esteárico/polietilenglicol | 1,0 % |
| polímero acrílico de estireno | 1,0 % |
| goma de xantano | 0,1 % |
| propilenglicol | 5,0 % |
| desespumante a base de silicona | 0,1 % |
| 1,2-benzisotiazolin-3-ona | 0,1 % |
| agua | 53,7 % |

10 Ejemplo J

Emulsión en agua

| | |
|--|--------|
| compuesto 32 (Referencia) | 10,0 % |
| copolímero de bloque de butil polioxietileno/polipropileno | 4,0 % |
| copolímero de ácido esteárico/polietilenglicol | 1,0 % |
| polímero acrílico de estireno | 1,0 % |
| goma de xantano | 0,1 % |
| propilenglicol | 5,0 % |
| desespumante a base de silicona | 0,1 % |
| 1,2-benzisotiazolin-3-ona | 0,1 % |
| hidrocarburo aromático a base de petróleo | 20,0 |
| agua | 58,7 % |

Ejemplo K

Dispersión de aceite

| | |
|---|--------|
| compuesto 42 (Referencia) | 25 % |
| hexaoleato de sorbitol polioxietileno | 15 % |
| arcilla de bentonita orgánicamente modificada | 2,5 % |
| éster metílico de ácido graso | 57,5 % |

Ejemplo L

Suspoemulsión

| | |
|--|--------|
| compuesto 48 | 10,0 % |
| imidacloprida | 5,0 % |
| copolímero de bloque de butil polioxietileno/polipropileno | 4,0 % |
| copolímero de ácido esteárico/polietilenglicol | 1,0 % |
| polímero acrílico de estireno | 1,0 % |
| goma de xantano | 0,1 % |
| propilenglicol | 5,0 % |
| desespumante a base de silicona | 0,1 % |
| 1,2-benzisotiazolin-3-ona | 0,1 % |
| hidrocarburo aromático a base de petróleo | 20,0 % |
| agua | 53,7 % |

- 5 Los compuestos de esta invención muestran actividad contra un amplio espectro de plagas de invertebrados. Estas plagas incluyen invertebrados que habitan en una variedad de entornos, tales como, por ejemplo, el follaje de las plantas, las raíces, el terreno, los cultivos cosechados u otros productos alimenticios, las edificaciones o los integumentos animales. Estas plagas incluyen, por ejemplo, invertebrados que se alimentan de follaje (incluidos hojas, tallos, flores y frutos), semillas, madera, fibras textiles o sangre o tejidos animales, y causando con ello lesiones o daños
- 10 a, por ejemplo, cultivos agronómicos en crecimiento o almacenados, bosques, cultivos de invernadero, plantas ornamentales, cultivos de viveros, productos alimenticios o productos de fibra almacenados, o casas u otras estructuras, o sus contenidos, o son nocivas para la salud pública o animal. Los expertos en la técnica apreciarán que no todos los compuestos son igual de efectivos contra todas las etapas de crecimiento de todas las plagas.
- 15 Estos compuestos y composiciones presentes son, por tanto, útiles agronómicamente para proteger cultivos de campo de plagas de invertebrados fitófagos, y también no agronómicamente para proteger otros cultivos hortícolas y plantas de plagas de invertebrados fitófagos. Esta utilidad incluye proteger cultivos y otras plantas (es decir, tanto agrónomas como no agrónomas) que contengan material genético introducido mediante ingeniería genética (es decir, transgénica) o modificado mediante mutagénesis para proporcionar rasgos ventajosos. Ejemplos de dichos rasgos incluyen
- 20 tolerancia a herbicidas, resistencia a plagas fitófagas (p. ej., insectos, ácaros, áfidos, arañas, nemátodos, caracoles, hongos fitopatógenos, bacterias y virus), mejora del crecimiento de la planta, mayor tolerancia contra las condiciones adversas de cultivo, tales como altas o bajas temperaturas, alta o baja humedad del suelo, y alta salinidad, aumento de la floración o de la fructificación, mejores rendimientos de cosecha, maduración más rápida, mayor calidad y/o valor nutricional del producto cosechado, o mejora de las propiedades de almacenamiento o de proceso de los productos
- 25 cosechados. Las plantas transgénicas se pueden modificar para expresar múltiples rasgos. Los ejemplos de plantas que contienen rasgos proporcionados mediante ingeniería genética o mutagénesis incluyen variedades de maíz, algodón, Soja y patata que expresan una toxina insecticida de *Bacillus thuringiensis*®, tales como YIELD GUARD®, KNOCKOUT®, STARLINK®, BOLLGARD®, NuCOTN® y NEWLEAF®, INVICTA RR2 PRO™, y variedades de maíz, algodón, Soja y colza resistentes a los herbicidas, tales como ROUNDUP READY®, LIBERTY LINK®, IMI®, STS® y
- 30 CLEARFIELD®, así como cultivos que expresen N-acetil transferasa (GAT) para proporcionar resistencia al herbicida glifosato, o cultivos que contengan el gen HRA que proporciona resistencia a los herbicidas que inhiben la acetolactato sintasa (ALS). Los presentes compuestos y composiciones pueden interactuar de manera sinérgica con rasgos introducidos mediante ingeniería genética o modificados mediante mutagénesis, aumentando así la expresión fenotípica o la efectividad de los rasgos, o aumentando la eficacia del control de plagas de invertebrados de los
- 35 presentes compuestos y composiciones. En particular, los presentes compuestos y composiciones pueden interactuar de manera sinérgica con la expresión fenotípica de las proteínas u otros productos naturales tóxicos para las plagas de invertebrados, para proporcionar un control de estas plagas mayor que el de los aditivos.
- 40 Las composiciones de esta invención pueden comprender, además, opcionalmente, nutrientes vegetales, p. ej., una composición fertilizante que comprenda al menos un nutriente vegetal seleccionado de nitrógeno, fósforo, potasio, azufre, calcio, magnesio, hierro, cobre, boro, manganeso, zinc y molibdeno. Son de destacar las composiciones que comprenden al menos una composición fertilizante que comprenda al menos un nutriente vegetal seleccionado de nitrógeno, fósforo, potasio, azufre, calcio y magnesio. Las composiciones de la presente invención que comprenden, además, al menos un nutriente vegetal pueden presentarse en forma líquida o sólida. Son de destacar las formulaciones sólidas en forma de
- 45 gránulos, barritas o tabletas. Las formulaciones sólidas que comprenden una composición fertilizante se pueden preparar mezclando el compuesto o composición de la presente invención con la composición fertilizante, junto con los ingredientes de formulación, y después preparar la formulación mediante métodos tales como granulación o extrusión. Alternativamente, las formulaciones sólidas pueden prepararse rociando una solución o suspensión de un compuesto o
- 50 composición de la presente invención en un solvente volátil sobre una composición fertilizante previamente preparada en la forma de mezclas dimensionalmente estables, p. ej., gránulos, barritas o tabletas, y evaporando después el solvente.

Los usos no agronómicos se refieren al control de plagas de invertebrados en áreas que no sean campos de plantas de cultivo. Los usos no agronómicos de los presentes compuestos y composiciones incluyen el control de plagas de invertebrados en granos, legumbres y otros productos alimenticios almacenados, y en textiles, tales como ropa y alfombras. Los usos no agronómicos de los presentes compuestos y composiciones también incluyen el control de plagas de invertebrados en plantas ornamentales, bosques, jardines, a lo largo de los derechos de paso de arceles y vías férreas, y sobre césped, tales como el de jardines, campos de golf y pastos. Los usos no agronómicos de los presentes compuestos y composiciones también incluyen el control de plagas de invertebrados en casas y otros edificios que puedan estar ocupados por seres humanos y/o acompañantes, de granjas, de ranchos, de zoológicos o de otros animales. Los usos no agrónomos de los presentes compuestos y composiciones también incluyen el control de plagas, tales como termitas, que puedan dañar la madera u otros materiales estructurales que se utilizan en edificios.

Los usos no agrónomos de los presentes compuestos y composiciones incluyen también proteger la salud humana y animal, mediante el control de plagas de invertebrados que sean parasíticas o transmitan enfermedades infecciosas. No se reivindican métodos terapéuticos de uso de los compuestos de la invención. El control de parásitos animales incluye controlar los parásitos externos que sean parasíticos para la superficie del cuerpo del animal huésped (p. ej., hombros, axilas, abdomen, parte interior de los muslos) y los parásitos internos que sean parasíticos para el interior del cuerpo del animal huésped (p. ej., estómago, intestino, pulmón, venas, bajo la piel, tejido linfático). Las plagas parasitarias externas o transmisoras de enfermedades incluyen, por ejemplo, chinches, garrapatas, piojos, mosquitos, moscas, ácaros y pulgas. Los parásitos internos incluyen parásitos del corazón, anquilostomas y helmintos. Los compuestos y composiciones de la presente invención son adecuados para el control sistémico y/o no sistémico de las infestaciones o infecciones causadas por parásitos en animales. Los compuestos y composiciones de la presente invención son particularmente adecuados para combatir plagas externas parasitarias o transmisoras de enfermedades. Los compuestos y composiciones de la presente invención son adecuados para combatir parásitos que infestan animales de trabajo agrícola, tales como ganado vacuno, ovejas, cabras, caballos, cerdos, burros, camellos, búfalos, conejos, gallinas, pavos, patos, gansos y abejas; animales de compañía y animales domésticos, tales como perros, gatos, aves de compañía y peces de acuario; así como los tan llamados animales experimentales, tales como hámsters, cobayas, ratas y ratones. Al combatir estos parásitos, se reducen las muertes y la baja productividad (en términos de carne, leche, lana, pieles, huevos, miel, etc.), de manera que al aplicar una composición que comprenda un compuesto de la presente invención, se permite una cría de animales más económica y simple.

Los ejemplos de plagas de invertebrados agrónomas o no agrónomas incluyen huevos, larvas y adultos del orden de los Lepidópteros, tales como orugas militares, gusanos cortadores, orugas medidoras, y heliottinas en la familia de los Noctuidae (p. ej., barrenador rosado del tallo (*Sesamia inferens* Walker), barrenador del maíz (*Sesamia nonagrioides* Lefebvre), gusano soldado sureño (*Spodoptera eridania* Cramer), gusano cogollero (*Spodoptera frugiperda* J. E. Smith), gusano soldado del betabel (*Spodoptera exigua* Hübner), oruga de la hoja del algodón (*Spodoptera littoralis* Boisduval), gusano soldado de manchas amarillas (*Spodoptera ornithogalli* Guenée), gusano trozador (*Agrotis ipsilon* Hufnagel), oruga de las leguminosas (*Anticarsia gemmatalis* Hübner), gusano verde del fruto (*Lithophane antennata* Walker), gusano soldado de la col (*Barathra brassicae* Linnaeus), falso medidor de la soja (*Pseudoplusia includens* Walker), gusano falso medidor de la col (*Trichoplusia ni* Hübner), gusano bellotero del algodón (*Heliothis virescens* Fabricius)); barrenadores, taladriillos, gusanos tejedores, gusanos de las bellotas del pino, orugas de la col y gusanos esqueletizadores de la familia de las Pyralidae (p. ej., barrenador europeo del maíz (*Ostrinia nubilalis* Hübner), gusano de la naranja de California (*Amyelois transitella* Walker), oruga tejedora de la raíz del maíz (*Crambus caliginosellus* Clemens), gusanos del césped (Pyralidae: *Crambinae*), tales como gusano blanco (*Herpetogramma licarsisalis* Walker), barrenador del tallo de la caña de azúcar (*Chilo infuscatellus* Snellen), barrenador del fruto del tomate (*Neoleucinodes elegantalis* Guenée), gusano verde enrollador de la hoja (*Cnaphalocrocis medinalis*), gusano enrollador de la uva (*Desmia funeralis* Hübner), gusano del melón (*Diaphania nitidalis* Stoll), larva del corazón de la col (*Helluala hydralis* Guenée), barrenador amarillo del tallo (*Scirpophaga incertulas* Walker), barrenador del inicio del tallo (*Scirpophaga infuscatellus* Snellen), barrenador blanco de tallo (*Scirpophaga innotata* Walker), barrenador del tallo terminal (*Scirpophaga nivella* Fabricius), barrenador de cabeza negra del tallo del arroz (*Chilo polychrysus* Meyrick), barrenador de franjas del arroz (*Chilo suppressalis* Walker), gusano de la cabeza de la col (*Crociodolomia binotalis* English)); enrolladores de hojas, gusanos del capullo, gusanos de semilla y gusanos de frutos en la familia de los Tortricidae (p. ej., polilla del manzano (*Cydia pomonella* Linnaeus), polilla de grano de la uva (*Endopiza viteana* Clemens), polilla oriental de la fruta (*Grapholita molesta* Busck), polilla falsa de los cítricos (*Cryptophlebia leucotreta* Meyrick), taladrador de cítricos (*Ecdytophaga aurantiana* Lima), enrollador de hojas de bandas rojas (*Argyrotaenia velutinana* Walker), enrollador de hojas bandas oblicuas (*Choristoneura rosaceana* Harris), polilla marrón clara de la manzana (*Epiphyas postvittana* Walker), polilla de bazas de la uva europea (*Eupoecilia ambiguella* Hübner), polilla de brotes de la manzana (*Pandemis pyrusana* Kearfott), enrollador de hojas omnívoro (*Platynota stultana* Walsingham), tortricido de la corteza de los frutales (*Pandemis cerasana* Hübner), tortricido marrón de la manzana (*Pandemis heparana* Denis & Schiffmüller)); y muchos otros lepidópteros económicamente importantes (p. ej., polilla de dorso de diamantes (*Plutella xilostella* Linnaeus), gusano rosado del algodón (*Pectinophora gossypiella* Saunders), polilla gitana (*Lymantria dispar* Linnaeus), barrenador del fruto del melocotonero (*Carposina niponensis* Walsingham), barrenador del melocotonero (*Anarsia lineatella* Zeller), palomilla de la patata (*Phthorimaea operculella* Zeller), minador moteado teniforme (*Lithocolletis blancardella* Fabricius), minador asiático de las hojas del manzano (*Lithocolletis ringoniella* Matsumura), enrollador de hojas del arroz (*Lerodea eufala* Edwards), minador de hojas del manzano (*Leucoptera scitella*

Zeller)); huevos, ninfas y adultos del orden de los Blattodea, incluidas cucarachas de las familias de las Blattellidae y de las Blattidae (p. ej., cucaracha oriental (*Blatta orientalis* Linnaeus), cucaracha asiática (*Blattella asahinai* Mizukubo), cucaracha alemana (*Blattella germanica* Linnaeus), cucaracha de banda marrón (*Supella longipalpa* Fabricius), cucaracha americana o voladora (*Periplaneta americana* Linnaeus), cucaracha marrón (5 *Periplaneta brunnea* Burmeister), cucaracha de Madeira (*Leucophaea maderae* Fabricius), cucaracha marrón-ahumado (*Periplaneta fuliginosa* Service), cucaracha australiana (*Periplaneta australasiae* Fabr.), cucaracha langosta (*Nauphoeta cinerea* Oliver) y cucaracha lisa (*Symploce pallens* Stephens)); huevos, larvas que se alimentan de hojas, frutas, raíces, semillas y tejido vesicular, y adultos del orden de los coleópteros, que incluyen gorgojos de las familias de los Anthribidae, los Bruchidae y los Curculionidae (p. ej., picudo del algodón (10 *Anthonomus grandis grandis* Boheman), gorgojo acuático del arroz (*Lissorhoptrus oryzophilus* Kuschel), gorgojo del trigo (*Sitophilus granarius* Linnaeus), gorgojo del arroz (*Sitophilus oryzae* Linnaeus)), picudo de las gramíneas (*Listronotus maculicollis* Dietz), picudo de la hierba que se usa como forraje (*Sphenophorus parvulus* Gillenhal), picudo de los céspedes (*Sphenophorus venatus vestitus*), picudo de Denver (*Sphenophorus cicatristriatus* Fahraeus)); pulguitas americanas, escarabajo del pepino, gusano de la raíz, escarabajos de las hojas, escarabajos de la patata de Colorado, y minadores en la familia de los Chrysomelidae (p. ej., escarabajo de la patata de Colorado (*Leptinotarsa decemlineata* Say), crisómela del maíz-WCR (*Diabrotica virgifera virgifera* LeConte)); escarabideos y otros escarabajos de la familia Scarabaeidae (p. ej., escarabajo japonés (*Popillia japónica* Newman), escarabajo oriental (*Anomala orientalis* Waterhouse, *Exomala orientalis* (Waterhouse) Baraud), gusano blanco del norte (*Cyclocephala borealis* Arrow), gusano blanco del sur (*Cyclocephala immaculata* Olivier o *C. lurida* Bland), escarabajo coprófago y gusano blanco (*Aphodius* spp.), escarabajo negro del césped del género *Ataenius* (*Ataenius spretulus* Haldeman), mayete o escarabajos de mayo (*Cotinis nitida* Linnaeus), escarabajo asiático de jardín (*Maladera castanea* Arrow), escarabajos de mayo/ junio (*Phyllophaga* spp.) y escarabidos europeo (*Rhizotrogus majalis* Razoumowsky)); escarabajos de las alfombras de la familia de los Dermestidae; gusanos de alambre de la familia de los Elateridae; escarabajos de la corteza de la familia de los Scolytidae y escarabajos de la harina de la familia de los Tenebrionidae.

Además, las plagas agrónomas y no agrónomas incluyen: huevos, adultos y larvas del orden de los dermápteros, que incluyen tijeretas de la familia de los forficúlidos (p. ej., tijereta europea (*Forficula auricularia* Linnaeus), tijereta negra (30 *Chelisoches morio* Fabricius)); huevos, inmaduros, adultos y ninfas de los órdenes de los hemípteros y homópteros, tales como chinches de las plantas de la familia de los Miridae, cigarras de la familia de los Cicadidae, insectos saltadores (p. ej., *Empoasca* spp.) de la familia de los Cicadellidae, chinches de cama (p. ej., *Cimex lectularius* Linnaeus) de la familia de los Cimicidae, cigarritas de las familias de los Fulgoridae y Delphacidae, membrácido de la familia de los Membracidae, psílidos de la familia de los Psyllidae, moscas blancas de la familia de los Aleyrodidae, áfidos de la familia de los Aphididae, filoxeras de la familia de los Phylloxeridae, chinches harinosas de la familia de los Pseudococcidae, escalas de las familias de las Coccidae, Diaspididae y Margarodidae, chinches de encaje de la familia de los Tingidae, chinches hediondas de la familia de los Pentatomidae, chinches (p. ej., chinche de las raíces (*Blissus leucopterus hirtus* Montandon) y chinches del pasto (*Blissus insularis* Barber)) y otras chinches de semillas de la familia de los Lygaeidae, salivazos de la familia de los Cercopidae, chinches de la calabaza de la familia de los Coreidae, y chinches rojos y manchadores del algodón de la familia de los Pyrrhocoridae.

