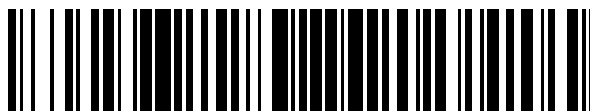


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 779 532**

51 Int. Cl.:

C07D 471/04 (2006.01)

C07D 519/00 (2006.01)

A01N 43/90 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **05.04.2016 PCT/EP2016/057389**

87 Fecha y número de publicación internacional: **13.10.2016 WO16162318**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **05.04.2016 E 16714418 (7)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **12.02.2020 EP 3280716**

54 Título: **Derivados de imidazo[1,2a]piridin-2-ilo como pesticidas y sus productos intermedios**

30 Prioridad:

08.04.2015 EP 15162775

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

18.08.2020

73 Titular/es:

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

72 Inventor/es:

**FISCHER, RÜDIGER;
WILCKE, DAVID;
HAGER, DOMINIK;
ILG, KERSTIN;
EILMUS, SASCHA;
GÖRGENS, ULRICH y
TURBERG, ANDREAS**

74 Agente/Representante:

GONZÁLEZ PECES, Gustavo Adolfo

ES 2 779 532 T3

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

DESCRIPCIÓN

Derivados de imidazo[1,2a]piridin-2-ilo como pesticidas y sus productos intermedios

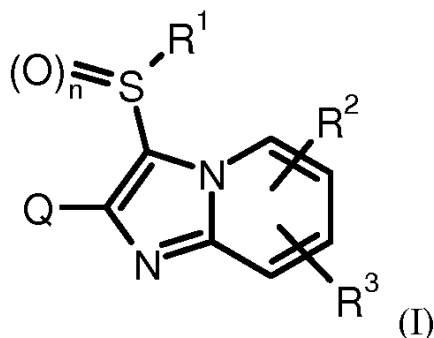
La presente invención se refiere a nuevos derivados heterocíclicos bicíclicos condensados de la fórmula (I), su aplicación como acaricidas y/o insecticidas para el control de plagas animales, sobre todo de artrópodos y en especial de insectos y arácnidos y procedimientos y productos intermedios para su producción.

Los derivados heterocíclicos bicíclicos condensados con propiedades insecticidas ya están descritos en la bibliografía por ejemplo en los documentos WO 2010/125985, WO 2012/074135, WO 2012/086848, WO 2013/018928, WO 2013/191113, WO 2014/142292, WO 2014/148451, WO 2015/000715, EP 15191440.5, EP 15197267.6 y EP 16152384.01, así como en Sythsis, tomo 47, n.º 05, páginas 659-671, documentos WO 2016/129684 y WO 2017/061497.

Los principios activos ya conocidos de acuerdo a los documentos anteriores sin embargo muestran inconvenientes en su aplicación, ya sea porque tienen un espectro reducido, ya sea porque no muestran un efecto insecticida o acaricida satisfactorio.

Se encontraron nuevos derivados heterocíclicos bicíclicos condensados que muestran ventajas frente a los compuestos ya conocidos, por ejemplo se mencionan a modo de ejemplo mejores propiedades biológicas o ecológicas, procedimientos de aplicación más amplios, mejores efectos insecticidas y acaricidas así como una buena compatibilidad con plantas útiles. Los derivados heterocíclicos bicíclicos condensados se pueden utilizar en combinación con otros agentes para mejorar la eficacia especialmente contra insectos difíciles de controlar.

Por eso, objeto de la presente invención son nuevos compuestos de la fórmula (I)



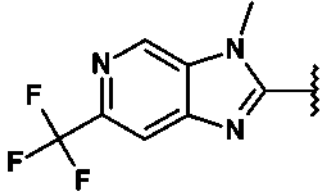
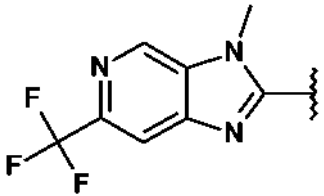
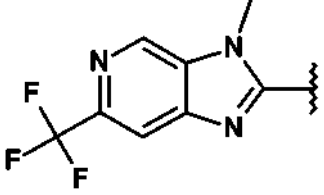
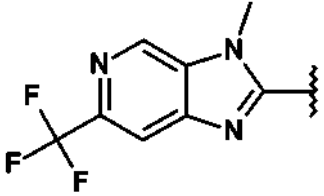
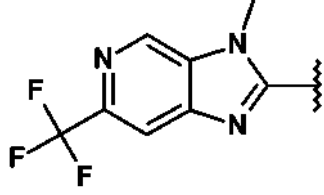
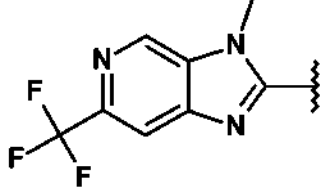
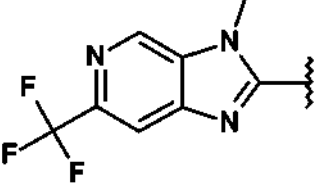
donde R³ representa hidrógeno y donde R¹, R², Q y n tienen los significacos indicados en la siguiente tabla y donde el enlace de Q a la molécula radical está caracterizado con una línea ondulada:

	R¹	n	R²	Q
I-1	C₂H₅	2	H	
I-2	C₂H₅	0	H	
I-7	C₂H₅	1	6-Cl	

(continuación)

	R ¹	n	R ²	Q
I-8	C ₂ H ₅	1	6-CF ₃	
I-9	C ₂ H ₅	0	H	
I-10	C ₂ H ₅	2	H	
I-11	C ₂ H ₅	1	H	
I-13	C ₂ H ₅	0	8-CF ₃	
I-14	C ₂ H ₅	0	8-Cl	
I-15	C ₂ H ₅	0	8-SC ₂ H ₅	

(continuación)

	R ¹	n	R ²	Q
I-18	C ₂ H ₅	1	7-CF ₃	
I-19	C ₂ H ₅	2	8-Cl	
I-20	C ₂ H ₅	0	5-CF ₃	
I-21	C ₂ H ₅	2	5-CF ₃	
I-22	C ₂ H ₅	1	5-CF ₃	
I-24	C ₂ H ₅	2	8-CF ₃	
I-25	C ₂ H ₅	1	8-CF ₃	

(continuación)

	R ¹	n	R ²	Q
I-26	C ₂ H ₅	0	5-CH ₃	
I-27	C ₂ H ₅	0	5-CF ₃	
I-28	C ₂ H ₅	0	6-CF ₃	
I-29	C ₂ H ₅	0	6-Cl	
I-30	C ₂ H ₅	0	7-CF ₃	
I-31	C ₂ H ₅	0	5-SC ₂ H ₅	
I-32	C ₂ H ₅	0	7-SC ₂ H ₅	

(continuación)

	R ¹	n	R ²	Q
I-33	C ₂ H ₅	2	7-CH ₃	
I-34	C ₂ H ₅	2	7-CF ₃	
I-35	C ₂ H ₅	2	6-CH ₃	
I-36	C ₂ H ₅	2	6-CF ₃	
I-37	C ₂ H ₅	0	7-CH ₃	
I-38	C ₂ H ₅	0	6-CH ₃	
I-39	C ₂ H ₅	2	8-SO ₂ C ₂ H ₅	

(continuación)

	R ¹	n	R ²	Q
I-40	C ₂ H ₅	2	H	
I-41	C ₂ H ₅	2	H	
I-42	C ₂ H ₅	2	6-Cl	
I-45	C ₂ H ₅	0	6-CH ₃	
I-46	C ₂ H ₅	2	5-CH ₃	
I-48	C ₂ H ₅	2	6-CH ₃	
I-54	C ₂ H ₅	2	6-OCH ₃	
I-55	C ₂ H ₅	1	6-OCH ₃	

Además se ha encontrado que los compuestos de la fórmula (I) tienen una muy buena eficacia como pesticidas preferiblemente como insecticidas y/o acaricidas; aparte de eso, por regla general son muy bien tolerados por las plantas de cultivo.

- 5 En las definiciones preferidas, a menos que se indique lo contrario,

halógeno se selecciona del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo y yodo, preferentemente a su vez del grupo flúor, cloro y bromo.

En las definiciones especialmente preferidas, a menos que se indique lo contrario,

- 10 halógeno se selecciona del grupo que consiste en flúor, cloro, bromo y yodo, preferentemente a su vez del grupo flúor, cloro y bromo.

- 15 En el contexto de la presente invención, a menos que se defina lo contrario en otra parte, se entiende por "alquilo", ya sea solo o en combinación con otros términos, como por ejemplo haloalquilo, un radical de un grupo hidrocarburo alifático saturado con 1 a 12 átomos de carbono, que puede ser ramificado o no ramificado. Ejemplos de radicales C₁-C₁₂-alquilo son metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo, terc-butilo, n-pentilo, iso-pentilo, neopentilo, tert.-pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 1-etilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, hexilo n-heptilo, n-octilo, n-nonilo, n-decilo, n-undecilo y n-dodecilo. Son especialmente preferidos los radicales C₁-C₆-alquilo. En particular se prefieren los radicales C₁-C₄-alquilo.

- 20 A menos que se defina lo contrario en otra parte, se entiende por "alquenilo", ya sea solo o en combinación con otros términos, según la invención, un radical C₂-C₁₂-alquenilo de cadena recta o ramificada, que presenta al menos un doble enlace, tal como por ejemplo vinilo, alilo, 1-propenilo, isopropenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1,3-butadienilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1,3-pentadienilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo y 1,4-hexadienilo. Son preferidos los radicales C₂-C₆-alquenilo y especialmente preferidos los radicales C₂-C₄-alquenilo.

- 25 A menos que se defina lo contrario en otra parte, se entiende por "alquinilo", ya sea solo o en combinación con otros términos, según la invención, un radical C₂-C₁₂-alquinilo de cadena recta o ramificada, que presenta al menos un triple enlace, tal como por ejemplo etinilo, 1-propinilo y propargilo. Son preferidos los radicales C₃-C₆-alquinilo y especialmente preferidos los radicales C₃-C₄-alquinilo. El radical alquinilo puede presentar también al menos un doble enlace.

- 30 A menos que se defina lo contrario en otra parte, se entiende por "cicloalquilo", ya sea solo o en combinación con otros términos, según la invención, un radical C₃-C₈-cicloalquilo, tal como por ejemplo ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo y ciclooctilo. Son preferidos los radicales C₃-C₆-cicloalquilo.

Por "alcoxi", ya sea solo o en combinación con otros términos, como por ejemplo haloalcoxi, se entiende un radical O-alquilo, donde el término "alquilo" tiene el significado que figura anteriormente.

- 35 Los radicales sustituidos por halógeno, por ejemplo haloalquilo, están monohalogenados o polihalogenados hasta el número máximo de posibles sustituyentes. En el caso de polihalogenación, los átomos de halógeno pueden ser idénticos o diferentes. A este respecto, halógeno es flúor, cloro, bromo o yodo, especialmente flúor, cloro o bromo.

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

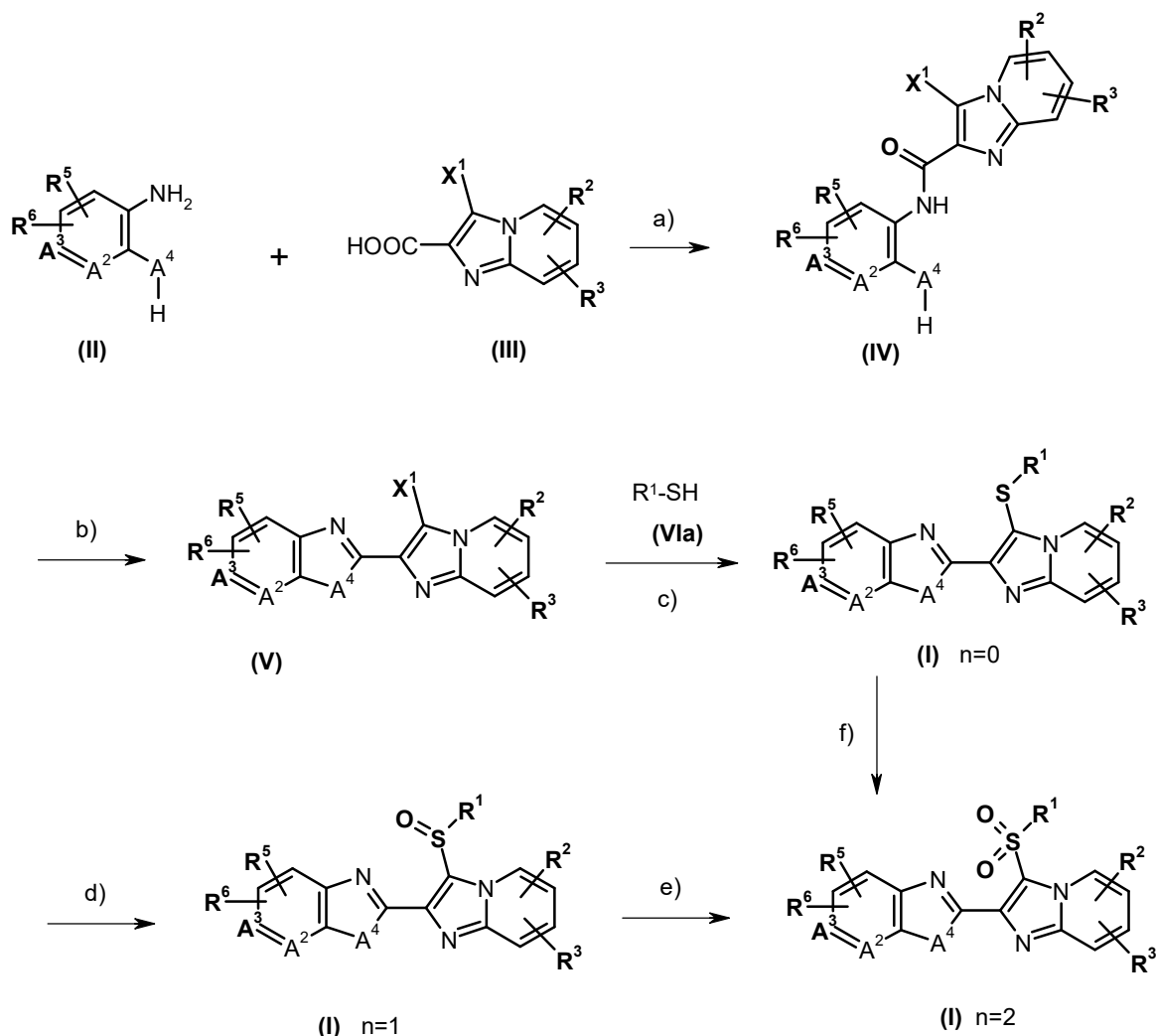
- 40 Las aclaraciones o definiciones de radicales provistas anteriormente en términos generales o dentro de las áreas de preferencia se aplican a los productos finales y correspondientemente a los productos de partida y productos intermedios. Estas definiciones de radicales pueden combinarse entre sí tal como se desee, es decir, también incluyendo combinaciones entre los respectivos intervalos de preferencia.

- 45 Dependiendo de la naturaleza de los sustituyentes, los compuestos de la fórmula (I) pueden estar en la forma de isómeros geométricos y/u ópticamente activos o mezclas de isómeros correspondientes en diferentes composiciones. Estos estereoisómeros son, por ejemplo, enantiómeros, diastereómeros, atropisómeros o isómeros geométricos. Por consiguiente, la invención abarca estereoisómeros puros y cualquier mezcla de estos isómeros.

Los compuestos de la fórmula (I) según la invención pueden obtenerse de acuerdo con los procedimientos que se muestran en los esquemas a continuación:

Procedimiento A

- 50 Los compuestos de la fórmula (I), en los que Q representa Q1 a Q9 o Q20, se pueden preparar por procedimientos conocidos, por ejemplo, de forma análoga a los procedimientos descritos en los documentos WO2009/131237, WO2010/125985, WO2011/043404, WO2011/040629, WO2012/086848, WO2013/018928 o WO2015/000715.



Los radicales R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y n tienen los significados indicados anteriormente, A² y A³ representan CH o N (donde A² y A³ no pueden representar simultáneamente N), A⁴ representa O, S o N-R⁴ y X¹ representa halógeno.

Etapas a)

- 5 Los compuestos de la fórmula (IV) pueden prepararse en forma análoga al procedimiento descrito en el documento US5576335 mediante la reacción de compuestos de la fórmula (II) con ácidos carboxílicos de la fórmula (III) en presencia de un agente de condensación o de una base.

Los compuestos de la fórmula (II) están comercialmente disponibles o se pueden preparar por procedimientos conocidos, por ejemplo, de forma análoga a los procedimientos descritos en los documentos US2003/69257, 10 WO2006/65703, WO2009/131237, WO2010/125985, WO2011/043404, WO2011/040629, WO2012/086848, WO2013/018928 o WO2015/000715.

Los ácidos carboxílicos de la fórmula (III) están comercialmente disponibles o pueden prepararse mediante procedimientos conocidos, por ejemplo de derivados 2-aminopiridina, de forma análoga a los procedimientos descritos en el documento WO2011/41713.

- 15 La reacción de los compuestos de la fórmula (II) con ácidos carboxílicos de la fórmula (III) puede realizarse en una sustancia o en un disolvente, preferentemente se realiza en un disolvente que está seleccionado entre los disolventes inertes habituales en las condiciones de reacción que prevalecen. Se prefieren éteres como por ejemplo diisopropiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano; hidrocarburos halogenados como por ejemplo diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; nitrilos, como por ejemplo acetonitrilo o 20 propionitrilo; hidrocarburos aromáticos como por ejemplo tolueno o xileno; disolventes polares apróticos como por ejemplo N,N-dimetilformamida o N-metilpirrolidona o compuestos nitrogenados como por ejemplo piridina.

Los agentes de condensación adecuados son por ejemplo carbodiimidas como 1-(3-dimetilaminopropil)-3- hidrocloruro de etilcarbodiimida (EDCI) o 1,3-diciclohexilcarbodiimida.

Las bases adecuadas que generalmente se usan en tales reacciones son bases inorgánicas. Preferentemente se usan bases seleccionadas por ejemplo del grupo que consiste de acetatos, fosfatos, carbonatos y bicarbonatos de metales alcalinos o alcalinotérreos. A este respecto, especialmente preferentes son acetato sódico, fosfato sódico, fosfato de potasio, carbonato de cesio, carbonato sódico, carbonato potásico, bicarbonato sódico, bicarbonato de potasio.

- 5 La reacción se puede realizar al vacío, a presión atmosférica o a sobrepresión y a temperaturas de 0 °C a 180 °C, la reacción se realiza preferentemente a presión atmosférica y a temperaturas de 20 a 140 °C.

Etapla b)

- 10 Los compuestos de la fórmula (V) pueden prepararse por condensación de los compuestos de la fórmula (IV) por ejemplo de forma análoga a los procedimientos descritos en los documentos WO2009/131237, WO2010/125985, WO2011/043404, WO2011/040629, WO2012/086848, WO2013/018928 o WO2015/000715.

- 15 La reacción de los compuestos de la fórmula (V) puede realizarse en una sustancia o en un disolvente, preferentemente se realiza en un disolvente que está seleccionado entre los disolventes inertes habituales en las condiciones de reacción que prevalecen. Se prefieren éteres como por ejemplo diisopropiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, metil terc-butil éter; hidrocarburos halogenados como por ejemplo diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; nitrilos, como por ejemplo acetonitrilo o propionitrilo; hidrocarburos aromáticos como por ejemplo tolueno o xileno; disolventes polares apróticos como por ejemplo N,N-dimetilformamida o N-metilpirrolidona o compuestos nitrogenados como por ejemplo piridina.

La reacción se puede llevar a cabo en presencia de un agente de condensación, de un ácido, de una base o de un agente de clorización.

- 20 Ejemplos de agentes de condensación adecuados son carbodiimidas como 1-(3-dimetilaminopropil)-3-clorhidrato de etilcarbodiimida (EDCI) o 1,3-diciclohexilcarbodiimida; anhídridos como anhídrido acético, anhídrido trifluoroacético; una mezcla de trifenilfosfina, una base y tetracloruro de carbono o una mezcla de trifenilfosfina y un azodiéster como por ejemplo azodicarboxilato de dietilo.

- 25 Ejemplos de ácidos adecuados que se pueden utilizar en la reacción descrita son ácidos sulfónicos como ácido para-toluenosulfónico; ácidos carboxílicos como ácido acético o ácido polifosfórico.

Ejemplos de bases adecuadas que se pueden utilizar son heterociclos nitrogenados como piridina, picolina, 2,6-lutidina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undecen (DBU); aminas terciarias como trietilamina y N,N-diisopropiletilamina; bases inorgánicas como fosfato de potasio, carbonato de potasio e hidruro sódico.

Un ejemplo de un agente de clorización adecuado es el oxiclورو de fósforo.

- 30 La reacción se puede realizar al vacío, a presión atmosférica o a sobrepresión y a temperaturas de 0 °C a 200 °C.

Etapla c)

Los compuestos de la fórmula (I), donde n representa 0, se pueden producir mediante reacción de los compuestos de la fórmula (V) con compuestos de la fórmula (VIa) en presencia de una base.

- 35 Los derivados de mercaptano de la fórmula (VIa) como por ejemplo metanotiol, etanotiol o mercaptano isopropílico están comercialmente disponibles o pueden prepararse mediante procedimientos conocidos, por ejemplo, de forma análoga a los procedimientos descritos en los documentos US2006/25633, US2006/111591, US2820062, Chemical Communications, 13 (2000), 1163-1164 o Journal of the American Chemical Society, 44 (1922), p. 1329.

- 40 La reacción al compuesto de la fórmula (I), donde n representa 0, puede realizarse en una sustancia o en un disolvente, preferentemente la reacción se realiza en un disolvente que está seleccionado entre los disolventes inertes habituales en las condiciones de reacción que prevalecen. Se prefieren éteres como por ejemplo diisopropiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, metil terc-butil éter; nitrilos, como por ejemplo acetonitrilo o propionitrilo; hidrocarburos aromáticos como por ejemplo tolueno o xileno; disolventes polares apróticos como por ejemplo N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona o dimetilsulfóxido.

- 45 Ejemplos de bases adecuadas son por ejemplo bases inorgánicas del grupo que consiste de acetatos, fosfatos y carbonatos de metales alcalinos o alcalinotérreos. A este respecto, se prefiere carbonato de cesio, carbonato sódico y carbonato potásico. Otras bases adecuadas son hidruros de metales alcalinos como por ejemplo hidruro de sodio.

La reacción se puede realizar al vacío, a presión atmosférica o a sobrepresión y a temperaturas de 0 °C a 200 °C.

En la reacción descrita X¹ representa preferentemente un átomo de flúor o de cloro.

Etapla d)

- 50 Los compuestos de la fórmula (I), donde n representa 1, pueden producirse por oxidación de los compuestos de la

fórmula (I), donde n representa 0. La oxidación generalmente se realiza en un disolvente que está seleccionado entre los disolventes inertes habituales en las condiciones de reacción que prevalecen. Se prefieren hidrocarburos halogenados como por ejemplo diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; alcoholes como metanol o etanol; ácido fórmico, ácido acético, ácido propanoico o agua.

- 5 Ejemplos de oxidantes adecuados son peróxido de hidrógeno, ácido metacloroperbenzoico o peryodato de sodio.

La reacción se puede realizar al vacío, a presión atmosférica o a sobrepresión y a temperaturas de -20 °C a 120 °C.

Etapas e)

- 10 Los compuestos de la fórmula (I), donde n representa 2, pueden producirse por oxidación de los compuestos de la fórmula (I), donde n representa 1. La oxidación generalmente se realiza en un disolvente. Se prefieren hidrocarburos halogenados como por ejemplo diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; alcoholes como metanol o etanol; ácido fórmico, ácido acético, ácido propanoico o agua.

Ejemplos de oxidantes adecuados son peróxido de hidrógeno y ácido metacloroperbenzoico.

- 15 La reacción se puede realizar al vacío, a presión atmosférica o a sobrepresión y a temperaturas de -20 °C a 120 °C.

Etapas f)

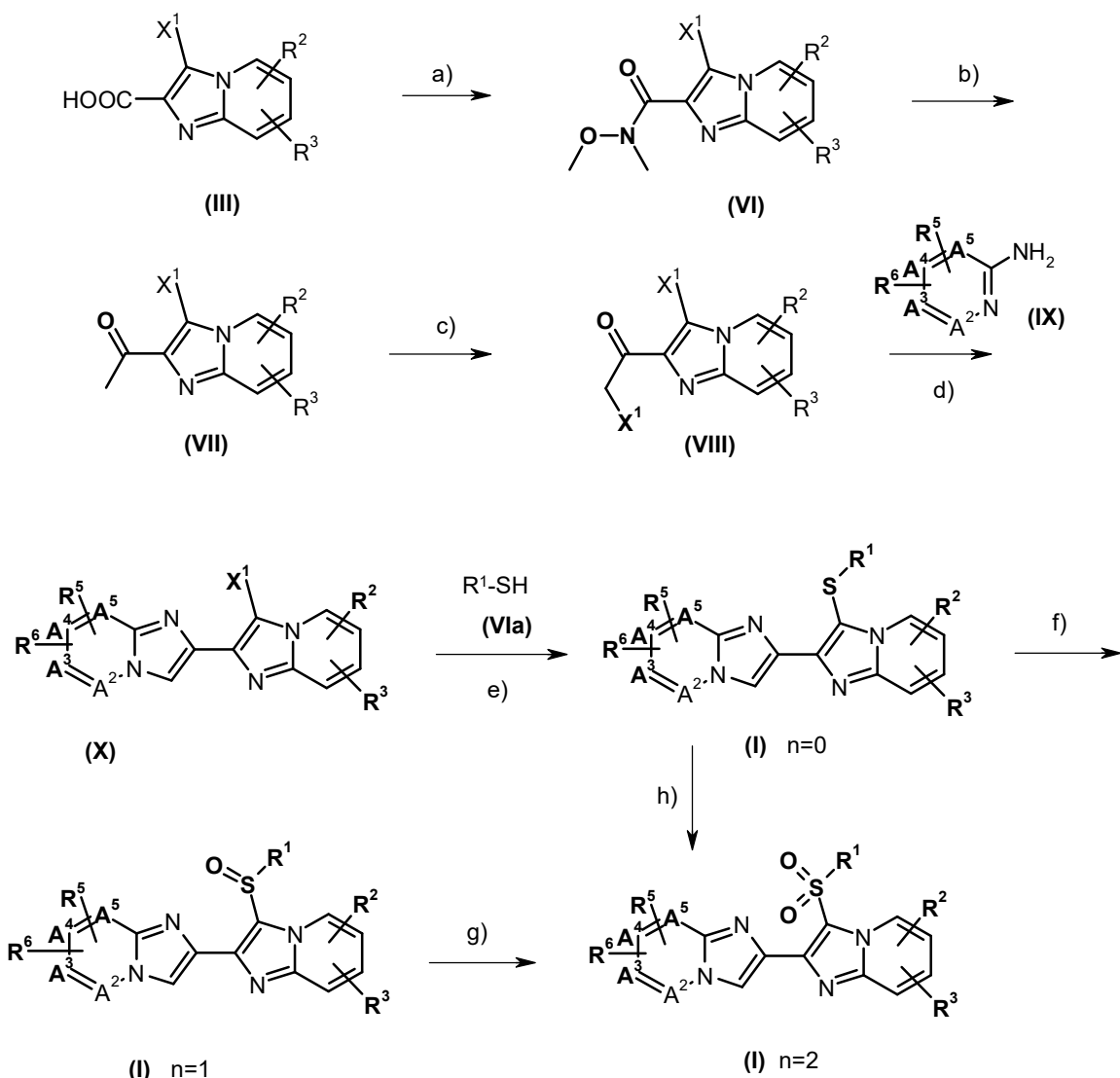
- 20 Los compuestos de la fórmula (I), donde n representa 2, pueden producirse en un proceso de una etapa por oxidación de los compuestos de la fórmula (I), donde n representa 0. La oxidación generalmente se realiza en un disolvente. Se prefieren hidrocarburos halogenados como por ejemplo diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; alcoholes como metanol o etanol; ácido fórmico, ácido acético, ácido propanoico o agua.

Ejemplos de oxidantes adecuados son peróxido de hidrógeno y ácido metacloroperbenzoico.

La reacción se puede realizar al vacío, a presión atmosférica o a sobrepresión y a temperaturas de -20 °C a 120 °C.

Procedimiento B

- 25 Los compuestos de la fórmula (I), en los que Q representa Q10, Q11, Q15 y Q16, se pueden preparar por procedimientos conocidos, por ejemplo, de forma análoga a los procedimientos descritos en los documentos US2009/203705, US2012/258951, WO2013/3298 o J. Med. Chem. 31, (1988) 1590-1595.



Los radicales R^1, R^2, R^3, R^5, R^6 y n tienen los significados indicados anteriormente. A^2, A^3, A^4 y A^5 representan CH o N (donde A^2, A^3, A^4 y A^5 no pueden representar simultáneamente N) y X^1 representa halógeno.

Etapa a)

- 5 En forma análoga a los procedimientos descritos en los documentos WO2011/75643 o EP2671582, los ácidos carboxílicos de la fórmula (III) se transforman en presencia de clorhidrato de O,N-dimetilhidroxilamina en amidas de Weinreb de la fórmula (VI).

Los ácidos carboxílicos de la fórmula (III) o bien están comercialmente disponibles o bien pueden prepararse mediante procedimientos conocidos, por ejemplo de derivados 2-aminopiridina, de forma análoga a los procedimientos descritos en el documento WO2011/41713.

Etapa b, c)

- Los compuestos de la fórmula (VI) luego se pueden transformar en cetonas de la fórmula (VII) mediante procedimientos conocidos, por ejemplo de forma análoga al procedimiento descrito en el documento WO2011/75643, con un reactivo de Grignard tal como por ejemplo bromuro de metilmagnesio. Mediante halogenación subsiguiente en forma análoga al procedimiento conocido descrito por ejemplo en el documento US2012/302573 se accede a compuestos de la fórmula (VIII).

Etapa d)

- Los compuestos de la fórmula (X) pueden prepararse por ciclación de los compuestos de la fórmula (VIII) con aminas de la fórmula (IX). La ciclación se realiza por ejemplo en etanol, acetonitrilo o N,N-dimetilformamida mediante procedimientos conocidos en forma análoga por ejemplo a los procedimientos descritos en los documentos

WO2005/66177, WO2012/88411, WO2013/3298, US2009/203705, US2012/258951, WO2012/168733, WO2014/187762 o J. Med. Chem. 31 (1988) 1590-1595.

Los compuestos de la fórmula (IX) están comercialmente disponibles.

Etapas e)

- 5 Los compuestos de la fórmula (I), donde n representa 0, se pueden producir mediante reacción de los compuestos de la fórmula (X) con compuestos de la fórmula (VIa) en presencia de una base. Los derivados de mercaptano de la fórmula (VIa) como por ejemplo metanotiol, etanotiol o mercaptano isopropílico o bien están comercialmente disponibles o bien pueden prepararse mediante procedimientos conocidos, por ejemplo, de forma análoga a los procedimientos descritos en los documentos US2006/25633, US2006/111591, US2820062, Chemical Communications, 13 (2000), 1163-1164 o Journal of the American Chemical Society, 44 (1922), p. 1329.

Etapas f, g)

Los compuestos de la fórmula (I), donde n representa 1, pueden producirse por oxidación de los compuestos de la fórmula (I), donde n representa 0. La oxidación se realiza mediante procedimientos conocidos con un agente de oxidación adecuado tal como por ejemplo peróxido de hidrógeno, ácido metacloroperbenzoico o peryodato de sodio.

- 15 Los compuestos de la fórmula (I), donde n representa 2, pueden producirse por oxidación de los compuestos de la fórmula (I), donde n representa 1.

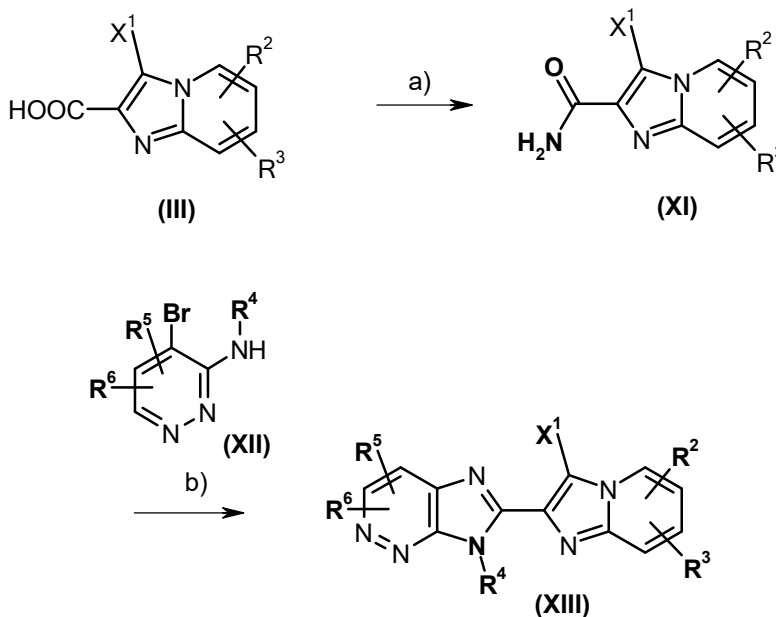
La oxidación generalmente se realiza en un disolvente. Se prefieren hidrocarburos halogenados como por ejemplo diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; alcoholes como metanol o etanol; ácido fórmico, ácido acético, ácido propanoico o agua. Son ejemplos de oxidantes adecuados peróxido de hidrógeno y ácido metacloroperbenzoico.

Etapas h)

- Los compuestos de la fórmula (I), donde n representa 2, pueden producirse en un proceso de una etapa por oxidación de los compuestos de la fórmula (I), donde n representa 0. La oxidación generalmente se realiza en un disolvente. Se prefieren hidrocarburos halogenados como por ejemplo diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; alcoholes como metanol o etanol; ácido fórmico, ácido acético, ácido propanoico o agua. Ejemplos de oxidantes adecuados son peróxido de hidrógeno y ácido metacloroperbenzoico.

Procedimiento C

Los compuestos de la fórmula (I), en los que Q representa Q17, se pueden preparar por procedimientos conocidos, por ejemplo, de forma análoga a los procedimientos descritos en el documento WO2014/142292.



Los radicales R^2 , R^3 , R^4 , R^5 y R^6 tienen los significados indicados anteriormente. X^1 representa halógeno.

Etapas a)

Los compuestos de la fórmula (XI) se pueden producir en forma análoga a los procedimientos descritos en los documentos US5374646 o Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters 2003, 13, 1093 - 1096 mediante la transformación de compuestos de la fórmula (III) con una fuente de amoníaco en presencia de un agente de condensación.

- 5 Los ácidos carboxílicos de la fórmula (III) o bien están comercialmente disponibles o bien pueden prepararse mediante procedimientos conocidos, por ejemplo de derivados 2-aminopiridina, de forma análoga a los procedimientos descritos en el documento WO2011/41713. Como fuente de amoníaco generalmente se utiliza hidróxido de amonio.

- 10 La transformación de los compuestos de la fórmula (III) con la fuente de amoníaco se realiza preferentemente en un disolvente que está seleccionado entre los disolventes inertes habituales en las condiciones de reacción que prevalecen. Se prefieren éteres como por ejemplo dioxano o tetrahidrofurano.

Un agente de condensación adecuado es por ejemplo carbonildiimidazol.

La reacción se puede realizar al vacío, a presión atmosférica o a sobrepresión. Preferentemente la reacción se realiza a presión atmosférica y a temperaturas de 20 a 70 °C.

Etapa b)

- 15 Los compuestos de la fórmula (XIII) pueden prepararse en forma análoga al procedimiento descrito en el documento WO2014/142292 por la transformación de compuestos de la fórmula (XI) con compuestos de la fórmula (XII) en presencia de un catalizador de paladio en condiciones básicas.

- 20 Los compuestos de la fórmula (XII) pueden prepararse de forma análoga al procedimiento descrito en el documento WO2014/142292. Como catalizador de paladio se puede utilizar por ejemplo [1,1'-bis-(difenilfosfina)ferrocen]dicloropaladio(II). Como bases se utilizan comúnmente bases inorgánicas tales como el potasio terc-butóxido.

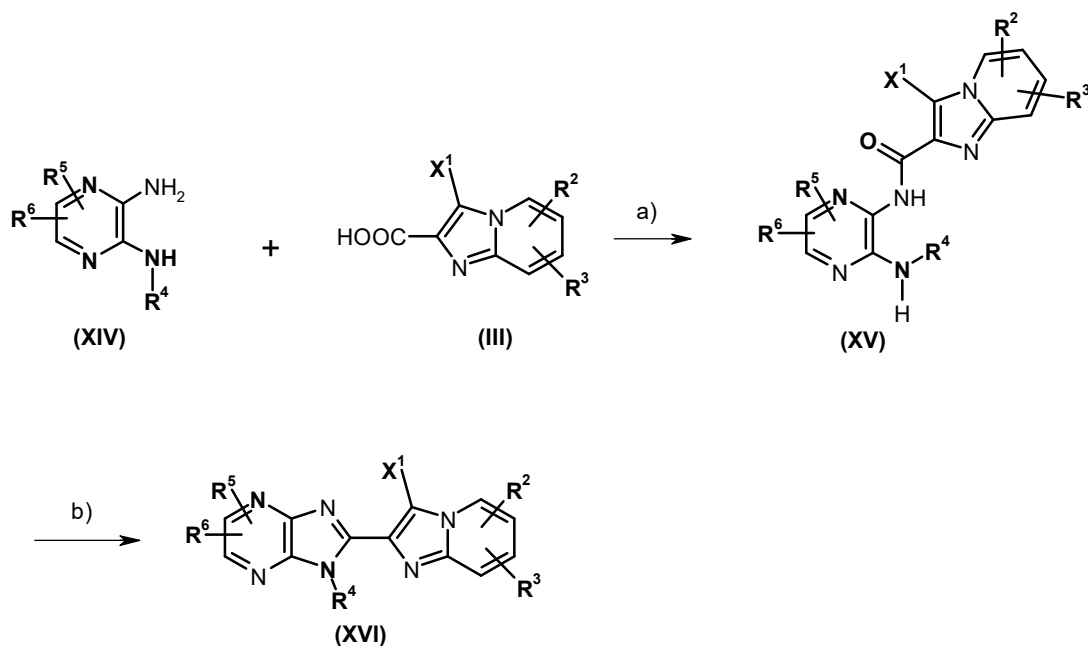
La transformación se realiza en un disolvente. Frecuentemente se utiliza tolueno.

La reacción se puede realizar al vacío, a presión atmosférica o a sobrepresión. Preferentemente la reacción se realiza a presión atmosférica y a temperaturas de 20 a 110 °C.

- 25 La reacción adicional de compuestos de fórmula (XIII) para dar compuestos de fórmula (I) se realiza de manera análoga al procedimiento A.

Procedimiento D

Los compuestos de la fórmula (I), en los que Q representa Q14, pueden prepararse por procedimientos conocidos, por ejemplo de forma análoga a los procedimientos descritos en el documento WO2011/073149.



30

Los radicales R^2 , R^3 , R^4 , R^5 y R^6 tienen los significados indicados anteriormente. X^1 representa halógeno.

Etapa a)

Los compuestos de la fórmula (XV), en forma análoga a los procedimientos descritos en los documentos WO2011/073149 o US5576335, pueden ser producidos por la transformación de compuestos de la fórmula (XIV) con un ácido carboxílico de la fórmula (III) en presencia de un agente de condensación o una base.

- 5 Los compuestos de la fórmula (XIV) o bien están comercialmente disponibles o bien pueden prepararse mediante procedimientos conocidos, por ejemplo de forma análoga a los procedimientos descritos en los documentos WO2008/51493 o Bioorganic and Medicinal Chemistry 2014, 22, 13, 3515 – 3526.

10 Los ácidos carboxílicos de la fórmula (III) o bien están comercialmente disponibles o bien pueden prepararse mediante procedimientos conocidos, por ejemplo de derivados 2-aminopiridina, de forma análoga a los procedimientos descritos en el documento WO2011/41713.

15 La reacción de los compuestos de la fórmula (XIV) con ácidos carboxílicos de la fórmula (III) puede realizarse en una sustancia o en un disolvente, preferentemente la reacción se realiza en un disolvente que está seleccionado entre los disolventes inertes habituales en las condiciones de reacción que prevalecen. Se prefieren éteres como por ejemplo diisopropiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano; hidrocarburos halogenados como por ejemplo diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; nitrilos, como por ejemplo acetonitrilo o propionitrilo; hidrocarburos aromáticos como por ejemplo tolueno o xileno; disolventes polares apróticos como por ejemplo N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona o compuestos que contienen nitrógeno tales como piridina.

Agentes de condensación adecuados son por ejemplo carbodiimidas tales como 1-(3-dimetilaminopropil)-3-clorhidrato de etilcarbodiimida (EDCI) o 1,3-diciclohexilcarbodiimida.

20 Bases adecuadas son las bases inorgánicas que se utilizan comúnmente en tales reacciones. Preferentemente se utilizan bases que se seleccionan por ejemplo del grupo que consiste de acetatos, fosfatos, carbonatos y bicarbonatos de metales alcalinos y alcalinotérreos. A este respecto, son especialmente preferentes acetato sódico, fosfato sódico, fosfato de potasio, carbonato de cesio, carbonato sódico, carbonato potásico, bicarbonato sódico y bicarbonato de potasio.

25 La reacción se puede realizar al vacío, a presión atmosférica o a sobrepresión y a temperaturas de 0 °C a 180 °C, preferentemente la reacción se realiza a presión atmosférica y a temperaturas de 20 a 140 °C.

Etapa b)

30 Los compuestos de la fórmula (XVI) pueden prepararse por condensación de los compuestos de la fórmula (XV) por ejemplo de forma análoga a los procedimientos descritos en los documentos WO2009/131237, WO2010/125985, WO2011/043404, WO2011/040629, WO2012/086848, WO2013/018928 o WO2015/000715.

35 La reacción para dar compuestos de la fórmula (XVI) puede realizarse en una sustancia o en un disolvente, preferentemente la reacción se realiza en un disolvente que está seleccionado entre los disolventes inertes habituales en las condiciones de reacción que prevalecen. Se prefieren éteres como por ejemplo diisopropiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, metil terc-butil éter; hidrocarburos halogenados como por ejemplo diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; nitrilos, como por ejemplo acetonitrilo o propionitrilo; hidrocarburos aromáticos como por ejemplo tolueno o xileno; disolventes polares apróticos como por ejemplo N,N-dimetilformamida o N-metilpirrolidona o compuestos nitrogenados como por ejemplo piridina.

La reacción se puede llevar a cabo en presencia de un agente de condensación, de un ácido, de una base o de un agente de clorización.

40 Ejemplos de agentes de condensación adecuados son carbodiimidas como 1-(3-dimetilaminopropil)-3-clorhidrato de etilcarbodiimida (EDCI) o 1,3-diciclohexilcarbodiimida; anhídridos como anhídrido acético, anhídrido trifluoroacético; una mezcla de trifenilfosfina, una base y tetracloruro de carbono o una mezcla de trifenilfosfina y un azodiéster como por ejemplo azodicarboxilato de dietilo.

45 Ejemplos de ácidos adecuados que se pueden utilizar en la reacción descrita son ácidos sulfónicos como ácido para-toluenosulfónico; ácidos carboxílicos como ácido acético o ácido polifosfórico.

Ejemplos de bases adecuadas son heterociclos nitrogenados como piridina, picolina, 2,6-lutidina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undecen (DBU); aminas terciarias como trietilamina y N,N-diisopropiletilamina; bases inorgánicas como fosfato de potasio, carbonato de potasio e hidruro sódico.

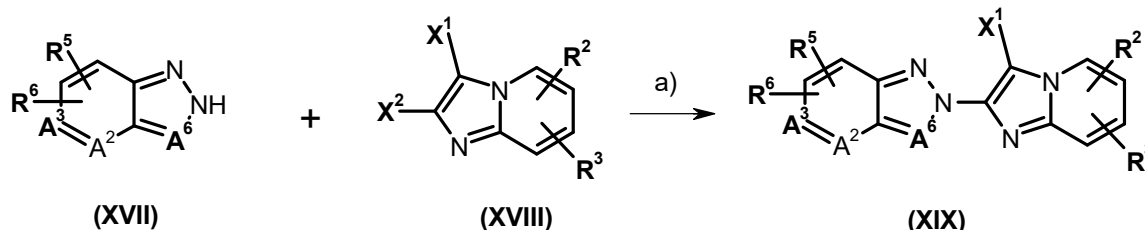
Un ejemplo de un agente de clorización adecuado es oxiclورو de fósforo.

50 La reacción se puede realizar al vacío, a presión atmosférica o a sobrepresión y a temperaturas de 0 °C a 200 °C.

La reacción adicional de compuestos de la fórmula (XVI) para dar compuestos de fórmula (I) se realiza de manera análoga al procedimiento A.

Procedimiento E

Los compuestos de la fórmula (I), en los que Q representa Q12, Q13, Q18 y Q19, se pueden preparar por procedimientos conocidos, por ejemplo de forma análoga a los procedimientos descritos en los documentos WO2010/091310, WO 2012/66061 o WO2013/099041.



Los radicales R^2 , R^3 , R^5 y R^6 tienen los significados indicados anteriormente. A^2 , A^3 y A^6 representan CH o N (donde A^2 y A^3 no pueden representar simultáneamente N). X^1 y X^2 representan halógeno.

Etapa a)

Los compuestos de la fórmula (XIX) pueden prepararse por transformación de compuestos de la fórmula (XVII) con compuestos de la fórmula (XVIII) en condiciones básicas, por ejemplo en forma análoga a los procedimientos descritos en los documentos WO2010/091310, WO 2012/66061 o WO2013/099041.

Los compuestos de la fórmula (XVII) o bien están comercialmente disponibles o bien pueden prepararse mediante procedimientos conocidos, por ejemplo de forma análoga a los procedimientos descritos en los documentos WO2005/100353, WO 2012/66061 o en European Journal of Medicinal Chemistry 2010, 45, 2214 - 2222.

Los compuestos de la fórmula (XVIII) o bien están comercialmente disponibles o bien pueden prepararse mediante procedimientos conocidos, por ejemplo de forma análoga a los procedimientos descritos en los documentos WO2013/43518, EP2168965 o en Journal of Medicinal Chemistry 2003, 46, 1449 – 1455.

Como bases se utilizan sobre todo bases inorgánicas tales como hidruro sódico, carbonato potásico o carbonato de cesio.

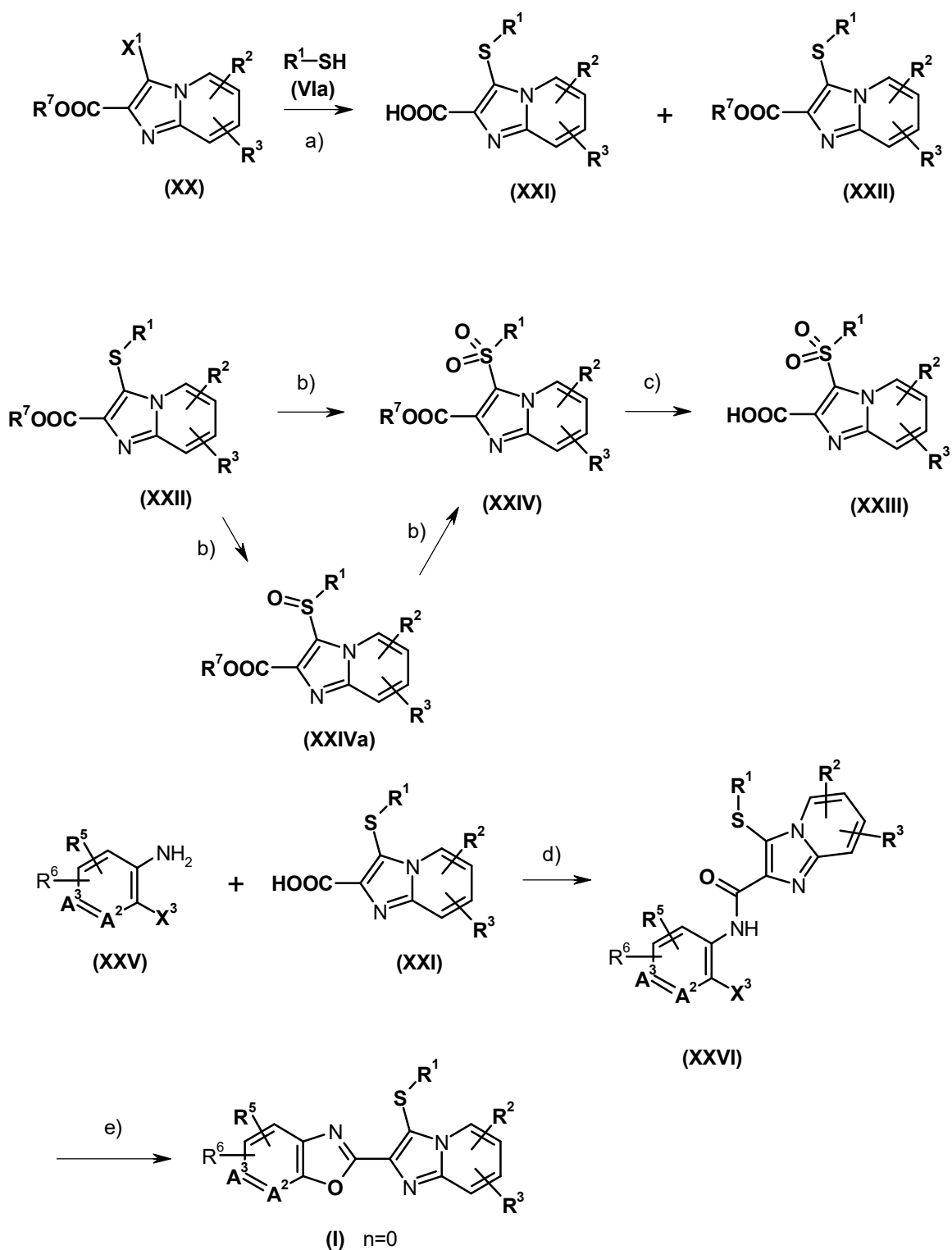
La reacción para formar compuestos de la fórmula (XIX) por lo general se lleva a cabo en un disolvente, preferentemente en un nitrilo, tal como acetonitrilo o propionitrilo o en disolventes polares apróticos tal como por ejemplo N,N-dimetilformamida o N-metilpirrolidona.

La reacción se puede realizar al vacío, a presión atmosférica o a sobrepresión y a temperaturas de 0 °C a 200 °C.

Alternativamente, la reacción de compuestos de la fórmula (XVII) con compuestos de la fórmula (XVIII) para dar compuestos de la fórmula (XIX) también se puede realizar por medio de *N*-arilación catalizada por paladio, por ejemplo en forma análoga a los procedimientos descritos en Angewandte Chemie Int. Ed. 2011, 50, 8944-8947.

La reacción adicional de compuestos de la fórmula (XIX) para dar compuestos de la fórmula (I) se realiza en forma análoga al procedimiento A.

Procedimiento F



Los radicales R^1, R^2, R^3, R^5, R^6 y n tienen los significados indicados anteriormente, A^2 y A^3 representan CH o N, X^1 representa halógeno, X^3 representa halógeno y R^7 representa (C_1-C_4) alquilo.

Etapas a)

- 5 Los compuestos de las fórmulas (XXI) y (XXII) pueden prepararse por transformación de los compuestos de la fórmula (XX) con compuestos de la fórmula (VIa) en presencia de una base.

Los compuestos de la fórmula (XX) o bien están comercialmente disponibles o bien pueden prepararse mediante procedimientos conocidos, por ejemplo de derivados 2-aminopiridina, de forma análoga a los procedimientos descritos en el documento WO2011/41713.

Los derivados de mercaptano de la fórmula (VIa) como por ejemplo metanotiol, etanotiol o mercaptano isopropílico o bien están comercialmente disponibles o bien pueden prepararse mediante procedimientos conocidos, por ejemplo, de forma análoga a los procedimientos descritos en los documentos US2006/25633, US2006/111591, US2820062, Chemical Communications, 13 (2000), 1163-1164 o Journal of the American Chemical Society, 44 (1922), p. 1329.

- 5 La reacción para dar compuestos de las fórmulas (XXI) y (XXII) puede realizarse en una sustancia o en un disolvente, preferentemente la reacción se realiza en un disolvente seleccionado entre los disolventes inertes habituales en las condiciones de reacción que prevalecen. Se prefieren éteres como por ejemplo diisopropiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, metil terc-butil éter; nitrilos, como por ejemplo acetonitrilo o propionitrilo; hidrocarburos aromáticos como por ejemplo tolueno o xileno; disolventes polares apróticos como por ejemplo N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona o dimetilsulfóxido.
- 10

Ejemplos de bases adecuadas son bases inorgánicas del grupo que consiste de acetatos, fosfatos y carbonatos de metales alcalinos o alcalinotérreos. A este respecto, se prefiere carbonato de cesio, carbonato sódico y carbonato potásico. Otras bases adecuadas son hidruros de metales alcalinos como por ejemplo hidruro de sodio.

La reacción se puede realizar al vacío, a presión atmosférica o a sobrepresión y a temperaturas de 0 °C a 200 °C.

15 **Etapla b)**

Los compuestos de la fórmula (XXIV) pueden prepararse por oxidación de los compuestos de la fórmula (XXII). La oxidación generalmente se realiza en un disolvente. Se prefieren hidrocarburos halogenados como por ejemplo diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; alcoholes como metanol o etanol; ácido fórmico, ácido acético, ácido propanoico o agua.

- 20 Ejemplos de oxidantes adecuados son peróxido de hidrógeno y ácido metacloroperbenzoico.

La reacción se puede realizar al vacío, a presión atmosférica o a sobrepresión y a temperaturas de -20 °C a 120 °C.

Los compuestos de la fórmula (XXIVa) pueden producirse en forma análoga mediante oxidación de los compuestos de la fórmula (XXII).

- 25 Los compuestos de la fórmula (XXIV) pueden producirse en forma análoga mediante oxidación de los compuestos de la fórmula (XXIVa).

Etapla c)

- 30 Los compuestos de la fórmula (XXIII) se pueden preparar por hidrólisis de los compuestos de la fórmula (XXIV) en presencia de una base. La hidrólisis generalmente se realiza en un disolvente. Se prefieren alcoholes como metanol o etanol; agua; éter como por ejemplo diisopropiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, metil terc-butil éter; nitrilos, como por ejemplo acetonitrilo o propionitrilo; hidrocarburos aromáticos como por ejemplo tolueno o xileno; disolventes polares apróticos como por ejemplo N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona o dimetilsulfóxido; o mezclas de los disolventes mencionados.

- 35 Ejemplos de bases adecuadas son bases inorgánicas del grupo que consiste de acetatos, fosfatos y carbonatos de metales alcalinos y alcalinotérreos. A este respecto, se prefieren carbonato de cesio, carbonato sódico y carbonato potásico.

La reacción se puede realizar al vacío, a presión atmosférica o a sobrepresión y a temperaturas de -20 °C a 200 °C.

- 40 La reacción adicional de compuestos de la fórmula (XXIII) para dar compuestos de la fórmula (I) se realiza en forma análoga al procedimiento A.