Las plagas agrónomas y no agrónomas incluyen también: huevos, larvas, ninfas y adultos del orden de los Acari (ácaros), tales como ácaros araña y ácaros rojos en la familia de los Tetranychidae (p. ej., ácaro rojo europeo (45 *Panonychus ulmi* Koch), ácaro araña manchado (*Tetranychus urticae* Koch), ácaro McDaniel (*Tetranychus mcdanieli* McGregor)); ácaros planos de la familia de los Tenuipalpidae (p. ej., ácaro plano de los cítricos (*Brevipalpus lewisi* McGregor)); ácaros de la roya y del brote, de la familia de los Eriophyidae y otros ácaros que se alimentan de hojas y ácaros importantes para la salud humana y animal, es decir, ácaros del polvo en la familia de los Epidermoptidae, ácaros del folículo en la familia de los Demodicidae, ácaros de los granos en la familia de los Glycyphagidae; garrapatas en la familia de los Ixodidae, comúnmente conocidas como garrapatas duras (p. ej., garrapata de ciervo (*Ixodes scapularis* Say), garrapata australiana de la parálisis (*Ixodes holocyclus* Neumann), garrapata americana del perro (*Dermacentor variabilis* Say), garrapata estrella solitaria (*Amblyomma americanum* Linnaeus)) y garrapatas en la familia de los Argasidae, comúnmente conocidas como garrapatas suaves (p. ej., garrapata de fiebre recurrente (*Ornithodoros turicata*), garrapata de ave común (*Argas radiatus*)); ácaros de la sarna en las familias de los Psoroptidae, Pyemotidae y Sarcoptidae; huevos, adultos e inmaduros del orden de los ortópteros que incluyen saltamontes, langostas y grillos (p. ej., saltamontes migratorios (p. ej., 55 *Melanoplus sanguinipes* Fabricius, *M. differentialis* Thomas), saltamontes americanos (p. ej., *Schistocerca americana* Drury), langosta del desierto (*Schistocerca gregaria* Forskal), langosta migratoria (*Locusta migratoria* Linnaeus), langosta de arbusto (*Zonocerus* spp.), grillo doméstico (*Acheta domestica* Linnaeus), grillos topo (p. ej., grillo topo leonado (*Scapteriscus vicinus* Scudder) y grillo topo del sur (*Scapteriscus borellii* Giglio-Tos)); huevos, adultos e inmaduros del orden de los Diptera que incluyen minadores de hojas (p. ej., *Liriomyza* spp., tal como la minadora vegetal serpentina (*Liriomyza sativae* Blanchard)), mosquitos, moscas de la fruta (Tephritidae), moscas de la frita (p. ej., *Oscinella frit* Linnaeus), moscas del suelo, mosca doméstica común (p. ej., *Musca domestica* Linnaeus), moscas domésticas menores (p. ej., *Fannia canicularis* Linnaeus, *F. femoralis* Stein), moscas de establo (p. ej., *Stomoxys calcitrans* Linnaeus), moscas faciales, moscas de los cuernos, moscardones (p. ej., *Chrysomya* spp., *Phormia* spp.), y otras plagas de moscas muscoides, mosca del caballo (p. ej., *Tabanus* spp.), mosca del tórulo (p. ej., *Gastrophilus* spp., *Oestrus* spp.), tórulos (p. ej., *Hypoderma* spp.), mosca del ciervo (p. ej., *Chrysops* spp.), moscas melófagas (p. ej., *Melophagus ovinus* Linnaeus) y otros braquíceros,

mosquitos (p. ej., *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp.), moscas negras (p. ej., *Prosimulium* spp., *Simulium* spp.), jejenes, moscas de la arena, ciáridos, y otros nematóceros; huevos, adultos e inmaduros del orden de los tisanópteros que incluyen trips de la cebolla (*Thrips tabaci* Lindeman), trips de flor (*Frankliniella* spp.), y otros trips de alimentación foliar; plagas de insectos del orden de los himenópteros que incluyen hormigas de la familia de los Formicidae que incluyen la hormiga carpintera de Florida (*Camponotus floridanus* Buckley), hormiga carpintera roja (*Camponotus ferrugineus* Fabricius), hormiga carpintera negra (*Camponotus pennsylvanicus* De Geer), hormiga de pie blanco (*Technomyrmex albipes* fr. Smith), hormigas cabezonas (*Pheidole* spp.), hormiga fantasma (*Tapinoma melanocephalum* Fabricius); hormiga faraona (*Monomorium pharaonis* Linnaeus), hormiga de fuego pequeña (*Wasmannia auropunctata* Roger), hormiga de fuego (*Solenopsis geminata* Fabricius), hormiga de fuego roja importada (*Solenopsis invicta* Buren), hormiga argentina (*Iridomyrmex humilis* Mayr), hormiga loca (*Paratrechina longicornis* Latreille), hormiga del pavimento (*Tetramorium caespitum* Linnaeus), hormiga del maizal (*Lasius alienus* Förster) y hormiga olorosa doméstica (*Tapinoma sessile* Say). Otros himenópteros que incluyen abejas (incluidas abejas carpinteras), avispones, avispas amarillas, avispas y sínfitos (especies *Neodiprion*; *Cephus* spp.); plagas de insectos del orden de los Isoptera que incluyen termitas en las Termitidae (p. ej., *Macrotermes* sp., *Odontotermes obesus* Rambur), Kalotermitidae (p. ej., *Cryptotermes* sp.) y familias de las Rhinotermitidae (p. ej., *Reticulitermes* sp., *Coptotermes* sp., *Heterotermes tenuis* Hagen), la termita subterránea oriental (*Reticulitermes flavipes* Kollar), termita subterránea occidental (*Reticulitermes hesperus* Banks), termita subterránea de Formosa (*Coptotermes formosanus* Shiraki), termita de la madera seca de las Indias Occidentales (*Incisitermes immigrans* Snyder), termita de la madera (*Cryptotermes brevis* Walker), termita de la madera seca (*Incisitermes snyderi* Light), termita subterránea sudoriental (*Reticulitermes virginicus* Banks), termita de la madera seca occidental (*Incisitermes minor* Hagen), termitas arbóreas, tales como *Nasutitermes* sp. y otras termitas de importancia económica; plagas de insectos del orden de los tisanuros, tales como lepisma (*Lepisma saccharina* Linnaeus) e insecto de fuego (*Thermobia domestica* Packard); plagas de insectos del orden de los Mallophaga y que incluyen el piojo de la cabeza (*Pediculus humanus capitis* De Geer), piojo del cuerpo (*Pediculus humanus* Linnaeus), piojo del cuerpo de la gallina (*Menacanthus stramineus* Nitzsch), piojo mordedor del perro (*Trichodectes canis* De Geer), piojo del plumón (*Goniocotes gallinae* De Geer), piojo del cuerpo de la oveja (*Bovicola ovis* Schrank), piojo de nariz corta de ganado (*Haematopinus eurysternus* Nitzsch), piojo de nariz larga de ganado (*Linognathus vituli* Linnaeus) y otros piojos parasíticos que succionan y mastican, que atacan a personas y animales; plagas de insectos del orden de los Sifonápteros que incluyen la pulga de la rata (*Xenopsylla cheopis* Rothschild), pulga de gato (*Ctenocephalides felis* Bouche), pulga de perro (*Ctenocephalides canis* Curtis), pulga de gallina (*Ceratophyllus gallinae* Schrank), pulga pegajosa de las aves (*Echidnophaga gallinacea* Westwood), pulga del ser humano (*Pulex irritans* Linnaeus) y otras pulgas que aquejan a mamíferos y aves. Las plagas adicionales de artrópodos cubiertas incluyen: arañas en el orden de los Araneae, tales como la araña café (*Loxosceles reclusa* Gertsch & Mulaik) y la araña viuda negra (*Latrodectus mactans* Fabricius), y centípedos en el orden de los Scutigeraomorpha, tales como el ciempiés doméstico (*Scutigera coleoptrata* Linnaeus).

Los ejemplos de plagas de invertebrados del grano almacenado incluyen el barrenador de grano mayor (*Prostephanus truncatus*), barrenador de grano menor (*Rhyzopertha dominica*), gorgojo del arroz (*Stiophilus oryzae*), gorgojo del maíz (*Stiophilus zeamais*), gorgojo caupí (*Callosobruchus maculatus*), escarabajo rojo de la harina (*Tribolium castaneum*), gorgojo de granero (*Stiophilus granarius*), polilla india de la comida (*Plodia interpunctella*), escarabajo mediterráneo de la harina (*Ephestia kuhniella*) y escarabajo de grano plano o tostado (*Cryptolestis ferrugineus*).

Los compuestos de la presente invención pueden tener actividad en miembros de las clases de Nematodos, Cestoda, Trematoda y Acantocéfalos, incluidos miembros económicamente importantes de los órdenes de los Strongilida, Ascaridida, Oxyurida, Rhabditida, Spirurida y Enoplida, tales como, aunque no de forma limitativa, plagas de importancia económica agrícola (i.e. nematodos agalladores del género *Meloidogyne*, nematodos de lesión del género *Pratilenchus*, nematodos de raíz rechoncha del género *Trichodorus*, etc.) y plagas de la salud humana y animal (es decir, todos los trematodos, tenias y nematodos de importancia económica, tales como *Strongilus vulgaris* en los caballos, *Toxocara canis* en los perros, *Haemonchus contortus* en las ovejas, *Dirofilaria immitis* Leidy en los perros, *Anoplocephala perfoliata* en los caballos, *Fasciola hepatica* Linnaeus en los rumiantes, etc.).

Los compuestos de la invención pueden tener actividad contra plagas en el orden de los Lepidópteros (p. ej., *Alabama argillacea* Hübner (gusano de hoja de algodón), *Archips argyrospila* Walker (enrollador de hojas de los frutos), *A. rosana* Linnaeus (enrollador de hojas europeo) y otras especies *Archips*, *Chilo suppressalis* Walker (barrenador del tallo del arroz), *Cnaphalocrosis medinalis* Guenée (enrollador de hojas de arroz), *Crambus caliginosellus* Clemens (oruga tejedora de la raíz del maíz), *Crambus teterrellus* Zincken (gusanos tejedores del pasto), *Cydia pomonella* Linnaeus (gusano de la pera y la manzana), *Earias insulana* Boisduval (oruga espinosa del algodón), *Earias vittella* Fabricius (gusano moteado), *Helicoverpa armigera* Hübner (gusano americano del algodón), *Helicoverpa zea* Boddie (gusano de la mazorca), *Heliothis virescens* Fabricius (gusano bellotero), *Herpetogramma licarsisalis* Walker (gusano del césped), *Lobesia botrana* Denis & Schiffermuller (polilla del grano de la uva), *Pectinophora gossypiella* Saunders (oruga rosada), *Phyllocnistis citrella* Stainton (barrenador de cítricos), *Pieris brassicae* Linnaeus (mariposa blanca grande de la col), *Pieris rapae* Linnaeus (mariposa blanca pequeña de la col), *Plutella xilostella* Linnaeus (polilla de dorso de diamante), *Spodoptera exigua* Hübner (gusano soldado del betabel), *Spodoptera litura* Fabricius (gusano gris del tabaco, oruga de racimo), *Spodoptera frugiperda* J. E. Smith (gusano cogollero), *Trichoplusia ni* Hübner (falso medidor de la col) y *Tuta absoluta* Meyrick (polilla barredora del tomate)).

Los compuestos de la invención tienen una actividad significativa en miembros del orden de los Homoptera que incluyen: *Acyrtosiphon pisum* Harris (pulgón del guisante), *Aphis craccivora* Koch (pulgón del caupí), *Aphis fabae* Scopoli (pulgón de la alubia negra), *Aphis gossypii* Glover (pulgón del algodón, pulgón del melón), *Aphis pomi* De Geer (pulgón de la manzana), *Aphis spiraecola* Patch (pulgón verde de los cítricos), *Aulacorthum solani* Kaltentbach (pulgón de la dedalera), *Chaetosiphon fragaefolii* Cockerell (pulgón de la fresa), *Diuraphis noxia* Kurdjumov/Mordvilko (pulgón ruso del trigo), *Dysaphis plantaginea* Paaserini (pulgón rosáceo del manzano), *Eriosoma lanigerum* Hausmann (pulgón lanoso del manzano), *Hyalopterus pruni* Geofroy (pulgón harinoso de la ciruela), *Lipaphis erysimi* Kaltentbach (pulgón del nabo), *Metopolophium dirrhodum* Walker (pulgón de los cereales), *Macrosiphum euphorbiae* Thomas (pulgón de la patata), *Myzus persicae* Sulzer (pulgón del melocotón y de la patata, pulgón verde del melocotonero), *Nasonovia ribisnigri* Mosley (pulgón de la lechuga), *Pemphigus* spp. (pulgones rizófagos y pulgones de las agallas), *Rhopalosiphum maidis* Fitch (pulgón de la hoja del maíz), *Rhopalosiphum padi* Linnaeus (pulgón de tallo o negrilla), *Schizaphis graminum* Rondani (pulgón de los cereales), *Sitobion avenae* Fabricius (pulgón inglés de grano), *Therioaphis maculata* Buckton (pulgón manchado de la alfalfa), *Toxoptera aurantii* Boyer de Fonscolombe (pulgón negro de los cítricos) y *Toxoptera citricida* Kirkaldy (pulgón marrón de los cítricos); especies *Adelges* (adélgidos); *Phylloxera devastatrix* Pergande (filoxera del nogal americano); *Bemisia tabaci* Gennadius (mosca blanca del tabaco, mosca blanca del camote), *Bemisia argentifolii* Bellows & Perring (mosca blanca de la hoja plateada), *Dialeurodes citri* Ashmead (mosca blanca de los cítricos) y *Trialeurodes vaporariorum* Westwood (mosca blanca de los invernaderos); *Empoasca fabae* Harris (saltador de la patata), *Laodelphax striatellus* Fallen (saltador de plantas marrón), *Macrolestes quadrilineatus* Forbes (saltador del áster), *Nephotettix cincticeps* Uhler (saltador verde), *Nephotettix nigropictus* Stål (saltador del arroz), *Nilaparvata lugens* Stål (saltador marrón), *Peregrinus maidis* Ashmead (saltador de la planta del maíz), *Sogatella furcifera* Horváth (saltador de lomo blanco), *Sogatodes orizicola* Muir (delfácidos del arroz), *Typhlocyba pomaria* McAtee (chicharrita blanca de la manzana), *Erythroneoura* spp. (chicharrita de la vid); *Magiciada septendecim* Linnaeus (cigarra periódica); *Icerya purchasi* Maskell (escama algodonosa), *Quadraspidiotus perniciosus* Comstock (escama de San Jose); *Pianococcus citri* Risso (piojo harinoso de los cítricos); especies *Pseudococcus* (otro complejo de piojo harinoso); *Cacopsilla piricola* Foerster (psila del peral), *Trioza diospiri* Ashmead (psilidos del caqui).

Los compuestos de esta invención tienen, además, actividad sobre miembros del orden de los Hemiptera que incluyen: *Acrosternum hilare* Say (chinche verde hedionda), *Anasa tristis* De Geer (chinche de la calabaza), *Blissus leucopterus leucopterus* Say (chinche del pasto), *Cimex lectularius* Linnaeus (chinche de cama), *Corythuca gossypii* Fabricius (chinche de encaje del algodón), *Cyrtopeltis modesta* Distant (chinche del tomate), *Dysdercus suturellus* Herrich Schäffer (manchadores de la fibra de algodón), *Euchistus servus* Say (chinche apestosa café), *Euchistus variolarius* Palisot de Beauvois (chinche apestosa manchada), *Graptosthetus* spp. (complejo de chinches de la semilla), *Halymorpha halys* Stål (chinche apestosa marmórea marrón), *Leptoglossus corculus* Say (insecto de la semilla del pie de la hoja de pino), *Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois (chinche delustrado de planta), *Nezada viridula* Linnaeus (chinche verde), *Oebalus pugnax* Fabricius (chinche apestosa del arroz), *Oncopeltus fasciatus* Dallas (chinche grande de algodoncillo), *Pseudatomoscelis seriatus* Reuter (pulga saltona del algodonoero). Otros órdenes de insectos controlados por los compuestos de la invención incluyen los Thysanoptera (p. ej., *Frankliniella occidentalis* Pergande (trips occidentales de las flores), *Scirtothrips citri* Moulton (trips de los cítricos), *Sericothrips variabilis* Beach (trips del Soja) y *Thrips tabaci* Lindeman (trips de la cebolla); y el orden de los coleópteros (p. ej., *Leptinotarsa decemlineata* Say (escarabajo de la patata de Colorado), *Epilachna varivestis* Mulsant (escarabajo mexicano del frijol) y gusanos alambre de los géneros *Agriotes*, *Athous* o *Limonijs*).

Obsérvese que algunos sistemas de clasificación contemporáneos colocan a los homópteros como un suborden dentro del orden de los hemípteros.

Es de destacar el uso de los compuestos de esta invención para controlar los trips occidentales de las flores (*Frankliniella occidentalis*). Es de destacar el uso de los compuestos de esta invención para controlar el saltador de la patata (*Empoasca fabae*). Es de destacar el uso de los compuestos de esta invención para controlar el pulgón del melón y algodón (*Aphis gossypii*). Es de destacar el uso de los compuestos de esta invención para controlar el pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*). Es de destacar el uso de los compuestos de esta invención para controlar la mosca blanca del camote (*Bemisia tabaci*).

Los compuestos de la presente invención también pueden ser útiles para aumentar el vigor de una planta cultivada. Este método comprende poner en contacto la planta de cultivo (p. ej., follaje, flores, frutas o raíces), o la semilla de la que se cultiva la planta, con un compuesto de Fórmula 1 en una cantidad suficiente para lograr el efecto deseado de vigor de la planta (es decir, la cantidad biológicamente efectiva). Típicamente, el compuesto de Fórmula 1 se aplica en una composición formulada. Aunque el compuesto de Fórmula 1, frecuentemente, se aplica directamente a la planta cultivada o a sus semillas, también se puede aplicar al lugar de la planta cultivada, es decir, el entorno de la plantas cultivadas, especialmente la parte del entorno suficientemente cerca para permitir al compuesto de Fórmula 1 migrar a la planta cultivada. El lugar relevante para este método más habitualmente comprende el medio de cultivo (es decir, el medio que proporciona los nutrientes a la planta), por lo general, el terreno donde se cultiva la planta. El tratamiento de una planta cultivada para aumentar el vigor de la planta cultivada comprende, por lo tanto, poner en contacto la planta cultivada, la semilla de la que se cultiva la planta cultivada o el lugar de la planta cultivada con una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de Fórmula 1.