Etapla d)

Los compuestos de la fórmula (XXVI) pueden prepararse por la transformación de los compuestos de la fórmula (XXV) con ácidos carboxílicos de la fórmula (XXI) en presencia de un agente de condensación o de una base.

- 45 Los compuestos de la fórmula (XXV) o bien están comercialmente disponibles o bien pueden prepararse mediante procedimientos conocidos, por ejemplo de forma análoga a los procedimientos descritos en los documentos US2003/069257, US2012/0319050, WO2011/107998 o WO2010/91310.

- 50 La reacción de los compuestos de la fórmula (XXV) con ácidos carboxílicos de la fórmula (XXI) puede realizarse en una sustancia o en un disolvente, preferentemente la reacción se realiza en un disolvente que está seleccionado entre los disolventes inertes habituales en las condiciones de reacción que prevalecen. Se prefieren éteres como por ejemplo diisopropiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano; hidrocarburos halogenados como por ejemplo diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; nitrilos, como por ejemplo

acetonitrilo o propionitrilo; hidrocarburos aromáticos como por ejemplo tolueno o xileno; disolventes polares apróticos como por ejemplo N,N-dimetilformamida o N-metilpirrolidona o compuestos nitrogenados como por ejemplo piridina.

Agentes de condensación adecuados son por ejemplo carbodiimidas tales como 1-(3-dimetilaminopropil)-3-clorhidrato de etilcarbodiimida (EDCI), 1,3-diciclohexilcarbodiimida, cloruro de tionilo o cloruro de oxalilo.

- 5 Bases adecuadas son bases inorgánicas que generalmente se usan en tales reacciones. Preferentemente se usan bases que están seleccionadas por ejemplo del grupo que consiste de acetatos, fosfatos, carbonatos y bicarbonatos de metales alcalinos o alcalinotérreos. A este respecto, especialmente preferentes son acetato sódico, fosfato sódico, fosfato de potasio, carbonato de cesio, carbonato sódico, carbonato potásico, bicarbonato sódico, bicarbonato de potasio. Otras bases adecuadas son hidruros de metales alcalinos como por ejemplo hidruro de sodio.
- 10 La reacción se puede realizar al vacío, a presión atmosférica o a sobrepresión y a temperaturas de 0 °C a 180 °C, preferentemente la reacción se realiza a presión atmosférica y a temperaturas de 20 a 140 °C.

Etapa e)

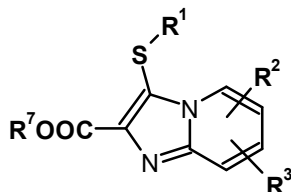
Los compuestos de la fórmula (I), donde n representa 0, se pueden producir mediante condensación de los compuestos de la fórmula (XXVI) en presencia de una base.

- 15 La reacción para dar compuestos de la fórmula (I), donde n representa 0, puede realizarse en una sustancia o en un disolvente, preferentemente la reacción se realiza en un disolvente que está seleccionado entre los disolventes inertes habituales en las condiciones de reacción que prevalecen. Se prefieren éteres como por ejemplo diisopropiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, metil terc-butil éter; hidrocarburos halogenados como por ejemplo diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; nitrilos, como por ejemplo
- 20 acetonitrilo o propionitrilo; hidrocarburos aromáticos como por ejemplo tolueno o xileno; disolventes polares apróticos como por ejemplo N,N-dimetilformamida o N-metilpirrolidona o compuestos que contienen nitrógeno tales como piridina.

- 25 Bases adecuadas son bases inorgánicas que se utilizan comúnmente en tales reacciones. Preferentemente se utilizan bases que se seleccionan por ejemplo del grupo que consiste de acetatos, fosfatos, carbonatos y bicarbonatos de metales alcalinos o alcalinotérreos. Son especialmente preferentes acetato sódico, fosfato sódico, fosfato de potasio, carbonato de cesio, carbonato sódico, carbonato potásico, bicarbonato sódico, bicarbonato de potasio.

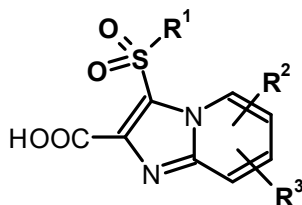
La reacción se puede realizar al vacío, a presión atmosférica o a sobrepresión y a temperaturas de 0 °C a 200 °C.

Objeto de la invención también son compuestos de la fórmula (XXII)



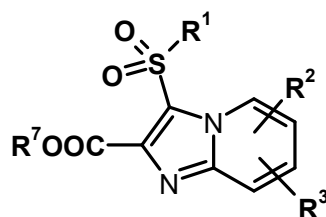
- 30 en la que
 R^1 , R^2 y R^3 tienen los significados dados anteriormente y
 R^7 representa (C_1 - C_4)alquilo (preferentemente metilo o etilo, especialmente preferente etilo).

Objeto de la invención también son compuestos de la fórmula (XXIII)



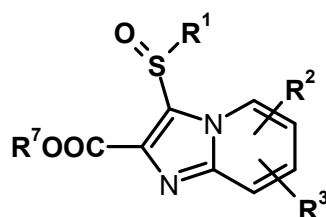
- 35 en la que R^1 , R^2 y R^3 tienen los significados dados anteriormente.

Objeto de la invención también son compuestos de la fórmula (XXIV)



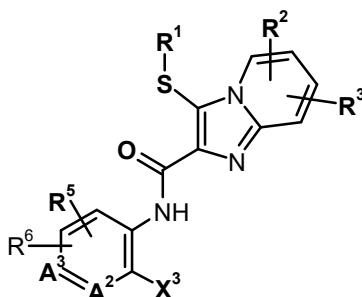
en la que R¹, R², R³ y R⁷ tienen los significados dados anteriormente.

Objeto de la invención también son compuestos de la fórmula (XXIVa)



5 en la que R¹, R², R³ y R⁷ tienen los significados dados anteriormente.

Objeto de la invención también son compuestos de la fórmula (XXVI)



en la que

- 10 X³ representa halógeno (preferentemente cloro, bromo, yodo o flúor; especialmente preferente cloro o bromo, muy especialmente preferente cloro),
A² y A³ representa CH o N,
R¹, R², R³, R⁵ y R⁶ tienen los significados dados anteriormente.

Los compuestos intermedios de la fórmula (III) se conocen en parte por los documentos: WO 2011/073316, WO 2013/018371, WO 2009/023179, WO 2011/041713.

- 15 Los compuestos intermedios de la fórmula (V) se conocen en parte por los documentos: Archiv der Pharmazie, tomo 335, n.º 1, páginas 27-32, Chemical and Pharmaceutical Bulletin, tomo 39, n.º 11, páginas 2937-2943, documentos EP 0120598 A1, EP 0052016 A1, The Journal of Organic Chemistry, tomo 41, n.º. 22, páginas 3549-3556.

- 20 Los compuestos intermedios de la fórmula (XXII) y de la fórmula (XXIV) se conocen en parte por los documentos: WO 97/11075, Tetrahedron, tomo 69, n.º 38, páginas 8255-8262, Chemometrics and Intelligent Laboratory Systems, tomo 20, n.º 1, páginas 71-84, Asian Journal of Organic chemistry, tomo 3, n.º 5, páginas 609-613, Journal of Organic Chemistry, tomo 46, n.º 5, páginas 1026-1030, Chemical Abstracts Service XP002757605.

Procedimientos y usos

- 25 La invención también se refiere a procedimientos para controlar plagas animales, donde los compuestos de fórmula (I) se dejan actuar sobre plagas animales y/o su hábitat. El control de las plagas animales se lleva a cabo preferentemente en agricultura y silvicultura y en la protección de materiales. Preferentemente excluidos de esto están los procedimientos para el tratamiento quirúrgico o terapéutico del cuerpo humano o animal y procedimientos de diagnóstico llevados a cabo en el cuerpo humano o animal.

Aparte de eso, la invención se refiere al uso de los compuestos de la fórmula (I) como pesticidas, especialmente agentes de protección de cultivo.

- 30 En el contexto de la presente solicitud, el término "pesticida" siempre comprende también el término "agente de

protección de cultivo".

Los compuestos de la fórmula (I), dada la buena tolerancia a las plantas, toxicidad de homeotermia favorable y buena compatibilidad ambiental, son adecuados para proteger plantas y órganos de plantas contra factores de estrés bióticos y abióticos, para aumentar los rendimientos de las cosechas, para mejorar la calidad del material cultivado y para controlar plagas animales, especialmente insectos, arácnidos, helmintos, nematodos y moluscos, que se encuentran en la agricultura, en la horticultura, en la cría de animales, en cultivos acuáticos, en bosques, en jardines y en instalaciones de recreación, en la protección de productos almacenados y de materiales así como en el sector de higiene.

En el contexto de la presente solicitud, el término "higiene" comprende la totalidad de las medidas, procedimientos y prácticas que tienen por objetivo evitar enfermedades – en particular enfermedades infecciosas – y que están al servicio de la salud de la gente, animales y/o del medio ambiente y/o para mantener la limpieza. De acuerdo con la invención, esto incluye en particular medidas para la limpieza, desinfección y esterilización de por ejemplo textiles o superficies duras, principalmente de vidrio, madera, hormigón, porcelana, cerámica, plástico o de metal(es), y la limpieza de las plagas sanitarias o sus heces respectivamente. Excluidos de esto a su vez están los procedimientos para el tratamiento quirúrgico o terapéutico del cuerpo humano o animal y procedimientos de diagnóstico llevados a cabo en el cuerpo humano o animal.

El término "área de la higiene" por lo tanto incluye todas las áreas, campos técnicos y usos comerciales, en los cuales tales medidas, procedimientos y prácticas en materia de higiene son de importancia, por ejemplo la higiene en cocinas, panaderías, aeropuertos, baños, piscinas, grandes almacenes, hoteles, hospitales, establos, etc.

El término "plagas sanitarias" comprende en consecuencia una o varias plaga(s) animal(es) cuya presencia en el área de la higiene es particularmente problemática por razones de salud. Por lo tanto el objetivo principal es evitar o minimizar las plagas sanitarias o el contacto con ellas en el área de la higiene. Esto puede lograrse particularmente con el uso de un pesticida, donde el agente se puede utilizar tanto de forma profiláctica así como solamente en caso de infestación para controlar la plaga. También es posible aplicar agentes que provocan que el contacto con la plaga sea evitado o reducido. Se consideran plagas sanitarias por ejemplo los organismos que se enumeran a continuación.

El término "protección de la higiene" por lo tanto comprende todas las acciones para mantener y/o mejorar tales medidas, procedimientos y prácticas para la higiene.

Los compuestos de la fórmula (I) se pueden usar preferentemente como pesticidas. Son activos contra especies normalmente sensibles y resistentes así como contra todas o algunas etapas de desarrollo. Las plagas antemencionadas incluyen:

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

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

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

de la clase de Diplopoda por ejemplo *Blaniulus guttulatus*;

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

del orden de Coleoptera por ejemplo *Acalymma vittatum*, *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus* spp., *Aethina tumida*, *Agelastica alni*, *Agriotes* spp., por ejemplo *Agriotes linneatus*, *Agriotes mancus*, *Alphitobius diaperinus*,

- Amphimallon solstitialis, Anobium punctatum, Anoplophora spp., Anthonomus spp., por ejemplo Anthonomus grandis, Anthrenus spp., Apion spp., Apogonia spp., Atomaria spp., por ejemplo Atomaria linearis, Attagenus spp., Baris caerulescens, Bruchidius obtectus, Bruchus spp., por ejemplo Bruchus pisorum, Bruchus rufimanus, Cassida spp., Cerotoma trifurcata, Ceutorhynchus spp., por ejemplo Ceutorhynchus assimilis, Ceutorhynchus quadridens, 5 Ceutorhynchus rapae, Chaetocnema spp., por ejemplo Chaetocnema confinis, Chaetocnema denticulata, Chaetocnema ectypa, Cleonus mendicus, Conoderus spp., Cosmopolites spp., por ejemplo Cosmopolites sordidus, Costelytra zealandica, Ctenicera spp., Curculio spp., por ejemplo Curculio caryae, Curculio caryatipes, Curculio obtusus, Curculio sayi, Cryptolestes ferrugineus, Cryptolestes pusillus, Cryptorhynchus lapathi, Cryptorhynchus mangiferae, Cylindrocopturus spp., Cylindrocopturus adpersus, Cylindrocopturus furnissi, Dermestes spp., 10 Diabrotica spp., por ejemplo Diabrotica balteata, Diabrotica barberi, Diabrotica undecimpunctata howardi, Diabrotica undecimpunctata, Diabrotica virgifera, Diabrotica virgifera zea, Dichocrocis spp., Diadisa armigera, Diloboderus spp., Epicaerus spp., Epilachna spp., por ejemplo Epilachna borealis, Epilachna varivestis, Epitrix spp., por ejemplo Epitrix cucumeris, Epitrix fuscata, Epitrix hirtipennis, Epitrix subcristata, Epitrix tuberis, Faustinus spp., Gibbium psyllodes, Gnathocerus cornutus, Hellula undalis, Heteronychus arator, Heteronyx spp., Hylamorphia 15 elegans, Hylotrupes bajulus, Hypera postica, Hypomeces squamosus, Hypothenemus spp., por ejemplo Hypothenemus hampei, Hypothenemus obscurus, Hypothenemus pubescens, Lachnosterna consanguinea, Lasioderma serricorne, Latheticus oryzae, Lathridius spp., Lema spp., Leptinotarsa decemlineata, Leucoptera spp., por ejemplo Leucoptera coffeella, Lissorhoptrus oryzophilus, Lissorhoptrus (= Hyperodes) spp., Lixus spp., Luperomorphia xanthodera, Luperodes spp., Lyctus spp., Megascelus spp., Melanotus spp., por ejemplo Melanotus 20 longulus oregonensis, Meligethes aeneus, Melolontha spp., por ejemplo Melolontha, Migdolus spp., Monochamus spp., Naupactus xanthographus, Necrobia spp., Neogalerucella spp., Niptus hololeucus, Oryctes rhinoceros, Oryzaephilus surinamensis, Oryzaphagus oryzae, Otiorhynchus spp., por ejemplo Otiorhynchus cribricollis, Otiorhynchus ligustici, Otiorhynchus ovatus, Otiorhynchus rugosostriatus, Otiorhynchus sulcatus, Oulema spp., Oulema oryzae, Oxycetonia jucunda, Phaedon cochleariae, Phyllophaga spp., Phyllophaga helleri, 25 Phyllotreta spp., por ejemplo Phyllotreta armoraciae, Phyllotreta pusilla, Phyllotreta ramosa, Phyllotreta striolata, Popillia japonica, Prosternon truncatus, Psylliodes spp., por ejemplo Psylliodes affinis, Psylliodes chrysocephala, Psylliodes punctulata, Ptinus spp., Rhizobius ventralis, Rhizophora dominica, Rhynchophorus spp., Rhynchophorus ferrugineus, Rhynchophorus palmarum, Sinocoryphus perforans, Sitophilus spp., por ejemplo Sitophilus granarius, Sitophilus linearis, Sitophilus oryzae, Sitophilus zeamais, Sphenophorus 30 spp., Stegobium paniceum, Stereococcus spp., por ejemplo Stereococcus paludatus, Symphyletes spp., Tanyecus spp., por ejemplo Tanyecus dilaticollis, Tanyecus indicus, Tanyecus palliatus, Tenebrio molitor, Tenebrioides mauritanicus, Tribolium spp., por ejemplo Tribolium audax, Tribolium castaneum, Tribolium confusum, Trogoderma spp., Tychius spp., Xylotrechus spp., Zabrus spp., por ejemplo Zabrus tenebrioides;
- del orden de Dermoptera por ejemplo Anisotoma maritime, Forficula auricularia, Labidura riparia;
- 35 del orden de Diptera por ejemplo Aedes spp., por ejemplo Aedes aegypti, Aedes albopictus, Aedes sticticus, Aedes vexans, Agomyza spp., por ejemplo Agomyza frontella, Agomyza parvicornis, Anastrepha spp., Anopheles spp., por ejemplo Anopheles quadrimaculatus, Anopheles gambiae, Asphondylia spp., Bactrocera spp., por ejemplo Bactrocera cucurbitae, Bactrocera dorsalis, Bactrocera oleae, Bibio hortulanus, Calliphora erythrocephala, Calliphora vicina, Ceratitis capitata, Chironomus spp., Chrysomya spp., Chrysops spp., Chrysopa pluvialis, 40 Cochliomya spp., Contarinia spp., por ejemplo Contarinia johnsoni, Contarinia nasturtii, Contarinia pyrivora, Contarinia schulzi, Contarinia sorghicola, Contarinia tritici, Cordylobia anthropophaga, Cricotopus sylvestris, Culex spp., por ejemplo Culex pipiens, Culex quinquefasciatus, Culicoides spp., Culiceta spp., Cuterebra spp., Dacus oleae, Dasineura spp., por ejemplo Dasineura brassicae, Delia spp., por ejemplo Delia antiqua, Delia coarctata, Delia florilega, Delia platura, Delia radicum, Dermatobia hominis, Drosophila spp., por ejemplo Drosophila melanogaster, Drosophila suzukii, Echinocnema spp., Euleia heraclei, Fannia spp., Gasterophilus spp., Glossina spp., Haematopota spp., Hydrella spp., Hydrellia griseola, Hylemya spp., Hippobosca spp., Hypoderma spp., 45 Liriomyza spp., por ejemplo Liriomyza brassicae, Liriomyza huidobrensis, Liriomyza sativae, Lucilia spp., por ejemplo Lucilia cuprina, Lutzomyia spp., Mansonia spp., Musca spp., por ejemplo Musca domestica, Musca domestica vicina, Oestrus spp., Oscinella frit, Paratanytarsus spp., Paralauterborniella subcincta, Pegomya spp., por ejemplo Pegomya betae, Pegomya hyoscyami, Pegomya rubivora, Phlebotomus spp., Phorbia spp., Phormia 50 spp., Piophilidae, Platyparea poeciloptera, Prodiptosis spp., Psila rosae, Rhagoletis spp., por ejemplo Rhagoletis cingulata, Rhagoletis completa, Rhagoletis fausta, Rhagoletis indifferens, Rhagoletis mendax, Rhagoletis pomonella, Sarcophaga spp., Simulium spp., por ejemplo Simulium meridionale, Stomoxys spp., Tabanus spp., Tetanops spp., Tipula spp., por ejemplo Tipula paludosa, Tipula simplex, Toxotrypana curvicauda;
- 55 del orden de Hemiptera por ejemplo Acizzia acaciaebaileyanae, Acizzia dodonaeae, Acizzia uncatoides, Acrida turrita, Acyrthosiphon spp., por ejemplo Acyrthosiphon pisum, Acrogonia spp., Aeneolamia spp., Agonosceles spp., Aleurocanthus spp., Aleyrodes proletella, Aleurolobus barodensis, Aleurothrix floccosus, Allocaridara malayensis, Amrasca spp., por ejemplo Amrasca biguttula, Amrasca devastans, Anuraphis cardui, Aonidiella spp., por ejemplo Aonidiella aurantii, Aonidiella citrina, Aonidiella inornata, Aphanostigma piri, Aphis spp., por ejemplo 60 Aphis citricola, Aphis craccivora, Aphis fabae, Aphis forbesi, Aphis glycines, Aphis gossypii, Aphis hederiae, Aphis illinoisensis, Aphis middletoni, Aphis nasturtii, Aphis nerii, Aphis pomi, Aphis spiraeola, Aphis viburniphila, Arboridia apicalis, Atractodes spp., Aspidiotus spp., Aspidiotus spp., por ejemplo Aspidiotus nerii, Atanous spp., Aulacorthum solani, Bemisia tabaci, Blastopsylla occidentalis, Boreioglycaspis melaleuciae, Brachycaudus

5 helichrysi, *Brachycolus* spp., *Brevicoryne brassicae*, *Cacopsylla* spp., por ejemplo *Cacopsylla pyricola*, *Calligypona marginata*, *Capulinia* spp., *Carneiocephala fulgida*, *Ceratovacuna lanigera*, *Cercopidae*, *Ceroplastes* spp., *Chaetosiphon fragaefolii*, *Chionaspis tegalensis*, *cloroita onukii*, *Chondracris rosea*, *Chromaphis juglandicola*, *Chrysomphalus aonidum*, *Chrysomphalus ficus*, *Cicadulina mbila*, *Coccoxystus halli*, *Coccus* spp., por ejemplo *Coccus hesperidum*, *Coccus longulus*, *Coccus pseudomagnoliarum*, *Coccus viridis*, *Cryptomyzus ribis*, *Cryptoneossa* spp., *Ctenarytaina* spp., *Dalbulus* spp., *Dialeurodes chittendeni*, *Dialeurodes citri*, *Diaphorina citri*, *Diaspis* spp., *Diuraphis* spp., *Drosicha* spp., *Dysaphis* spp., por ejemplo *Dysaphis apiifolia*, *Dysaphis plantaginea*, *Dysaphis tulipae*, *Dysmicoccus* spp., *Empoasca* spp., por ejemplo *Empoasca abrupta*, *Empoasca fabae*, *Empoasca maligna*, *Empoasca solana*, *Empoasca stevensi*, *Eriosoma* spp., por ejemplo *Eriosoma americanum*, *Eriosoma lanigerum*, *Eriosoma pyricola*, *Erythroneura* spp., *Eucalyptolyma* spp., *Euphyllura* spp., *Euscelis bilobatus*, *Ferrisia* spp., *Fiorinia* spp., *Furcaspis oceanica*, *Geococcus coffeae*, *Glycaspis* spp., *Heteropsylla cubana*, *Heteropsylla spinulosa*, *Homalodisca coagulata*, *Hyalopterus arundinis*, *Hyalopterus pruni*, *Icerya* spp., por ejemplo *Icerya purchasi*, *Idiocerus* spp., *Idioscopus* spp., *Laodelphax striatellus*, *Lecanium* spp., por ejemplo *Lecanium corni* (= *Parthenolecanium corni*), *Lepidosaphes* spp., por ejemplo *Lepidosaphes ulmi*, *Lipaphis erysimi*, *Lopholeucaspis japonica*, *Lycorma delicatula*, *Macrosiphum* spp., por ejemplo *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphum lili*, *Macrosiphum rosae*, *Macrosteles facifrons*, *Mahanarva* spp., *Melanaphis sacchari*, *Metcalfiella* spp., *Metcalfa pruinosa*, *Metopolophium dirhodum*, *Monellia costalis*, *Monelliopsis pecanis*, *Myzus* spp., por ejemplo *Myzus ascalonicus*, *Myzus cerasi*, *Myzus ligustri*, *Myzus ornatus*, *Myzus persicae*, *Myzus nicotianae*, *Nasonovia ribisnigri*, *Neomaskellia* spp., *Nephotettix* spp., por ejemplo *Nephotettix cincticeps*, *Nephotettix nigropictus*, *Nettigoniclla spectra*, *Nilaparvata lugens*, *Oncometopia* spp., *Orthezia praelonga*, *Oxya chinensis*, *Pachypsylla* spp., *Parabemisia myricae*, *Paratrioza* spp., por ejemplo *Paratrioza cockerelli*, *Parlatoria* spp., *Pemphigus* spp., por ejemplo *Pemphigus bursarius*, *Pemphigus populiveneris*, *Peregrinus maidis*, *Perkinsiella* spp., *Phenacoccus* spp., por ejemplo *Phenacoccus madeirensis*, *Phloeomyzus passerinii*, *Phorodon humuli*, *Phylloxera* spp., por ejemplo *Phylloxera devastatrix*, *Phylloxera notabilis*, *Pinnaspis aspidistrae*, *Planococcus* spp., por ejemplo *Planococcus citri*, *Prosopidopsylla flava*, *Protopulvinaria pyrifomis*, *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pseudococcus* spp., por ejemplo *Pseudococcus calceolariae*, *Pseudococcus comstocki*, *Pseudococcus longispinus*, *Pseudococcus maritimus*, *Pseudococcus viburni*, *Psyllopsis* spp., *Psylla* spp., por ejemplo *Psylla buxi*, *Psylla mali*, *Psylla pyri*, *Pteromalus* spp., *Pulvinaria* spp., *Pyrilla* spp., *Quadraspidiotus* spp., por ejemplo *Quadraspidiotus juglansregiae*, *Quadraspidiotus ostreaeformis*, *Quadraspidiotus perniciosus*, *Quesada gigas*, *Rastrococcus* spp., *Rhopalosiphum* spp., por ejemplo *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum oxyacanthae*, *Rhopalosiphum padi*, *Rhopalosiphum rufiabdominale*, *Saissetia* spp., por ejemplo *Saissetia coffeae*, *Saissetia miranda*, *Saissetia neglecta*, *Saissetia oleae*, *Scaphoideus titanus*, *Schizaphis graminum*, *Selenaspidus articulatus*, *Sitobion avenae*, *Sogata* spp., *Sogatella furcifera*, *Sogatodes* spp., *Stictocephala festina*, *Siphoninus phillyrae*, *Tenalaphara malayensis*, *Tetragonocephala* spp., *Tinocallis caryaefoliae*, *Tomasia* spp., *Toxoptera* spp., por ejemplo *Toxoptera aurantii*, *Toxoptera citricidus*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Trioza* spp., por ejemplo *Trioza diospyri*, *Typhlocyba* spp., *Unaspis* spp., *Viteus vitifolii*, *Zygina* spp.;

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

del orden de Hymenoptera por ejemplo *Acromyrmex* spp., *Athalia* spp., por ejemplo *Athalia rosae*, *Atta* spp., *Camponotus* spp., *Dolichovespula* spp., *Diprion* spp., por ejemplo *Diprion similis*, *Hoplocampa* spp., por ejemplo *Hoplocampa cooki*, *Hoplocampa testudinea*, *Lasius* spp., *Linepithema humile*, *Monomorium pharaonis*, *Paratrechina* spp., *Paravespula* spp., *Plagiolepis* spp., *Sirex* spp., *Solenopsis invicta*, *Tapinoma* spp., *Technomyrmex albipes*, *Urocera* spp., *Vespa* spp., por ejemplo *Vespa crabro*, *Wasmannia auropunctata*, *Xeris* spp.;

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

55 del orden de Isoptera por ejemplo *Coptotermes* spp., por ejemplo *Coptotermes formosanus*, *Cornitermes cumulans*, *Cryptotermes* spp., *Incisitermes* spp., *Kalotermites* spp., *Microtermes obesi*, *Nasutitermes* spp., *Odontotermes* spp., *Porotermes* spp., *Reticulitermes* spp., por ejemplo *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes hesperus*;

60 del orden de Lepidoptera por ejemplo *Achroia grisella*, *Acronicta major*, *Adoxophyes* spp., por ejemplo *Adoxophyes orana*, *Aedia leucomelas*, *Agrotis* spp., por ejemplo *Agrotis segetum*, *Agrotis ipsilon*, *Alabama* spp., por ejemplo *Alabama argillacea*, *Amyelois transitella*, *Anarsia* spp., *Anticarsia* spp., por ejemplo *Anticarsia gemmatilis*, *Argyroprocta* spp., *Autographa* spp., *Barathra brassicae*, *Blastodacna atra*, *Borbo cinnara*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Busseola* spp., *Cacoecia* spp., *Caloptilia theivora*, *Capua reticulana*, *Carpocapsa pomonella*,