65

Un aumento en el vigor del cultivo puede producir uno o más de los siguientes efectos observados: (a) establecimiento óptimo del cultivo, como se demuestra con una germinación de la semilla, una emergencia del cultivo y unos rodales del cultivo excelentes; (b) crecimiento mejorado del cultivo, como se demuestra por el rápido y robusto crecimiento de las hojas (p. ej., medido mediante el índice de superficie foliar), la altura de la planta, el número de vástagos (p. ej., para el arroz), la masa radicular y el peso seco total de la masa vegetativa del cultivo; (c) rendimientos mejorados de los cultivos, como se demuestra mediante el tiempo hasta la floración, la duración de la floración, el número de flores, la acumulación de biomasa total (es decir, cantidad de producción) y/o la comerciabilidad del nivel de la fruta o del grano del producto (i.e. calidad de la producción); (d) capacidad mejorada del cultivo para soportar o prevenir las infecciones de enfermedades de las plantas y las infestaciones de las plagas de artrópodos, nematodos o moluscos; y (e) mayor capacidad del cultivo para resistir las tensiones ambientales, tales como la exposición a extremos térmicos, humedad insuficiente o químicos fitotóxicos.

Los compuestos de la presente invención pueden aumentar el vigor de plantas tratadas en comparación con plantas no tratadas, mediante el exterminio o, de cualquier otra forma, prevenir la alimentación de plagas de invertebrados fitófagos en el entorno de las plantas. En ausencia de dicho control de plagas de invertebrados fitófagos, las plagas reducen el vigor de las plantas al consumir los tejidos vegetales o la savia, o al transmitir patógenos de plantas, tales como los virus. Incluso en ausencia de plagas de invertebrados fitófagos, los compuestos de la invención pueden aumentar el vigor de las plantas mediante la modificación del metabolismo de las plantas. Generalmente, el vigor de una planta de cultivo se incrementará lo más significativamente al tratar la planta con un compuesto de la invención, si la planta se cultiva en un ambiente no ideal, es decir, un ambiente que comprenda uno o más aspectos adversos para evitar que la planta logre el potencial genético completo que mostraría en un entorno ideal.

Es de destacar un método para aumentar el vigor de una planta de cultivo, en donde la planta de cultivo se cultiva en un entorno que comprenda plagas de invertebrados fitófagos. También es de destacar un método para aumentar el vigor de una planta de cultivo, en donde la planta de cultivo se cultiva en un entorno que no comprenda plagas de invertebrados fitófagos. También es de destacar un método para aumentar el vigor de una planta de cultivo, en donde la planta de cultivo se cultiva en un entorno que comprenda una cantidad de humedad menor que la ideal para soportar el crecimiento de la planta de cultivo. Es de destacar un método para aumentar el vigor de una planta de cultivo, en donde el cultivo es arroz. También es de destacar un método para aumentar el vigor de una planta de cultivo, en donde el cultivo es maíz. También es de destacar un método para aumentar el vigor de una planta de cultivo, en donde el cultivo es soja.

Los compuestos de esta invención también pueden mezclarse con uno o más de otros compuestos o agentes biológicamente activos que incluyan insecticidas, fungicidas, nematocidas, bactericidas, acaricidas, herbicidas, protectores de herbicidas, reguladores del crecimiento, tales como inhibidores de muda de insectos y estimulantes del enraizamiento, quimioesterilizantes, semioquímicos, repelentes, atrayentes, feromonas, estimulantes de la alimentación, otros compuestos biológicamente activos o bacterias entomopatógenicas, virus u hongos para formar un pesticida multicomponente que proporcione un espectro aún más amplio de utilidad agronómica y no agronómica. Por lo tanto, la presente invención también se refiere a una composición que comprende una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de Fórmula 1, al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en surfactantes, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, y al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional. Para mezclas de la presente invención, los otros compuestos o agentes biológicamente activos se pueden formular junto con los compuestos presentes, incluidos los compuestos de Fórmula 1, para formar una premezcla, o los otros compuestos o agentes biológicamente activos se pueden formular de manera separada de los presentes compuestos, incluidos los compuestos de Fórmula 1, y las dos formulaciones combinadas antes de la aplicación (p. ej., en un depósito de pulverización) o, alternativamente, aplicadas en sucesión.

Ejemplos de tales compuestos o principios biológicamente activos con los que los compuestos de esta invención pueden formularse son insecticidas tales como abamectina, acefato, acequinocilo, acetamiprida, acrinatrina, [(3*S*,4*R*,4*aR*,6*S*,6*aS*,12*R*,12*aS*,12*bS*)-3-[(ciclopropilcarbonil)oxi]-1,3,4,4*a*,5,6,6*a*,12,12*a*,12*b*-decahidro-6,12-dihidroxi-4,6*a*,12*b*-trimetil-11-oxo-9-(3-piridinil)-2*H*,11*H*-naphtho[2,1-*b*]pirano[3,4-*e*]piran-4-il]metil ciclopropanecarboxilato) de afidopiropeno, amidoflumet, amitraz, avermectina, azadiractina, azinfos-metilo, benfuracarb, bensultap, bifentrina, bifenazato, bistriflurón, borato, buprofezina, cadusafos, carbarilo, carbofurano, cartap, carzol, clorantraniliprol, clorfenapir, clorfluazurón, clorpirifos, clorpirifos-metilo, cromafenoza, clofentezina, clotianidina, ciantraniliprol (3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-*N*-[4-ciano-2-metil-6-[(metilamino)carbonil]fenil]-1*H*-pirazole-5-carboxamida), ciclaniliprole (3-bromo-*N*-[2-bromo-4-cloro-6-[[1-(1-ciclopropiletil)amino]carbonil]fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1*H*-pirazole-5-carboxamida), cicloprotrina, cicloxaprid ((5*S*,8*R*)-1-[(6-cloro-3-piridinil)metil]-2,3,5,6,7,8-hexahidro-9-nitro-5,8-Epoxi-1*H*-imidazo[1,2-*a*]azepina) ciflumetofeno, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, gamma-cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, zeta-cipermetrina, ciromacina, deltametrina, diafentiurón, diazinon, dieltrina, diflubenzurón, dimeflutrina, dimehipo, dimetoato, dinotefurano, diofenolano, emamectina, endosulfano, esfenvalerato, etiprol, etofenprox, etoxazol, óxido de fenbutaína, fenitrotión, fenotiocarb, fenoxicarb, fenpropatrina, fenvalerato, fiprolina, (2-etil-3,7-dimetil-6-[4-(trifluorometoxi)fenoxi]-4-quinolinil metil carbonato) de flometoquina, flonicamida, flubendiamida, flucitrinato, flufenerim, flufenoxurona, flufenoxistrobina ((α)-2-[[2-cloro-4-(trifluorometil)fenoxi]metil]- α -(metoximetilene)benzeneacetato de metilo), flufensulfona (5-cloro-2-[(3,4,4-trifluoro-3-buten-1-il)sulfonil]thiazole), fluhexafon, fluopiram, flupiprole ((1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-5-[(2-metil-2-propen-1-il)amino]-4-[(trifluorometil)sulfonil]-1*H*-pirazole-3-carbonitrilo), flupiradifurona ((4-[[6-cloro-3-piridinil]metil](2,2-difluoroetil)amino]-2(5*H*)-furanona), fluvalinato, tau-fluvalinato, fonofós, formetanato, fostiazato,

halofenozida, heptaflutrina (2,2-dimetil-3-[(1Z)-3,3,3-trifluoro-1-propen-1-il]ciclopropanecarboxilato de [2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)fenil]metilo), hexaflumurona, hexitiazox, hidrametilnona, imidacloprid, indoxacarb, jabones insecticidas, isofenfos, lufenurona, malatión, meperflutrina ((1R,3S)-3-(2,2-dicloroethenil)-2,2-dimetilciclopropanecarboxilato de [2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)fenil]metilo), metaflumizona, metaldehído, 5 metamidofos, metidación, metiodicarb, metomilo, metopreno, metoxicloro, metoflutrina, metoxifenozida, metoflutrina, monocrotófós, monofluorotrina (3-(2-ciano-1-propen-1-il)-2,2-dimetilciclopropanecarboxilato de [2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)fenil]metilo), nicotina, nitenpiram, nitiacina, novalurona, noviflumurona, oxamil, parationa, parationa-metilo, permetrina, forato, fosalona, fosmet, fosfamidón, pirimicarb, profenofós, proflutrina, propargita, protrifenbuto, piflubumida (1,3,5-trimetil-N-(2-metil-1-oxopropil)-N-[3-(2-metilpropil)-4-[2,2,2-trifluoro-1-metoxi-1-(trifluorometil)etil]fenil]-1H-pirazole-4-carboxamida), pimetrozina, pirafluprol, piretrina, piridabeno, piridalil, 10 pirifluquinazona, piriminostrobina ((αE)-2-[[2-[(2,4-diclorofenil)amino]-6-(trifluorometil)-4-pirimidinil]oxi]metil]-α-(metoximetilene)benzeneacetato de metilo), piriprol, piriproxifeno, rotenona, rianodina, silafluofeno, espinetoram, espinosad, espirodiclofeno, espiromesifeno, espirotetramato, sulprofos, sulfoxaflor (N-[metiloxido[1-[6-(trifluorometil)-3-piridinil]etil]-λ⁴-sulfanilidene]cyanamida), tebufenocida, tebufenpirad, teflubenzurón, tefluburón, terbufós, tetraclorvinfós, tetrametrina, tetrametilflutrina (2,2,3,3-tetrametilciclopropanecarboxilato de [2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)fenil]metilo), tetraniliprol, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodio, tiozafafeno (3-fenil-5-(2-tienil)-1,2,4-oxadiazol), tolfenpirad, tralometrina, triazamato, triclorfón, triflumezopirim (2,4-dioxo-1-(5-pirimidinilmetil)-3-[3-(trifluorometil)fenil]-2H-pirido[1,2-a]pirimidinio, sal interna), triflumurona, delta-endotoxinas de *Bacillus thuringiensis*, bacterias entomopatógenas, virus entomopatógenos y hongos entomopatógenos.

Son de destacar insecticidas tales como abamectina, acetamiprida, acrinatrina, afidopiropen, amitraz, avermectina, azadiractina, benfuracarb, bensultap, bifentrina, buprofezina, cadusafos, carbarilo, cartap, clorantraniliprol, clorfenapir, clorpirifos, clotianidina, ciantraniliprol, ciclanilprole, cicloprotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, gamma-cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, zeta-cipermetrina, ciromacina, deltametrina, dieldrina, dinotefurano, 25 diofenolano, emamectina, endosulfano, esfenvalerato, etiprol, etofenprox, etoxazol, fenitrotion, fenotiocarb, fenoxicarb, fenvalerato, fipronil, flometoquin, flonicamida, flubendiamida, flufenoxurona, flufenoxistrobina, flufensulfona, flupiprol, flupiradifurona, fluvalinato, formetanato, fostiazato, heptaflutrin, hexaflumurón, hidrametilnón, imidacloprid, indoxacarb, lufenurona, meperflutrin, metaflumizona, metiodicarb, metomilo, metopreno, metoxifenozida, metoflutrina, monofluorothrin, nitenpiram, nitiacina, novalurona, oxamil, piflubumida, pimetrozina, piretrina, piridabeno, piridalil, 30 piriminostrobin, piriproxifeno, rianodina, espinetoram, espinosad, espirodiclofen, espiromesifeno, espirotetramato, sulfoxaflor, tebufenocida, tetrametrina, tetrametilflutrin, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodio, tralometrina, triazamato, triflumezopirim, triflumurón, delta-endotoxinas de *Bacillus thuringiensis*, todas las cepas de *Bacillus thuringiensis* y todas las cepas de los virus de la polyhedrosis nuclear.

Una realización de los agentes biológicos, para mezclar con los compuestos de la presente invención, incluye la bacteria entomopatógena, tales como la *Bacillus thuringiensis*, y delta-endotoxinas encapsuladas de *Bacillus thuringiensis*, tales como los bioinsecticidas MVP® y MVPII® preparados mediante el proceso CellCap® (CellCap®, MVP® y MVPII® son marcas registradas de Mycogen Corporation, Indianápolis, Indiana, EE. UU.); los hongos entomopatógenos, tales como la muscardina verde; y virus entomopatógenos (tanto de origen natural como modificados genéticamente), que incluyen baculovirus, virus nucleopolihedros (NPV), tales como el nucleopolihedrovirus *Helicoverpa zea* (HzNPV), el nucleopolihedrovirus de *Anagrapha falcifera* (AfNPV); y el virus de la granulosis (GV), tales como el virus de la granulosis *Cydia pomonella* (CpGV).

Es de destacar una combinación tal en donde el otro ingrediente activo para el control de plagas invertebradas pertenece a una clase química diferente, o tiene un sitio de acción distinto que el compuesto de Fórmula 1. En algunos casos, una combinación con al menos otro ingrediente activo para el control de plagas invertebradas que tenga un espectro de control similar, pero un sitio de acción diferente, será particularmente ventajoso para la gestión de la resistencia. Por lo tanto, una composición de la presente invención puede comprender, además, una cantidad biológicamente efectiva de al menos un ingrediente activo adicional para el control de plagas de invertebrados que tenga un espectro de control similar, pero que pertenezca a una clase química distinta, o que tenga un sitio distinto de acción. Estos compuestos o agentes biológicamente activos adicionales incluyen, aunque no de forma limitativa, inhibidores de la acetilcolinesterasa (AChE), tales como carbamatos metomilo, oxamilo, tiodicarb, triazamato y organofosfatos clorpirifos; antagonistas del canal de cloruro dependientes de GABA, tales como los ciclodienos, dieldrina y endosulfán, y los fenilpirazoles, etiprol y fipronil; moduladores del canal de sodio, tales como lo piretroides, bifentrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, deltametrina, dimeflutrina, esfenvalerato, metoflutrina y proflutrina; los agonistas del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR), tales como la neonicotinoides, acetamiprida, clotianidina, dinotefurano, imidacloprid, nitenpiram, nitiacina, tiacloprid y tiametoxam, y sulfoxaflor; activadores alostéricos del receptor nicotínico de la acetilcolina (nAChR), tales como las espinosinas espinetoram y espinosad; activadores del canal de cloruro, tales como las avermectinas abamectina y emamectina; imitadores de la hormona juvenil, tales como diofenolano, metopreno, fenoxicarb y piriproxifeno; bloqueantes homópteros selectivos de la alimentación, tales como pimetrozina y flonicamida; inhibidores del crecimiento del ácaro, tal como el etoxazol; inhibidores de ATP sintasa mitocondrial, tal como la propargita; agentes de desacoplamiento de la fosforilación oxidativa mediante la interrupción del gradiente de protones, tal como el clorfenapir; bloqueadores del canal receptor nicotínico de la acetilcolina (nAChR), tales como los análogos de nereistoxina, cartap; inhibidores de la biosíntesis de la quitina, tales como las benzotilureas flufenoxurona, hexaflumurona, lufenurona, novalurona, noviflumurona y triflumurona, y buprofezina; interruptores de la muda dípteros, tal como la ciromacina; agonistas del receptor de la ecdisona, tales como las diacilhidrazinas, metoxifenozida y tebufenocida; agonistas del

receptor de octopamina, tal como el amitraz; inhibidores del transporte de electrones del complejo mitocondrial III, tal como el hidrametilnon; inhibidores del transporte de electrones del complejo mitocondrial I, tal como el piridaben; bloqueadores del canal de sodio dependientes de voltaje, tal como el indoxacarb; inhibidores de la acetil CoA carboxilasa, tales como los ácidos tetrónicos y tetrámicos, espiromesifeno y espirotetramat; inhibidores del transporte de electrones del complejo
 5 mitocondrial II, tales como los β -quetonitrilos cienopirafeno y ciflumetofeno; moduladores del receptor de rianidina, tales como las diamidas antranílicas clorantraniliprol, ciantraniliprol y ciantraniliprol, diamidas, tal como la flubendiamida, y ligandos del receptor de rianodina, tal como la rianodina; compuestos en donde el sitio objetivo responsable de la actividad biológica es desconocido o no está caracterizado, tales como azadiractina, bifenazato, piridalilo, pirifluquinazon y triflumezopirim; disruptores microbianos de membranas de intestino medio de insecto tales como *Bacillus thuringiensis* y las delta-endotoxinas que estos producen y *Bacillus sphaericus*; y agentes biológicos incluidos nucleo polyhedro virus (virus de nucleopolihedro NPV) y otros virus insecticidas naturales o modificados genéticamente.
 10

Otros ejemplos de compuestos o principios biológicamente activos con los que los compuestos de esta invención pueden formularse, son: fungicidas, tales como acibenzolar-S-metil, aldimorf, ametocradina, amisulbrom, anilazina, azaconazol, azoxistrobina, benalaxil (incluido benalaxil-M), benodanilo, benomilo, bentiavalicarb (incluido bentiavalicarb-isopropilo), benzovindiflupir, betoxazina, binapacril, bifenilo, bitertanol, bixafeno, blasticidina-S, boscalida, bromuconazol, bupirimato, butiobato, carboxina, carpropamid, captafol, captan, carbendazima, cloroneb, clorotalonil, clozolinato, hidróxido de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre, coumoxistrobin, ciazofamida, ciflufenamida, cimoxanilo, ciproconazol, ciprodinilo, diclofluanida, diclocimet, diclomezina, dicloran, dietofencarb, difenoconazol, diflumetorim, dimetirimol, dimetomorf, dimoxistrobina, diniconazol (incluido diniconazol-M), dinocap, ditionona, ditiolanos, dodemorf, dodina, econazol, etaconazol, edifenfos, enoxastrobin (también conocido como enestroburina), epoxiconazol, etaboxam, etirimol, etridiazol, famoxadona, fenamidona, fenaminstrobin, fenarimol, fenbuconazol, fenfuram, fenhexamida, fenoxanil, fenciclonilo, fenpropidina, fenpropimorf, fenpirazamina, acetato de fentin, hidróxido de fentin, ferbam, ferimzona, flometoquin, fluazinam, fludioxonil, flufenoxistrobin, flumorf, fluopicolida, fluopiram, fluoxastrobina, fluquinconazol, flusilazol, flusulfamida, flutianil, flutolanil, flutriafol, fluxapiroxad, folpet, ftalida (también conocido como ftalida), fuberidazol, furalaxil, furametpir, hexaconazol, himexazol, guazatina, imazalil, imibenconazol, iminoctadina albesilato, iminoctadine triacetato, iodicarb, ipconazol, isofetamid, iprobenfos, iprodiona, improvalcarbo, isoprotiolano, isopirazam, isotianil, kasugamicina, cresoxim-metil, mancozeb, mandipropamid, mandestrobin, maneb, mapanipirin, mepronil, meptildinocap, metalaxil (incluido metalaxilo-M/mefenoxam), metconazol, metasulfocarb, metiram, metominostrobin, metrafenona, miclobutanil, naftitine, neo-asozin (metanoarsonato férrico), nuarimol, octilinona, ofurace, orysastrobin, oxadixilo, oxathiapiprolin, ácido oxolínico, oxpoconazol, oxicarboxin, oxitetraciclina, penconazol, pencicurona, penflufeno, pentiopirad, perfurazoato, ácido fosforoso (incluidas sales del mismo, p. ej., foseetil-aluminm), picoxistrobina, piperalina, polioxina, probenazol, procloraz, procimidona, propamocarb, propiconazol, propineb, proquinazid, protiocarb, protioconazol, piraclostrobina, pirametostrobin, piraoxistrobin, pirazofos, piribencarb, piributacarb, pirifenox, piriofenona, perisoxazole, pirimetanil, pirifenox, pirrolnitrina, piroquilon, quinconazol, quinmetionate, quinoxifeno, quintoceno, siltiofam, sedaxano, simeconazol, espiroxamina, estreptomina, azufre, tebuconazol, tebufloquin, teclofthalam, tecloftalam, tecnaceno, terbinafina, tetraconazol, tiabendazol, tifulzamide, tiofanato, tiofanato-metilo, tiram, tiadinilo, tolclofos-metilo, tolprocarb, tolfluanid, triadimefon, triadimenol, triarimol, triazóxido, sulfato de cobre tribásico, triclopiricarb, tridemorf, trifloxistrobina, triflumizol, triciclazol trimoprhamide, trifloxistrobina, triforina, triticonazol, uniconazol, validamicina, valifenalato (también conocido como valifenal), vinclozolina, zineb, ziram, zoxamida y 1-[4-[4-[5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-3-isoxazolil]-2-thiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona; nematocidas tales como fluopiram, espirotetramato, tiodicarb, fostiazato, abamectina, iprodiona, fluensulfona, disulfuro de dimetilo, tioxafen, 1,3-dicloropropeno (1,3-D), metam (sodio y potasio), dazomet, cloropicrina, fenamifos, etoprofos, cadusafos, terbufos, imiciafos, oxamil, carbofurano, tioxafen, *Bacillus firmus* y *Pasteuria nishizawae*; bactericidas tales como la estreptomina; acaricidas tales como amitraz, quinometionato, clorobenzilato, cihexatina, dicofol, dienocloro, etoxazol, fenazaquina, óxido de fenbutatina, fenpropatrina, fenpiroximato, hexitiazox, propargita, piridabén y tebufenpirad.
 15
 20
 25
 30
 35
 40
 45