- 5 Carposina niponensis, Cheimatomia brumata, Chilo spp., por ejemplo Chilo plejadellus, Chilo suppressalis, Choreutis pariana, Choristonuevara spp., Chrysodeixis chalcites, Clysia ambiguella, Cnaphalocerus spp., Cnaphalocrocis medinalis, Cnephasia spp., Conopomorpha spp., Conotrachelus spp., Copitarsia spp., Cydia spp., por ejemplo Cydia nigricana, Cydia pomonella, Dalaca noctuides, Diaphania spp., Diparopsis spp., Diatraea saccharalis, Earias spp., Ecdytolopha aurantium, Elasmopalpus lignosellus, Eldana saccharina, Ephestia spp., por ejemplo Ephestia elutella, Ephestia kuehniella, Epinotia spp., Epiphyas postvittana, Erannis spp., Erschoviella musculana, Etiella spp., Eudocima spp., Eulia spp., Eupoecilia ambiguella, Euproctis spp., por ejemplo Euproctis chrysorrhoea, Euxoa spp., Feltia spp., Galleria mellonella, Gracillaria spp., Grapholitha spp., por ejemplo Grapholitha molesta, Grapholita prunivora, Hedylepta spp., Helicoverpa spp., por ejemplo Helicoverpa armigera, Helicoverpa zea, Heliothis spp., por ejemplo Heliothis virescens, Hofmannophila pseudospretella, Homoeosoma spp., Homona spp., Hyponomeuta padella, Kakivoria flavofasciata, Lampides spp., Laphygma spp., Laspeyresia molesta, Leucinodes orbonalis, Leucoptera spp., por ejemplo Leucoptera coffeella, Lithocolletis spp., por ejemplo Lithocolletis blancardella, Lithophane antennata, Lobesia spp., por ejemplo Lobesia botrana, Loxagrotis albicosta, Lymantria spp., por ejemplo Lymantria dispar, Lyonetia spp., por ejemplo Lyonetia clerkella, Malacosoma neustria, Maruca testulalis, Mamestra brassicae, Melanitis leda, Mocis spp., Monopis obviella, Mythimna separata, Nemapogon cloacellus, Nymphula spp., Oiketicus spp., Omphisa spp., Operophtera spp., Oria spp., Orthaga spp., Ostrinia spp., por ejemplo Ostrinia nubilalis, Oulema melanopus, Oulema oryzae, Panolis flammea, Parnara spp., Pectinophora spp., por ejemplo Pectinophora gossypiella, Perileucoptera spp., Phthorimaea spp., por ejemplo Phthorimaea operculella, Phyllocnistis citrella, Phyllonorycter spp., por ejemplo Phyllonorycter blancardella, Phyllonorycter crataegella, Pieris spp., por ejemplo Pieris rapae, Platynota stultana, Plodia interpunctella, Plusia spp., Plutella xylostella (=Plutella maculipennis), Prays spp., Prodenia spp., Protoperla spp., Pseudaletia spp., por ejemplo Pseudaletia unipuncta, Pseudoplusia includens, Pyrausta nubilalis, Rachiplusia nu, Schoenobius spp., por ejemplo Schoenobius bipunctifer, Scirpophaga spp., por ejemplo Scirpophaga innotata, Scotia segetum, Sesamia spp., por ejemplo Sesamia inferens, Sparganothis spp., Spodoptera spp., por ejemplo Spodoptera eridania, Spodoptera exigua, Spodoptera frugiperda, Spodoptera praefica, Stathmopoda spp., Stenoma spp., Stomopteryx subsecivella, Synanthedon spp., Tecia solanivora, Thaumetopoea spp., Thermesia gemmatilis, Tinea cloacella, Tinea pellionella, Tineola bisselliella, Tortrix spp., Trichophaga tapetzella, Trichoplusia spp., por ejemplo Trichoplusia ni, Tryporyza incertulas, Tuta absoluta, Virachola spp.;
- 30 del orden de Orthoptera o Saltatoria por ejemplo Acheta domesticus, Dichroplus spp., Gryllotalpa spp., por ejemplo Gryllotalpa gryllotalpa, Hieroglyphus spp., Locusta spp., por ejemplo Locusta migratoria, Melanoplus spp., por ejemplo Melanoplus devastator, Paratlanticus ussuriensis, Schistocerca gregaria;
- del orden de Phthiraptera por ejemplo Damalinia spp., Haematopinus spp., Linognathus spp., Pediculus spp., Phylloxera vastatrix, Phthirus pubis, Trichodectes spp.;
- del orden de Psocoptera por ejemplo Lepinotus spp., Liposcelis spp.;
- 35 del orden de Siphonaptera por ejemplo Ceratophyllus spp., Ctenocephalides spp., por ejemplo Ctenocephalides canis, Ctenocephalides felis, Pulex irritans, Tunga penetrans, Xenopsylla cheopis;
- 40 del orden de Thysanoptera por ejemplo Anaphothrips obscurus, Baliothrips bififormis, Chaetanaphothrips leeuweni, Drepanothrips reuteri, Enneothrips flavens, Frankliniella spp., por ejemplo Frankliniella fusca, Frankliniella occidentalis, Frankliniella schultzei, Frankliniella tritici, Frankliniella vaccinii, Frankliniella williamsi, Haplothrips spp., Heliotothrips spp., Hercinothrips femoralis, Rhipiphorotheus cruentatus, Scirtothrips spp., Taeniothrips cardamomi, Thrips spp., por ejemplo Thrips palmi, Thrips tabaci;
- del orden de Zygentoma (= Thysanura), por ejemplo Ctenolepisma spp., Lepisma saccharina, Lepismodes inquilinus, Thermobia domestica;
- de la clase de Symphyla por ejemplo Scutigera spp., por ejemplo Scutigera immaculata;
- 45 plagas del filo de Mollusca, en particular de la clase de Bivalvia, por ejemplo Dreissena spp.;
- así como de la clase de Gastropoda por ejemplo Arion spp., por ejemplo Arion ater rufus, Biomphalaria spp., Bulinus spp., Deroceras spp., por ejemplo Deroceras laeve, Galba spp., Lymnaea spp., Oncomelania spp., Pomacea spp., Succinea spp.;
- 50 parásitos de animales y humanos del filo de Platyhelminthes y Nematoda, por ejemplo Aelurostrongylus spp., Amidostomum spp., Ancylostoma spp., Angiostrongylus spp., Anisakis spp., Anoplocephala spp., Ascaris spp., Ascaridia spp., Baylisascaris spp., Brugia spp., Bunostomum spp., Capillaria spp., Chabertia spp., Clonorchis spp., Cooperia spp., Crenosoma spp., Cyathostoma spp., Dicrocoelium spp., Dictyocaulus spp., Diphylobothrium spp., Dipylidium spp., Dirofilaria spp., Dracunculus spp., Echinococcus spp., Echinostoma spp., Enterobius spp., Eucoleus spp., Fasciola spp., Fascioloides spp., Fasciolopsis spp., Filaroides spp., Gongylonema spp., Gyrodactylus spp., Habronema spp., Haemonchus spp., Heligmosomoides spp., Heterakis spp., Hymenolepis spp., Hyostrongylus spp., Litomosoides spp., Loa spp., Metastrongylus spp., Metorchis spp., Mesocostoides spp., Moniezia spp., Muellerius spp., Necator spp., Nematodirus spp., Nippostrongylus spp., Oesophagostomum spp., Ollulanus spp., Onchocerca spp., Opisthorchis spp., Oslerus spp., Ostertagia spp., Oxyuris spp., Paracapillaria spp.,
- 55

Parafilaria spp., Paragonimus spp., Paramphistomum spp., Paranoplocephala spp., Parascaris spp., Passalurus spp., Protostrongylus spp., Schistosoma spp., Setaria spp., Spirocerca spp., Stephanofilaria spp., Stephanurus spp., Strongyloides spp., Strongylus spp., Syngamus spp., Taenia spp., Teladorsagia spp., Thelazia spp., Toxascaris spp., Toxocara spp., Trichinella spp., Trichobilharzia spp., Trichostrongylus spp., Trichuris spp., Uncinaria spp., Wuchereria spp.;

plagas de plantas del filo de Nematoda, es decir nematodos fitoparasíticos, especialmente Aglenchus spp., por ejemplo Aglenchus agricola, Anguina spp., por ejemplo Anguina tritici, Aphelenchoides spp., por ejemplo Aphelenchoides arachidis, Aphelenchoides fragariae, Belonolaimus spp., por ejemplo Belonolaimus gracilis, Belonolaimus longicaudatus, Belonolaimus nortoni, Bursaphelenchus spp., por ejemplo Bursaphelenchus cocophilus, Bursaphelenchus eremus, Bursaphelenchus xylophilus, Cacopaurus spp., por ejemplo Cacopaurus pestis, Criconemella spp., por ejemplo Criconemella curvata, Criconemella onoensis, Criconemella ornata, Criconemella rusium, Criconemella xenoplax (= Mesocriconema xenoplax), Criconemoides spp., por ejemplo Criconemoides ferniae, Criconemoides onense, Criconemoides ornatum, Ditylenchus spp., por ejemplo Ditylenchus dipsaci, Dolichodorus spp., Globodera spp., por ejemplo Globodera pallida, Globodera rostochiensis, Helicotylenchus spp., por ejemplo Helicotylenchus dihystra, Hemicroconemoides spp., Hemicyclophora spp., Heterodera spp., por ejemplo Heterodera avenae, Heterodera glycines, Heterodera schachtii, Hoplolaimus spp., Longidorus spp., por ejemplo Longidorus africanus, Meloidogyne spp., por ejemplo Meloidogyne chitwoodi, Meloidogyne fallax, Meloidogyne hapla, Meloidogyne incognita, Meloinema spp., Nacobbus spp., Neotylenchus spp., Paralongidorus spp., Paraphelenchus spp., Paratrichodorus spp., por ejemplo Paratrichodorus minor, Pratylenchus spp., por ejemplo Pratylenchus penetrans, Pseudohalenchus spp., Psilenchus spp., Punctodera spp., Quinisulcius spp., Radopholus spp., por ejemplo Radopholus citrophilus, Radopholus similis, Rotylenchulus spp., Rotylenchus spp., Scutellonema spp., Subanguina spp., Trichodorus spp., por ejemplo Trichodorus obtusus, Trichodorus primitivus, Tylenchulus spp., Tylenchorhynchus spp., por ejemplo Tylenchorhynchus annulatus, Tylenchulus spp., por ejemplo Tylenchulus semipenetrans, Xiphinema spp., por ejemplo Xiphinema index.

Además, es posible controlar, del subreino de Protozoarios, el orden de Coccidia, por ejemplo Eimeria spp.

Los compuestos de la fórmula (I) opcionalmente pueden, en determinadas concentraciones o cantidades de aplicación, usarse también como herbicidas, protectores, reguladores de crecimiento o agentes para mejorar las propiedades de plantas, como microbicidas o gametocidas, por ejemplo como fungicidas, antimicóticos, bactericidas, virucidas (incluyendo contra viroides) o como agentes contra MLO (organismos tipo micoplasma) y RLO (organismos tipo rickettsia). Si corresponde, también se pueden usar como productos intermedios o precursores para la síntesis de otros compuestos activos.

Formulaciones

La presente invención se refiere además a formulaciones y formas de uso preparadas a partir de estas como pesticidas, por ejemplo licores de empapado, de goteo y de pulverización, que comprenden al menos un compuesto de la fórmula (I). Dado el caso, las formas de uso comprenden además pesticidas y/o adyuvantes que mejoran la acción, tales como penetrantes, por ejemplo, aceites vegetales, por ejemplo, aceite de colza, aceite de girasol, aceites minerales, por ejemplo, aceite de parafina, alquil ésteres de ácidos grasos vegetales, por ejemplo metil éster de aceite de colza o metil éster de aceite de soja, o alcanol alcoxilatos y/o esparcidores, por ejemplo, alquilsiloxanos y/o sales, por ejemplo, sales de amonio o fosfonio orgánicas o inorgánicas, por ejemplo, sulfato de amonio o hidrogeno fosfato de diamonio y/o promotores de retención, por ejemplo diocetil sulfosuccinato o polímeros de hidroxipropil guar y/o humectantes, por ejemplo, glicerol y/o fertilizantes, por ejemplo, fertilizantes que contienen amonio, potasio o fósforo.

Las formulaciones habituales son, por ejemplo, líquidos solubles en agua (SL), concentrados de emulsión (EC), emulsiones en agua (EW), concentrados de suspensión (SC, SE, FS, OD), gránulos dispersables en agua (WG), gránulos (GR) y concentrados de cápsulas (CS); estos y otros tipos posibles de formulaciones se describen, por ejemplo, en Crop Life International y en Pesticide Specifications, Manual del desarrollo y uso de especificaciones de la FAO y la OMS para pesticidas, FAO Plant Production and Protection Papers – 173, preparados por FAO/OMS Joint Meeting on Pesticide Specifications, 2004, ISBN: 9251048576. Las formulaciones, además de uno o más compuestos de la fórmula (I), comprenden opcionalmente otros compuestos activos agroquímicamente.

Se da preferencia a las formulaciones o formas de uso que comprenden auxiliares, por ejemplo, extensores, solventes, promotores de espontaneidad, portadores, emulsionantes, dispersantes, agentes de protección contra escarcha, biocidas, espesantes y/u otros auxiliares, por ejemplo adyuvantes. Un adyuvante en este contexto es un componente que mejora el efecto biológico de la formulación, sin que el componente en sí mismo tenga efecto biológico alguno. Ejemplos de adyuvantes son agentes que promueven la retención, la propagación, la unión a la superficie de la hoja o la penetración.

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

Los auxiliares usados pueden ser sustancias que son adecuadas para impartir propiedades especiales, tales como

determinadas propiedades físicas, técnicas y/o biológicas, a la formulación de los compuestos de fórmula (I), o para usar formas preparadas a partir de estas formulaciones (por ejemplo, pesticidas listos para usar tales como licores en spray o productos de recubrimiento de semillas).

- 5 Los extensores adecuados son por ejemplo agua, líquidos químicos orgánicos polares y no polares, por ejemplo de las clases de hidrocarburos aromáticos y no aromáticos (tales como parafinas, alquilbencenos, alquilnaftalenos, clorobencenos), los alcoholes y polioles (que, si corresponde, también se pueden sustituir, eterificar y/o esterificar), las cetonas (tales como acetona, ciclohexanona), ésteres (incluyendo grasas y aceites) y poli(éteres), las aminas, amidas, lactamas (tales como N-alquilpirrolidonas) y lactonas insustituídas y sustituidas, las sulfonas y sulfóxidos (tales como dimetil sulfóxido).
- 10 Si el extensor utilizado es agua, también es posible usar por ejemplo solventes orgánicos como solventes auxiliares. Los solventes líquidos adecuados son esencialmente: aromáticos, tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, hidrocarburos aromáticos clorados o alifáticos clorados, tales como clorobencenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos na, solventes fuertemente polares tales como dimetilformamida y dimetil sulfóxido así como agua. tales como ciclohexano o parafinas, por ejemplo, fracciones de aceite mineral, aceites minerales y vegetales,
- 15 alcoholes tales como butanol o glicol y sus éteres y ésteres, cetonas tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona o ciclohexano

- En principio, es posible usar todos los solventes adecuados. Ejemplos de solventes adecuados son hidrocarburos aromáticos, tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, hidrocarburos aromáticos o alifáticos clorados, tales como clorobenceno, cloroetileno o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano, parafinas,
- 20 fracciones aceites minerales, aceites minerales y vegetales, alcoholes, tales como metanol, etanol, isopropanol, butanol o glicol y sus éteres y ésteres, cetonas tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona o ciclohexanona, solventes fuertemente polares tales como dimetil sulfóxido así como agua.

- En principio, es posible usar todos los portadores adecuados. Los portadores útiles incluyen especialmente: por ejemplo sales de amonio y minerales naturales molidos tales como caolinas, arcillas, talco, tiza, cuarzo, atapulgita,
- 25 montmorillonita o tierra diatomea, y minerales sintéticos molidos tales como sílice finamente dividida, alúmina y silicatos naturales o sintéticos, resinas, ceras y/o fertilizantes sólidos. También es posible usar mezclas de tales portadores. Los portadores útiles para gránulos incluyen: por ejemplo, rocas naturales molidas y fraccionadas tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita y gránulos sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas y también gránulos de material orgánico tal como aserrín, papel, cáscaras de coco, maíz y tallos de tabaco.

- 30 También es posible usar solventes o extensores gaseosos licuados. Especialmente adecuados son los extensores o portadores que son gaseosos a temperatura estándar y a presión atmosférica, por ejemplo, propulsores en aerosol, tales como hidrocarburos halogenados y también butano, propano, nitrógeno y dióxido de carbono.

- Los ejemplos de emulsionantes y/o formadores de espuma, dispersantes o agentes humectantes con propiedades iónicas o no iónicas, o mezclas de estas sustancias tensioactivas, son sales de ácido poliacrílico, sales de ácido
- 35 lignosulfónico, sales de ácido fenolsulfónico o ácido naftalenosulfónico, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o con ácidos grasos o con aminas grasas, con fenoles sustituidos (preferentemente alquilfenoles o arilfenoles), sales de ésteres sulfosuccínicos, derivados de taurina (preferentemente alquil tauratos), ésteres fosfóricos de alcoholes polietoxilados o fenoles, ésteres de ácidos grasos de polioles y derivados de los compuestos que contienen sulfatos, sulfonatos y fosfatos, por ejemplo, alquilaril poliglicol éteres, alquilsulfonatos, alquilsulfatos,
- 40 arilsulfonatos, hidrolizados de proteína, licores de residuos de lignosulfito y metilcelulosa. La presencia de un tensioactivo es ventajosa si uno de los compuestos de fórmula (I) y/o uno de los portadores inertes no es soluble en agua y cuando la aplicación tiene lugar en agua.

- Otros auxiliares que pueden estar presentes en las formulaciones y las formas de uso derivadas de ellas son colorantes tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo óxido de hierro, óxido de titanio y azul de Prusia, y colorantes orgánicos
- 45 tales como colorantes de alizarina, colorantes azo y colorantes de metal ftalocianina, y nutrientes y nutrientes traza tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y zinc.

Componentes adicionales que pueden estar presentes son estabilizantes tales como estabilizantes fríos, conservantes, antioxidantes, estabilizantes livianos u otros agentes que mejoran la estabilidad química y/o física. Los generadores de espuma o antiespumantes también pueden estar presentes.

- 50 Aparte de eso, las formulaciones y formas de uso derivadas de ellas también pueden comprender, como auxiliares adicionales, adhesivos tales como carboximetilcelulosa y polímeros naturales y sintéticos en la forma de polvos, gránulos o redes, tales como goma arábiga, polivinil alcohol y polivinil acetato o fosfolípidos naturales tales como cefalinas y lecitinas y fosfolípidos sintéticos. Otros auxiliares pueden ser aceites minerales y vegetales.

- Dado el caso, es posible que auxiliares adicionales estén presentes en las formulaciones y las formas de uso derivadas de ellas. Los ejemplos de tales aditivos son fragancias, coloides protectores, aglutinantes, adhesivos, espesantes,
- 55 agentes tixotrópicos, penetrantes, promotores de retención, estabilizadores, secuestrantes, agentes formadores de complejo, humectantes, esparcidores. En general, los compuestos de la fórmula (I) se pueden combinar con cualquier aditivo sólido o líquido usado comúnmente a efectos de formulación.

Los promotores de retención útiles incluyen todas esas sustancias que reducen la tensión de superficie dinámica, por ejemplo dioctil sulfosuccinato o aumentan la viscoelasticidad, por ejemplo polímeros de hidroxipropilguar.

Los penetrantes adecuados en el presente contexto son todas esas sustancias que se usan comúnmente para mejorar la penetración de compuestos activos como agroquímicos en plantas. Los penetrantes se definen en este contexto por su capacidad de penetrar del licor de aplicación (generalmente acuoso) y/o del recubrimiento de pulverizador en la cutícula de la planta y así aumentar la movilidad de los compuestos activos en la cutícula. El procedimiento descrito en la literatura (Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152) se puede usar para determinar esta propiedad. A modo de ejemplo se mencionan alcoxilatos de alcohol tales como etoxilato graso de coco (10) o etoxilato de isotridecilo (12), ésteres de ácido graso, por ejemplo, metil éster de aceite de colza o metil éster de aceite de soja, alcoxilados de amina grasa, por ejemplo, etoxilato de amina de sebo (15) o sales de amonio y/o fosfonio, por ejemplo sulfato de amonio o hidrogeno fosfato de diamonio.

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

El contenido del compuesto de fórmula (I) en las formas de uso preparadas a partir de las formulaciones (en particular pesticidas) puede variar dentro de amplios intervalos. La concentración del compuesto de la fórmula (I) en las formas de uso puede ser típicamente de entre el 0,00000001 % y el 95 % en peso del compuesto de la fórmula (I), preferentemente entre el 0,00001 % y el 1 % en peso, en función del peso de la forma de uso. La aplicación se logra en una forma habitual apropiada para las formas de uso.

Mezclas

Los compuestos de la fórmula (I) también se pueden utilizar en una mezcla con uno o más fungicidas, bactericidas, acaricidas, molusquicidas, nematocidas, insecticidas, agentes microbiológicos, organismos beneficiosos, herbicidas, fertilizantes, repelentes de aves, fitotónicos, esterilizadores, protectores, semioquímicos y/o reguladores de crecimiento de plantas adecuados, para poder así, por ejemplo, ampliar el espectro de acción, prolongar el período de acción, mejorar la velocidad de acción, prevenir la repelencia o evitar la evolución de resistencia. Además, las combinaciones de compuestos activos de este tipo pueden mejorar el crecimiento y/o tolerancia de las plantas a factores abióticos, por ejemplo altas o bajas temperaturas, a sequías o a elevados contenidos de agua o salinidad de la tierra. También es posible mejorar el rendimiento de la generación de flores y frutas, optimizar la capacidad de germinación y desarrollo de la raíz, facilitar la cosecha y mejorar los rendimientos, influir en la maduración, mejorar la calidad y/o el valor nutricional de los productos cosechados, prolongar la duración en almacenaje y/o mejorar la procesabilidad de los productos cosechados.

Además, los compuestos de la fórmula (I) pueden estar presentes en una mezcla con otros compuestos activos o semioquímicos tales como atrayentes y/o repelentes de aves y/o activadores de plantas y/o reguladores de crecimiento y/o fertilizantes. Asimismo, los compuestos de la fórmula (I) pueden usarse en mezclas con agentes para mejorar las propiedades de las plantas, por ejemplo, crecimiento, rendimiento y calidad del material cosechado.

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

Si uno de los compuestos mencionados a continuación puede ocurrir en diferentes formas tautoméricas, estas formas también se incluyen incluso si no se mencionan explícitamente en cada caso.

Insecticidas/acaricidas/nematicidas

Los compuestos activos especificados en la presente con sus nombres comunes se conocen y describen, por ejemplo, en el Manual de Pesticidas („The Pesticide Manual“ 16th Ed., British Crop Protection Council 2012) o pueden buscarse en Internet (por ejemplo <http://www.alanwood.net/pesticides>).

(1) Inhibidores de acetilcolinesterasa (AChE), tales como, por ejemplo, carbamatos, por ejemplo alanicarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbaril, carbofuran, carbosulfan, etiofencarb, fenobucarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metiocarb, metomil, metolcarb, oxamil, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, triazamato, trimetacarb, XMC y xilicarb; u organofosfatos, por ejemplo acefato, azametifos, azinfos-etilo, azinfos-metilo, cadusafos, cloretoxifos, clorfenvinfos, clormefos, clorpirifos, clorpirifos-metilo, coumafos, cianofos, demeton-S-metilo, diazinon, diclorvos/DDVP, dicrotofos, dimetoato, dimetilvinfos, disulfoton, EPN, etion, etoprofos, famfur, fenamifos, fenitrothion, fention, fostiazato, heptenofos, imiciafos, isofenfos, isopropil O-(metoxiaminotiofosforilo) salicilato, isoxation, malation, mecarbam, metamidofos, metidation, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemeton-metilo, paration, paration-metilo, fentoato, forato, fosalona, fosmet, fosfamidon, foxim, pirimifos-metilo, profenofos, propetamfos, protiofos, piraclofos, piridafention, quinalfos, sulfotep, tebupirifos, temefos, terbufos, tetraclorvinfos, tiometon, triazofos, triclofon y vamidotion.

- (2) Antagonistas del canal de cloruro regulado por GABA, por ejemplo, ciclodieno-organocloruros, por ejemplo, clordano y endosulfan o fenilpirazolos (fipros), por ejemplo etiprol y fipronil.
- (3) Moduladores del canal de sodio/bloqueadores del canal de sodio regulados por voltaje, por ejemplo, piretroides, por ejemplo acrinatrin, alletrin, d-cis-trans aletrin, d-trans aletrin, bifentrin, bioaletrin, bioaletrin s-ciclopentenil isómero, bioresmetrin, cicloprotrin, ciflutrin, beta-ciflutrin, cihalotrin, lambda-cihalotrin, gamma-cihalotrin, cipermetrin, alfa-cipermetrin, beta-cipermetrin, theta-cipermetrin, zeta-cipermetrin, cifenotrin [(1R)-trans isómero], deltametrin, empentrin [(EZ)-(1R) isómero], esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrin, fenvalerato, flucitrinato, flumetrin, tau-fluvalinato, halfenprox, imiprotrin, kadetrin, momfluorotrin, permetrin, fenotrin [(1R)-trans isómero], pralletrin, piretrinas (piretro), resmetrin, silafluofen, teflutrin, tetrametrin, tetrametrin [(1R)- isómero]], tralometrin y transflutrin o DDT o metoxiclor.
- (4) Agonistas del receptor de acetilcolina nicotinérgica (nAChR), por ejemplo, neonicotinoides, por ejemplo, acetamiprid, clotianidin, dinotefuran, imidacloprid, nitenpiram, tiacloprid y tiametoxam o nicotina o sulfoxaflor o flupiradifurona.
- (5) Activadores alostéricos del receptor de acetilcolina nicotinérgica (nAChR), por ejemplo, espinosinas, por ejemplo espinetoram y espinosad.
- (6) Activadores del canal de cloruro, por ejemplo, avermectinas/milbemicinas, por ejemplo abamectina, emamectina benzoato, lepimectina y milbemectina.
- (7) Imitadores de la hormona juvenil, por ejemplo, análogos de la hormona juvenil, por ejemplo hidropreno, kinopreno y metopreno o fenoxicarb o piriproxifen.
- (8) Compuestos activos con mecanismos no conocidos o no específicos de acción, por ejemplo, haluros de alquilo, por ejemplo, bromuro de metilo y otros haluros de alquilo; o cloropirina o fluoruro de sulfurilo o borax o tartaro emético.
- (9) Antialimentarios selectivos, por ejemplo pimetrozina o flonicamid.
- (10) Inhibidores del crecimiento de ácaros, por ejemplo clofentezina, hexitiazox y diflovidazin o etoxazol.
- (11) Alteradores microbianos de la membrana intestinal de insectos, por ejemplo, *Bacillus thuringiensis* subespecie israelensis, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* subespecie aizawai, *Bacillus thuringiensis* subespecie kurstaki, *Bacillus thuringiensis* subespecie tenebrionis, y proteínas de plantas BT: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry2Ab, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34/35Ab1.
- (12) Inhibidores de fosforilación oxidativa, alteradores de ATP, por ejemplo, compuestos de diafenturon u organoestaño, por ejemplo azociclotina, cihexatina y óxido de fenbutatina o propargita o tetradifon.
- (13) Desacopladores de fosforilación oxidativa que interrumpen el gradiente de protones H, por ejemplo, clorfenapir, DNOC y sulfluramid.
- (14) Antagonistas del receptor de acetilcolina nicotinérgica, por ejemplo, bensultap, cartap clorhidrato, tiociclam, y tiosultap-sodio.
- (15) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 0, por ejemplo, bistrifluron, clorfluazuron, diflubenzuron, flucicloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron y triflumuron.
- (16) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 1, por ejemplo buprofezin.
- (17) Inhibidores de muda (especialmente para Diptera, es decir, dípteros), por ejemplo, ciromazina.
- (18) Agonistas del receptor de ecdisona, por ejemplo, cromafenoazida, halofenoazida, metoxifenoazida y tebufenoazida.
- (19) Agonistas octopaminérgicos, por ejemplo, amitraz.
- (20) Inhibidores de transporte de electrones de complejo III, por ejemplo hidrametilnon o acequinocilo o fluacripirim.
- (21) Inhibidores de transporte de electrones de complejo I, por ejemplo acaricidas METI, por ejemplo fenazaquin, fenpiroximato, pirimidifen, piridaben, tebufenpirad y tolfenpirad o rotenona (Derris).
- (22) Bloqueadores de canal de sodio regulado por voltaje, por ejemplo, indoxacarb o metaflumizona.
- (23) Inhibidores de acetil-CoA carboxilasa, por ejemplo, derivados de ácido tetrónico y tetrámico, por ejemplo, espiroclorfen, espiromesifen y espirotetramat.
- (24) Inhibidores del transporte de electrones del complejo IV, por ejemplo, fosfinas, por ejemplo, fosfito de aluminio, fosfito de calcio, fosfina y fosfito de zinc o cianuro.