En algunos casos, las combinaciones de un compuesto de esta invención con otros compuestos o agentes (es decir, ingredientes activos) biológicamente activos (particularmente, para el control de plagas de invertebrados) pueden producir un efecto mayor que un aditivo (es decir, sinérgico). Es siempre deseable reducir la cantidad de ingredientes activos liberados en el entorno, a la vez que se asegure el control efectivo de las plagas. Cuando se produce una sinergia de los ingredientes activos para el control de plagas de invertebrados en concentraciones de aplicación que dan niveles agrónomicamente satisfactorios de control de plagas de invertebrados, dichas combinaciones pueden ser ventajosas para reducir el coste de producción del cultivo y disminuir la carga ambiental.
 50
 55

Los compuestos de esta invención y las composiciones de estos pueden aplicarse a plantas genéticamente transformadas para expresar proteínas que son tóxicas para las plagas de invertebrados (tales como las delta-endotoxinas de *Bacillus thuringiensis*). Tal aplicación puede proporcionar un espectro más amplio de protección de plantas y ser ventajoso para la gestión de la resistencia. El efecto de los compuestos para el control de plagas de invertebrados aplicados exógenamente de esta invención puede ser sinérgico con las proteínas de toxinas expresadas.
 60

Las referencias generales para estos protectores agrícolas (es decir, insecticidas, fungicidas, nematocidas, acaricidas, herbicidas y agentes biológicos) incluyen *The Pesticide Manual*, 13.^a edición, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, Reino Unido, 2003 y *The BioPesticide manual*, 2.^a edición, L. G. Copping, editor, British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, Reino Unido, 2001.
 65

Para las realizaciones donde se utilizan uno o más de estos diversos complementos de mezclado, la relación de peso de estos diversos complementos (en total) al compuesto de Fórmula 1 es típicamente entre aproximadamente 1:3000 y aproximadamente 3000:1. Destacan las relaciones de peso entre aproximadamente 1:300 y aproximadamente 300:1 (por ejemplo, relaciones entre aproximadamente 1:30 y aproximadamente 30:1). Un experto en la técnica puede determinar fácilmente mediante simple experimentación las cantidades biológicamente eficaces de ingredientes activos necesarios para el espectro deseado de actividad biológica. Es evidente que incluir estos componentes adicionales puede ampliar el espectro de las plagas de invertebrados controladas más allá del espectro controlado por el compuesto de la Fórmula 1 por sí solo.

En la Tabla A se indican combinaciones específicas de un compuesto de la Fórmula 1 con otros agentes para el control de plagas de invertebrados que ilustran las mezclas, composiciones y métodos de la presente invención. En la primera columna de la Tabla A se enumeran los agentes específicos para el control de plagas de invertebrados (p. ej., "Abamectina" en la primera línea). En la segunda columna de la Tabla A se indica el modo de acción (si se conoce) o la clase química de los agentes para el control de plagas de invertebrados. En la tercera columna de la Tabla A se indican la(s) realización(realizaciones) de los rangos de relaciones de peso para las relaciones las se puede aplicar el agente de control de plagas de invertebrados con relación a un compuesto de Fórmula 1 (p. ej., "de 50:1 a 1:50" de abamectina en relación con un compuesto de la Fórmula 1 en peso). Por lo tanto, por ejemplo, en la primera línea de la Tabla A se describe específicamente que la combinación de un compuesto de Fórmula 1 con abamectina puede aplicarse en una relación de peso entre 50:1 y 1:50. Las líneas restantes de la Tabla A deben interpretarse de manera similar. Destaca adicionalmente que en la Tabla A se indican combinaciones específicas de un compuesto de la Fórmula 1 con otros agentes para el control de plagas de invertebrados que ilustran las mezclas, composiciones y métodos de la presente invención e incluye realizaciones adicionales de rangos de relaciones de peso para relaciones de aplicación.

Tabla A

| Agente de control de plagas de invertebrados | Modo de acción o clase química | Relación de peso típica |
|--|--|-------------------------|
| Abamectina | activador del canal de cloruro | de 50:1 a 1:50 |
| Acetamiprida | agonista de receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR) | de 150:1 a 1:200 |
| Amitraz | agonistas de receptor de octopamina | de 200:1 a 1:100 |
| Avermectina | lactonas macrocíclicas | de 50:1 a 1:50 |
| Azadiractina | sitio de acción desconocido | de 100:1 a 1:120 |
| Beta-ciflutrina | moduladores del canal de sodio | de 150:1 a 1:200 |
| Bifentrina | moduladores del canal de sodio | de 100:1 a 1:10 |
| Buprofezina | inhibidores de la biosíntesis de quitina | de 500:1 a 1:50 |
| Cartap | bloqueador del canal del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR) | de 100:1 a 1:200 |
| Clorantraniliprol | modulador del receptor de rianodina | de 100:1 a 1:120 |
| Clorfenapir | desacopladores de fosforilación oxidativa | de 300:1 a 1:200 |
| Clorpirifos | inhibidor de acetilcolinesterasa | de 500:1 a 1:200 |
| Clotianidina | agonista del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR) | de 100:1 a 1:400 |
| Ciantraniliprol | Modulador del receptor de rianodina | de 100:1 a 1:120 |
| Ciflutrina | modulador del canal de sodio | de 150:1 a 1:200 |
| Cialotrina | modulador del canal de sodio | de 150:1 a 1:200 |
| Cipermetrina | modulador del canal de sodio | de 150:1 a 1:200 |
| Ciromacina | dipterano disruptor de la muda | de 400:1 a 1:50 |
| Deltametrina | moduladores del canal de sodio | de 50:1 a 1:400 |
| Dieldrina | Antagonista del canal de cloruro de apertura regulada por GABA | de 200:1 a 1:100 |
| Dinotefurano | agonista del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR) | de 150:1 a 1:200 |
| Diofenolán | mimético de la hormona juvenil | de 150:1 a 1:200 |
| Emamectina | activador del canal de cloruro | de 50:1 a 1:10 |
| Ensodulfano | Antagonista del canal de cloruro de apertura regulada por GABA | de 200:1 a 1:100 |
| Esfenvalerato | modulador del canal de sodio | de 100:1 a 1:400 |
| Etiprol | Antagonista del canal de cloruro regulado por GABA | de 200:1 a 1:100 |

ES 2 778 628 T3

| Agente de control de plagas de invertebrados | Modo de acción o clase química | Relación de peso típica |
|---|---|-------------------------|
| Fenotiocarb | | de 150:1 a 1:200 |
| Fenoxicarb | mimético de la hormona juvenil | de 500:1 a 1:100 |
| Fenvalerato | modulador del canal de sodio | de 150:1 a 1:200 |
| Fipronil | Antagonista del canal de cloruro regulado por GABA | de 150:1 a 1:100 |
| Fonicamida | bloqueador alimentación homoptera selectivo | de 200:1 a 1:10 |
| Flubendiamida | modulador del receptor de rianodina | de 100:1 a 1:120 |
| Flufenoxurona | inhibidor de la biosíntesis de quitina | de 200:1 a 1:100 |
| Hexaflumurona | inhibidor de la biosíntesis de quitina | de 300:1 a 1:50 |
| Hidrametilnona | inhibidores del complejo III de transporte electrónico mitocondrial | de 150:1 a 1:250 |
| Imidacloprid | agonista del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR) | de 1000:1 a 1:1000 |
| Indoxacarb | bloqueador del canal de sodio dependiente de voltaje | de 200:1 a 1:50 |
| Lambda-cialotrina | modulador del canal de sodio | de 50:1 a 1:250 |
| Lufenurona | inhibidor de la biosíntesis de quitina | de 500:1 a 1:250 |
| Metaflumizona | bloqueador del canal de sodio dependiente de voltaje | de 200:1 a 1:200 |
| Metomilo | inhibidor de acetilcolinesterasa | de 500:1 a 1:100 |
| Metopreno | mimético de la hormona juvenil | de 500:1 a 1:100 |
| Metoxifeno | agonista del receptor de ecdisona | de 50:1 a 1:50 |
| Nitenpiram | agonista del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR) | de 150:1 a 1:200 |
| Nitiazina | agonista del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR) | de 150:1 a 1:200 |
| Novalurona | inhibidor de la biosíntesis de quitina | de 500:1 a 1:150 |
| Oxamilo | inhibidores de acetilcolinesterasa | de 200:1 a 1:200 |
| Pimetrozina | bloqueador alimentación homoptera selectivo | de 200:1 a 1:100 |
| Piretrina | modulador del canal de sodio | de 100:1 a 1:10 |
| Piridabeno | inhibidor del complejo I de transporte electrónico mitocondrial | de 200:1 a 1:100 |
| Piridaliilo | sitio de acción desconocido | de 200:1 a 1:100 |
| Piriproxifeno | mimético de la hormona juvenil | de 500:1 a 1:100 |
| Rianodina | ligando del receptor de rianodina | de 100:1 a 1:120 |
| Espinetoram | activador alostérico del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR) | de 150:1 a 1:100 |
| Espinosad | activadores alostéricos del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR) | de 500:1 a 1:10 |
| Espirodiclofeno | inhibidor de acetil CoA carboxilasa | de 200:1 a 1:200 |
| Espiromesifeno | inhibidor de acetil CoA carboxilasa | de 200:1 a 1:200 |
| Tebufenozida | agonista del receptor de ecdisona | de 500:1 a 1:250 |
| Tiacloprida | agonista del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR) | de 100:1 a 1:200 |
| Tiametoxam | agonista del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR) | de 1250:1 a 1:1000 |
| Tiodicarb | inhibidores de acetilcolinesterasa | de 500:1 a 1:400 |
| Tiosultap-sodio | bloqueador del canal del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR) | de 150:1 a 1:100 |
| Tralometrina | modulador del canal de sodio | de 150:1 a 1:200 |
| Triazamato | inhibidores de acetilcolinesterasa | 250:1 a 1:100 |
| Triflumezopirim | | |
| Triflumurona | inhibidor de la síntesis de quitina | de 200:1 a 1:100 |
| <i>Bacillus thuringiensis</i> | agentes biológicos | de 50:1 a 1:10 |
| Delta-endotoxina de <i>Bacillus thuringiensis</i> | agentes biológicos | de 50:1 a 1:10 |

| Agente de control de plagas de invertebrados | Modo de acción o clase química | Relación de peso típica |
|--|--------------------------------|-------------------------|
| NPV (p. ej., Gemstar) | agentes biológicos | de 50:1 a 1:10 |

Destaca la composición de la presente invención en donde el al menos un compuesto o principio biológicamente activo adicional se selecciona de los agentes para el control de plagas de invertebrados indicados en la Tabla A anterior.

- 5 Las relaciones de peso de un compuesto, incluido un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal de este, al agente adicional para el control de plagas invertebradas son, típicamente, entre 1000:1 y 1:1000, siendo otra realización entre 500:1 y 1:500, y siendo otra realización entre 250:1 y 1:200 y siendo otra realización entre 100:1 y 1:50.

- 10 A continuación, en las Tablas B1 a B8, se indican realizaciones de composiciones específicas que comprenden un compuesto de Fórmula 1 (los números de compuesto se refieren a compuestos de la Tabla de índice A) y un agente adicional para el control de plagas de invertebrados.

Tabla B1

| Mezcla n.º | Comp. N.º | y | Agente de control de plagas de invertebrados | Mezcla n.º | Comp. N.º | y | Agente de control de plagas de invertebrados |
|------------|-----------|---|--|------------|-----------|---|---|
| B1-1 | 2 | y | Abamectina | B1-38 | 2 | y | Indoxacarb |
| B1-2 | 2 | y | Acetamiprida | B1-39 | 2 | y | Lambda-cialotrina |
| B1-3 | 2 | y | Amitraz | B1-40 | 2 | y | Lufenurona |
| B1-4 | 2 | y | Avermectina | B1-41 | 2 | y | Metaflumizona |
| B1-5 | 2 | y | Azadiractina | B1-42 | 2 | y | Metomilo |
| B1-6 | 2 | y | Bensultap | B1-43 | 2 | y | Metopreno |
| B1-7 | 2 | y | Beta-ciflutrina | B1-44 | 2 | y | Metoxifenoza |
| B1-8 | 2 | y | Bifentrina | B1-45 | 2 | y | Nitenpiram |
| B1-9 | 2 | y | Buprofezina | B1-46 | 2 | y | Nitiazina |
| B1-10 | 2 | y | Cartap | B1-47 | 2 | y | Novalurona |
| B1-11 | 2 | y | Clorantropiliprol | B1-48 | 2 | y | Oxamilo |
| B1-12 | 2 | y | Clorfenapir | B1-49 | 2 | y | Fosmet |
| B1-13 | 2 | y | Clorpirifos | B1-50 | 2 | y | Pimetrozina |
| B1-14 | 2 | y | Clotianidina | B1-51 | 2 | y | Piretrina |
| B1-15 | 2 | y | Ciantraniliprol | B1-52 | 2 | y | Piridabeno |
| B1-16 | 2 | y | Ciflutrina | B1-53 | 2 | y | Piridaililo |
| B1-17 | 2 | y | Cialotrina | B1-54 | 2 | y | Piriproxifeno |
| B1-18 | 2 | y | Cipermetrina | B1-55 | 2 | y | Rianodina |
| B1-19 | 2 | y | Ciromacina | B1-56 | 2 | y | Espinetoram |
| B1-20 | 2 | y | Deltametrina | B1-57 | 2 | y | Espinosad |
| B1-21 | 2 | y | Dieldrina | B1-58 | 2 | y | Espirodiclofeno |
| B1-22 | 2 | y | Dinotefurano | B1-59 | 2 | y | Espiromesifeno |
| B1-23 | 2 | y | Diofenolán | B1-60 | 2 | y | Espirotetramat |
| B1-24 | 2 | y | Emamectina | B1-61 | 2 | y | Sulfoxaflor |
| B1-25 | 2 | y | Ensodulfano | B1-62 | 2 | y | Tebufenozida |
| B1-26 | 2 | y | Esfenvalerato | B1-63 | 2 | y | Teflutrina |
| B1-27 | 2 | y | Etiprol | B1-64 | 2 | y | Tiacloprida |
| B1-28 | 2 | y | Fenotiocarb | B1-65 | 2 | y | Tiametoxam |
| B1-29 | 2 | y | Fenoxicarb | B1-66 | 2 | y | Tiodicarb |
| B1-30 | 2 | y | Fenvalerato | B1-67 | 2 | y | Tiosultap-sodio |
| B1-31 | 2 | y | Fipronil | B1-68 | 2 | y | Tolfenpirad |
| B1-32 | 2 | y | Flonicamida | B1-69 | 2 | y | Tralometrina |
| B1-33 | 2 | y | Flubendiamida | B1-70 | 2 | y | Triazamato |
| B1-34 | 2 | y | Flufenoxurona | B1-71 | 2 | y | Triflumezopirim |
| B1-35 | 2 | y | Hexaflumurona | B1-72 | 2 | y | Triflumurona |
| B1-36 | 2 | y | Hidrametilnona | B1-73 | 2 | y | <i>Bacillus thuringiensis</i> |
| B1-37 | 2 | y | Imidacloprid | B1-74 | 2 | y | Delta-endotoxina de <i>Bacillus thuringiensis</i> |
| | | | | B1-75 | 2 | y | NPV (p. ej., Gemstar) |

Tabla B4

La Tabla B4 es idéntica a la Tabla B1, salvo que cada referencia al compuesto 2 en la columna titulada “Comp. n.º” se reemplaza por una referencia al compuesto 48. Por ejemplo, la primera mezcla de la Tabla B4 se designa B4-1 y es una mezcla del compuesto 48 y el agente adicional para el control de plagas de invertebrados abamectina.

En las mezclas específicas indicadas en las Tablas B1 y B4 se combinan típicamente un compuesto de Fórmula 1 con el otro agente para plagas de invertebrados en las relaciones indicadas en la Tabla A.

- 10 A continuación en las Tablas C1 y C4 figuran mezclas específicas que comprenden un compuesto de Fórmula 1 (números de compuesto (Comp. n.º) se refieren a los compuestos de la Tabla de índice A) y un agente adicional para el control de plagas de invertebrados. En las Tablas C1 y C4 se indican además relaciones de peso específicas típicas de las mezclas de las Tablas C1 y C4. Por ejemplo, la primera entrada de relación de peso de la primera línea de la Tabla C1 describe específicamente la mezcla del Compuesto 2 de la Tabla de índice A con abamectina aplicada en una relación de peso de 100 partes del Compuesto 2 a 1 parte de abamectina.
- 15

Tabla C1

| Mezcla n.º | Comp. N.º | y | Agente de control de plagas de invertebrados | Relaciones de mezcla típicas (en peso) | | | | | | | | |
|------------|-----------|---|--|--|------|-----|-----|-----|-----|-----|------|-------|
| | | | | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-1 | 2 | y | Abamectina | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-2 | 2 | y | Acetamiprida | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-3 | 2 | y | Amitraz | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-4 | 2 | y | Avermectina | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-5 | 2 | y | Azadiractina | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-6 | 2 | y | Bensultap | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-7 | 2 | y | Beta-ciflutrina | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-8 | 2 | y | Bifentrina | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-9 | 2 | y | Buprofezina | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-10 | 2 | y | Cartap | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-11 | 2 | y | Clorantraniliprol | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-12 | 2 | y | Clorfenapir | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-13 | 2 | y | Clorpirifos | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-14 | 2 | y | Clotianidina | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-15 | 2 | y | Ciantraniliprol | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-16 | 2 | y | Ciflutrina | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-17 | 2 | y | Cialotrina | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-18 | 2 | y | Cipermetrina | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-19 | 2 | y | Ciromacina | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-20 | 2 | y | Deltametrina | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-21 | 2 | y | Dieldrina | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-22 | 2 | y | Dinotefurano | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-23 | 2 | y | Diofenolán | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-24 | 2 | y | Emamectina | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-25 | 2 | y | Ensodulfano | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-26 | 2 | y | Esfenvalerato | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-27 | 2 | y | Etiprol | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-28 | 2 | y | Fenotiocarb | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-29 | 2 | y | Fenoxicarb | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-30 | 2 | y | Fenvalerato | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-31 | 2 | y | Fipronil | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-32 | 2 | y | Flonicamida | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-33 | 2 | y | Flubendiamida | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-34 | 2 | y | Flufenoxurona | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-35 | 2 | y | Hexaflumurona | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-36 | 2 | y | Hidrametilnona | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-37 | 2 | y | Imidacloprid | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-38 | 2 | y | Indoxacarb | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |

| | | | | | | | | | | | | |
|-------|---|---|---|-------|------|-----|-----|-----|-----|-----|------|-------|
| C1-39 | 2 | y | Lambda-cialotrina | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-40 | 2 | y | Lufenurona | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-41 | 2 | y | Metaflumizona | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-42 | 2 | y | Metomilo | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-43 | 2 | y | Metopreno | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-44 | 2 | y | Metoxifenozida | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-45 | 2 | y | Nitenpiram | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-46 | 2 | y | Nitiazina | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-47 | 2 | y | Novalurona | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-48 | 2 | y | Oxamilo | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-49 | 2 | y | Fosmet | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-50 | 2 | y | Pimetrozina | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-51 | 2 | y | Piretrina | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-52 | 2 | y | Piridabeno | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-53 | 2 | y | Piridalilo | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-54 | 2 | y | Piriproxifeno | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-55 | 2 | y | Rianodina | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-56 | 2 | y | Espinetoram | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-57 | 2 | y | Espinosad | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-58 | 2 | y | Espiroidiclofeno | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-59 | 2 | y | Espiromesifeno | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-60 | 2 | y | Espirotetramat | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-61 | 2 | y | Sulfoxaflor | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-62 | 2 | y | Tebufenozida | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-63 | 2 | y | Teflutrina | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-64 | 2 | y | Tiacloprida | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-65 | 2 | y | Tiametoxam | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-66 | 2 | y | Tiodicarb | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-67 | 2 | y | Tiosultap-sodio | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-68 | 2 | y | Tolfenpirad | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-69 | 2 | y | Tralometrina | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-70 | 2 | y | Triazamato | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-71 | 2 | y | Triflumezopirim | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-72 | 2 | y | Triflumurona | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-73 | 2 | y | <i>Bacillus thuringiensis</i> | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-74 | 2 | y | Delta-endotoxina de <i>Bacillus thuringiensis</i> | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |
| C1-75 | 2 | y | NPV (p. ej., Gemstar) | 100:1 | 10:1 | 5:1 | 2:1 | 1:1 | 1:2 | 1:5 | 1:10 | 1:100 |

Tabla C4

5 La Tabla C4 es idéntica a la Tabla C1, salvo que cada referencia al compuesto 2 en la columna titulada “Comp. n.º” se reemplaza por una referencia al compuesto 48. Por ejemplo, la primera entrada de la relación de peso de la primera línea de la Tabla C4 describe específicamente la mezcla del Compuesto 48 con abamectina aplicada en una relación de peso de 100 partes Compuesto 48 a 1 parte de abamectina.

10 A continuación en las Tablas D1 y D4 figuran realizaciones de composiciones específicas que comprenden un compuesto de Fórmula 1 (números de compuestos (Comp. n.º) se refieren a los compuestos de la Tabla de índice A) y un fungicida adicional.

Tabla D1

| Mezcla n.º | Comp. N.º | y | Fungicida | Mezcla n.º | Comp. N.º | y | Fungicida |
|------------|-----------|---|------------|------------|-----------|---|---------------|
| D1-1 | 2 | y | Probenazol | D1-17 | 2 | y | Difenoconazol |
| D1-2 | 2 | y | Tiadinil | D1-18 | 2 | y | Ciproconazol |
| D1-3 | 2 | y | Isotianil | D1-19 | 2 | y | Propiconazol |

| | | | | | | | |
|-------|---|---|------------------|-------|---|---|--------------------|
| D1-4 | 2 | y | Piroquilon | D1-20 | 2 | y | Fenoxanil |
| D1-5 | 2 | y | Metominostrobin | D1-21 | 2 | y | Ferimzona |
| D1-6 | 2 | y | Flutolanilo | D1-22 | 2 | y | Ftalida |
| D1-7 | 2 | y | Validamicina | D1-23 | 2 | y | Kasugamicina |
| D1-8 | 2 | y | Furametpir | D1-24 | 2 | y | Picoxistrobina |
| D1-9 | 2 | y | Pencicurona | D1-25 | 2 | y | Pentopirad |
| D1-10 | 2 | y | Simeconazol | D1-26 | 2 | y | Famoxadona |
| D1-11 | 2 | y | Orysastrobina | D1-27 | 2 | y | Cimoxanilo |
| D1-12 | 2 | y | Trifloxistrobina | D1-28 | 2 | y | Proquinazid |
| D1-13 | 2 | y | Isoprotiolano | D1-29 | 2 | y | Flusilazol |
| D1-14 | 2 | y | Azoxistrobina | D1-30 | 2 | y | Mancozeb |
| D1-15 | 2 | y | Triciclazol | D1-31 | 2 | y | Hidróxido de cobre |
| D1-16 | 2 | y | Hexaconazol | D1-32 | 2 | y | Oxatiapirolina |

Tabla D4

5 La Tabla D4 es idéntica a la Tabla D1, salvo que cada referencia al compuesto 2 en la columna titulada “Comp. n.º” se reemplaza por una referencia al compuesto 48. Por ejemplo, la primera mezcla de la Tabla D4 se designa D4-1 y es una mezcla del compuesto 48 y el fungicida adicional probenazol.

10 Las plagas de invertebrados se controlan en aplicaciones agronómicas y no agronómicas mediante la aplicación de uno o más compuestos de esta invención, típicamente, en la forma de una composición, en una cantidad biológicamente efectiva, al entorno de las plagas, que incluye el lugar agronómico y/o no agronómico de la infestación, hasta el área a proteger, o directamente sobre las plagas que se han de controlar.

15 Por lo tanto, la presente invención comprende un método para controlar una plaga de invertebrados en aplicaciones agronómicas y/o no agronómicas, que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su entorno con una cantidad biológicamente eficaz de uno o más compuestos de la invención, o con una composición que comprenda al menos uno de dichos compuestos, o una composición que comprenda al menos uno de dichos compuestos y una cantidad biológicamente activa de al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional, con la condición de que el método no sea un método de tratamiento del cuerpo humano o animal mediante terapia. Los ejemplos de composiciones adecuadas que comprenden un compuesto de la invención y una cantidad biológicamente eficaz de al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional incluyen, composiciones granulares en donde el compuesto activo adicional está presente sobre el mismo gránulo que el compuesto de la invención, o en gránulos distintos de aquellos del compuesto de la invención.

25 Para lograr el contacto con un compuesto o composición de la invención para proteger a un cultivo de las plagas de invertebrados, el compuesto o composición se aplica, típicamente, a la semilla del cultivo antes de la siembra, al follaje (p. ej., hojas, tallos, flores, frutos) de las plantas de cultivo, o al terreno o a otro medio del cultivo antes o después de plantar el cultivo.

30 Una realización de un método de contacto es mediante pulverización. Alternativamente, una composición granular que comprende un compuesto de la invención puede aplicarse al follaje de la planta o a al terreno. Los compuestos de esta invención pueden suministrarse, además, eficazmente a través de la absorción de las plantas al poner en contacto la planta con una composición que comprenda un compuesto de esta invención que se aplique empapando el terreno con una formulación líquida, una formulación granular al terreno, un tratamiento de caja de vivero o una inmersión de trasplantes. Es de destacar una composición de la presente invención en forma de una formulación líquida para empapar el terreno. También es de destacar un método para controlar una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados, o su entorno, con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de la presente invención o con una composición que comprenda una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de la presente invención. También es de destacar este método en donde el entorno es el terreno y la composición se aplica al terreno como una formulación para empapar el terreno. También es de destacar que los compuestos de esta invención también son efectivos mediante la aplicación localizada en el lugar de la infestación. Otros métodos de contacto incluyen la aplicación de un compuesto o una composición de la invención mediante pulverización directa y residual, fumigaciones aéreas, geles, recubrimientos de semillas, microencapsulaciones, absorción sistémica, cebos, marcas auriculares, bolos, vaporizadores, fumigantes, aerosoles, polvos y muchos otros. Una realización de un método de contacto es un gránulo, barra o tableta fertilizante dimensionalmente estable que comprende un compuesto o composición de la invención. Los compuestos de esta invención pueden impregnarse, además, en materiales para fabricar dispositivos para el control de invertebrados (p. ej., redes para insectos).

50 Los compuestos de la invención son útiles para tratar todas las plantas, partes de plantas y semillas. Las variedades de plantas y semillas, y los cultivares pueden obtenerse por métodos convencionales de propagación y cultivo, o por métodos de ingeniería genética. Las plantas o semillas genéticamente modificadas (plantas o semillas transgénicas) son aquellas en las que un gen heterólogo (transgén) se ha integrado de forma estable en

el genoma de la planta o de la semilla. Un transgén que se define por su ubicación particular en el genoma de la planta, se denomina una transformación o un evento transgénico.

5 Los cultivares de las plantas y semillas modificadas genéticamente que pueden tratarse según la invención, incluyen aquellos que son resistentes contra uno o más estreses bióticos (plagas, tales como nematodos, insectos, ácaros, hongos, etc.) o estreses abióticos (sequía, baja temperatura, salinidad del terreno, etc.), o que
10 contengan otras características deseadas. Las plantas y las semillas pueden modificarse genéticamente para mostrar rasgos de, por ejemplo, tolerancia a los herbicidas, resistencia a insectos, perfiles de aceite modificados o tolerancia a la sequía. En la tabla Z se indican plantas modificadas genéticamente útiles y semillas que contienen transformaciones de un solo gen o combinaciones de transformaciones. La información adicional para las modificaciones genéticas indicadas en la tabla Z pueden obtenerse de las siguientes bases de datos:

<http://www2.oecd.org/biotech/byidentifier.aspx>

<http://www.aphis.usda.gov>

<http://gmoinfo.jrc.ec.europa.eu>

15 En la tabla Z que se indica a continuación se usan las siguientes abreviaturas: tol. es tolerancia, res. es resistencia, SU es sulfonilurea, ALS es acetolactato sintasa, HPPD es 4-hidroxifenilpiruvato dioxigenasa, ND ¿no está disponible?

Tabla Z

20

| Cosecha | Nombre de la transformación | Código de la transformación | Rasgo(s) | Gen(es) |
|---------------------|-----------------------------|-----------------------------|--|----------------------------------|
| Alfalfa | J101 | MON-00101-8 | Tol. glifosato | cp4 epsps (aroA:CP4) |
| Alfalfa | J163 | MON-ØØ163-7 | Tol. glifosato | cp4 epsps (aroA:CP4) |
| Colza* | 23-18-17 (Modificación 18) | CGN-89465-2 | Aceite de ácido láurico de alto peso molecular | te |
| Colza* | 23-198 (Modificación 23) | CGN-89465-2 | Aceite de ácido láurico de alto peso molecular | te |
| Colza* | 61061 | DP-Ø61Ø61-7 | Tol. glifosato | gat4621 |
| Colza* | 73496 | DP-Ø73496-4 | Tol. glifosato | gat4621 |
| Colza* | GT200 (RT200) | MON-89249-2 | Tol. glifosato | cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247 |
| Colza* | GT73 (RT73) | MON-ØØØ73-7 | Tol. glifosato | cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247 |
| Colza* | HCN10 (Topas 19/2) | ND | Tol. glufosinato | Bar |
| Colza* | HCN28 (T45) | ACS-BNØØ8-2 | Tol. glufosinato | pat (syn) |
| Colza* | HCN92 (Topas 19/2) | ACS-BNØØ7-1 | Tol. glufosinato | Bar |
| Colza* | MON88302 | MON-883Ø2-9 | Tol. glifosato | cp4 epsps (aroA:CP4) |
| Colza* | MPS961 | ND | Ruptura de fitato | phyA |
| Colza* | MPS962 | ND | Ruptura de fitato | phyA |
| Colza* | MPS963 | ND | Ruptura de fitato | phyA |
| Colza* | MPS964 | ND | Ruptura de fitato | phyA |
| Colza* | MPS965 | ND | Ruptura de fitato | phyA |
| Colza* | MS1 (B91-4) | ACS-BNØØ4-7 | Tol. glufosinato | bar |
| Colza* | MS8 | ACS-BNØØ5-8 | Tol. glufosinato | bar |
| Colza* | OXY-235 | ACS-BNØ11-5 | Tol. oxinilo | bxn |
| Colza* | PHY14 | ND | Tol. glufosinato | bar |
| Colza* | PHY23 | ND | Tol. glufosinato | bar |
| Colza* | PHY35 | ND | Tol. glufosinato | bar |
| Colza* | PHY36 | ND | Tol. glufosinato | bar |
| Colza* | RF1 (B93-101) | ACS-BNØØ1-4 | Tol. glufosinato | bar |
| Colza* | RF2 (B94-2) | ACS-BNØØ2-5 | Tol. glufosinato | bar |
| Colza* | RF3 | ACS-BNØØ3-6 | Tol. glufosinato | bar |
| Legumbre | EMBRAPA 5.1 | EMB-PV051-1 | Res. enfermedad | ac1 (sentido y antisentido) |
| Brinjal (Berenjena) | EE-1 | | Res. insectos | cry1Ac |
| Clavel | 11 (7442) | FLO-07442-4 | Tol. SU; color de flor modificado | surB; dfr; hfl (f3'5'h) |
| Clavel | 11363 (1363A) | FLO-11363-1 | Tol. SU; color de flor modificado | surB; dfr; bp40 (f3'5'h) |
| Clavel | 1226A (11226) | FLO-11226-8 | Tol. SU; color de flor modificado | surB; dfr; bp40 (f3'5'h) |

ES 2 778 628 T3

| | | | | |
|-----------|------------------|--------------|-----------------------------------|--------------------------|
| Clavel | 123.2.2 (40619) | FLO-40619-7 | Tol. SU; color de flor modificado | surB; dfr; hfl (f3'5'h) |
| Clavel | 123.2.38 (40644) | FLO-40644-4 | Tol. SU; color de flor modificado | surB; dfr; hfl (f3'5'h) |
| Clavel | 123.8.12 | FLO-40689-6 | Tol. SU; color de flor modificado | surB; dfr; bp40 (f3'5'h) |
| Clavel | 123.8.8 (40685) | FLO-40685-1 | Tol. SU; color de flor modificado | surB; dfr; bp40 (f3'5'h) |
| Clavel | 1351A (11351) | FLO-11351-7 | Tol. SU; color de flor modificado | surB; dfr; bp40 (f3'5'h) |
| Clavel | 1400A (11400) | FLO-11400-2 | Tol. SU; color de flor modificado | surB; dfr; bp40 (f3'5'h) |
| Clavel | 15 | FLO-00015-2 | Tol. SU; color de flor modificado | surB; dfr; hfl (f3'5'h) |
| Clavel | 16 | FLO-00016-3 | Tol. SU; color de flor modificado | surB; dfr; hfl (f3'5'h) |
| Clavel | 4 | FLO-00004-9 | Tol. SU; color de flor modificado | surB; dfr; hfl (f3'5'h) |
| Clavel | 66 | FLO-00066-8 | Tol. SU; senescencia retardada | surB; acc |
| Clavel | 959A (11959) | FLO-11959-3 | Tol. SU; color de flor modificado | surB; dfr; bp40 (f3'5'h) |
| Clavel | 988A (11988) | FLO-11988-7 | Tol. SU; color de flor modificado | surB; dfr; bp40 (f3'5'h) |
| Clavel | 26407 | IFD-26497-2 | Tol. SU; color de flor modificado | surB; dfr; bp40 (f3'5'h) |
| Clavel | 25958 | IFD-25958-3 | Tol. SU; color de flor modificado | surB; dfr; bp40 (f3'5'h) |
| Achicoria | RM3-3 | ND | Tol. glufosinato | bar |
| Achicoria | RM3-4 | ND | Tol. glufosinato | bar |
| Achicoria | RM3-6 | ND | Tol. glufosinato | bar |
| Algodón | 19-51a | DD-01951A-7 | Tol. herbicida ALS | S4-HrA |
| Algodón | 281-24-236 | DAS-24236-5 | Tol. glufosinato; res. insectos | pat (syn); cry1F |
| Algodón | 3006-210-23 | DAS-21023-5 | Tol. glufosinato; res. insectos | pat (syn); cry1Ac |
| Algodón | 31707 | ND | Tol. oxinilo; res. insectos | bxn; cry1Ac |
| Algodón | 31803 | ND | Tol. oxinilo; res. insectos | bxn; cry1Ac |
| Algodón | 31807 | ND | Tol. oxinilo; res. insectos | bxn; cry1Ac |
| Algodón | 31808 | ND | Tol. oxinilo; res. insectos | bxn; cry1Ac |
| Algodón | 42317 | ND | Tol. oxinilo; res. insectos | bxn; cry1Ac |
| Algodón | BNLA-601 | ND | Res. insectos | cry1Ac |
| Algodón | BXN10211 | BXN10211-9 | Tol. oxinilo | bxn; cry1Ac |
| Algodón | BXN10215 | BXN10215-4 | Tol. oxinilo | bxn; cry1Ac |
| Algodón | BXN10222 | BXN10222-2 | Tol. oxinilo | bxn; cry1Ac |
| Algodón | BXN10224 | BXN10224-4 | Tol. oxinilo | bxn; cry1Ac |
| Algodón | COT102 | SYN-IR102-7 | Res. insectos | vip3A(a) |
| Algodón | COT67 | BSYN-IR67B-1 | Res. insectos | cry1Ab |
| Algodón | COT202 | | Res. insectos | vip3A |
| Algodón | Modificación 1 | ND | Res. insectos | cry1Ac |
| Algodón | GMF CriIA | GTL-GMF311-7 | Res. insectos | cry1Ab-Ac |
| Algodón | GHB119 | BCS-GH005-8 | Res. insectos | cry2Ae |
| Algodón | GHB614 | BCS-GH002-5 | Tol. glifosato | 2mepsps |
| Algodón | GK12 | ND | Res. insectos | cry1Ab-Ac |
| Algodón | LLCotton25 | ACS-GH001-3 | Tol. glufosinato | bar |
| Algodón | MLS 9124 | ND | Res. insectos | cry1C |
| Algodón | MON1076 | MON-89924-2 | Res. insectos | cry1Ac |
| Algodón | MON1445 | MON-01445-2 | Tol. glifosato | cp4 epsps (aroA:CP4) |
| Algodón | MON15985 | MON-15985-7 | Res. insectos | cry1Ac; cry2Ab2 |
| Algodón | MON1698 | MON-89383-1 | Tol. glifosato | cp4 epsps (aroA:CP4) |
| Algodón | MON531 | MON-00531-6 | Res. insectos | cry1Ac |
| Algodón | MON757 | MON-00757-7 | Res. insectos | cry1Ac |
| Algodón | MON88913 | MON-88913-8 | Tol. glifosato | cp4 epsps (aroA:CP4) |