(25) Inhibidores de transporte de electrones de complejo II, por ejemplo, cienopirafen y ciflometofen.

(28) Efectores del receptor de rianodina, por ejemplo, diamidas, por ejemplo, clorantraniliprol, ciantraniliprol y flubendiamida.

Otros compuestos activos con un mecanismo de acción no conocido o no claro, por ejemplo, afidopiropen, afoxolaner, azadiractina, benclotiaz, benzoximato, bifenazato, broflanilide, bromopropilato, quinometionat, criolita, ciclaniliprol, cicloxadrid, cihalodiamida, dicloromezotiaz, dicofol, diflovidazin, flometoquin, fluazaindolizina, fluensulfona, flufenerim, flufenoxistrobina, flufiprol, fluhexafon, fluopiram, fluralaner, fluxametamida, fufenozida, guadipir, heptaflutrina, imidaclozid, iprodiona, lotilaner, meperflutrin, paichongding, piflbumida, piridalil, pirifluquinazon, piriminostrobina, sarolaner, tetrametilflutrina, tetraniliprol, tetraclorantraniliprol, tioazafen, triflumezopirim y yodometano; y adicionalmente preparaciones en función de *Bacillus firmus* (I-1582, BioNeem, Votivo), y los siguientes compuestos activos conocidos: 1-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil}-3-(trifluorometil)-1H-1,2,4-triazol-5-amina (conocido de WO2006/043635), {1'-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]-5-fluorospiro[indol-3,4'-piperidin]-1(2H)-il}(2-cloropiridin-4-il)metanona (conocido por el documento WO2003/106457), 2-cloro-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]piperidin-4-il}-4-(trifluorometil)fenil]isonicotinamida (conocido por el documento WO2006/003494), 3-(2,5-dimetilfenil)-4-hidroxi-8-metoxi-1,8-diazaspiro[4,5]dec-3-en-2-ona (conocido por el documento WO2009/049851), carbonato de 3-(2,5-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1,8-diazaspiro[4,5]dec-3-en-4-iletilo (conocido por el documento WO2009/049851), 4-(but-2-in-1-iloxi)-6-(3,5-dimetilpiperidin-1-il)-5-fluoropirimidina (conocido por el documento WO2004/099160), 4-(but-2-in-1-iloxi)-6-(3-clorofenil)pirimidina (conocido por el documento WO2003/076415), PF1364 (n.º de CAS-Reg. 1204776-60-2), metil-2-[2-({3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il}carbonil)amino]-5-cloro-3-metilbenzoil]-2-metilhidrazinecarboxilato (conocido por el documento WO2005/085216), metil-2-[2-({3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il}carbonil)amino]-5-ciano-3-metilbenzoil]-2-etilhidrazinecarboxilato (conocido por el documento WO2005/085216), metil-2-[2-({3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il}carbonil)amino]-5-ciano-3-metilbenzoil]-2-metilhidrazinecarboxilato (conocido por el documento WO2005/085216), metil-2-[3,5-dibromo-2-({3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il}carbonil)amino]benzoil]-2-etilhidrazinecarboxilato (conocido de WO2005/085216), N-[2-(5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-il)-4-cloro-6-metilfenil]-3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido por el documento CN102057925), 4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-2-metil-N-(1-oxidotietan-3-il)benzamida (conocido por el documento WO2009/080250), N-[(2E)-1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]piridin-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoroacetamida (conocido por el documento WO2012/029672), 1-[(2-cloro-1,3-tiazol-5-il)metil]-4-oxo-3-fenil-4H-pirido[1,2-a]pirimidin-1-ium-2-olato (conocido por el documento WO2009/099929), 1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]-4-oxo-3-fenil-4H-pirido[1,2-a]pirimidin-1-ium-2-olato (conocido por el documento WO2009/099929), 4-(3-{2,6-dicloro-4-[(3,3-dicloroprop-2-en-1-il)oxil]fenoxil}propoxi)-2-metoxi-6-(trifluorometil)pirimidina (conocido por el documento CN101337940), N-[2-(terc-butilcarbamoil)-4-cloro-6-metilfenil]-1-(3-cloropiridin-2-il)-3-(fluorometoxi)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido por el documento WO2008/134969), [2-(2,4-diclorofenil)-3-oxo-4-oxaspiro[4,5]dec-1-en-1-il]carbonato de butilo (conocido por el documento CN 102060818), (3E)-3-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiniliden]-1,1,1-trifluoropropan-2-ona (conocido por el documento WO2013/144213), N-(metilsulfonil)-6-[2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-il]piridin-2-carboxamida (conocido por el documento WO2012/000896), N-[3-(bencilcarbamoil)-4-clorofenil]-1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido por el documento WO2010/051926).

Fungicidas

Los compuestos activos especificados en la presente por sus nombres comunes se conocen y describen, por ejemplo, en "Pesticide Manual" o en Internet (por ejemplo: <http://www.alanwood.net/pesticides>).

Todos los componentes fungicidas de mezcla que figuran en las clases (1) a (15) pueden opcionalmente formar sales con las correspondientes bases o ácidos si hay presentes grupos funcionales adecuados. Además, los componentes fungicidas de mezcla que figuran en las clases (1) a (15) también incluyen formas tautoméricas si es posible el tautomerismo.

1) Inhibidores de biosíntesis de ergosterol, por ejemplo (1,01) aldimorf, (1,02) azaconazol, (1,03) bitertanol, (1,04) bromuconazol, (1,05) ciproconazol, (1,06) diclobutrazol, (1,07) difenoconazol, (1,08) diniconazol, (1,09) diniconazol-M, (1,10) dodemorf, (1,11) dodemorf acetato, (1,12) epoxiconazol, (1,13) etaconazol, (1,14) fenarimol, (1,15) fenbuconazol, (1,16) fenhexamida, (1,17) fenpropidin, (1,18) fenpropimorf, (1,19) fluquinconazol, (1,20) flurprimidol, (1,21) flusilazol, (1,22) flutriafol, (1,23) furconazol, (1,24) furconazol-cis, (1,25) hexaconazol, (1,26) imazalil, (1,27) imazalil sulfato, (1,28) imibenconazol, (1,29) ipconazol, (1,30) metconazol, (1,31) miclobutanil, (1,32) naftifin, (1,33) nuarimol, (1,34) oxpoconazol, (1,35) paclobutrazol, (1,36) pefurazoato, (1,37) penconazol, (1,38) piperalin, (1,39) procloraz, (1,40) propiconazol, (1,41) protioconazol, (1,42) piributicarb, (1,43) pirifenox, (1,44) quinconazol, (1,45) simeconazol, (1,46) spiroxamina, (1,47) tebuconazol, (1,48) terbinafin, (1,49) tetraconazol, (1,50) triadimefon, (1,51) triadimenol, (1,52) tridemorf, (1,53) triflumizol, (1,54) triforina, (1,55) triticonazol, (1,56) uniconazol, (1,57) uniconazol-P, (1,58) viniconazol, (1,59) voriconazol, (1,60) 1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)cicloheptanol, (1,61) 1-(2,2-dimetil-2,3-dihidro-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato de metilo, (1,62) N'-{5-(difluorometil)-2-metil-4-[3-(trimetilsilil)propoxil]fenil}-N-etil-N-metilimidoformamida, (1,63) N-etil-N-metil-N'-{2-metil-5-(trifluorometil)-4-[3-(trimetilsilil)propoxil]fenil}imidoformamida, (1,64) O-[1-(4-metoxifenoxi)-3,3-dimetilbutan-2-il]-1H-imidazol 1-carbotioato, (1,65) pirisoxazol, (1,66) 2-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1,67) 1-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-

difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-il tiocianato, (1,68) 5-(allilsulfanil)-1-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazolo, (1,69) 2-[1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-iona, (1,70) 2-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-iona, (1,71) 2-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-iona, (1,72) 1-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-il tiocianato, (1,73) 1-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-il tiocianato, (1,74) 5-(allilsulfanil)-1-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazolo, (1,75) 5-(allilsulfanil)-1-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazolo, (1,76) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-iona, (1,77) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-iona, (1,78) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-iona, (1,79) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-iona, (1,80) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-iona, (1,81) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-iona, (1,82) 2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-iona, (1,83) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-iona, (1,84) 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1,85) 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1,86) 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)pentan-2-ol, (1,87) 2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1,88) 2-[2-cloro-4-(2,4-diclorofenoxi)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1,89) (2R)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1R)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1,90) (2R)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1S)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1,91) (2S)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1S)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1,92) (2S)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1R)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1,93) (1S,2R,5R)-5-(4-clorobencil)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetil)ciclopentanol, (1,94) (1R,2S,5S)-5-(4-clorobencil)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetil)ciclopentanol, (1,95) 5-(4-clorobencil)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetil)ciclopentanol.

2) Inhibidores de la cadena respiratoria en el complejo I o II, por ejemplo, (2,01) bixafen, (2,02) boscalid, (2,03) carboxin, (2,04) diflumetorim, (2,05) fenfuram, (2,06) fluopiram, (2,07) flutolanil, (2,08) fluxapiraxad, (2,09) furametpir, (2,10) furmeciclox, (2,11) isopirazam (mezcla de racemato syn-epimérico 1RS,4SR,9RS y racemato anti-epimérico 1RS,4SR,9SR), (2,12) isopirazam (racemato anti-epimérico 1RS,4SR,9SR), (2,13) isopirazam (enantiómero anti-epimérico 1R,4S,9S), (2,14) isopirazam (enantiómero anti-epimérico 1S,4R,9R), (2,15) isopirazam (racemato syn-epimérico 1RS,4SR,9RS), (2,16) isopirazam (enantiómero syn-epimérico 1R,4S,9R), (2,17) isopirazam (enantiómero syn-epimérico 1S,4R,9S), (2,18) mepronil, (2,19) oxicarboxin, (2,20) penflufen, (2,21) pentiopirad, (2,22) sedaxan, (2,23) tifluzamid, (2,24) 1-metil-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil]-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2,25) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2,26) 3-(difluorometil)-N-[4-fluoro-2-(1,1,2,3,3,3-hexafluoropropoxi)fenil]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2,27) N-[1-(2,4-diclorofenil)-1-metoxipropan-2-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2,28) 5,8-difluoro-N-[2-(2-fluoro-4-[[4-(trifluorometil)piridin-2-il]oxi]fenil)etil]-quinazolina-4-amina, (2,29) benzovindiflupir, (2,30) N-[(1S,4R)-9-(diclorometil)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2,31) N-[(1R,4S)-9-(diclorometil)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2,32) 3-(difluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2,33) 1,3,5-trimetil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2,34) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2,35) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2,36) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2,37) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2,38) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2,39) 1,3,5-trimetil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2,40) 1,3,5-trimetil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2,41) benodanil, (2,42) 2-cloro-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)piridin-3-carboxamida, (2,43) isofetamid, (2,44) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[2'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2,45) N-(4'-clorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2,46) N-(2',4'-diclorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2,47) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[4'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2,48) N-(2',5'-difluorobifenil-2-il)-1-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2,49) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2,50) 5-fluoro-1,3-dimetil-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2,51) 2-cloro-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]nicotinamida, (2,52) 3-(difluorometil)-N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2,53) N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2,54) 3-(difluorometil)-N-(4'-etnilbifenil-2-il)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2,55) N-(4'-etnilbifenil-2-il)-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2,56) 2-cloro-N-(4'-etnilbifenil-2-il)nicotinamida, (2,57) 2-cloro-N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]nicotinamida, (2,58) 4-(difluorometil)-2-metil-N-[4'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1,3-tiazol-5-carboxamida, (2,59) 5-fluoro-N-[4'-(3-hidroxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2,60) 2-cloro-N-[4'-(3-hidroxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]nicotinamida, (2,61) 3-(difluorometil)-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2,62) 5-fluoro-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1,3-

- dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2,63) 2-cloro-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)]bifenil-2-il]nicotinamida, (2,64) 1,3-dimetil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2,65) 1,3-dimetil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2,66) 1,3-dimetil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2,67) 3-(difluorometil)-N-metoxi-1-metil-N-[1-(2,4,6-triclorofenil)propan-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2,68) 3-(difluorometil)-N-(7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2,69) 3-(difluorometil)-N-[(3R)-7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2,70) 3-(difluorometil)-N-[(3S)-7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida.
- 3) Inhibidores de la cadena respiratoria en el complejo III, por ejemplo (3,01) ametocetradin, (3,02) amisulbrom, (3,03) azoxistrobina, (3,04) ciazofamid, (3,05) coumetoxistrobina, (3,06) coumoxistrobina, (3,07) dimoxistrobina, (3,08) enoxastrobina, (3,09) famoxadona, (3,10) fenamidona, (3,11) flufenoxistrobina, (3,12) fluoxastrobina, (3,13) kresoxim-metilo, (3,14) metominostrobin, (3,15) orisastrobina, (3,16) picoxistrobina, (3,17) piraclostrobina, (3,18) pirametostrobin, (3,19) piraxistrobina, (3,20) piribencarb, (3,21) triclopíricarb, (3,22) trifloxistrobina, (3,23) (2E)-2-{2-[[6-(3-cloro-2-metilfenoxi)-5-fluoropirimidin-4-il]oxi]fenil}-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida, (3,24) (2E)-2-(metoxiimino)-N-metil-2-{2-[[[(1E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etiliden]amino]oxi]metil]fenil}acetamida, (3,25) (2E)-2-(metoxiimino)-N-metil-2-{2-[(E)-{1-[3-(trifluorometil)fenil]etoxi]imino]metil]fenil}acetamida, (3,26) (2E)-2-{2-[[[(1E)-1-[3-[(E)-1-fluoro-2-fenilvinil]oxi]fenil]etiliden]amino]oxi]metil]fenil}-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida, (3,27) fenaminostrobin, (3,28) 5-metoxi-2-metil-4-{2-[[[(1E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etiliden]amino]oxi]metil]fenil}-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-ona, (3,29) metil (2E)-2-{2-[[ciclopropil[(4-metoxifenil)imino]metil]sulfanil]metil]fenil}-3-metoxiacrilato, (3,30) N-(3-etil-3,5,5-trimetilciclohexil)-3-formamido-2-hidroxibenzamida, (3,31) 2-{2-[(2,5-dimetilfenoxi)metil]fenil}-2-metoxi-N-metilacetamida, (3,32) 2-{2-[(2,5-dimetil-fenoxi)metil]fenil}-2-metoxi-N-metilacetamida, (3,33) (2E,3Z)-5-[[1-(4-clorofenil)-1H-pirazol-3-il]oxi]-2-(metoxiimino)-N,3-dimetilpent-3-enamida.
- 4) Inhibidores de la mitosis y la división celular, por ejemplo (4,01) benomil, (4,02) carbendazim, (4,03) clorfenazol, (4,04) dietofencarb, (4,05) etaboxam, (4,06) fluopicolida, (4,07) fuberidazol, (4,08) pencicuron, (4,09) tiabendazol, (4,10) tiofanato-metilo, (4,11) tiofanato, (4,12) zoxamida, (4,13) 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina, (4,14) 3-cloro-5-(6-cloropiridin-3-il)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)piridazina.
- 5) Compuestos capaces de tener actividad en múltiples sitios ("Multisite Action"), por ejemplo (5,01) mezcla Bordeaux, (5,02) captafol, (5,03) captan, (5,04) clorotalonil, (5,05) hidróxido de cobre, (5,06) naftenato de cobre, (5,07) óxido de cobre, (5,08) oxocloruro de cobre, (5,09) sulfato de cobre(2+), (5,10) diclofluanid, (5,11) ditianon, (5,12) dodina, (5,13) dodina base libre, (5,14) ferbam, (5,15) fluorofolpet, (5,16) folpet, (5,17) guazatina, (5,18) guazatina acetato, (5,19) iminocadina, (5,20) iminocadina albesilato, (5,21) iminocadina triacetato, (5,22) mancozeb, (5,23) mancozeb, (5,24) maneb, (5,25) metiram, (5,26) metiram de cinc, (5,27) oxina de cobre, (5,28) propamidina, (5,29) propineb, (5,30) azufre y preparaciones de azufre tales como, por ejemplo, polisulfuro de calcio, (5,31) tiram, (5,32) tolilfluanid, (5,33) zineb, (5,34) ziram, (5,35) anilazina.
- 6) Compuestos capaces de inducir la defensa del hospedador, por ejemplo (6,01) acibenzolar-S-metilo, (6,02) isotianil, (6,03) probenazol, (6,04) tiadinil, (6,05) laminarin.
- 7) Inhibidores de la biosíntesis de proteína y/o de aminoácido, por ejemplo (7,01) andoprim, (7,02) blasticidin-S, (7,03) ciprodinil, (7,04) kasugamicina, (7,05) hidrato de kasugamicina clorhidrato, (7,06) mepanipirim, (7,07) pirimetanil, (7,08) 3-(5-fluoro-3,3,4,4-tetrametil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina, (7,09) oxitetraciclina, (7,10) estreptomina.
- 8) Inhibidores de producción de ATP tales como, por ejemplo, (8,01) acetato de fentina, (8,02) cloruro de fentina, (8,03) hidróxido de fentina, (8,04) siltiofam.
- 9) Inhibidores de la síntesis de paredes celulares, por ejemplo (9,01) bentiavalicarb, (9,02) dimetomorf, (9,03) flumorf, (9,04) iprovalicarb, (9,05) mandipropamid, (9,06) polioxinas, (9,07) polioxorim, (9,08) validamicina A, (9,09) valifenalato, (9,10) polioxina B, (9,11) (2E)-3-(4-terc-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona, (9,12) (2Z)-3-(4-terc-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona.
- 10) Inhibidores de síntesis de membrana y de lípidos, por ejemplo, (10,01) bifenilo, (10,02) cloroneb, (10,03) dicloran, (10,04) edifenfos, (10,05) etridiazol, (10,06) yodocarb, (10,07) iprobenfos, (10,08) isoprotiolano, (10,09) propamocarb, (10,10) propamocarb clorhidrato, (10,11) protiocarb, (10,12) pirazofos, (10,13) quintozeno, (10,14) tecnazeno, (10,15) tolclofos-metilo.
- (11) Inhibidores de la biosíntesis de melanina, por ejemplo (11,01) carpropamid, (11,02) diclocimet, (11,03) fenoxanil, (11,04) ftalida, (11,05) piroquilon, (11,06) triciclazol, (11,07) {3-metil-1-[(4-metilbenzoi)amino]butan-2-il}carbamato de 2,2,2-trifluoroetilo.
- 12) Inhibidores de la síntesis de ácido nucleico, por ejemplo, (12,01) benalaxilo, (12,02) benalaxil-M (kiralaxil), (12,03) bupirimato, (12,04) clozilacon, (12,05) dimetirimol, (12,06) etirimol, (12,07) furalaxilo, (12,08) himexazol, (12,09) metalaxilo, (12,10) metalaxil-M (mefenoxam), (12,11) ofurace, (12,12) oxadixilo, (12,13) ácido oxolinico, (12,14) octilino.

13) Inhibidores de la transducción de señales tales como, por ejemplo, (13,01) clozolinato, (13,02) fenpiclonil, (13,03) fludioxonil, (13,04) iprodiona, (13,05) procimidona, (13,06) quinoxifen, (13,07) vinclozolin, (13,08) proquinazid.

14) Compuestos capaces de actuar como desacopladores, por ejemplo, (14,01) binapacril, (14,02) dinocap, (14,03) ferimzona, (14,04) fluazinam, (14,05) meptildinocap.

15) Compuestos adicionales, por ejemplo, (15,001) bentiazol, (15,002) betoxazin, (15,003) capsimicina, (15,004) carvona, (15,005) quinometionat, (15,006) piriofenona (clazafenona), (15,007) cufraneb, (15,008) ciflufenamid, (15,009) cimoxanil, (15,010) ciprosulfamida, (15,011) dazomet, (15,012) debacarb, (15,013) diclorofen, (15,014) diclomezina, (15,015) difenzoquat, (15,016) difenzoquat metilsulfato, (15,017) difenilamina, (15,018) ecomato, (15,019) fenpirazamina, (15,020) flumetover, (15,021) fluoroimida, (15,022) flusulfamida, (15,023) flutianil, (15,024) fosetil-aluminio, (15,025) fosetil-calcio, (15,026) fosetil-sodio, (15,027) hexaclorobenceno, (15,028) irumamicina, (15,029) metasulfocarb, (15,030) metil isotiocianato, (15,031) metrafenona, (15,032) mildiomicina, (15,033) natamicina, (15,034) dimetilditiocarbamato de níquel, (15,035) nitroal-isopropilo, (15,036) oxamocarb, (15,037) oxifentini, (15,038) pentaclorofenol y sales, (15,039) fenotrin, (15,040) ácido de fósforo y sus sales, (15,041) propamocarb-fosetilato, (15,042) propanosin-sodio, (15,043) pirimorf, (15,044) pirrolnitrin, (15,045) tebufloquin, (15,046) tecloftalam, (15,047) tolifenida, (15,048) triazoxida, (15,049) triclamida, (15,050) zarilamida, (15,051) (3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[[[3-[(isobutirilo)metoxi]-4-metoxipiridin-2-il]carbonil]amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxan-7-il 2-metilpropanoato, (15,052) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, (15,053) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, (15,054) oxatiapiprolina, (15,055) 1-(4-metoxifenoxi)-3,3-dimetilbutan-2-il 1H-imidazol-1-carboxilato, (15,056) 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)piridina, (15,057) 2,3-dibutyl-6-clorotieno[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona, (15,058) 2,6-dimetil-1H,5H-[1,4]ditiino[2,3-c:5,6-c']dipirrol-1,3,5,7(2H,6H)-tetrona, (15,059) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(5R)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona, (15,060) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(5S)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona, (15,061) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il)-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona, (15,062) 2-butoxi-6-iodo-3-propil-4H-cromen-4-ona, (15,063) 2-cloro-5-[2-cloro-1-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-4-metil-1H-imidazol-5-il]piridina, (15,064) 2-fenilfenol y sales, (15,065) 3-(4,4,5-trifluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina, (15,066) 3,4,5-tricloropiridina-2,6-dicarbonitrilo, (15,067) 3-cloro-5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-metilpiridazina, (15,068) 4-(4-clorofenil)-5-(2,6-difluorofenil)-3,6-dimetilpiridazina, (15,069) 5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-tiol, (15,070) 5-cloro-N'-fenil-N'-(prop-2-in-1-il)tiopen-2-sulfonohidrazida, (15,071) 5-fluoro-2-[(4-fluorobencil)oxi]pirimidin-4-amina, (15,072) 5-fluoro-2-[(4-metilbencil)oxi]pirimidin-4-amina, (15,073) 5-metil-6-octil[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, (15,074) etil (2Z)-3-amino-2-ciano-3-fenilacrilato, (15,075) N'-(4-{[3-(4-clorobencil)-1,2,4-tiadiazol-5-il]oxi})-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (15,076) N-(4-clorobencil)-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]propanamida, (15,077) N-[(4-clorofenil)(ciano)metil]-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]propanamida, (15,078) N-[(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)metil]-2,4-dicloronicotinamida, (15,079) N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloronicotinamida, (15,080) N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2-fluoro-4-iodonicotinamida, (15,081) N-{E}-[(ciclopropilmetoxi)imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-fenilacetamida, (15,082) N-{Z}-[(ciclopropilmetoxi)imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-fenilacetamida, (15,083) N'-{4-[(3-terc-butyl-4-ciano-1,2-tiazol-5-il)oxi]-2-cloro-5-metilfenil}-N-etil-N-metilimidoformamida, (15,084) N-metil-2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-N-(1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il)-1,3-tiazol-4-carboxamida, (15,085) N-metil-2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il]-1,3-tiazol-4-carboxamida, (15,086) N-metil-2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-N-[(1S)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il]-1,3-tiazol-4-carboxamida, (15,087) {6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]amino]oxi]metil]piridin-2-il}carbamato de pentilo, (15,088) ácido fenazin-1-carboxílico, (15,089) quinolin-8-ol, (15,090) sulfato de quinolin-8-ol (2:1), (15,091) {6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]amino]oxi]metil]piridin-2-il}carbamato de terc-butilo, (15,092) (5-bromo-2-metoxi-4-metilpiridin-3-il)(2,3,4-trimetoxi-6-metilfenil)metanona, (15,093) N-[2-(4-{[3-(4-clorofenil)prop-2-in-1-il]oxi}-3-metoxifenil)etil]-N2-(metilsulfonil)valinamida, (15,094) ácido 4-oxo-4-[(2-feniletil)amino]butanoico, (15,095) {6-[[[(Z)-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]amino]oxi]metil]piridin-2-il}carbamato de but-3-in-1-ilo, (15,096) 4-amino-5-fluoropirimidin-2-ol (forma tautomérica: 4-amino-5-fluoropirimidin-2(1H)-ona), (15,097) propilo 3,4,5-trihidroxibenzoato, (15,098) [3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (15,099) (S)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (15,100) (R)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (15,101) 2-fluoro-6-(trifluorometil)-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)benzamida, (15,102) 2-(6-bencilpiridin-2-il)quinazolina, (15,103) 2-[6-(3-fluoro-4-metoxifenil)-5-metilpiridin-2-il]quinazolina, (15,104) 3-(4,4-difluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina, (15,105) ácido abscísico, (15,106) N'-[5-bromo-6-(2,3-dihidro-1H-inden-2-iloxi)-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (15,107) N'-[5-bromo-6-[1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (15,108) N'-[5-bromo-6-[(1R)-1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (15,109) N'-[5-bromo-6-[(1S)-1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (15,110) N'-[5-bromo-6-[(cis-4-isopropilciclohexil)oxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (15,111) N'-[5-bromo-6-[(trans-4-isopropilciclohexil)oxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (15,112) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15,113) N-

ciclopropil-N-(2-ciclopropilbencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15,114) N-(2-terc-butilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15,115) N-(5-cloro-2-etilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15,116) N-(5-cloro-2-isopropilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15,117) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-5-fluorobencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15,118) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(5-fluoro-2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15,119) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropil-5-fluorobencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15,120) N-(2-ciclopentil-5-fluorobencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15,121) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-fluoro-6-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15,122) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-5-metilbencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15,123) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropil-5-metilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15,124) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropil-5-metilbencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15,125) N-(2-terc-butil-5-metilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15,126) N-[5-cloro-2-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15,127) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15,128) N-[2-cloro-6-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15,129) N-[3-cloro-2-fluoro-6-(trifluorometil)-bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15,130) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-4,5-dimetilbencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15,131) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15,132) N'-(2,5-dimetil-4-fenoxifenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (15,133) N'-4-[(4,5-dicloro-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilfenil]-N-etil-N-metilimidoformamida, (15,134) N-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15,135) 9-fluoro-2,2-dimetil-5-(quinolin-3-il)-2,3-dihidro-1,4-benzoxazepina, (15,136) 2-[2-fluoro-6-[(8-fluoro-2-metilquinolin-3-il)oxi]fenil]propan-2-ol, (15,137) 2-[2-[(7,8-difluoro-2-metilquinolin-3-il)oxi]-6-fluorofenil]propan-2-ol, (15,138) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15,139) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15,140) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2-cloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15,141) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-cloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15,142) N-(2-bromo-6-fluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15,143) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-bromofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15,144) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-bromo-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15,145) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-clorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15,146) N-(2-bromofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15,147) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2-clorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15,148) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15,149) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15,150) N'-(4-{3-[(difluorometil)sulfanil]-fenoxi}-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (15,151) N'-(2,5-dimetil-4-{3-[(1,1,2,2-tetrafluoroetil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (15,152) N'-(2,5-dimetil-4-{3-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (15,153) N'-(2,5-dimetil-4-{3-[(2,2,3,3-tetrafluoropropil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (15,154) N'-(2,5-dimetil-4-{3-[(pentafluoroetil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (15,155) N'-(4-{3-[(difluorometoxi)fenil]-sulfanil}-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (15,156) N'-(2,5-dimetil-4-{3-[(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil]sulfanil}fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (15,157) N'-(2,5-dimetil-4-{3-[(2,2,2-trifluoroetoxi)fenil]sulfanil}fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (15,158) N'-(2,5-dimetil-4-{3-[(2,2,3,3-tetrafluoropropoxy)fenil]-sulfanil}fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (15,159) N'-(2,5-dimetil-4-{3-[(pentafluoroetoxi)fenil]sulfanil}fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (15,160) 2-[3,5-bis-(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il}-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15,161) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-fluoro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il}-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15,162) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-cloro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il}-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15,163) 2-[3-2-(1-{[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]fenil metanosulfonato, (15,164) 2-[3-2-(1-{[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]-3-clorofenil metanosulfonato, (15,165) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{(5S)-5-[2-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il}-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15,166) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{(5R)-5-[2-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il}-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15,167) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{(5S)-5-[2-fluoro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il}-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15,168) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{(5R)-5-[2-fluoro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il}-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15,169) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{(5S)-5-[2-cloro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il}-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15,170) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{(5R)-5-[2-cloro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il}-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15,171) 2-[(5S)-3-2-(1-{[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]fenil metanosulfonato, (15,172) 2-[(5R)-3-2-(1-{[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]fenil metanosulfonato, (15,173) 2-[(5S)-3-2-(1-{[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]-3-clorofenil metanosulfonato, (15,174) 2-[(5R)-3-2-(1-{[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]-3-clorofenil metanosulfonato.