ES 2 778 628 T3

| | | | | |
|--------------------|-------------------|--------------|---|--|
| Algodón | Nqwe Chi 6 Bt | ND | Res. insectos | ¿ND? |
| Algodón | SKG321 | ND | Res. insectos | cry1A CpTI |
| Algodón | T303-3 | BCS-GH003-6 | Res. insectos; tol. glufosinato | cryIAb; bar |
| Algodón | T304-40 | BCS-GH004-7 | Res. insectos; tol. glufosinato | cryIAb; bar |
| Algodón | CE43-67B | | Res. insectos | cry1Ab |
| Algodón | CE46-02A | | Res. insectos | cry1Ab |
| Algodón | CE44-69D | | Res. insectos | cry1Ab |
| Algodón | 1143-14A | | Res. insectos | cry1Ab |
| Algodón | 1143-51B | | Res. insectos | cry1Ab |
| Algodón | T342-142 | | Res. insectos | cry1Ab |
| Algodón | PV-GHGT07 (1445) | | Tol. glifosato | cp4 epsps (aroA:CP4) |
| Algodón | EE-GH3 | | Tol. glifosato | mepsps |
| Algodón | EE-GH5 | | Res. insectos | cry1Ab |
| Algodón | MON88701 | MON-88701-3 | Tol. a Dicamba y glufosinato | Dmo modificado; bar |
| Algodón | OsCr11 | | Anti alergia | Cry j modificado |
| Hierba rastrera | ASR368 | SMG-368ØØ-2 | Tol. glifosato | cp4 epsps (aroA:CP4) |
| Eucalipto | 20-C | | Tol. sal | codA |
| Eucalipto | 12-5C | | Tol. sal | codA |
| Eucalipto | 12-5B | | Tol. sal | codA |
| Eucalipto | 107-1 | | Tol. sal | codA |
| Eucalipto | 1/9/2001 | | Tol. sal | codA |
| Eucalipto | 2/1/2001 | | Tol. sal | codA |
| Eucalipto | | | Tol. frío | des9 |
| Lino | FP967 | CDC-FL001-2 | Tol. herbicida ALS | als |
| Lenteja | RH44 | | Tol. imidazolinona | als |
| Maíz | 3272 | SYN-E3272-5 | Alfa-amilasa modificada | amy797E |
| Maíz | 5307 | SYN-05307-1 | Res. insectos | ecry3.1Ab |
| Maíz | 59122 | DAS-59122-7 | Res. insectos; tol. glufosinato | cry34Ab1; cry35Ab1; pat |
| Maíz | 676 | PH-000676-7 | Tol. glufosinato; control polinización | pat; dam |
| Maíz | 678 | PH-000678-9 | Tol. glufosinato; control polinización | pat; dam |
| Maíz | 680 | PH-000680-2 | Tol. glufosinato; control polinización | pat; dam |
| Maíz | 98140 | DP-098140-6 | Tol. glifosato; Tol. herbicida ALS | gat4621 zm-hra |
| Maíz | Bt10 | ND | Res. insectos; tol. glufosinato | cry1Ab; pat |
| Maíz | BtI76 (176) | SYN-EV176-9 | Res. insectos; tol. glufosinato | cry1Ab; bar |
| Maíz | BVLA430101 | ND | Ruptura de fitato | phyA2 |
| Maíz | CBH-351 | ACS-ZM004-3 | Res. insectos; tol. glufosinato | cry9C; bar |
| Maíz | DAS40278-9 | DAS40278-9 | tol. 2,4-D | faad 1 |
| Maíz | DBT418 | DKB-89614-9 | Rres. insectos; tol. glufosinato | cryIAc; pinII; bar |
| Maíz | DLL25 (B16) | DKB-89790-5 | Tol. glufosinato | bar |
| Maíz | GA21 | MON-00021-9 | Tol. glifosato | mepsps |
| Maíz | GG25 | | Tol. glifosato | mepsps |
| Maíz | GJ11 | | Tol. glifosato | mepsps |
| Maíz | F1117 | | Tol. glifosato | mepsps |
| Maíz | GAT-ZM1 | | Tol. glufosinato | pat |
| Maíz | LY038 | REN-00038-3 | Lisina elevada | cordapA |
| Maíz | MIR162 | SYN-IR162-4 | Res. insectos | vip3Aa20 |
| Maíz | MIR604 | SYN-IR604-5 | Res. insectos | mcry3A |
| Maíz | MON801 (MON80100) | MON801 | Res. insectos; tol. glifosato | cryIAb; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247 |
| Maíz | MON802 | MON-80200-7 | Res. insectos; tol. glifosato | cryIAb; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247 |
| Maíz | MON809 | PH-MON-809-2 | Res. insectos; tol. glifosato | cryIAb; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247 |
| Maíz | MON810 | MON-00810-6 | Res. insectos; tol. glifosato | cryIAb; cp4 epsps |

ES 2 778 628 T3

| | | | | |
|---------|------------------------|----------------|---|---|
| Maíz | MON832 | ND | Tol. glifosato | (aroA:CP4); goxv247 cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247 |
| Maíz | MON863 | MON-00863-5 | Res. insectos | cry3Bbl |
| Maíz | MON87427 | MON-87427-7 | Tol. glifosato | cp4 epsps (aroA:CP4) |
| Maíz | MON87460 | MON-87460-4 | Tol. sequía | cspB |
| Maíz | MON88017 | MON-88017-3 | Res. insectos; tol. glifosato | cry3Bbl; cp4 epsps (aroA:CP4) |
| Maíz | MON89034 | MON-89034-3 | Res. insectos | cry2Ab2; criIA.105 |
| Maíz | MS3 | ACS-ZM001-9 | Tol. glufosinato; control polinización | bar; barnasa |
| Maíz | MS6 | ACS-ZM005-4 | Tol. glufosinato; control polinización | bar; barnasa |
| Maíz | NK603 | MON-00603-6 | Tol. glifosato | cp4 epsps (aroA:CP4) |
| Maíz | T14 | ACS-ZM002-1 | Tol. glufosinato | pat (syn) |
| Maíz | T25 | ACS-ZM003-2 | Tol. glufosinato | pat (syn) |
| Maíz | TC1507 | DAS-01507-1 | Res. insectos; tol. glufosinato | criIFa2; pat |
| Maíz | TC6275 | DAS-06275-8 | Res. insectos; tol. glufosinato | mocryIF; bar |
| Maíz | VIP1034 | | Res. insectos; tol. glufosinato | vip3A; pat |
| Maíz | 43A47 | DP-043A47-3 | Res. insectos; tol. glufosinato | cry1F; cry34Abl; cry35Abl; pat |
| Maíz | 40416 | DP-040416-8 | Res. insectos; tol. glufosinato | cry1F; cry34Abl; cry35Ab1; pat |
| Maíz | 32316 | DP-032316-8 | Res. insectos; tol. glufosinato | cry1F; cry34Ab1; cry35Abl; pat |
| Maíz | 4114 | DP-004114-3 | Res. insectos; tol. glufosinato | cry1F; cry34Abl; cry35Abl; pat |
| Melón | Melón A | ND | Maduración/senescencia retardada | sam-k |
| Melón | Melón B | ND | Maduración/senescencia retardada | sam-k |
| Papaya | 55-1 | CUH-CP551-8 | Res. enfermedad | prsv cp |
| Papaya | 63-1 | CUH-CP631-7 | Res. enfermedad | prsv cp |
| Papaya | Huanong n.º 1 | ND | Res. enfermedad | prsv rep |
| Papaya | X17-2 | UFL-X17CP-6 | Res. enfermedad | prsv cp |
| Petunia | Petunia-CHS | ND | Calidad de producto modificado | supre.sión de CHS |
| Ciruela | C-5 | ARS-PLMC5-6 | Res. enfermedad | ppv cp |
| Colza** | ZSR500 | ND | Tol. glifosato | cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247 |
| Colza** | ZSR502NA | Tol. glifosato | cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247 | |
| Colza** | ZSR503NA | Tol. glifosato | cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247 | |
| Chopo | Bt chopo | ND | Res. insectos | cryIAC; API |
| Chopo | Clon chopo híbrido 741 | ND | Res. insectos | cryIAC; API |
| Chopo | trg300 | | Alto contenido celulosa | AaXEG2 |
| Chopo | trg300-2 | | Alto contenido celulosa | AaXEG2 |
| Patata | 1210 amk | ND | Res. insectos | cry3A |
| Patata | 2904/1 kg | ND | Res. insectos | cry3A |
| Colza** | ZSR500 | ND | Tol. glifosato | cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247 |
| Colza** | ZSR502NA | Tol. glifosato | cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247 | |
| Patata | ATBT04-27 | NMK-89367-8 | Res. insectos | cry3A |
| Patata | ATBT04-30 | NMK-89613-2 | Res. insectos | cry3A |
| Patata | ATBT04-31 | NMK-89170-9 | Res. insectos | cry3A |
| Patata | ATBT04-36 | NMK-89279-1 | Res. insectos | cry3A |
| Patata | ATBT04-6 | NMK-89761-6 | Res. insectos | cry3A |
| Patata | BT06 | NMK-89812-3 | Res. insectos | cry3A |
| Patata | BT10 | NMK-89175-5 | Res. insectos | cry3A |

ES 2 778 628 T3

| | | | | |
|--------|-----------------------|------------------------------|---|--|
| Patata | BT12 | NMK-89601-8 | Res. insectos | cry3A |
| Patata | BT16 | NMK-89167-6 | Res. insectos | cry3A |
| Patata | BT17 | NMK-89593-9 | Res. insectos | cry3A |
| Patata | BT18 | NMK-89906-7 | Res. insectos | cry3A |
| Patata | BT23 | NMK-89675-1 | Res. insectos | cry3A |
| Patata | EH92-527-1 | BPS-25271-9 | Almidón modificado/carbohidrato | gbss (antisentido) |
| Patata | HLMT15-15 | ND | Res. insectos y enfermedad | cry3A; pvy cp |
| Patata | HLMT15-3 | ND | Res. insectos y enfermedad | cry3A pvy cp |
| Patata | HLMT15-46 | ND | Res. insectos y enfermedad | cry3A; pvy cp |
| Patata | RBMT15-101 | NMK-89653-6 | Res. insectos y enfermedad | cry3A; pvy cp |
| Patata | RBMT21-129 | NMK-89684-1 | Res. insectos y enfermedad | cry3A; plrv orf1; plrv orf2 |
| Patata | RBMT21-152 | ND | Res. insectos y enfermedad | cry3A; plrv orf1; plrv orf2 |
| Patata | RBMT21-350 | NMK-89185-6 | Res. insectos y enfermedad | cry3A; plrv orf1; plrv orf2 |
| Patata | RBMT22-082 | NMK-89896-6 | Res. insectos y enfermedad; Tol. glifosato | cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4) |
| Patata | RBMT22-186 | ND | Res. insectos y enfermedad; Tol. glifosato | cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4) |
| Patata | RBMT22-238 | ND | Res. insectos y enfermedad; Tol. glifosato | cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4) |
| Patata | RBMT22-262 | ND | Res. insectos y enfermedad; Tol. glifosato | cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4) |
| Patata | SEMT15-02 | NMK-89935-9 | Res. insectos y enfermedad | cry3A; pvy cp |
| Patata | SEMT15-07 | ND | Res. insectos y enfermedad | cry3A; pvy cp |
| Patata | SEMT15-15 | NMK-89930-4 | Res. insectos y enfermedad | cry3A; pvy cp |
| Patata | SPBT02-5 | NMK-89576-1 | Res. insectos | cry3A |
| Patata | SPBT02-7 | NMK-89724-5 | Res. insectos | cry3A |
| Arroz | 7Crp#242-95-7 | | Anti alergia | 7crp |
| Arroz | 7Crp#10 | ND | Anti alergia | 7crp |
| Arroz | GM Shanyou 63 | ND | Res. insectos | cry1Ab; cry1Ac |
| Arroz | Huahui-1/TT51-1 | ND | Res. insectos | cry1Ab; cry1Ac |
| Arroz | LLRICE06 | ACS-OS001-4 | Tol. glufosinato | bar |
| Rice | LLRICE601 | BCS-OS003-7 | Tol. glufosinato | bar |
| Arroz | LLRICE62 | ACS-OS002-5 | Tol. glufosinato | bar |
| Arroz | Tarom molaii + cry1Ab | ND | Res. insectos | cry1Ab (truncada) |
| Arroz | GAT-OS2 | | Tol. glufosinato | bar |
| Arroz | GAT-OS3 | | Tol. glufosinato | bar |
| Arroz | PE-7 | | Res. insectos | Cry1Ac |
| Arroz | 7Crp #10 | ND | Anti alergia | 7crp |
| Arroz | KPD627-8 | | Alto contenido en triptófano | OASA1D |
| Arroz | KPD722-4 | | Alto contenido en triptófano | OASA1D |
| Arroz | KA317 | | Alto contenido en triptófano | OASA1D |
| Arroz | HW5 | | Alto contenido en triptófano | OASA1D |
| Arroz | HW1 | | Alto contenido en triptófano | OASA1D |
| Arroz | B-4-1-18 | | Semienano de hojas erguidas | Δ OsBR11 |
| Arroz | G-3-3-22 | | Semienano | OSGA2oxl |
| Arroz | AD77 | | Res. enfermedad | DEF |
| Arroz | AD51 | | Res. enfermedad | DEF |
| Arroz | AD48 | | Res. enfermedad | DEF |
| Arroz | AD41 | | Res. enfermedad | DEF |
| Arroz | 13pNasNaatAprt1 | | Tol. bajo nivel de hierro | HvNAS1; HvNAAT un; APRT |
| Arroz | 13pAprtl | | Tol. bajo nivel de hierro | APRT |
| Arroz | gHvNAS1-gHvNAAT-1 | | Tol. bajo nivel de hierro | HvNAS1; HvNAAT-A; HvNAAT-B |
| Arroz | gHvIDS3-1 | Tol. bajo nivel de hierro | HvIDS3 | |
| Arroz | gHvNAAT1 | | Tol. bajo nivel de hierro | HvNAAT-A; HvNAAT-B |
| Arroz | gHvNAS1-1 | | Tol. bajo nivel de hierro | HvNAS1 |

ES 2 778 628 T3

| | | | | |
|---------------------|------------------------------|-------------|---|--|
| Arroz | NIA-OS006-4 | | Res. enfermedad | WRKY45 |
| Arroz | NIA-OS005-3 | | Res. enfermedad | WRKY45 |
| Arroz | NIA-OS004-2 | | Res. enfermedad | WRKY45 |
| Arroz | NIA-OS003-1 | | Res. enfermedad | WRKY45 |
| Arroz | NIA-OS002-9 | | Res. enfermedad | WRKY45 |
| Arroz | NIA-OS001-8 | | Res. enfermedad | WRKY45 |
| Arroz | OsCr11 | | Anti alergia | Cry j modificado |
| Arroz | 17053 | | Tol. glifosato | cp4 epsps (aroA:CP4) |
| Arroz | 17314 | | Tol. glifosato | cp4 epsps (aroA:CP4) |
| Rosa | WKS82 / 130-4-1 | IFD-52401-4 | Color de flor modificado | 5AT; bp40 (f3'5'h) |
| Rosa | WKS92 / 130-9-1 | IFD-52901-9 | Color de flor modificado | 5AT; bp40 (f3'5'h) |
| Soja | 260-05 (G94-1, G94-19, G168) | ND | Ácido graso/aceite modificado | gm-fad2-1 (silenciamiento de locus) |
| Soja | A2704-12 | ACS-GM005-3 | Tol. glufosinato | pat |
| Soja | A2704-21 | ACS-GM004-2 | Tol. glufosinato | pat |
| Soja | A5547-127 | ACS-GM006-4 | Tol. glufosinato | pat |
| Soja | A5547-35 | ACS-GM008-6 | Tol. glufosinato | pat |
| Soja | CV127 | BPS-CV127-9 | Tol. imidazolinona | csr1-2 |
| Soja | DAS68416-4 | DAS68416-4 | Tol. glufosinato | pat |
| Soja | DP305423 | DP-305423-1 | Ácido graso/aceite modificado; Tol. herbicida ALS | gm-fad2-1 (silenciamiento de locus); gm-hra |
| Soja | DP356043 | DP-356043-5 | Ácido graso/aceite modificado; tol. glifosato | gm-fad2-1 (silenciamiento de locus); gat4601 |
| Soja | FG72 | MST-FG072-3 | Tol. a glifosato y HPPD | 2mepsps hppdPF W336 |
| Soja | GTS 40-3-2 (40-3-2) | MON-04032-6 | Tol. glifosato | cp4 epsps (aroA:CP4) |
| Soja | GU262 | ACS-GM003-1 | Tol. glufosinato | pat |
| Soja | MON87701 | MON-87701-2 | Res. insectos | cry1Ac |
| Soja | MON87705 | MON-87705-6 | Ácido graso/aceite modificado; tol. glifosato | fatb1-A (sentido y antisentido); fad2-1A (sentido y antisentido); cp4 epsps (aroA:CP4) |
| Soja | MON87708 | MON-87708-9 | Tol. a dicamba y glifosato | dmo; cp4 epsps (aroA:CP4) |
| Soja | MON87769 | MON-87769-7 | Ácido graso/aceite modificado; tol. glifosato | Pj.D6D; Nc.Fad3; cp4 epsps (aroA:CP4) |
| Soja | MON89788 | MON-89788-1 | Tol. glifosato | cp4 epsps (aroA:CP4) |
| Soja | W62 | ACS-GM002-9 | Tol. glufosinato | bar |
| Soja | W98 | ACS-GM001-8 | Tol. glufosinato | bar |
| Soja | MON87754 | MON-87754-1 | Alto contenido en aceite | dgat2A |
| Soja | DAS21606 | DAS-21606 | Tol. a ariloxialcanoato y glufosinato | Aad-12 modificado; pat |
| Soja | DAS44406 | DAS-44406-6 | Tol. a ariloxialcanoato, glifosato y glufosinato | Aad-12 modificado; 2mepsps; pat |
| Soja | SYHT04R | SYN-0004R-8 | Tol. a mesotriona | Avhppd modificado |
| Soja | 9582.814.19.1 | | Res. insectos y tol. a glufosinato | cry1Ac, cry1F, PAT |
| Calabacín | CZW3 | SEM-ØCZW3-2 | Res. enfermedad | cmv cp, zymv cp, wmv cp |
| Calabacín | ZW20 | SEM-OZW20-7 | Res. enfermedad | zymv cp, wmv cp |
| Remolacha azucarera | GTSB77 (T9100152) | SY-GTSB77-8 | Tol. glifosato | cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247 |
| Remolacha azucarera | H7-1 | KM-000H71-4 | Tol. glifosato | cp4 epsps (aroA:CP4) |
| Remolacha azucarera | T120-7 | ACS-BV001-3 | Tol. glufosinato | pat |
| Remolacha azucarera | T227-1 | | Tol. glifosato | cp4 epsps (aroA:CP4) |
| Caña de azúcar | NXI-1T | | Tol. sequía | EcbetA |
| Girasol | X81359 | | Tol. imidazolinona | als |
| Pimienta dulce | PK-SP01 | ND | Res. enfermedad | cmv cp |

| | | | | |
|--------|-------------------------------|--------------|----------------------------------|--|
| Tabaco | C/F/93/08-02 | ND | Tol. oxinilo | bxn |
| Tabaco | Vector 21-41 | ND | Nicotina reducida | NtQPT1 (antisentido) |
| Tomate | 1345-4 | ND | Maduración/senescencia retardada | acc (truncada) |
| Tomate | 35-1-N | ND | Maduración/senescencia retardada | sam-k |
| Tomate | 5345 | ND | Res. insectos | cryIAc |
| Tomate | 8338 | CGN-89322-3 | Maduración/senescencia retardada | accd |
| Tomate | B | SYN-0000B-6 | Maduración/senescencia retardada | pg (sentido o antisentido) |
| Tomate | Da | SYN-0000DA-9 | Maduración/senescencia retardada | pg (sentido o antisentido) GirasolX81359 tol. a imidazolinona als |
| Tomate | Da Dong n.º 9 | ND | Producto modificado | ND |
| Tomate | F (1401F, h38F, 11013F,7913F) | SYN-0000F-1 | Maduración/senescencia retardada | pg (sentido o antisentido) |
| Tomate | FLAVR SAVR™ | CGN-89564-2 | Maduración/senescencia retardada | pg (sentido o antisentido) |
| Tomate | Huafan n.º 1 | ND | Maduración/senescencia retardada | anti-efe |
| Tomate | PK-TM8805R (8805R) | ND | Res. enfermedad | cmv cp |
| Trigo | MON71800 | MON-718ØØ-3 | Tol. glifosato | cp4 epsps (aroA:CP4) |

* Argentina, ** Polaco, # Berenjena

5 El tratamiento de plantas y semillas modificadas genéticamente con compuestos de la invención puede producir efectos superaditivos o sinérgicos. Por ejemplo, la reducción en las proporciones de aplicación, la ampliación del espectro de actividad, la mayor tolerancia a los estreses bióticos/abióticos o la estabilidad mejorada de almacenamiento pueden ser mayor de lo esperado, debido tan solo a los simples efectos aditivos de la aplicación de los compuestos de la invención en plantas y semillas genéticamente modificadas.

10 Los compuestos de esta invención también son útiles en los tratamientos de semillas para la protección de las semillas contra las plagas de invertebrados. En el contexto de la presente descripción y reivindicaciones, tratar una semilla significa poner en contacto la semilla con una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de esta invención, que se formula, típicamente, como una composición de la invención. Este tratamiento de la semilla protege la semilla de las plagas de invertebrados del terreno y, generalmente, también puede proteger a las raíces y otras partes vegetales, en contacto con el terreno de los semilleros que se desarrollan a partir de la semilla que se germina. El tratamiento de la semilla también puede proteger el follaje reubicando el compuesto de esta invención, o un segundo ingrediente activo, dentro de la planta en desarrollo. Los tratamientos de semillas se pueden aplicar a todos los tipos de semillas, incluidas aquellas semillas que germinarán de las plantas genéticamente transformadas para expresar rasgos especializados. Ejemplos representativos incluyen aquellos que expresen proteínas tóxicas para las plagas de invertebrados, tales como la toxina de *Bacillus thuringiensis* o que expresen resistencia a herbicidas, tales como el glifosato acetiltransferasa, que proporciona resistencia al glifosato. Los tratamientos de semillas con compuestos de esta invención pueden aumentar, además, el vigor de las plantas que crecen de la semilla.

25 Un método para tratar semillas consiste en pulverizar o espolvorear la semilla con un compuesto de la invención (es decir, como una composición formulada) antes de sembrar las semillas. Las composiciones formuladas para el tratamiento de las semillas comprenden, generalmente, un formador de película o agente adherente. Por lo tanto, típicamente, una composición de revestimiento de semillas de la presente invención comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo, y un formador de película o agente adherente. La semilla se puede recubrir mediante la pulverización de un concentrado fluido en suspensión directamente en un lecho giratorio de semillas y, después, secar las semillas. Alternativamente, se pueden pulverizar a la semilla otros tipos de formulaciones, tales como polvos humedecidos, soluciones, suspoemulsiones, concentrados emulsionables y emulsiones en agua. Este proceso es particularmente útil para aplicar recubrimientos de película sobre las semillas. Las diversas máquinas y procedimientos de recubrimiento están disponibles para el experto en la técnica. Los procedimientos adecuados incluyen los enumerados en P. Kusters y col., *Seed Treatment: Progress and Prospects*, 1994 BCPC Monograph n.º 57, y las referencias que se citan en el mismo.

35 Los compuestos de Fórmula 1 y sus composiciones, tanto solos como en combinación con otros insecticidas, nematocidas y fungicidas, son particularmente útiles en el tratamiento de las semillas para cultivos, que incluyen, aunque no de forma limitativa, maíz, soja, algodón, cereales (p. ej., trigo, avena, cebada, centeno y arroz), patatas, vegetales y colza.

40 Otros insecticidas con cuyos compuestos de Fórmula 1 se puede formular para proporcionar mezclas útiles en el tratamiento de semillas, incluyen abamectina, acetamiprida, acrinatrina, amitraz, avermectina, azadiractina, bensultap, bifentrina, buprofezina, cadusafos, carbarilo, carbofurano, cartap, clorantraniliprol, clorfenapir, clorpirifos,

clotianidina, ciantraniliprol, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, gamma-cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, zeta-cipermetrina, ciromazina, deltametrina, dieldrina, dinotefurano, diofenolano, emamectina, endosulfán, esfenvalerato, etiprol, etofenprox, etoxazol, fenotiocarb, fenoxicarb, fenvalerato, fipronil, flonicamida, flubendiamida, flufenoxurón, fluvalinato, formetanato, fostiazato, hexaflumurón, hidrametilnón, imidacloprid, 5 indoxacarb, lufenurona, metaflumizona, metiocarb, metomilo, metopreno, metoxifenoza, nitenpiram, nitiazina, novalurona, oxamilo, pimetrozina, piretrina, piridabeno, piridalilo, piriproxifeno, rianodina, espinetoram, espinosad, espiroclifofen, espiromesifeno, espirotetramat, sulfoxaflor, tebufenoza, tetrametrina, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap de sodio, tralometrina, triazamato, triflumurona, delta-endotoxinas de *Bacillus thuringiensis*, todas las cepas de *Bacillus thuringiensis* y todas las cepas de los virus de la polihedrosis nucleó.

10 Fungicidas con cuyos compuestos de Fórmula 1 se pueden formular para proporcionar mezclas útiles en el tratamiento de semillas, incluyen amisulbrom, azoxistrobina, boscalida, carbendazima, carboxina, cimoxanilo, ciproconazol, difenoconazol, dimetomorf, fluazinam, fludioxonil, fluquinconazol, fluopicolide, fluoxastrobina, flutriafol, fluxapiroxad, ipconazol, iprodiona, metalaxil, mefenoxam, metconazol, miclobutanilo, paclobutrazol, 15 penflufeno, picoxistrobina, protriconazol, piraclostrobina, sedaxano, siltiofam, tebuconazol, tiabendazol, tiofanato-metilo, tiram, trifloxistrobina y triticonazol.

Las composiciones que comprenden compuestos de Fórmula 1 útiles para el tratamiento de semillas pueden comprender, además, bacterias y hongos que tengan la capacidad de proporcionar protección contra los efectos 20 perjudiciales de los hongos o bacterias patógenas vegetales y/o contra animales naturales del terreno, tales como los nematodos. Las bacterias que muestran propiedades nematocidas pueden incluir, aunque no de forma limitativa, *Bacillus firmus*, *Bacillus cercus*, *Bacillus subtilis* y *Pasteuria penetrans*. Una cepa de *Bacillus firmus* adecuada es la cepa CNCM 1-1582 (GB-126) que se comercializa como BioNem™. Una cepa de *Bacillus cereus* adecuada es la cepa NCMM I-1592. Ambas cepas de *Bacillus* se describen en US-6.406.690. Otras bacterias 25 adecuadas que presentan actividad nematocida son *B. amiloliquefaciens* IN937a y la cepa de *B. subtilis* GB03. Las bacterias que presentan propiedades fungicidas pueden incluir, aunque no de forma limitativa, la cepa de *B. pumilus* GB34. Las especies fúngicas que presentan propiedades nematocidas pueden incluir, aunque no de forma limitativa, *Myrothecium verrucaria*, *Paecilomyces lilacinus* y *Purpureocillium lilacinum*.

30 Los tratamientos de semillas pueden incluir, además, uno o más agentes nematocidas de origen natural, tal como la proteína inductora llamada harpin, que se aísla de determinados patógenos bacterianos vegetales tal como *Erwinia amylovora*. Un ejemplo es la tecnología de tratamiento de semillas Harpin-N-Tek, disponible como N-Hibit™ Gold CST.

Los tratamientos de semillas también puede incluir una o más especies de bacterias nodulantes de raíces de legumbres, 35 tales como la bacteria microsimbótica fijadora de nitrógeno *Bradyrhizobium japonicum*. Estos inoculantes pueden incluir, opcionalmente, uno o más lipochitoooligosacáridos (LCOs), que son los factores de nodulación (Nod) producidos por las bacterias rizobios durante el inicio de la formación del nódulo en las raíces de las legumbres. Por ejemplo, la tecnología de la marca Optimize® para el tratamiento de semillas incorpora LCO Promoter Technology™ junto con un inoculante.

40 Los tratamientos de semillas también puede incluir una o más isoflavonas que puede aumentar el nivel de colonización de raíz mediante hongos micorrícicos. Los hongos micorrícicos mejoran el crecimiento de las plantas, aumentando en la raíz la absorción de nutrientes, tales como agua, sulfatos, nitratos, fosfatos y metales. Los ejemplos de isoflavonas incluyen, aunque no de forma limitativa, genisteína, biocanina, formononetina, daidzeína, gliciteína, hesperetina, naringenina y pratenseína. La formononetina se encuentra 45 disponible como un ingrediente activo en productos inoculantes micorrícicos, tales como PHC Colonize® AG.

Los tratamientos de semillas pueden incluir también uno o más activadores de plantas que induzcan la resistencia 50 adquirida sistémica en plantas tras contactar con un patógeno. Un ejemplo de un activador de planta que induzca tales mecanismos protectores es acibenzolar-S-metilo.

La semilla tratada comprende, típicamente, un compuesto de la presente invención en una cantidad de 55 aproximadamente 0,1 g a 1 kg por 100 kg de semillas (es decir, de aproximadamente 0,0001 a 1 % en peso de la semilla, antes del tratamiento). Una suspensión fluida formulada para el tratamiento de semillas comprende típicamente de aproximadamente 0,5 a aproximadamente 70 % del ingrediente activo, de aproximadamente 0,5 a aproximadamente 30 % de un adherente formador de película, de aproximadamente 0,5 a aproximadamente 20 % de un agente dispersante, de 0 a aproximadamente 5 % de un espesante, de 0 a aproximadamente 5 % de un pigmento y/o tinte, de 0 a aproximadamente 2 % de un agente antiespumante, de 0 a aproximadamente 1 % de un conservante, y de 0 a aproximadamente 75 % de un diluyente líquido volátil.

60 Los compuestos de esta invención pueden incorporarse en una composición de cebo que una plaga de invertebrados consuma, o usarse dentro de un dispositivo, tal como una trampa, estación de cebo y similares. Dicha composición de cebo puede estar en forma de gránulos que comprenden (a) ingredientes activos, a saber, una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1, un N-óxido o una sal del mismo; (b) uno o más materiales alimenticios; opcionalmente, (c) un agente atrayente y, opcionalmente, (d) uno o más 65 humectantes. Son de destacar las composiciones de cebo o gránulos que comprenden entre aproximadamente 0,001-5 % de ingredientes activos, aproximadamente 40-99 % de material alimenticio y/o agente atrayente; y,

opcionalmente, aproximadamente 0,05-10 % de humectantes, que son efectivos para controlar plagas de invertebrados del terreno a concentraciones de aplicación muy bajas, particularmente, en dosis de ingrediente activo que son letales mediante la ingestión, en vez de por contacto directo. Algunos materiales alimenticios pueden funcionar como una fuente alimenticia y un agente atrayente. Los materiales alimenticios incluyen 5 carbohidratos, proteínas y lípidos. Los ejemplos de materiales alimenticios son harina vegetal, azúcar, almidones, grasa animal, aceite vegetal, extractos de levadura y sólidos lácteos. Los ejemplos de agentes atrayentes son odorantes y saborizantes, tales como extractos de frutas o vegetales, perfumes u otros componentes animales o vegetales, feromonas u otros agentes que se sepan que atraen un objetivo de plagas de invertebrados. Los 10 ejemplos de humectantes, es decir, agentes que retienen la humedad, son glicoles y otros polioles, glicerina y sorbitol. Es de destacar una composición de cebo (y un método que utiliza dicha composición de cebo) que se utiliza para controlar al menos una plaga de invertebrados seleccionada del grupo que consiste en hormigas, termitas y cucarachas. Un dispositivo para controlar una plaga de invertebrados puede comprender la composición de cebo presente y una carcasa adaptada para recibir la composición de cebo, en donde la carcasa 15 tenga al menos una abertura de un tamaño que permita a la plaga de invertebrados acceder a la composición de cebo desde una ubicación exterior a la carcasa, y en donde la carcasa, además, esté adaptada para colocarse en, o cerca de, un lugar de actividad potencial o conocida de plagas de invertebrados.

Una realización de la presente invención se refiere a un método no terapéutico para controlar plagas de invertebrados, que comprende diluir la composición pesticida de la presente invención (un compuesto de Fórmula 1 formulado con 20 tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, o una mezcla formulada de un compuesto de Fórmula 1 y al menos otro pesticida) con agua y, opcionalmente, añadir un adyuvante para formar una composición diluida, y poner en contacto la plaga de invertebrados, o su entorno, con una cantidad eficaz de dicha composición diluida.

Aunque una composición por pulverización formada mediante dilución con agua de una concentración adecuada de la 25 presente composición pesticida puede proporcionar suficiente eficacia para controlar plagas de invertebrados, los productos adyuvantes formulados por separado también se pueden añadir a las mezclas de depósito de pulverización. Estos adyuvantes adicionales se conocen comúnmente como “adyuvantes de pulverización” o “adyuvantes de mezcla de depósito”, e incluyen cualquier sustancia mezclada en un depósito de pulverización para mejorar la productividad de un pesticida, o alterar las propiedades físicas de la mezcla de pulverización. Los adyuvantes pueden ser surfactantes, 30 agentes emulsionantes, aceites de cultivo a base de petróleo, aceites de semillas derivadas de cultivos, acidificantes, tampones, espesantes o agentes desespumantes. Los adyuvantes se utilizan para mejorar la eficacia (p. ej., disponibilidad biológica, adhesión, penetración, uniformidad de cobertura y durabilidad de protección), o para minimizar o eliminar los problemas de la aplicación por pulverización asociados con incompatibilidad, espumación, desvío, evaporación, volatilización y degradación. Para obtener un rendimiento óptimo, los adyuvantes se seleccionan con 35 respecto a las propiedades del ingrediente activo, la formulación y el objetivo (p. ej., cultivos, plagas de insectos).

Entre los adyuvantes de pulverización, se utilizan comúnmente aceites que incluyen aceites de cultivo, concentrados de aceites de cultivo, concentrados de aceite vegetal y concentrados de aceite metilado de semilla para mejorar la 40 eficacia de los pesticidas, posiblemente mediante el estímulo de depósitos de pulverización más uniformes y mejor distribuidos. En situaciones en las que preocupa que la fitotoxicidad se cause potencialmente por aceites u otros líquidos inmiscibles en agua, las composiciones de pulverización que se preparan a partir de la composición de la presente invención no contendrán, generalmente, adyuvantes de pulverización basados en aceite. Sin embargo, en situaciones en las que la fitotoxicidad que causan los adyuvantes de pulverización basados en aceite es 45 comercialmente insignificante, las composiciones de pulverización preparadas a partir de la composición de la presente composición también pueden contener adyuvantes de pulverización basados en aceite, que pueden aumentar potencialmente el control de las plagas de invertebrados, así como la resistencia a la lluvia.

Los productos definidos como “aceite de cultivo”, típicamente, contienen de 95 % a 98 % de parafina o aceite de petróleo basado en nafta, y de 1 a 2 % de uno o más tensioactivos que funcionan como emulsionantes. Los productos definidos 50 como “concentrados de aceite de cultivo” consisten, típicamente, en de 80 a 85 % de aceite emulsionable basado en petróleo, y en de 15 a 20 % de tensioactivos no iónicos. Los productos correctamente identificados como “concentrados de aceite vegetal” consisten, típicamente, en de 80 a 85 % de aceite vegetal (es decir, aceite de semilla o de fruto, lo más comúnmente de algodón, linaza, Soja o girasol) y en de 15 a 20 % de tensioactivos no iónicos. El rendimiento del adyuvante se puede mejorar reemplazando el aceite vegetal con ésteres metílicos de ácidos grasos que, por lo general, se 55 derivan de aceites vegetales. Los ejemplos de concentrados de aceite de semillas metilados incluyen MSO® Concentrate (UAP-Loveland Products, Inc.) y Premium MSO Metilated Spray Oil (Helena Chemical Company).