Los compuestos de la fórmula (I) se pueden combinar con pesticidas biológicos.

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

- 5 Los pesticidas biológicos incluyen bacterias tales como bacterias que forman esporas, bacterias de colonización de raíz y bacterias que actúan como insecticidas, fungicidas o nematocidas biológicos.

Ejemplos de tales bacterias que se usan o pueden usarse como pesticidas biológicos son:

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

Ejemplos de hongos y levaduras que se usan o pueden usarse como pesticidas biológicos son:

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

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

- 30 *Adoxophyes orana* (tortrix de fruta de verano) virus granulosis (GV), *Cydia pomonella* (polilla del manzano) virus granulosis (GV), *Helicoverpa armigera* (gusano cogollero) virus de la polihedrosis nuclear (NPV), *Spodoptera exigua* (gusano soldado) mNPV, *Spodoptera frugiperda* (cogollero del maíz) mNPV, *Spodoptera littoralis* (rosquilla negra) NPV.

También se incluyen bacterias y hongos que se agregan como "inoculante" para plantas o partes de plantas u órganos de plantas y que, en virtud de sus propiedades particulares, promueven el crecimiento de plantas y salud de plantas. Los ejemplos que se pueden mencionar son:

- 35 *Agrobacterium spp.*, *Azorhizobium caulinodans*, *Azospirillum spp.*, *Azotobacter spp.*, *Bradyrhizobium spp.*, *Burkholderia spp.*, especialmente *Burkholderia cepacia* (antes conocida como *Pseudomonas cepacia*), *Gigaspora spp.*, o *Gigaspora monosporum*, *Glomus spp.*, *Laccaria spp.*, *Lactobacillus buchneri*, *Paraglomus spp.*, *Pisolithus tinctorius*, *Pseudomonas spp.*, *Rhizobium spp.*, especialmente *Rhizobium trifolii*, *Rhizopogon spp.*, *Scleroderma spp.*, *Suillus spp.*, *Streptomyces spp.*

Ejemplos de extractos y productos de plantas formados por microorganismos incluyendo proteínas y metabolitos secundarios que se utilizan o se pueden utilizar como pesticidas biológicos son:

- 40 *Allium sativum*, *Artemisia absinthium*, *Azadirachtin*, *Biokeeper WP*, *Cassia nigricans*, *Celastrus angulatus*, *Chenopodium anthelminticum*, *Chitin*, *Armour-Zen*, *Dryopteris filix-mas*, *Equisetum arvense*, *Fortune Aza*, *Fungastop*, *Heads Up* (extracto de quinoa saponina *Chenopodium*), *Pyrethrum/Pyrethrins*, *Quassia amara*, *Quercus*, *Quillaja*, *Regalia*, „Requiem™ Insecticide“, *rotenona*, *riania/rianodina*, *Symphytum officinale*, *Tanacetum vulgare*, *Timol*, *Triact* 70, *TriCon*, *Tropaeolum majus*, *Urtica dioica*, *Veratrin*, *Viscum album*, extracto de *Brassicaceae*, especialmente colza en polvo o mostaza en polvo.

Protectores como componentes de mezcla

- 50 Los compuestos de la fórmula (I) se pueden combinar con protectores, por ejemplo, benoxacor, cloquintocet (-mexil), ciometrinil, cipro sulfamida, diclormid, fenclozazol (-etil), fenclozolim, flurazol, fluxofenim, furilazol, isoxadifen (-etil), mefenpir (-dietil), anhídrido naftálico, oxabetrinilo, 2-metoxi-N-({4-[(metilcarbamoil)amino]fenil}sulfonil)benzamida (CAS 129531-12-0), 4-(dicloroacetil)-1-oxa-4-azaspiro[4,5]decano (CAS 71526-07-3), 2,2,5-trimetil-3-(dicloroacetil)-1,3-oxazolidina (CAS 52836-31-4).

Plantas y partes de plantas

- 55 Todas las plantas y partes de plantas se pueden tratar de acuerdo con la invención. Plantas se refiere aquí a todas las plantas y poblaciones de plantas tales como plantas salvajes deseadas e indeseadas o plantas de cultivo (incluyendo plantas de cultivo de origen natural), por ejemplo, cereales (trigo, arroz, triticale, cebada, centeno, avena), maíz, semillas de soja, patata, remolacha azucarera, caña de azúcar, tomates, frijoles y otras especies vegetales,

- algodón, tabaco, semilla de colza y también plantas frutales (con las frutas manzana, pera, frutas cítricas y parras). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que se pueden obtener por procedimientos de reproducción y optimización convencionales o por procedimientos de ingeniería genética y biotecnológicos o combinaciones de estos procedimientos, incluyendo las plantas transgénicas e incluyendo las variedades de plantas que pueden o no estar protegidas por derechos de cultivadores de plantas. Partes de plantas se refiere a todas las partes y órganos de las plantas por encima y debajo de la tierra, tales como tallo, hoja, flor y raíz, algunos ejemplos que se dan son hojas, agujas, caña, tallo, flores, cuerpos de frutas, frutas y semillas y también raíces, tubérculos y rizomas. Las partes de plantas también incluyen material cosechado y material de propagación vegetativa y generativa, por ejemplo, esquejes, tubérculos, rizomas, plántulas y semillas.
- 10 El tratamiento de acuerdo con la invención de las plantas y partes de plantas con los compuestos de la fórmula (I) se lleva a cabo directamente o permitiendo que los compuestos actúan en sus alrededores, ambiente o espacio de almacenamiento por los procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo, por inmersión, pulverización, evaporación, niebla, dispersión, pintura, inyección y, en el caso de material de propagación, en particular en el caso de semillas, también aplicando una o más capas.
- 15 Como ya se mencionó anteriormente, es posible tratar todas las plantas y las partes de las mismas de acuerdo con la invención. En una forma de realización preferida, se tratan las especies de planta silvestre y variedades cultivadas de planta, o las obtenidas por procedimientos de reproducción biológica convencional, tales como cruzamiento o fusión de protoplastos, y partes de estas. En una forma de realización preferida, se tratan las plantas transgénicas y variedades cultivadas de plantas obtenidas por procedimientos de ingeniería genética, si corresponde en combinación con procedimientos convencionales (organismos genéticamente modificados) y partes de estos. El término "partes" o "partes de plantas" o "partes de planta" se explicaron anteriormente. De acuerdo con la invención se da particular preferencia a tratar plantas de las variedades de plantas cultivadas comercialmente habituales respectivas o las que están en uso. Se entiende que las variedades de plantas cultivadas son plantas que tienen nuevas propiedades ("rasgos") y que se cultivaron mediante cruzamiento convencional, por mutagénesis o por técnicas de ADN recombinante. Estas pueden ser variedades cultivadas, variedades, biotipos o genotipos.

Plantas transgénicas, tratamiento de semilla y eventos de integración

- Las plantas o plantas cultivadas transgénicas preferidas (las obtenidas por ingeniería genética) que se deben tratar de acuerdo con la invención incluyen todas las plantas que, a través de modificación genética, recibieron material genético que otorga propiedades útiles ventajosas particulares ("rasgos") a estas plantas. Ejemplos de tales propiedades son mejor crecimiento de la planta, mayor tolerancia a altas o bajas temperaturas, mayor tolerancia a sequía o a niveles de agua o salinidad del suelo, mejor rendimiento de la floración, cosecha más fácil, maduración acelerada, mayores rendimientos de cosecha, mayor calidad y/o mayor valor nutricional de los productos cosechados, mejor vida en almacenamiento y/o procesabilidad de los productos cosechados. Ejemplos adicionales y particularmente destacados de tales propiedades son mayor resistencia de las plantas contra plagas animales y microbianas, tales como insectos, arácnidos, nematodos, ácaros, babosas y caracoles que se deben, por ejemplo, a toxinas formadas en las plantas, en particular las producidas en las plantas por el material genético de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo por los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF y también combinaciones de estos), y también mayor resistencia de las plantas contra hongos, bacterias y/o virus fitopatogénicos causados, por ejemplo, por resistencia adquirida sistémica (SAR), sistemina, fitoalexinas, provocadores y genes de resistencia y proteínas y toxinas expresadas conforme a esto, y también mayor tolerancia de las plantas a determinados compuestos herbicidamente activos, por ejemplo, imidazolinonas, sulfonilureas, glifosatos o fosfotricina (por ejemplo el gen "PAT"). Los genes que otorgan las propiedades deseadas ("rasgos") en cuestión también pueden estar presentes en combinaciones entre sí en las plantas transgénicas. Los ejemplos de plantas transgénicas incluyen las plantas de cultivo importantes, tales como cereales (trigo, arroz, triticale, cebada, centeno, avena), maíz, semillas de soja, patata, remolacha azucarera, caña de azúcar, tomates, frijoles y otros tipos de vegetales, algodón, tabaco, semilla de colza y también plantas frutales (con las frutas manzana, pera, frutas cítricas y uvas), con énfasis particular en el maíz, semillas de soja, trigo, arroz, patatas, algodón, caña de azúcar, tabaco y semilla de colza. Las propiedades ("rasgos") a los que se les da un énfasis particular son la mayor resistencia de las plantas a insectos, arácnidos, nematodos y caracoles.

50 Protección de cultivo - tipos de tratamiento

- Las plantas y partes de plantas se tratan con los compuestos de la fórmula (I) directamente o por acción de su ambiente, hábitat o espacio de almacenamiento usando procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo por inmersión, pulverización, atomización, irrigación, evaporación, espolvoreo, niebla, transmisión, formación de espuma, pintada, aplicación, inyección, agua (empapado), irrigación por goteo y, en el caso de material de propagación, en particular en el caso de semillas, adicionalmente mediante el tratamiento de semilla seca, tratamiento de semilla líquida, tratamiento de suspensión, mediante incrustación, recubrimiento con una o más capas, etc. También es posible aplicar los compuestos de la fórmula (I) mediante el procedimiento de volumen ultra bajo o inyectando la forma de aplicación o el propio compuesto de la fórmula (I) en el suelo.

- Un tratamiento directo preferido de las plantas es la aplicación foliar, es decir, los compuestos de la fórmula (I) se aplican al follaje, donde la frecuencia de tratamiento y la velocidad de aplicación se deberían ajustar de acuerdo con

el nivel de infestación de la plaga en cuestión.

En el caso de compuestos sistemáticamente activos, los compuestos de la fórmula (I) también acceden a las plantas mediante el sistema de raíces. Luego las plantas se tratan mediante la acción de los compuestos de la fórmula (I) en el hábitat de la planta. Esto se puede lograr, por ejemplo, por empapado o mezclando con el suelo o la solución de nutriente, que significa que el locus de la planta (por ejemplo, suelo o sistemas hidropónicos) se impregna con una forma líquida de los compuestos de la fórmula (I), o por aplicación en el suelo, que significa que los compuestos de la fórmula (I) se introducen en forma sólida (por ejemplo, en la forma de gránulos) en el locus de las plantas. En el caso de cultivos de arroz, esto se puede lograr dosificando el compuesto de la fórmula (I) en una forma de aplicación sólida (por ejemplo como gránulos) en un campo de arroz inundado.

10 Tratamiento de semillas

El control de plagas animales mediante el tratamiento de la semilla de las plantas se conoce desde hace mucho tiempo y es sujeto de mejoras continuas. Sin embargo, el tratamiento de semillas implica una serie de problemas que no siempre se pueden solucionar de forma satisfactoria. Por lo tanto, es deseable desarrollar procedimientos para proteger la semilla y la planta germinada de manera que no sea necesario o al menos se pueda reducir considerablemente la aplicación adicional de pesticidas durante el almacenamiento, después de la siembra o después de que la planta emerge. Adicionalmente se desea optimizar la cantidad de compuesto activo utilizado de forma de proporcionar protección óptima para la semilla y planta germinada contra ataques de plagas animales, pero sin dañar la planta en sí misma con el compuesto activo utilizado. En particular, los procedimientos para el tratamiento de semillas también deberían tener en cuenta las propiedades insecticidas o nematocidas intrínsecas de plantas transgénicas resistentes o tolerantes a las plagas para lograr la protección óptima de la semilla y la planta germinada con un mínimo de gasto en pesticidas.

Por lo tanto la presente invención también se refiere especialmente a un procedimiento para la protección de semillas y plantas germinadas de los ataques de plagas, tratando la semilla con uno de los compuestos de la fórmula (I). El procedimiento de acuerdo con la invención para proteger semillas y plantas germinadas de los ataques de plagas también comprende un procedimiento por el cual la semilla se trata simultáneamente en una operación o secuencialmente con un compuesto de la fórmula (I) y un componente de mezcla. Comprende además un procedimiento donde la semilla se trata en momentos diferentes con un compuesto de la fórmula (I) y un componente de mezcla.

La invención igualmente se refiere al uso de los compuestos de la fórmula (I) para el tratamiento de semillas para proteger la semilla y la planta resultante contra plagas animales.

La invención además se refiere a semillas que se trataron con un compuesto de la fórmula (I) para la protección contra plagas animales. La invención también se refiere a semillas que se trataron simultáneamente con un compuesto de la fórmula (I) y un componente de mezcla. La invención también se refiere a semillas que se trataron en momentos diferentes con un compuesto de la fórmula (I) y un componente de mezcla. En el caso de semillas tratadas en momentos diferentes con un compuesto de la fórmula (I) y un componente de mezcla, las sustancias individuales pueden estar presentes en la semilla en diferentes capas. En este caso, las capas que comprenden un compuesto de la fórmula (I) y un componente de mezcla se pueden separar opcionalmente por una capa intermedia. La invención también se refiere a semillas en las cuales un compuesto de la fórmula (I) y un componente de mezcla se aplicaron como parte de un recubrimiento o como una capa adicional o capas adicionales además del recubrimiento.

La invención además se refiere a semillas que, después del tratamiento con un compuesto de la fórmula (I), se someten a un proceso de recubrimiento de película para evitar la abrasión de polvos en la semilla.

Una de las ventajas encontradas con un compuesto de acción sistémica de la fórmula (I) es el hecho de que, al tratar la semilla, no solo la semilla en sí misma sino también las plantas que resultan de estas estén, después de la emergencia, protegidas contra plagas de animales. De esta manera, se puede prescindir del tratamiento inmediato del cultivo al momento de sembrar o poco después de ello.

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

También se considera ventajoso que los compuestos de la fórmula (I) se pueden usar también especialmente en la semilla transgénica.

Además, los compuestos de la fórmula (I) se pueden usar en combinación con composiciones de tecnología de señalización, lo que lleva a una mejor colonización por simbiosis tales como, por ejemplo, hongos o bacterias rizobio, micorrizas y/o endofítica y/o a una mejor fijación de nitrógeno.

Los compuestos de la fórmula (I) son adecuados para la protección de semillas de cualquier variedad de planta que se usa en la agricultura, en el invernadero, en bosques o en horticultura. Más particularmente, esto incluye semilla de cereales (por ejemplo, trigo, cebada, centeno, mijo y avena), maíz, algodón, semillas de soja, arroz, patatas, girasol, café, tabaco, canola, semilla de colza, remolacha (por ejemplo remolacha azucarera y forrajera), maní, vegetales (por

ejemplo, tomates, pepinos, frijol, vegetales crucíferos, cebollas y lechugas), plantas de frutas, pastos y plantas ornamentales. Es de particular importancia el tratamiento de la semilla de cereales (tales como trigo, cebada, centeno y avena), maíz, semillas de sojas, algodón, canola, semilla de colza y arroz.

- 5 Como ya se mencionó anteriormente, el tratamiento de la semilla transgénica con un compuesto de la fórmula (I) también es de particular importancia. Esto implica la semilla de plantas que generalmente contiene al menos un gen heterólogo que controla la expresión de un polipéptido con propiedades insecticidas y/o nematocidas en particular. Los genes heterólogos en semillas transgénicas pueden originarse en este caso a partir de microorganismos tales como *Bacillus*, *Rhizobium*, *Pseudomonas*, *Serratia*, *Trichoderma*, *Clavibacter*, *Glomus* o *Gliocladium*. La presente invención es particularmente adecuada para el tratamiento de semillas transgénicas que contienen al menos un gen heterólogo que se origina a partir de *Bacillus* sp. El gen heterólogo se deriva más preferentemente de *Bacillus thuringiensis*.

- 10 En el contexto de la presente invención, el compuesto de la fórmula (I) se aplica a la semilla. La semilla se trata preferentemente en un estado donde está suficientemente estable para que no ocurra un daño en el transcurso del tratamiento. En general, la semilla se puede tratar en cualquier momento entre la cosecha y la siembra. Es normal usar semillas que se separaron de la planta y libres de mazorca, cáscaras, tallos, cubiertas, pelos o la pulpa de las frutas. Por ejemplo, es posible usar semillas que se cosecharon, limpiaron y secaron hasta lograr un contenido de humedad que permita su almacenamiento. De manera alternativa, también es posible usar semillas que, luego del secado, fueron tratadas con, por ejemplo, agua y luego volvieron a secarse, por ejemplo cebarse (priming). En el caso de semillas de arroz, también es posible usar semillas que se empaparon en agua hasta determinada etapa ("pigeon breast Stadium", etapa pecho de paloma), por ejemplo, que conlleva una mejora en la germinación y un surgimiento más uniforme.

Al tratar la semilla, generalmente se debe tener cuidado de que la cantidad del compuesto de la fórmula (I) aplicado a la semilla y/o la cantidad de aditivos adicionales se elija de forma tal que la germinación de la semilla no se vea afectada de forma adversa, o que la planta resultante no se dañe. Eso se tiene que asegurar particularmente en el caso de compuestos activos que pueden presentar efectos fitotóxicos en determinadas cantidades de aplicación.

- 25 En general, los compuestos de la fórmula (I) se aplican a la semilla en la forma de una formulación adecuada. El experto en la técnica conoce formulaciones y procedimientos adecuados para el tratamiento de semillas.

Los compuestos de la fórmula (I) se pueden convertir en las formulaciones de recubrimiento de semilla habituales, tales como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, espumas, lechadas u otras composiciones de recubrimiento para semillas, y también formulaciones de ULV.

- 30 Estas formulaciones se preparan de forma conocida mezclando los compuestos de la fórmula (I) con aditivos habituales tales como, por ejemplo, extensores habituales y también solventes o diluyentes, colorantes, agentes humectantes, dispersantes, emulsionantes, antiespumantes, conservantes, espesantes secundarios, adhesivos, giberelinas y también agua.

- 35 Los colorantes que pueden estar presentes en las formulaciones de revestimiento útiles de acuerdo con la invención son todos los colorantes que son habituales para dichos fines. Es posible usar pigmentos, que son solubles con moderación en agua, o colorantes, que son solubles en agua. Ejemplos incluyen colorantes conocidos por los nombres Rodamina B, C.I. Pigmento rojo 112 y C.I. Solvente rojo 1.

- 40 Los agentes humectantes útiles que pueden estar presentes en las formulaciones de revestimiento de semillas útiles de acuerdo con la invención son todas las sustancias que promueven la humectación y que son habituales para la formulación de los compuestos agroquímicos activos. Se da preferencia al uso de alquilnaftalenosulfonatos, tales como diisopropil o diisobutil naftalenosulfonatos.

- 45 Los agentes dispersantes y/o emulsionantes adecuados que pueden estar presentes en las formulaciones de revestimiento de semillas útiles de acuerdo con la invención son todos los dispersantes no iónicos, aniónicos y catiónicos habituales para la formulación de los compuestos agroquímicos activos. Se da preferencia al uso de dispersantes no iónicos o aniónicos o mezclas de dispersantes no iónicos o aniónicos. Los dispersantes no iónicos adecuados incluyen en particular polímeros de bloque de óxido de etileno/óxido de propileno, éteres de alquilfenol poliglicol y éteres de tritirilfenol poliglicol y los derivados fosfatados o sulfatados de estos. Los dispersantes aniónicos adecuados son especialmente lignosulfonatos, sales de ácido poliacrílico y condensados de arilsulfonato-formaldehído.

- 50 Los agentes antiespumantes útiles que pueden estar presentes en las formulaciones de revestimiento de semillas útiles de acuerdo con la invención son todas las sustancias que inhiben la espuma habitual para la formulación de los compuestos agroquímicos activos. Antiespumantes de silicona y estearato de magnesio se pueden usar preferentemente.

- 55 Los conservantes útiles que pueden estar presentes en las formulaciones de revestimiento de semillas útiles de acuerdo con la invención son todas las sustancias útiles para dichos fines en las composiciones agroquímicas. Ejemplos incluyen diclorofeno y alcohol bencílico hemiformal.

Los espesantes secundarios que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semilla útiles de acuerdo con la invención son todas las sustancias que se pueden usar con tales efectos en las composiciones agroquímicas. Ejemplos preferidos incluyen derivados de celulosa, derivados de ácido acrílico, xantano, arcillas modificadas y sílice dividido finamente.

- 5 Los adhesivos útiles que pueden estar presentes en las formulaciones de revestimiento de semillas útiles de acuerdo con la invención son todos los aglutinantes habituales que se pueden usar en los productos de revestimiento de semillas. Ejemplos preferidos incluyen polivinilpirrolidona, polivinil acetato, polivinil alcohol y tilosa.

- 10 Las giberelinas que pueden estar presentes en las formulaciones de revestimiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención son preferentemente las giberelinas A1, A3 (= ácido giberélico), A4 y A7; se da particular preferencia a usar ácido giberélico. Las giberelinas se conocen (véase, R. Wegler "Chemie der Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmittel", vol. 2, Springer Verlag, 1970, pp. 401-412 ("Química de los pesticidas y plaguicidas", tomo 2, Edit. Springer, 190, pág. 401-412).

- 15 Las formulaciones de recubrimiento de semilla útiles de acuerdo con la invención se pueden usar para tratar una amplia variedad de diferentes tipos de semillas, sea directamente o después de la dilución previa con agua. Por ejemplo, los concentrados o las preparaciones que se pueden obtener a partir de estos por dilución con agua se pueden usar para recubrir la semilla de cereales, tales como trigo, cebada, centeno, avena y triticale y también la semilla de maíz, arroz, semilla de colza, arvejas, frijoles, algodón, girasol, semillas de soja y remolachas o una amplia variedad de diferentes semillas vegetales. Las formulaciones de recubrimiento de semillas útiles de acuerdo con la invención, o las formas de uso diluidas de estas, también se pueden usar para recubrir la semilla de plantas transgénicas.

- 20 Para el tratamiento de semillas con las formulaciones de recubrimiento de semilla de acuerdo con la invención, o las formas de uso preparadas a partir de ellas, son útiles todas las unidades de mezcla útiles habitualmente para el recubrimiento de semillas. Específicamente, el procedimiento de recubrimiento de semilla consiste en colocar la semilla en un mezclador, de funcionamiento por lotes o continuo, agregar la cantidad deseada de formulaciones de recubrimiento de semilla, sea como tal o después de la dilución previa con agua y mezclar hasta que la formulación se distribuya homogéneamente en la semilla. Dado el caso, a esto le sigue una operación de secado.

- 25 La cantidad de aplicación de las formulaciones que se pueden usar de acuerdo con la invención puede variar dentro de un intervalo relativamente amplio. Depende del respectivo contenido de los compuestos de la fórmula (I) en las formulaciones y de la semilla. Las cantidades de aplicación del compuesto de fórmula (I) se encuentran generalmente entre 0,001 y 50 g por kilogramo de semilla, preferentemente entre 0,01 y 15 g por kilogramo de semilla.

Sanidad animal

- 35 En el campo de la sanidad animal, es decir, en el campo de la medicina veterinaria, los compuestos de la fórmula (I) son activos contra parásitos, en particular ectoparásitos o endoparásitos. El término endoparásitos comprende en particular helmintos y protozoarios tal como coccidia. Los ectoparásitos son típica y preferentemente artrópodos, en particular insectos y ácaros.

En el campo de la medicina veterinaria, los compuestos de la fórmula (I) con toxicidad de homeotermia favorable son adecuados para controlar parásitos que ocurren en la reproducción animal y cría animal en animales de ganado, animales de reproducción, animales de zoológico, animales de laboratorio, animales experimentales y animales domésticos. Son activos contra todas las etapas o etapas específicas de desarrollo de los parásitos.

- 40 El ganado agrícola incluye, por ejemplo, mamíferos, tales como ovejas, cabras, caballos, burros, camellos, búfalos, conejos, renos, gamos, particularmente ganado y cerdos; aves de corral tales como pavos, patos, gansos y particularmente gallinas; peces y crustáceos, por ejemplo, en cultivo acuático, y también insectos tales como abejas.

Los animales domésticos incluyen, por ejemplo, mamíferos, tales como hámster, cobayos, ratas, ratones, chinchillas, hurones y particularmente perros, gatos, aves enjauladas, reptiles, anfibios y peces de acuario.

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

De acuerdo con otra forma de realización preferida, los compuestos de la fórmula (I) se administran a aves, a saber aves de jaulas y particularmente aves de corral.

- 50 Con el uso de los compuestos de la fórmula (I) para el control de parásitos de animales se pretende reducir o prevenir enfermedades, casos de muerte y reducciones de rendimiento (en carne, leche, lana, pieles, huevos, miel y similares), de modo de alcanzar una cría de animales más económica y simple y un mejor bienestar animal.

En relación con el campo de la salud animal, el término "control" o "controlar" significa que mediante los compuestos de la fórmula (I) se puede reducir eficazmente la incidencia del parásito particular en un animal infectado con tales parásitos hasta un grado inocuo. Más específicamente, "controlar" en el contexto presente significa que el compuesto de la fórmula (I) puede matar el parásito correspondiente, inhibir su crecimiento o inhibir su proliferación.

Los artrópodos incluyen:

- del orden de Anoplurida, por ejemplo *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp., *Solenopotes* spp.; del orden de Mallophagida y los subórdenes de Amblycerina e Ischnocerina, por ejemplo *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp., *Felicola* spp.; del orden de Diptera y los subórdenes de Nematocera y Brachycera, por ejemplo *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp., *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides* spp., *Chrysops* spp., *Odagmia* spp., *Wilhelmia* spp., *Hybomitra* spp., *Atylotus* spp., *Tabanus* spp., *Haematopota* spp., *Philipomyia* spp., *Braula* spp., *Musca* spp., *Hydrotaea* spp., *Stomoxys* spp., *Haematobia* spp., *Morellia* spp., *Fannia* spp., *Glossina* spp., *Calliphora* spp., *Lucilia* spp., *Chrysomyia* spp., *Wohlfahrtia* spp., *Sarcophaga* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Gasterophilus* spp., *Hippobosca* spp., *Lipoptena* spp., *Melophagus* spp., *Rhinoestrus* spp., *Tipula* spp.; del orden de Siphonaptera, por ejemplo *Pulex* spp., *Ctenocephalides* spp., *Tunga* spp., *Xenopsylla* spp., *Ceratophyllus* spp.; del orden de Heteroptera, por ejemplo *Cimex* spp., *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp.; así como plagas problemáticas o de higiene del orden de Blattaria.

Los artrópodos incluyen además:

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

Los protozoarios de parásitos incluyen:

- Mastigophora* (Flagellata), por ejemplo *Trypanosomatidae*, por ejemplo *Trypanosoma* b. *brucei*, T.b. *gambiense*, T.b. *rhodesiense*, T. *congolense*, T. *cruxi*, T. *evansi*, T. *equinum*, T. *lewisii*, T. *percae*, T. *simiae*, T. *vivax*, *Leishmania* *brasiliensis*, L. *donovani*, L. *tropica*, por ejemplo *Trichomonadidae*, por ejemplo *Giardia lamblia*, G. *canis*;
- Sarcomastigophora* (Rhizopoda), tal como *Entamoebidae*, por ejemplo *Entamoeba histolytica*, *Hartmannellidae*, por ejemplo *Acanthamoeba* sp., *Harmanella* sp.;
- Apicomplexa* (Sporozoa), tal como *Eimeridae*, por ejemplo *Eimeria* *acervulina*, E. *adenoides*, E. *alabamensis*, E. *anatis*, E. *anserina*, E. *arlingi*, E. *ashata*, E. *auburnensis*, E. *bovis*, E. *brunetti*, E. *canis*, E. *chinchillae*, E. *clupearum*, E. *columbae*, E. *contorta*, E. *crandallii*, E. *debliecki*, E. *dispersa*, E. *ellipsoides*, E. *falciformis*, E. *faurei*, E. *flavescens*, E. *gallopavonis*, E. *hagani*, E. *intestinalis*, E. *iroquoiana*, E. *irresidua*, E. *labbeana*, E. *leucarti*, E. *magna*, E. *maxima*, E. *media*, E. *meleagridis*, E. *meleagritidis*, E. *mitis*, E. *necatrix*, E. *ninakholyakimovae*, E. *ovis*, E. *parva*, E. *pavonis*, E. *perforans*, E. *phasani*, E. *piriformis*, E. *praecox*, E. *residua*, E. *scabra*, E. *spec.*, E. *stiedai*, E. *suis*, E. *tenella*, E. *truncata*, E. *truttae*, E. *zuernii*, *Globidium spec.*, *Isospora belli*, I. *canis*, I. *felis*, I. *ohioensis*, I. *rivolta*, I. *spec.*, I. *suis*, *Cystispora spec.*, *Cryptosporidium spec.*, especialmente C. *parvum*; tal como *Toxoplasmodidae*, por ejemplo *Toxoplasma gondii*, *Hammondia heydornii*, *Neospora caninum*, *Besnoitia besnoitii*; tal como *Sarcocystidae*, por ejemplo *Sarcocystis bovis*, S. *bovohominis*, S. *ovicanis*, S. *ovifelis*, S. *nuevarona*, S. *spec.*, S. *suihominis*, tal como *Leucosporidae*, por ejemplo *Leucosporidium simondi*, tal como *Plasmodiidae*, por ejemplo *Plasmodium berghei*, P. *falciparum*, P. *malariae*, P. *ovale*, P. *vivax*, P. *spec.*, tal como *Piroplasma*, por ejemplo *Babesia argentina*, B. *bovis*, B. *canis*, B. *spec.*, *Theileria parva*, *Theileria spec.*, tal como *Adeleina*, por ejemplo *Hepatozoon canis*, H. *spec.*

Los endoparásitos patógenos que son helmintos incluyen platelmintos (por ejemplo *Monogenea*, *Cestodes* y *Trematodes*), nematodos, *Acanthocephala* y *Pentastoma*. Estos incluyen:

Monogenea: por ejemplo: *Gyrodactylus* spp., *Dactylogyrus* spp., *Polystoma* spp.;

- Cestodos*: del orden de *Pseudophyllidea* por ejemplo: *Diphyllbothrium* spp., *Spirometra* spp., *Schistocephalus* spp., *Ligula* spp., *Bothridium* spp., *Diplogonoporus* spp.;

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

- Trematodos*: de la clase de *Digenea* por ejemplo: *Diplostomum* spp., *Posthodiplostomum* spp., *Schistosoma* spp., *Trichobilharzia* spp., *Ornithobilharzia* spp., *Austrobilharzia* spp., *Gigantobilharzia* spp., *Leucocloroidium* spp., *Brachylaima* spp., *Echinostoma* spp., *Echinoparyphium* spp., *Echinochasmus* spp., *Hypoderaeum* spp., *Fasciola*

spp., Fascioloides spp., Fasciolopsis spp., Cyclocoelum spp., Typhlocoelum spp., Paramphistomum spp., Calicophoron spp., Cotylophoron spp., Gigantocotyle spp., Fiscoederius spp., Gastrothylacus spp., Notocotylus spp., Catatropis spp., Plagiorchis spp., Prosthogonimus spp., Dicrocoelium spp., Eurytrema spp., Troglotrema spp., Paragonimus spp., Collyriclum spp., Nanophyetus spp., Opisthorchis spp., Clonorchis spp., Metorchis spp., Heterophyes spp., Metagonimus spp.;

Nematodos: Trichinellida por ejemplo: Trichuris spp., Capillaria spp., Paracapillaria spp., Eucoleus spp., Trichomosoides spp., Trichinella spp.;

del orden de Tylenchida por ejemplo: Micronema spp., Strongyloides spp.;

del orden de Rhabditida por ejemplo: Strongylus spp., Triodontophorus spp., Oesophagodontus spp., Trichonema spp., Gyalocephalus spp., Cyliodropharynx spp., Poterostomum spp., Cyclocercus spp., Cylicostephanus spp., Oesophagostomum spp., Chabertia spp., Stephanurus spp., Ancylostoma spp., Uncinaria spp., Necator spp., Bunostomum spp., Globocephalus spp., Syngamus spp., Cyathostoma spp., Metastrongylus spp., Dictyocaulus spp., Muellerius spp., Protostrongylus spp., Neostrongylus spp., Cystocaulus spp., Pnuevamostrongylus spp., Spicocaulus spp., Elaphostrongylus spp., Parelaphostrongylus spp., Crenosoma spp., Paracrenosoma spp., Oslerus spp., Angiostrongylus spp., Aelurostrongylus spp., Filaroides spp., Parafilaroides spp., Trichostrongylus spp., Haemonchus spp., Ostertagia spp., Teladorsagia spp., Marshallagia spp., Cooperia spp., Nippostrongylus spp., Heligmosomoides spp., Nematodirus spp., Hyostrongylus spp., Obeliscoides spp., Amidostomum spp., Ollulanus spp.;

del orden de Spirurida por ejemplo: Oxyuris spp., Enterobius spp., Passalurus spp., Syphacia spp., Aspiculuris spp., Heterakis spp.; Ascaris spp., Toxascaris spp., Toxocara spp., Baylisascaris spp., Parascaris spp., Anisakis spp., Ascaridia spp.; Gnathostoma spp., Physaloptera spp., Thelazia spp., Gongylonema spp., Habronema spp., Parabronema spp., Draschia spp., Dracunculus spp.; Stephanofilaria spp., Parafilaria spp., Setaria spp., Loa spp., Dirofilaria spp., Litomosoides spp., Brugia spp., Wuchereria spp., Onchocerca spp., Spirocerca spp.;

Acanthocephala: del orden de Oligacanthorhynchida por ejemplo: Macracanthorhynchus spp., Prosthenorchis spp.; del orden de Polymorphida por ejemplo: Filicollis spp.; del orden de Moniliformida por ejemplo: Moniliformis spp.;

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

Pentastoma: del orden de Porocephalida por ejemplo Linguatula spp.

En el campo veterinario y la cría de animales, los compuestos de la fórmula (I) se administran mediante procedimientos conocidos generalmente en la técnica, tales como a través de la vía enteral, parenteral, dérmica o nasal en la forma de preparaciones adecuadas. La administración puede ser profiláctica o terapéutica.

Por lo tanto, una forma de realización de la presente invención se refiere al uso de un compuesto de la fórmula (I) como medicamento.

Un aspecto adicional se refiere al uso de un compuesto de la fórmula (I) como agente antiendoparasitario, en particular un agente helminticida o un agente antiprotosoario. Los compuestos de la fórmula (I) son adecuados para usarse como agente antiendoparasitario, especialmente como un agente helminticida o agente antiprotosoario, por ejemplo en la cría de animales, en la reproducción de animales, en establos y en el sector de higiene.

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

Componentes de mezcla antihelmínticos

A modo de ejemplo pueden mencionarse los siguientes componentes de mezcla antihelmínticos: compuestos antihelmínticamente activos, incluyendo compuestos trematocidalmente y cestocidalmente activos:

de la clase de **lactomas macrocíclicas**, por ejemplo: abamectina, doramectina, emamectina, eprinomectina, ivermectina, milbemicina, moxidectina, nemadectina, selamectina;

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

de la clase de **ciclooctadeepsipéptidos**, por ejemplo: emodepsida, PF1022;

de la clase de **derivados de aminoacetónitrilo**, por ejemplo: monepante;

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

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

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

de la clase de **paraquerquamidias**, por ejemplo: derquantel, paraquerquamida;

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

de la clase de **organofosfatos**, por ejemplo: coumafós, crufomato, diclorvos, haloxon, naftalofos, triclorfon;

de la clase de **fenoles sustituidos**, por ejemplo: bitionol, disofenol, hexaclorofen, niclofolan, meniclofolan, nitroxinil;

de la clase de **piperazinonas**, por ejemplo: praziquantel, epsiprantel;

10 de **varias otras clases**, por ejemplo: amoscanato, befenio, bunamidina, clonazepam, clorsulon, diamfenetida, diclorofen, dietilcarbamazina, emetina, hetolin, hicanona, lucantona, miracil, mirasan, niclosamida, nirdazol, nitroxinil, nitroscanato, oltipraz, omfalotin, oxamniquina, paromomicina, piperazina, resorantel.

Control de vector

15 Los compuestos de la fórmula (I) también se pueden usar en el control de vector. En el contexto de la presente invención, un vector es un artrópodo, especialmente un insecto o un arácnido, capaz de transmitir patógenos, por ejemplo, virus, gusanos, organismos unicelulares y bacterias de un depósito (planta, animal, humano, etc.) a un hospedador. Los patógenos se pueden transmitir mecánicamente (por ejemplo tracoma por moscas que no pican) a un hospedador o después de la inyección (por ejemplo, parásitos de malaria por mosquitos) en un hospedador.

Ejemplos de vectores y las enfermedades o patógenos que transmiten son:

20 1) Mosquitos

- Anopheles: malaria, filariasis;

- Culex: encefalitis japonesa, filariasis, otras enfermedades virales, transmisión de gusanos;

- Aedes: fiebre amarilla, fiebre del dengue, filariasis, otras enfermedades virales;

- Simuliidae: transmisión de gusanos, en particular Onchocerca volvulus;

25 2) Piojos: infecciones de piel, tifus epidémica;

3) Pulgas: peste, tifus endémica;

4) Moscas: enfermedad del sueño (trpanosomiasis); cólera, otras enfermedades bacterianas;

5) Ácaros: acariosis, tifus epidémica, rickettsialpox, tularemia, encefalitis de San Luis, encefalitis transmitida por garrapatas (TBE), fiebre hemorrágica de Crimea–Congo, borreliosis;

30 6) Garrapatas: borreliosis tales como Borrelia duttoni, encefalitis transmitida por garrapatas, fiebre Q (Coxiella burnetii), babesiosis (Babesia canis canis).

Los ejemplos de vectores en el sentido de la presente invención son insectos, tales como áfidos, moscas, chicharritas o trips, que pueden transmitir virus de plantas a plantas. Otros vectores que pueden transmitir virus de plantas son los ácaros de araña, piojos, escarabajos y nematodos.

35 Ejemplos adicionales de vectores en el sentido de la presente invención son insectos y arácnidos tales como mosquitos, especialmente del género Aedes, Anopheles, por ejemplo A. gambiae, A. arabiensis, A. funestus, A. dirus (malaria) y Culex, piojos, pulgas, moscas, ácaros y garrapatas que pueden transmitir patógenos a animales y/o seres humanos.

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

40 Los compuestos de la fórmula (I) son adecuados para usarse en la prevención de enfermedades o patógenos transmitidos por vectores. Por lo tanto, un aspecto adicional de la presente invención es el uso de compuestos de la fórmula (I) para el control de vectores, por ejemplo en la agricultura, horticultura, silvicultura, en jardines e instalaciones de recreación y también en la protección de materiales y de productos almacenados.

Protección de materiales técnicos

45 Los compuestos de la fórmula (I) son adecuados para proteger materiales técnicos contra el ataque o la destrucción

por insectos, p.ej. del orden Coleóptera, Himenóptera, Isóptera, Lepidóptera, Psocóptera y Zygentoma.

Materiales industriales en el contexto de la presente se refiere a materiales inanimados, tales como preferentemente plásticos, adhesivos, colas, papeles y cartones, cuero, madera, productos de madera procesada y composiciones de recubrimiento. El uso de la invención para proteger madera es particularmente preferido.

- 5 En otra forma de realización los compuestos de la fórmula (I) se usan junto con al menos un insecticida adicional y/o al menos un fungicida.

En una forma de realización adicional, los compuestos de la fórmula (I) están presentes como un pesticida pronto para usarse (ready-to-use), es decir, se puede aplicar al material en cuestión sin modificaciones adicionales. Insecticidas o fungicidas adicionales adecuados son en particular los mencionados anteriormente.

- 10 Sorprendentemente, también se encontró que los compuestos de la fórmula (I) se pueden utilizar para proteger objetos que entran en contacto con agua salada o agua salobre, en particular, cascos de barcos, pantallas, redes, edificios, amarraderos y sistemas de señalización, contra contaminaciones. Es igualmente posible usar los compuestos de la fórmula (I), por sí solos o en combinaciones con otros compuestos activos como agentes anticontaminantes.

Control de plagas animales en el sector de la higiene

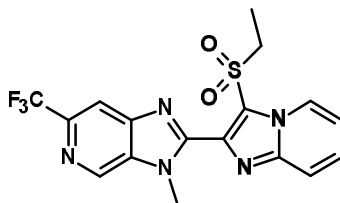
- 15 Los compuestos de la fórmula (I) son adecuados para controlar plagas animales en el sector de la higiene. Más particularmente, la invención se puede usar en el sector de protección doméstica, en el sector de protección de higiene y en la protección de productos almacenados, particularmente para el control de insectos, arácnidos y ácaros encontrados en espacios cerrados por ejemplo viviendas, fábricas, oficinas, cabinas de vehículos. Para controlar plagas animales, los compuestos de la fórmula (I) se usan solos o en combinación con otros compuestos activos y/o
- 20 auxiliares. Se usan preferentemente en productos insecticidas domésticos. Los compuestos de la fórmula (I) son eficaces contra especies sensibles y resistentes, y contra todas las etapas de desarrollo.

- Estas plagas incluyen, por ejemplo, plagas de la clase Arachnida, del orden Scorpiones, Araneae y Opiliones, de las clases Chilopoda y Diplopoda, de la clase Insecta del orden Blattodea, del orden Coleoptera, Dermaptera, Diptera, Heteroptera, Hymenoptera, Isoptera, Lepidoptera, Phthiraptera, Psocoptera, Saltatoria u Orthoptera, Siphonaptera y
- 25 Zygentoma y de la clase Malacostraca del orden Isopoda.

- La aplicación se efectúa, por ejemplo, en aerosoles, productos de pulverización sin presión, por ejemplo pulverizadores de bomba o atomizador, sistemas de niebla automáticos, formadores de niebla, espumas, geles, productos evaporadores con tabletas de evaporación hechas de celulosa o plástico, evaporadores líquidos, evaporadores de gel y membrana, evaporadores impulsados por propulsor, sistemas de evaporación libres de energía o pasivos, papel de
- 30 polilla, bolsa de polilla y geles de polilla, como gránulos o polvos, en cebos para esparcir o estaciones de cebos.

Ejemplos de preparación:

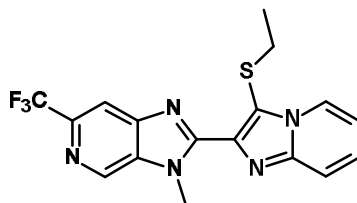
2-(3-etilsulfonilimidazo[1,2-a]piridina-2-il)-3-metil-6-(trifluormetil)-imidazo[4,5c]piridina (I-1)



- 35 Se disolvieron 52 mg (0,13 mmol) de 2-(3-etilsulfonilimidazo[1,2-a]piridina-2-il)-3-metil-6-(trifluormetil)-imidazo[4,5-c]piridina en 15 ml de diclorometano, a temperatura ambiente se agregaron 31,8 mg (0,68 mmol) de ácido fórmico y 133,9 mg (1,37 mmol) de peróxido de hidrógeno y luego se agitó durante 8 h a temperatura ambiente. La mezcla se diluyó con agua y se mezcló con una solución de bisulfito sódico, se agitó durante 10 min y a continuación se agitó con una solución de bicarbonato sódico al 10 %. Se separó la fase orgánica, la fase acuosa se extrajo dos veces con diclorometano y las fases orgánicas combinadas luego se separaron al vacío del disolvente. El residuo se purificó
- 40 mediante purificación por cromatografía en columna por HPLC preparativa con un gradiente de agua / acetonitrilo como eluyente.

(logP (neutral): 2,07; MH⁺: 410; ¹H-RMN(400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 1,28 (t, 3H), 3,87 (q, 2H), 4,08 (s, 3H), 7,41 (t, 1H), 7,75-7,79 (m, 1H), 7,99 (d, 1H), 8,29 (s, 1H), 9,07 (d, 1H), 9,28 (s, 1H).

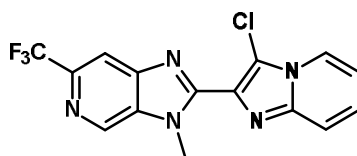
2-(3-etilsulfonilimidazo[1,2-a]piridina-2-il)-3-metil-6-(trifluormetil)-imidazo[4,5c]piridina (I-2)



Se agitaron a temperatura ambiente 101 mg (0,28 mmol) de 2-(3-cloroimidazo[1,2-a]piridina-2-il)-3-metil-6-(trifluormetil)imidazo[4,5-c]piridina y 73 mg (0,86 mmol) de etantionato de sodio en DMF durante 8 h. Se mezcló con agua y se extrajo dos veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se lavaron con una solución de

5 cloruro sódico, se separaron, se secaron en sulfato sódico y se separaron al vacío del disolvente.
(logP (neutral): 2,75; MH⁺: 378; ¹H-RMN(400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 1,08 (t, 3H), 3,04 (q, 2H), 4,29 (s, 3H), 7,24 (t, 1H), 7,54-7,58 (m, 1H), 7,83 (d, 1H), 8,26 (s, 1H), 8,79 (d, 1H), 9,22 (s, 1H).

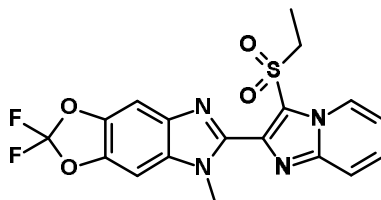
2-(3-cloroimidazo[1,2-a]piridina-2-il)-3-metil-6-(trifluormetil)imidazo[4,5-c]piridina (V-1)



10 Se agitaron 250 mg (1,30 mmol) de N³-metilo-6-(trifluormetil)piridina-3,4-diamin, 305 mg (1,30 mmol) de 3-cloroimidazo[1,2-a]piridina-2-clorhidrato de ácido carboxílico y 251 mg (1,30 mmol) de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-clorhidrato de etilcarbodiimida (EDCI) en 5 ml piridina durante 9 h a 120 °C. La mezcla de reacción se separó al vacío del disolvente, luego se agregó agua y se extrajo tres veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se

15 secaron en sulfato sódico, se volvieron a concentrar y se purificaron por cromatografía en columna por HPLC preparativa con un gradiente de agua / acetonitrilo como eluyente.
(logP (neutral): 2,38; MH⁺: 352; ¹H-RMN(400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 4,42 (s, 3H), 7,26 (t, 1H), 7,52-7,57 (m, 1H), 7,84 (d, 1H), 8,27 (s, 1H), 8,54 (d, 1H), 9,22 (s, 1H).

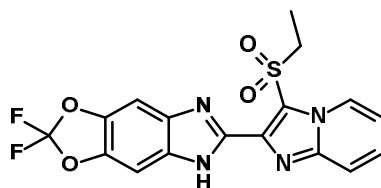
6-[3-(etilsulfonil)imidazo[1,2-a]piridina-2-il]-2,2-difluor-5-metil-5H-[1,3]dioxolo[4,5-f]benzimidazol (I-41)



20 Se disolvieron 48 mg (0,11 mmol) de 6-[3-(etilsulfonil)imidazo[1,2-a]piridina-2-il]-2,2-difluor-5H-[1,3]dioxolo[4,5-f]benzimidazol en 5 ml acetona, a temperatura ambiente se agregaron 32,7 mg (0,23 mmol) de carbonato potásico y 23,5 mg (0,16 mmol) de yoduro de metilo y luego se calentó durante 4 h a 60 °C. El disolvente se separó al vacío, se disolvió el residuo en acetato de etilo y se lavó la fase orgánica con agua. La fase acuosa se extrajo dos veces con acetato de etilo y las fases orgánicas combinadas se secaron en sulfato sódico. Luego se separó el disolvente al vacío.

25 El producto bruto se purificó mediante MPLC con un gradiente de ciclohexano / acetato de etilo como eluyente.
(logP (neutral): 2,62; MH⁺: 421; ¹H-RMN(600 MHz, CD₃CN) δ ppm: 1,32 (t, 3H), 3,82 (q, 2H), 3,92 (s, 3H), 7,20-7,22 (m, 1H), 7,42 (s, 1H), 7,50 (s, 1H), 7,61-7,64 (m, 1H), 7,78-7,80 (m, 1H), 9,10-9,12 (m, 1H).

6-[3-(etilsulfonil)imidazo[1,2-a]piridina-2-il]-2,2-difluor-5H-[1,3]dioxolo[4,5-f]benzimidazol (I-40)

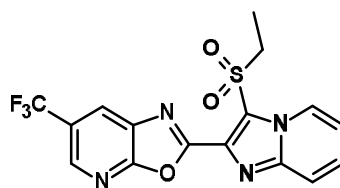


30 A una solución de 57 mg (0,22 mmol) de ácido carboxílico 3-(etilsulfonil)imidazo[1,2-a]piridina-2 en 3 ml de tetrahidrofuran y 3 ml de dimetilformamida se agregaron 128 mg (0,33 mmol) de 1-[Bis(dimetilamino)metileno]-1H-

1,2,3-triazolo[4,5-*b*]piridinio-3-oxid hexafluorofosfato (HATU) y 115 mg (0,89 mmol) de *N*-etilidiisopropilamina y se agitó la mezcla durante 15 min a temperatura ambiente. A continuación se agregó por goteo una solución de 42,1 mg (0,22 mmol) de 2,2-difluor-1,3-benzodioxol-5,6-diamin en 3 ml de tetrahidrofurano y se agitó la mezcla de reacción durante la noche a temperatura ambiente. La mezcla se trató con agua y se extrajo tres veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se secaron en sulfato sódico y luego se separó el disolvente. El residuo se disolvió en 20 ml tolueno y se añadieron 91,2 mg (0,48 mmol) de ácido *p*-toluenosulfónico así como tamiz molecular. La mezcla de reacción se calentó durante 2 h a 120 °C. La mezcla se diluyó con agua y se extrajo tres veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se lavaron dos veces con una solución de bicarbonato sódico, una vez con solución de cloruro sódico, se secó en sulfato sódico y luego se separó el disolvente. El producto bruto se purificó mediante HPLC con un gradiente de agua / acetonitrilo como eluyente.

(logP (neutral): 2,59; MH⁺: 407; ¹H-RMN(400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 1,28 (t, 3H), 4,17 (q, 2H), 7,31-7,34 (m, 1H), 7,53 (s, 1H), 7,68-7,72 (m, 1H), 7,77 (s, 1H), 7,91 (d, 1H), 9,21 (d, 1H).

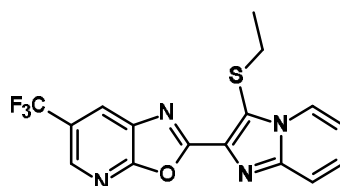
2-[3-(etilsulfonil)imidazo[1,2-*a*]piridina-2-il]-6-(trifluormetil)[1,3]oxazolo[5,4-*b*]piridina (I-44) se aplica como compuesto de referencia para la preparación



Se disolvieron 21 mg (0,05 mmol) de 2-[3-(etilsulfanil)imidazo[1,2-*a*]piridina-2-il]-6-(trifluormetil)[1,3]oxazolo[5,4-*b*]piridina en 10 ml de diclorometano, a 0 °C se agregaron 29,8 mg (0,17 mmol) de 3-clorobenceno carboperoxiácido (MCPBA) y luego se agitó durante 4 h a temperatura ambiente. La mezcla se diluyó con agua, se mezcló con una solución de bisulfito sódico, se agitó durante 10 min y a continuación se agitó con una solución de bicarbonato sódico al 10 %. Se separó la fase orgánica, la fase acuosa se extrajo dos veces con diclorometano y las fases orgánicas combinadas luego se separaron al vacío del disolvente. El residuo se purificó mediante purificación por cromatografía en columna por HPLC preparativa con un gradiente de agua / acetonitrilo como eluyente.

(logP (neutral): 2,52; MH⁺: 397; ¹H-RMN(400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 1,33 (t, 3H), 3,92 (q, 2H), 7,40-7,44 (m, 1H), 7,76-7,80 (m, 1H), 8,02 (d, 1H), 8,97-8,98 (m, 2H), 9,13 (d, 1H).

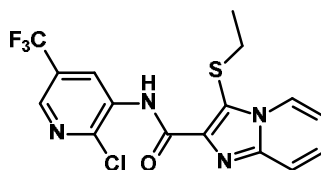
2-[3-(etilsulfanil)imidazo[1,2-*a*]piridina-2-il]-6-(trifluormetil)[1,3]oxazolo[5,4-*b*]piridina (I-60) se aplica como compuesto de referencia para la preparación



A una solución de 39,8 mg (0,09 mmol) de *N*-[2-cloro-5-(trifluormetil)piridina-3-il]-3-(etilsulfanil)imidazo[1,2-*a*]piridina-2-carboxamida en 1 ml *N,N*-dimetilformamida se agregaron 10,5 mg (0,09 mmol) de carbonato sódico y se calentó la mezcla durante 4 h a 145 °C. La mezcla de reacción se enfrió hasta temperatura ambiente, se vertió sobre agua helada y se extrajo dos veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se secaron en sulfato sódico y luego se separó el disolvente. El producto bruto se purificó mediante HPLC con un gradiente de agua / acetonitrilo como eluyente.