La cantidad de adyuvantes añadidos a las mezclas de pulverización, generalmente, no superan de 60 aproximadamente 2,5 % en volumen y, más generalmente, la cantidad es de aproximadamente 0,1 % a aproximadamente 1 % en volumen. Las concentraciones de aplicación de adyuvantes añadidos a las mezclas de pulverización son, típicamente, entre aproximadamente 1 y 5 l por hectárea. Ejemplos representativos de adyuvantes de pulverización incluyen: Adigor® (Syngenta) 47 % de aceite metilado de colza en hidrocarburos líquidos, Silwet® (Helena Chemical Company) heptametiltrisiloxano de polialquilenoóxido modificado, y Assist® (BASF) 17 % de mezcla tensioactivo en 83 % de aceite mineral basado en parafina.

Los compuestos de esta invención pueden aplicarse sin otros adyuvantes, pero con la máxima frecuencia la aplicación será de una formulación que comprenda uno o más ingredientes activos con portadores, diluyentes y surfactantes adecuados y, posiblemente, en combinación con un alimento en función del uso final que se contemple. Un método de aplicación implica pulverizar una dispersión de agua o solución de aceite refinado de un compuesto de la presente invención. Las combinaciones con aceites pulverizables, concentraciones de aceites pulverizables, difusores de adherencia, adyuvantes, otros disolventes y sinergistas, tales como el butóxido de piperonilo, a menudo mejoran la eficacia del compuesto. Para usos no agronómicos, tales pulverizadores pueden aplicarse desde envases de pulverización, tales como una lata, una botella u otro recipiente, ya sea por medio de una bomba o liberándolo de un envase presurizado, p. ej., un de aerosol pulverizador presurizado. Estas composiciones pulverizables pueden adoptar diversas formas, por ejemplo, rocíos, vapores, espumas, humo o niebla. Estas composiciones pulverizables pueden, además, comprender propelentes, agentes espumantes, etc., según sea el caso. Es de destacar una composición pulverizable que comprende una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto o una composición de la presente invención y un portador. Una realización de dicha composición pulverizable comprende una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto o una composición de la presente invención y un propelente. Los propelentes representativos incluyen, aunque no de forma limitativa, metano, etano, propano, butano, isobutano, buteno, pentano, isopentano, neopentano, penteno, hidrofluorocarbonos, clorofluorocarbonos, éter dimetilico y mezclas de los mismos. Es de destacar una composición pulverizable (y un método que utiliza dicha composición pulverizable que se dispensa desde un recipiente pulverizador), utilizada para controlar al menos una plaga de invertebrados, seleccionada del grupo que consiste en mosquitos, moscas negras, moscas de establo, moscas del ciervo, moscas del caballo, avispas, vespulas, avispones, garrapatas, arañas, hormigas, jején y similares, incluidos individualmente o en combinaciones.

Ejemplos biológicos de la invención

Las siguientes pruebas demuestran la eficacia de control de los compuestos de esta invención en plagas específicas. "Eficacia de control" representa la inhibición del desarrollo de la plaga de invertebrados (incluida la mortalidad) que hace que se reduzca significativamente la alimentación. Sin embargo, la protección para controlar plagas que proporcionan los compuestos no se limita a estas especies. Ver la Tabla índice A para las descripciones de los compuestos.

Metodología de formulación y pulverización para las Pruebas A-E

Los compuestos experimentales se formularon utilizando una solución que contenía 10 % de acetona, 90 % de agua y 300 ppm de tensioactivo no iónico X-77® Spreader Lo-Foam Formula que contenía alquilarilopolioxietileno, ácidos grasos libres, glicoles e isopropanol (Loveland Industries, Inc., Greeley, Colorado, EE. UU.). Los compuestos formulados se aplicaron en 1 ml de líquido a través de una boquilla de pulverizador SUJ2 con cuerpo adaptado 1/8 JJ (Spraying Systems Co., Wheaton, Illinois, EE. UU.) colocado a 1,27 cm (0,5 pulgadas) por encima de la parte superior de cada unidad de prueba. Los compuestos experimentales se pulverizaron a las concentraciones indicadas, y cada prueba se replicó tres veces.

Prueba A

Para evaluar el control de pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae* [Sulzer]) por medios de contacto y/o sistémicos, la unidad de prueba consistió en un pequeño recipiente abierto con una planta de rábano de 12-15 días de edad en su interior, que se infestó previamente colocando sobre una hoja de la planta de prueba 30-40 áfidos en una pieza de hoja extirpada de una planta de cultivo (método de hoja cortada). Los áfidos se ubicaron sobre la planta de prueba a medida que la pieza de la hoja se desecaba. Después de la infestación previa, el suelo de la unidad de prueba se cubrió con una capa de arena.

Los compuestos experimentales se formularon y pulverizaron a 250 y/o 50 ppm. Después de pulverizar el compuesto formulado experimental, se dejó secar cada unidad de prueba durante 1 hora y, a continuación, se colocó en la parte superior un tapón negro con tamiz. Las unidades de prueba se mantuvieron durante 6 días en una cámara de crecimiento a 19-21 °C y 50-70 % de humedad relativa. Después, cada unidad de prueba se evaluó visualmente para la mortalidad del insecto.

De los compuestos de Fórmula 1 probados a 250 ppm, los siguientes resultaron en al menos 80 % de mortalidad: 47 y 48.

De los compuestos de Fórmula 1 probados a 50 ppm, los siguientes resultaron en al menos 80 % de mortalidad: 2, 3, 4, 31, 33, 34, 37, 47 y 48.

Prueba B

Para evaluar el control del pulgón del algodón y melón (*Aphis gossypii* [Glover]) por medios de contacto y/o sistémicos, la unidad de prueba consistió en un pequeño recipiente abierto con una planta de algodón de 6-7 días de edad en su interior, que se infestó previamente con 30-40 insectos sobre un trozo de hoja, según el método de hoja cortada, y el suelo de la unidad de prueba se cubrió con una capa de arena.

Los compuestos experimentales se formularon y pulverizaron a 250 y/o 50 ppm. Después de la pulverización, las unidades de prueba se mantuvieron en una cámara de crecimiento durante 6 días a 19 °C y 70 % de humedad relativa. Después, cada unidad de prueba se evaluó visualmente para la mortalidad del insecto.

5 De los compuestos de Fórmula 1 probados a 250 ppm, los siguientes resultaron en al menos 80 % de mortalidad: 48.

De los compuestos de Fórmula 1 probados a 50 ppm, los siguientes resultaron en al menos 80 % de mortalidad: 2.

Prueba D

10 Para evaluar el control de las trips occidentales de las flores (*Frankliniella occidentalis*) por medios de contacto y/o sistémicos, la unidad de prueba consistió en un pequeño recipiente abierto con una planta de haba de Soleil de 5-7 días de edad en su interior.

15 Los compuestos experimentales se formularon y pulverizaron a 50 ppm. Después de la pulverización, las unidades de prueba se dejaron secar durante 1 hora, y después se añadieron 22-27 trips adultos a la unidad. Se colocó una tapa negra con tamiz en la parte superior de la unidad de prueba, y las unidades de prueba se mantuvieron durante 7 días a 25 °C y 45-55 % de humedad relativa.

20 De los compuestos de Fórmula 1 probados a 50 ppm, los siguientes mostraron niveles de eficacia de control de muy buenos a excelentes (40 % o menos daño a la plantas y/o 100 % de mortalidad): 2 y 31.

Prueba E

25 Para evaluar el control de la mosca blanca del camote (*Bemisia tabaci* [Gennadius]) por medios de contacto y/o sistémicos, la unidad de prueba consistió en un pequeño recipiente abierto con una planta de algodón de 12-14 días de edad en su interior. Antes de aplicar la pulverización, ambos cotiledones se retiraron de la planta, dejando una hoja verdadera para la prueba. Se permitió que las moscas blancas adultas pusieran huevos sobre la planta y después se retiraron de la unidad de prueba. Las plantas de algodón infestadas con al menos 15 huevos se sometieron a la prueba para la pulverización.

30 Los compuestos experimentales se formularon y pulverizaron a 250 y/o 50 ppm. Después de la pulverización, las unidades de prueba se dejaron secar durante 1 hora. A continuación, se retiraron los cilindros y las unidades se llevaron a una cámara de crecimiento y se mantuvieron durante 13 días a 28 °C y 50-70 % de humedad relativa.

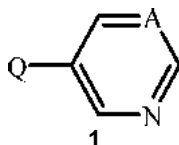
35 Después, cada unidad de prueba se evaluó visualmente para la mortalidad del insecto.

De los compuestos de Fórmula 1 probados a 250 ppm, los siguientes resultaron en al menos 50 % de mortalidad: 30 y 47.

40 De los compuestos de Fórmula 1 probados a 50 ppm, los siguientes dieron lugar a al menos 50 % de mortalidad: 30.

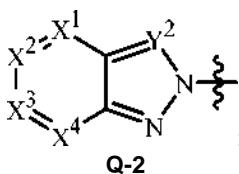
REIVINDICACIONES

1. Un compuesto seleccionado de la Fórmula 1, un *N*-óxido o sal del mismo,



en donde

Q es



A es CH;

X¹ es CR², y X², X³ y X⁴ son cada uno CH; o X² es CR², y X¹, X³ y X⁴ son cada uno CH;

R² es C(=Z)R¹¹;

Z es O o S;

Y² es CR^{5a};

R^{5a} es H;

cada R^x es independientemente halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, C(=NR¹⁰)R¹¹, C(O)OR²¹, C(O)NR¹⁵R¹⁶, OC(O)R²², NR²⁵R²⁶, NR²⁴C(O)R²², C(O)R²², S(O)_nR²³, Si(R²⁸)₃, OSi(R²⁸)₃ o Q^b;

cada R¹⁰ es independientemente OR¹², S(O)_nR¹³ o NHR¹⁴;

cada R¹¹ es independientemente H; o alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₆ o alquino C₂-C₆, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un R^x; o alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, C(O)OR²¹, C(O)NR¹⁵R¹⁶, o C(O)R²²;

cada R¹² es independientemente alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, C(O)R²², S(O)_nR¹³ o Q^b;

cada R¹³ es independientemente alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄;

R¹⁴ es alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, C(O)R²² o C(O)OR²¹; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

cada R¹⁵ es independientemente H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₄, C(O)R²⁷ o S(O)₂R²⁷; o fenilo, o un anillo aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

cada R¹⁶ es independientemente H, alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₄; o

R¹⁵ y R¹⁶ se toman junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos para formar un anillo de 3 a 7 miembros que contiene miembros anulares seleccionados de átomos de carbono, y hasta 2 heteroátomos independientemente seleccionados de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, y hasta 2 átomos de nitrógeno, en donde hasta 2 miembros anulares de átomo de carbono son independientemente seleccionados de C(=O) y C(=S) y el miembro anular de átomo de azufre se selecciona de S, S(O) o S(O)₂, estando dicho anillo no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

cada R²¹ es independientemente alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ o halocicloalquilo C₃-C₆; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

cada R²² es independientemente alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ o halocicloalquilo C₃-C₆; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

cada R²³ es independientemente alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilalquilo C₃-C₆ o halocicloalquilalquilo C₃-C₆; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo

que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

cada R²⁴ es independientemente alquilo C₁-C₄;

cada R²⁵ es independientemente H, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

cada R²⁶ es independientemente alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄; o

R²⁵ y R²⁶ se toman independientemente junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos para formar un anillo de 3 a 7 miembros que contiene miembros anulares seleccionados de átomos de carbono, y hasta 2 heteroátomos independientemente seleccionados de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, y hasta 2 átomos de nitrógeno, en donde hasta 2 miembros anulares de átomo de carbono son independientemente seleccionados de C(=O) y C(=S) y el miembro anular de átomo de azufre se selecciona de S, S(O) o S(O)₂, estando dicho anillo no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

cada R²⁷ es independientemente alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆ o NR²⁹R³⁰; o fenilo, o un anillo aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

cada R²⁸ es independientemente alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o fenilo;

cada R²⁹ es independientemente H o Q^b; o alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₆ o alquino C₂-C₆, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

cada R³⁰ es independientemente H o Q^b; o alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₆ o alquino C₂-C₆, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄; o

R²⁹ y R³⁰ se toman junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos para formar un anillo de 3 a 10 miembros que contiene miembros anulares seleccionados de átomos de carbono y hasta 2 heteroátomos independientemente seleccionados de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, y hasta 2 átomos de nitrógeno, en donde hasta 2 miembros anulares de átomo de carbono son independientemente seleccionados de C(=O) y C(=S) y el miembro anular de átomo de azufre se selecciona de S, S(O) o S(O)₂, estando dicho anillo no sustituido o sustituido con hasta 4 sustituyentes independientemente seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

cada Q^b es independientemente fenilo, un anillo aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros o un anillo no aromático heterocíclico de 3 a 6 miembros, conteniendo cada anillo miembros anulares seleccionados de átomos de carbono, y hasta 2 heteroátomos independientemente seleccionados de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, y hasta 2 átomos de nitrógeno, en donde hasta 2 miembros anulares de átomo de carbono son independientemente seleccionados de C(=O) y C(=S) y el miembro anular de átomo de azufre se selecciona de S, S(O) o S(O)₂, cada anillo no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

cada n es independientemente 0, 1 o 2;

con la condición de que el compuesto no sea éster metílico del ácido 2-(3-piridinil)-2H-indazol-5-carboxílico.

2. El compuesto de la reivindicación 1 que es 3-(metiltio)-1-[2-(3-piridinil)-2H-indazol-4-il]-1-propanona.
3. Una composición que comprende un compuesto de la reivindicación 1 o la reivindicación 2 y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, comprendiendo dicha composición opcionalmente además al menos un compuesto o principio biológicamente activo adicional.
4. La composición de la reivindicación 3, en donde el al menos un compuesto o principio biológicamente activo adicional se selecciona del grupo que consiste en abamectina, acefato, acequinocilo, acetamiprida, acrinatrina, afidopiropen, amidoflumet, amitraz, avermectina, azadiractina, azinfos-metilo, benfuracarb,

- bensultap, bifentrina, bifenazato, bistrifluron, borato, buprofezina, carbarilo, carbofurano, cartap, carzol, clorantraniliprol, clorfenapir, clorfluazurón, clorpirifos, clorpirifos-metilo, cromafenozida, clofentezina, clotianidina, ciantraniliprol, ciclaniliprol, cicloprotrina, cicloxaprid, ciflumetofeno, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, gamma-cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, zeta-cipermetrina, ciromazina, deltametrina, diafentiurón, diazinón, dieldrina, diflubenzurón, dimeflutrina, dimehypo, dimetoato, dinotefurano, diofenolano, emamectina, endosulfano, esfenvalerato, etiprol, etofenprox, etoxazol, óxido de fenbutatina, fenitrotión, fenotiocarb, fenoxicarb, fenpropatrina, fenvalerato, fipronil, flometoquin, flonicamida, flubendiamida, flucitrinato, flufenerim, flufenoxurón, flufenoxistrobin, flufensulfona, fluorpiram, flupiprole, flupiradifurona, fluvalinato, tau-fluvalinato, fonofos, formetanato, fostiazato, halofenozida, heptaflutrina, hexaflumurón, hexitiazox, hidrametilnón, imidacloprid, indoxacarb, jabones insecticidas, isofenfos, lufenurona, malatión, meperfluthrin, metaflumizona, metaldehído, metamidofos, metidation, metiodicarb, metomilo, metopreno, metoxicloro, metoflutrina, monocrotofos, monofluthrin, metoxifenoazida, nitenpiram, nitiazina, novalurón, noviflumurón, oxamilo, paratión, paratión-metilo, permetrina, forato, fosalona, fosmet, fosfamidón, pirimicarb, profenofos, proflutrina, propargita, protrifenbuto, piflubumida, pimetrozina, pirafluprol, piretrina, piridabeno, piridalilo, pirifluquinazona, piriminostrobina, piriprol, piriproxifeno, rotenona, rianodina, silafluofeno, espinetoram, espinosad, espirodiclofen, espiromesifeno, espirotetramato, sulprofos, sulfoxaflor, tebufenozida, tebufenpirad, teflubenzurón, teflutrina, terbufos, tetraclorvinfos, tetrametrina, tetrametilfluthrin, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodio, tolfenpirad, tralometrina, triazamato, triclorfón, triflumurón, todas las cepas de *Bacillus thuringiensis*, bacterias entomopatógenas, todas las cepas de los virus de *Nucleo polyhedrosis*, virus entomopatógenos y hongos entomopatógenos.
- 5.
- La composición de la reivindicación 4, en donde el al menos un compuesto o principio biológicamente activo adicional se selecciona del grupo que consiste en abamectina, acetamiprida, acrinatrina, afidopiropen, amitraz, avermectina, azadiractina, benfuracarb, bensultap, bifentrina, 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-*N*-[4-ciano-2-metil-6-[(metilamino)-carbonil]-fenil]-1*H*-pirazol-5-carboxamida, buprofezin, carbarilo, cartap, clorantraniliprol, clorfenapir, clorpirifos, clotianidina, ciantraniliprol, ciclaniliprole, cicloprotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, gamma-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, zeta-cipermetrina, ciromazina, deltametrina, dieldrina, dinotefurano, diofenolano, emamectina, endosulfano, esfenvalerato, etiprol, etofenprox, etoxazol, fenitrotión, fenotiocarb, fenoxicarb, fenvalerato, fipronil, flometoquin, flonicamida, flubendiamida, flufenoxurón, flufenoxistrobin, flufensulfone, flupiprole, flupiradifurone, fluvalinato, formetanato, fostiazato, heptafluthrin, hexaflumurón, hidrametilnón, imidacloprid, indoxacarb, lufenurona, meperflutim, metaflumizona, metiodicarb, metomilo, metopreno, metoxifenoazida, metoflutrina, monofluthrin, nitenpiram, nitiazina, novalurón, oxamil, piflubumida, pimetrozina, piretrina, piridabeno, piridalil, piriminostrobina, piriproxifeno, rianodina, espinetoram, espinosad, espirodiclofeno, espiromesifeno, espirotetramato, sulfoxaflor, tebufenocida, tetrametrina, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodio, tralometrina, tetrametilfluthrin, triazamato, triflumurón, todas las cepas de *Bacillus thuringiensis* y todas las cepas de los virus de *Nucleo polyhedrosis*.
- 6.
- Un método para controlar una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su entorno con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de la reivindicación 1 o la reivindicación 2, con la condición de que el método no sea un método de tratamiento médico de un cuerpo humano o animal mediante terapia.
- 7.
- Una semilla tratada que comprenda un compuesto de la reivindicación 1 o la reivindicación 2 en una cantidad de 0,0001 a 1 % en peso de la semilla antes del tratamiento.