(logP (neutral): 3,15; MH⁺: 365; ¹H-RMN(400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 1,11 (t, 3H), 3,03 (q, 2H), 7,23-7,28 (m, 1H), 7,55-7,59 (m, 1H), 7,82 (d, 1H), 8,77 (d, 1H), 8,87 (s, 2H).

***N*-[2-cloro-5-(trifluormetil)piridina-3-il]-3-(etilsulfanil)imidazo[1,2-*a*]piridina-2-carboxamida (XXVI-1)**

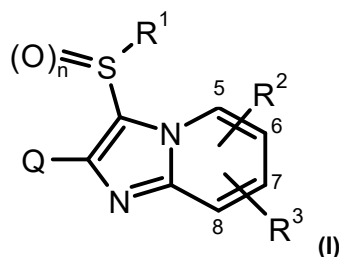


A una solución de 298 mg (1,33 mmol) de 3-(etilsulfanil)imidazo[1,2-*a*]piridina-2-ácido carboxílico en 10 ml de acetonitrilo se agregaron gota a gota 1,1 mg (9,37 mmol) de cloruro de tionilo, la mezcla se sometió a reflujo durante

3 h. El disolvente se separó al vacío y se co-evaporó dos veces al vacío con tolueno. El residuo se disolvió en 3 ml de N,N-dimetilformamida. De ello se separaron 263 mg (1,33 mmol) de 2-cloro-5-(trifluormetil)piridina-3-amina añadiéndose a una suspensión fría a 0 °C de 107 mg (2,67 mmol) de hidruro de sodio en 7 ml de N,N-dimetilformamida, la mezcla se volvió a agitar durante 30 min. A continuación se agregó por gotas lentamente la solución de cloruro de ácido preparada de antemano. La mezcla de reacción se volvió a agitar durante 2 h a temperatura ambiente. La mezcla se vertió sobre agua helada y se extrajo dos veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se secaron en sulfato sódico y luego se separó el disolvente. El producto bruto se purificó mediante HPLC con un gradiente de agua / acetonitrilo como eluyente.

(logP (neutral): 4,39; MH⁺: 401; ¹H-RMN(400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 1,09 (t, 3H), 2,98 (q, 2H), 7,22-7,25 (m, 1H), 7,55-7,60 (m, 1H), 7,82 (d, 1H), 8,66 (d, 1H), 8,73 (d, 1H), 9,07 (d, 1H).

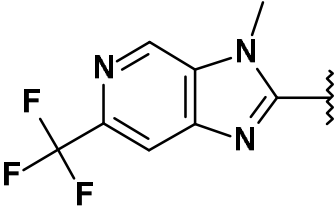
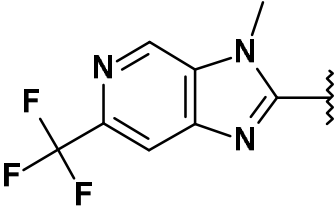
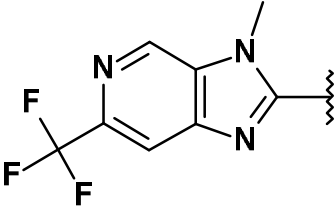
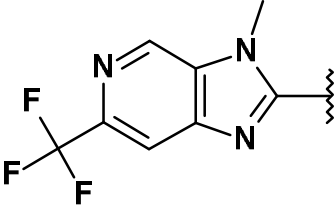
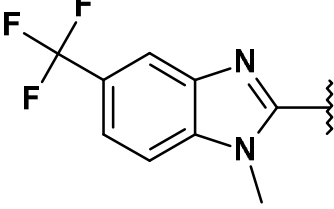
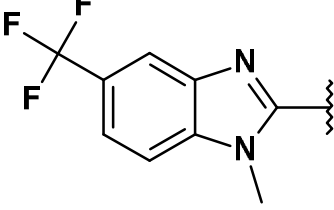
En analogía a los ejemplos y de acuerdo con los procedimientos de preparación descritos anteriormente, pueden obtenerse los siguientes compuestos de fórmula (I):



donde R³ representa hidrógeno y donde R¹, R², Q y n tienen los significados indicados en la siguiente tabla y donde el enlace de Q a la molécula radical se caracteriza con una línea ondulada:

Ej.	R ¹	n	R ²	Q
-----	----------------	---	----------------	---

(continuación)

Ej.	R ¹	n	R ²	Q
I-1	C ₂ H ₅	2	H	
I-2	C ₂ H ₅	0	H	
I-7	C ₂ H ₅	1	6-Cl	
I-8	C ₂ H ₅	1	6-CF ₃	
I-9	C ₂ H ₅	0	H	
I-10	C ₂ H ₅	2	H	

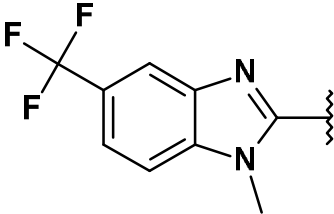
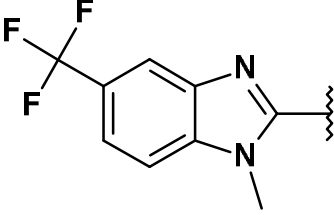
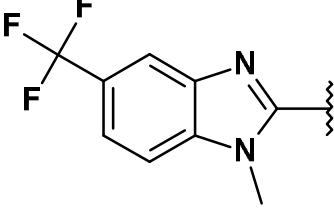
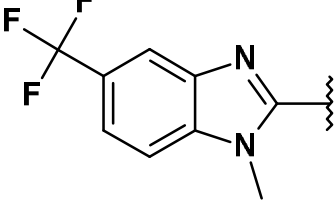
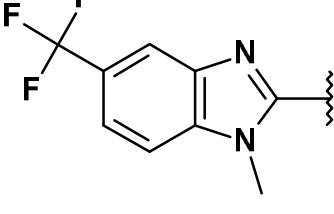
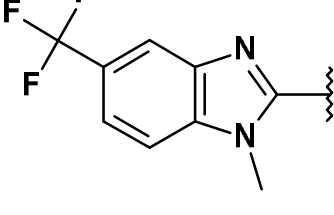
(continuación)

Ej.	R ¹	n	R ²	Q
I-11	C ₂ H ₅	1	H	
I-13	C ₂ H ₅	0	8-CF ₃	
I-14	C ₂ H ₅	0	8-Cl	
I-15	C ₂ H ₅	0	8-SC ₂ H ₅	
I-18	C ₂ H ₅	1	7-CF ₃	
I-19	C ₂ H ₅	2	8-Cl	

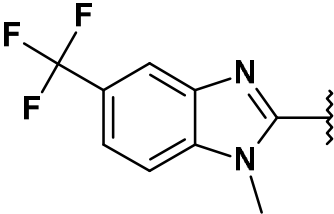
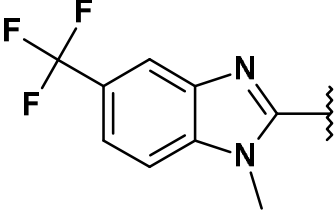
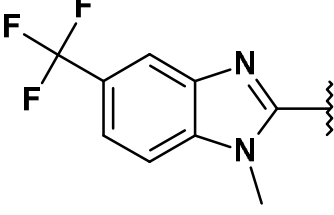
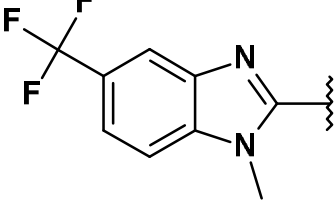
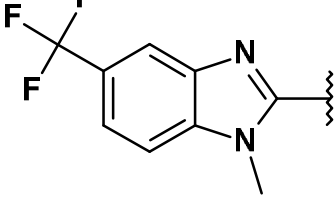
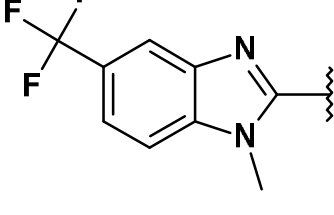
(continuación)

Ej.	R ¹	n	R ²	Q
I-20	C ₂ H ₅	0	5-CF ₃	
I-21	C ₂ H ₅	2	5-CF ₃	
I-22	C ₂ H ₅	1	5-CF ₃	
I-24	C ₂ H ₅	2	8-CF ₃	
I-25	C ₂ H ₅	1	8-CF ₃	
I-26	C ₂ H ₅	0	5-CH ₃	

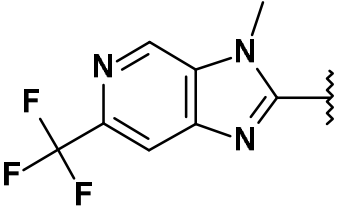
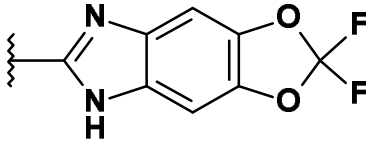
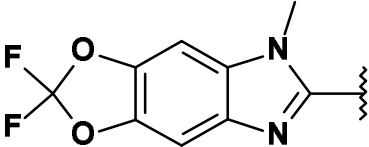
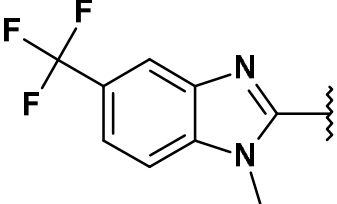
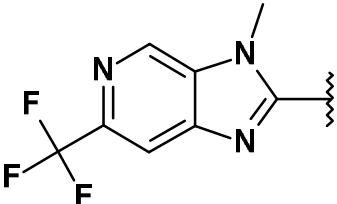
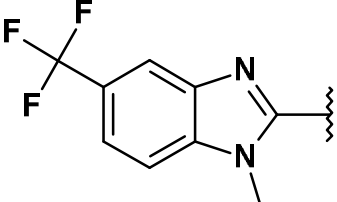
(continuación)

Ej.	R ¹	n	R ²	Q
I-27	C ₂ H ₅	0	5-CF ₃	
I-28	C ₂ H ₅	0	6-CF ₃	
I-29	C ₂ H ₅	0	6-Cl	
I-30	C ₂ H ₅	0	7-CF ₃	
I-31	C ₂ H ₅	0	5-SC ₂ H ₅	
I-32	C ₂ H ₅	0	7-SC ₂ H ₅	

(continuación)

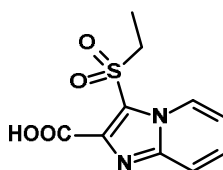
Ej.	R ¹	n	R ²	Q
I-33	C ₂ H ₅	2	7-CH ₃	
I-34	C ₂ H ₅	2	7-CF ₃	
I-35	C ₂ H ₅	2	6-CH ₃	
I-36	C ₂ H ₅	2	6-CF ₃	
I-37	C ₂ H ₅	0	7-CH ₃	
I-38	C ₂ H ₅	0	6-CH ₃	

(continuación)

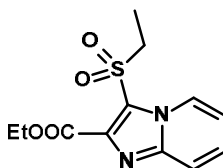
Ej.	R ¹	n	R ²	Q
I-39	C ₂ H ₅	2	8-SO ₂ C ₂ H ₅	
I-40	C ₂ H ₅	2	H	
I-41	C ₂ H ₅	2	H	
I-42	C ₂ H ₅	2	6-Cl	
I-45	C ₂ H ₅	0	6-CH ₃	
I-46	C ₂ H ₅	2	5-CH ₃	

(continuación)

Ej.	R ¹	n	R ²	Q
I-48	C ₂ H ₅	2	6-CH ₃	
I-54	C ₂ H ₅	2	6-OCH ₃	
I-55	C ₂ H ₅	1	6-OCH ₃	

Ejemplos de preparación para los compuestos intermedios:**3-(etilsulfonil)imidazo[1,2-a]piridina-2-ácido carboxílico (XXIII-1)**

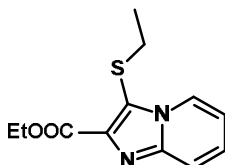
- 5 A una solución de 161 mg (0,57 mmol) de etilo-3-(etilsulfonil)imidazo[1,2-a]piridina-2-carboxilato en 5 ml etanol se agregaron 34,1 mg (1,42 mmol) de hidróxido de litio y se agita la mezcla durante 3 h a temperatura ambiente. Se recogió el precipitado resultante.
(logP (ácido): 0,54; MH⁺: 255; ¹H-RMN(400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 1,22 (t, 3H), 3,65 (q, 2H), 7,32 (t, 1H), 7,68 (t, 1H), 7,87 (d, 1H), 8,99 (d, 1H).

10 etilo-3-(etilsulfonil)imidazo[1,2-a]piridina-2-carboxilato (XXIV-1)

Se diluyeron 210 mg (0,83 mmol) de etilo-3-(etilsulfonil)imidazo[1,2-a]piridina-2-carboxilato en 10 ml de diclorometano, a 0 °C se agregaron 434 mg (2,51 mmol) de 3-clorobenceno carboperoxiácido (MCPBA) y luego se agitó durante 2 h a temperatura ambiente. La mezcla se diluyó en agua y se mezcló con una solución de bisulfito sódico, se agitó durante

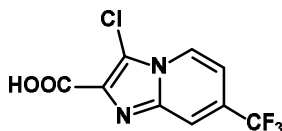
10 min y luego se agitó con una solución de bicarbonato sódico al 10 %. Se separó la fase orgánica, la fase acuosa se extrajo dos veces con diclorometano y las fases orgánicas combinadas luego se separaron al vacío del disolvente. (logP (neutral): 1,52; MH⁺: 283; ¹H-RMN(400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 1,24 (t, 3H), 1,34 (t, 3H), 3,65 (q, 2H), 4,37 (q, 2H), 7,34 (t, 1H), 7,68-7,72 (m, 1H), 7,89 (d, 1H), 8,98 (d, 1H).

5 **etilo-3-(etilsulfanil)imidazo[1,2-a]piridina-2-carboxilato (XXII-1)**



500 mg (2,22 mmol) de etilo-3-cloroimidazo[1,2-a]piridina-2-carboxilato se disolvieron en 10 ml de N,N-dimetilformamida, a temperatura ambiente se agregaron 562 mg (6,67 mmol) de tioetanolato de sodio y luego se agitó durante 2,5 h a temperatura ambiente. La mezcla se diluyó en agua y se extrajo tres veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se secaron en sulfato sódico y a continuación se separaron al vacío del disolvente. El producto se purificó mediante MPLC con un gradiente de agua / acetonitrilo como eluyente. (logP (neutral): 2,05; MH⁺: 251; ¹H-RMN(400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 1,06 (t, 3H), 1,35 (t, 3H), 2,88 (q, 2H), 4,34 (q, 2H), 7,15-7,19 (t, 1H), 7,47-7,51 (m, 1H), 7,71 (d, 1H), 8,67 (d, 1H).

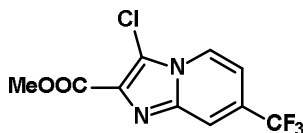
3-cloro-7-(trifluorometil)imidazo[1,2-a]piridina-2-ácido carboxílico (III-1)



A una solución de 1,22 g (4,27 mmol) de etilo-3-cloro-7-(trifluorometil)imidazo[1,2-a]piridina-2-carboxilato en 20 ml de metanol se agregaron 256 mg (10,6 mmol) de hidróxido de litio y se agitó la mezcla durante la noche a temperatura ambiente. Se separó el disolvente, se disolvió el residuo en agua y se extrajo la fase acuosa una vez con diclorometano. Luego se acidificó la fase acuosa con una solución HCl y se recogió el precipitado resultante.

(logP (ácido): 1,50; MH⁺: 265; ¹H-RMN(400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 7,38-7,42 (m, 1H), 8,26 (s, 1H), 8,62 (d, 1H).

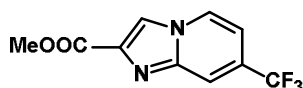
etilo-3-cloro-7-(trifluorometil)imidazo[1,2-a]piridina-2-carboxilato



A una solución de 136 mg (0,55 mmol) de etilo-7-(trifluorometil)imidazo[1,2-a]piridina-2-carboxilato en 0,6 ml de N,N-dimetilformamida se agregaron 81,8 mg (0,61 mmol) de N-clorosuccinimida (NCS) y se agitó la mezcla durante 4 h a 40 °C. La reacción se inactivó con una solución de bisulfito sódico y se extrajo la fase acuosa tres veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se secaron en sulfato sódico y a continuación se separó al vacío el disolvente.

(logP (neutral): 2,10; MH⁺: 279; ¹H-RMN(400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 3,91 (s, 3H), 7,41-7,43 (m, 1H), 8,28 (s, 1H), 8,64 (d, 1H).

etilo-7-(trifluorometil)imidazo[1,2-a]piridina-2-carboxilato



A una solución de 5,0 g (30,8 mmol) de 4-(trifluorometil)piridina-2-amina en 70 ml de acetonitrilo se agregaron 13,8 g (73,9 mmol) de metilo-3-brom-2-oxopropanoato y se agitó la mezcla durante 3 h a 50 °C. Se recogió el precipitado resultante.

(logP (neutral): 1,59; MH⁺: 245; ¹H-RMN(400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 3,88 (s, 3H), 7,28-7,31 (m, 1H), 8,16 (s, 1H), 8,74 (s, 1H), 8,79 (d, 1H).

La medición de los valores logP se determinó de acuerdo a la directiva EEC 79/831 anexo V.A8 mediante HPLC (High

Performance Liquid Chromatography; cromatografía líquida de alto rendimiento) usando una columna de fase inversa (C 18). Temperatura: 55°C.

5 La determinación LC-MS en el intervalo ácido se llevó a cabo a pH 2,7 con el 0,1 % de ácido fórmico acuoso y acetonitrilo (contiene el 0,1 % de ácido fórmico) como eluyente; gradiente lineal del 10 % de acetonitrilo al 95 % de acetonitrilo. Mencionado en la tabla logP (HCOOH).

La determinación LC-MS en el intervalo neutro se llevó a cabo a pH 7,8 con 0,001 molar de solución de hidrogenocarbonato amonio acuoso y acetonitrilo como eluyente; gradiente lineal del 10 % de acetonitrilo al 95 % de acetonitrilo. Mencionado en la tabla logP (neutral).

10 La calibración se llevó a cabo utilizando alcan-2-onas no ramificadas (con 3 a 16 átomos de carbono) con valores logP conocidos (los valores logP determinados en función de los tiempos de retención mediante interpolación lineal entre dos alcanonas sucesivas).

Los datos de RMN de los ejemplos seleccionados se establecen en la forma clásica valores δ , división de multipletes, cantidad de átomos de hidrógeno) o figuran como listas de pico de RMN.

El disolvente en el cual se midieron los espectros de RMN, se indica en cada caso.

15 Procedimientos de lista de picos RMN

Los datos ^1H -RMN de los ejemplos seleccionados se enumeran en forma de listas de picos ^1H -RMN. Para cada pico de señal se indica el valor δ en ppm en primer lugar y después la intensidad de la señal en paréntesis. Los pares de números de intensidad de señal de valor δ para los diferentes picos de señales se muestran separados entre sí por punto y coma.

20 Por lo tanto, la lista de picos de un ejemplo tiene la forma de:

$$\delta_1 (\text{intensidad}_1); \delta_2 (\text{intensidad}_2); \dots; \delta_i (\text{intensidad}_i); \dots; \delta_n (\text{intensidad}_n)$$

25 La intensidad de las señales agudas se correlaciona con la altura de las señales en un ejemplo impreso de un espectro RMN en cm y muestra las relaciones reales de las intensidades de señal. En el caso de las señales amplias, se pueden mostrar varios picos o el medio de la señal y la intensidad relativa de ella en comparación con la señal más intensa del espectro.

La calibración del cambio químico para espectros ^1H -RMN se logra utilizando tetrametilsilano y/o el cambio químico del solvente, en particular en el caso de espectros medidos en DMSO. Entonces, el pico de tetrametilsilano puede ocurrir pero no necesariamente en listas de pico RMN.

30 Las listas de los picos ^1H -RMN son similares a los listados ^1H -RMN convencionales y por lo general contienen todos los picos que se enumeran en una interpretación RMN convencional.

Además, tal como los listados convencionales de ^1H -RMN estos pueden mostrar señales de solventes, señales de estereoisómeros de los compuestos diana que también forman parte de la materia de la invención, y/o picos de impurezas.

35 En los informes de señales de los compuestos dentro del intervalo delta de solventes y/o agua, nuestras listas de picos ^1H -RMN muestran los picos de solventes estándar, por ejemplo picos de DMSO en DMSO- D_6 y el pico de agua, que generalmente tiene una intensidad mayor en promedio.

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

40 Dichos estereoisómeros y/o impurezas pueden ser típicos de un proceso de preparación particular. Sus picos pueden por lo tanto ayudar en este caso a identificar la reproducción de nuestro proceso de preparación con referencia a las "huellas de subproductos".

45 Un experto, que calcula los picos de los compuestos diana mediante procedimientos conocidos (MestreC, simulación ACD, pero también con valores esperados evaluados empíricamente) puede, si es necesario, aislar los picos de los compuestos diana usando opcionalmente filtros de intensidad adicionales. El aislamiento sería similar a la recolección de pico en cuestión en la interpretación convencional de ^1H -RMN.

Más información sobre las listas de picos ^1H -RMN puede encontrarse en la Research Disclosure Database (base de datos de investigación de descripción) número 564025.

LOGP_NEUTRAL	LOGP_HCOOH	RMN
--------------	------------	-----

ES 2 779 532 T3

2,05	2,08	Ejemplo I-1: ¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): □= 9,276(3,9);9,220(0,4);9,083(1,9);9,065(2,0);8,311(0,4);8,292(4,1);8,265(0,4);8,008(1,7);7,985(2,1);7,787(1,0);7,785(1,1);7,770(1,2);7,767(1,3);7,747(0,9);7,745(0,9);7,425(1,0);7,423(1,0);7,408(1,9);7,405(1,9);7,391(0,9);7,388(0,9);4,421(1,8);4,081(16,0);3,902(1,1);3,884(3,5);3,865(3,5);3,847(1,1);3,309(74,3);2,674(0,7);2,670(1,0);2,666(0,8);2,523(3,0);2,505(115,6);2,501(152,9);2,497(116,3);2,332(0,7);2,328(1,0);2,323(0,7);1,299(3,7);1,280(8,1);1,262(3,6);1,234(0,4);0,008(0,5);0,000(15,0);-0,063(0,4)
2,75	2,84	Ejemplo I-2: ¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): □= 9,224(4,1);8,823(0,3);8,802(1,8);8,785(1,8);8,314(0,4);8,261(4,0);7,953(0,7);7,841(1,7);7,818(2,0);7,577(1,0);7,574(1,1);7,560(1,2);7,557(1,2);7,552(1,0);7,538(1,0);7,535(0,9);7,262(0,3);7,255(1,0);7,239(1,8);7,237(1,8);7,220(0,9);6,838(0,3);4,507(1,1);4,422(2,0);4,288(16,0);4,019(0,6);3,386(0,8);3,318(63,2);3,070(1,3);3,052(4,1);3,033(4,1);3,015(1,4);2,892(5,3);2,875(0,4);2,863(0,4);2,812(0,4);2,799(0,4);2,732(4,6);2,676(0,7);2,671(1,0);2,667(0,7);2,524(2,6);2,507(110,0);2,502(145,5);2,498(110,6);2,333(0,7);2,329(0,9);2,325(0,8);1,234(0,9);1,221(0,4);1,202(0,6);1,183(0,3);1,093(4,3);1,075(8,9);1,056(4,2);0,146(1,0);0,008(8,2);0,000(197,0);-0,008(11,7);-0,150(1,0)
2,83	2,93	Ejemplo I-7: ¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): □= 9,405(2,9);9,402(2,9);9,260(4,2);8,313(3,0);8,247(4,6);8,014(2,4);7,990(2,8);7,719(1,9);7,714(1,8);7,695(1,5);7,690(1,6);5,753(2,2);4,443(16,0);4,406(0,6);4,085(0,4);3,777(0,4);3,757(1,1);3,738(1,0);3,723(1,3);3,705(1,1);3,686(0,4);3,579(0,5);3,561(1,2);3,542(1,3);3,527(1,0);3,508(1,0);3,490(0,5);3,402(0,3);3,370(0,5);3,315(482,6);2,670(8,1);2,644(0,5);2,505(967,2);2,501(1216,0);2,422(0,8);2,413(0,8);2,401(0,8);2,395(0,8);2,363(0,5);2,328(7,7);1,412(3,9);1,393(8,1);1,375(3,6);1,306(0,3);1,260(0,3);1,245(0,3);1,233(0,6);0,000(10,5)
	3,25	Ejemplo I-8: ¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): □= 9,782(1,9);9,275(3,5);9,246(1,6);8,959(0,9);8,313(0,5);8,284(1,7);8,259(3,6);8,257(3,7);8,152(1,4);8,129(1,7);8,056(0,6);8,032(0,8);7,884(1,4);7,879(1,4);7,860(1,2);7,855(1,2);7,780(0,7);7,776(0,7);7,756(0,6);7,752(0,6);4,466(16,0);4,417(7,8);3,788(0,8);3,770(0,9);3,755(1,2);3,737(1,1);3,603(1,1);3,585(1,2);3,570(0,9);3,551(0,8);3,315(98,3);2,675(0,7);2,671(1,0);2,666(0,7);2,661(0,3);2,524(2,3);2,519(3,6);2,511(54,7);2,506(114,1);2,502(153,7);2,497(112,7);2,492(55,0);2,337(0,3);2,333(0,7);2,328(1,0);2,324(0,7);2,073(0,7);1,428(3,6);1,410(8,1);1,391(3,5);0,146(1,1);0,008(8,5);0,000(245,0);-0,009(9,1);-0,150(1,1)
3,41	3,25	Ejemplo I-9: ¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): □= 8,786(1,7);8,768(1,8);8,108(2,6);7,902(1,7);7,880(2,0);7,819(1,7);7,797(2,0);7,675(1,5);7,672(1,4);7,653(1,2);7,651(1,2);7,554(0,9);7,552(1,0);7,537(1,1);7,534(1,2);7,529(0,8);7,515(0,9);7,512(0,9);7,236(1,0);7,234(1,0);7,219(1,7);7,217(1,8);7,202(0,9);7,200(0,8);4,149(16,0);3,318(51,5);3,068(1,2);3,050(4,0);3,031(4,0);3,013(1,3);2,676(0,3);2,671(0,5);2,667(0,4);2,507(60,2);2,502(78,8);2,498(57,5);2,333(0,4);2,329(0,5);2,324(0,3);1,398(1,4);1,092(4,3);1,073(8,9);1,055(4,1);0,000(3,9)
2,64	2,70	Ejemplo I-10: ¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): □= 9,095(1,8);9,077(1,9);8,313(0,5);8,125(2,7);7,991(1,7);7,968(2,0);7,945(1,7);7,924(2,0);7,767(1,0);7,747(1,3);7,724(2,2);7,699(1,3);7,403(1,0);7,386(1,7);7,384(1,7);7,369(0,9);3,974(16,0);3,944(1,0);3,926(3,3);3,907(3,4);3,889(1,0);3,317(130,6);2,675(1,0);2,671(1,4);2,666(1,0);2,524(3,6);2,506(179,5);2,501(236,7);2,497(173,9);2,333(1,0);2,328(1,4);2,324(1,1);1,301(3,5);1,283(7,8);1,264(3,4);0,146(0,6);0,008(5,0);0,000(138,8);-0,008(5,3);-0,149(0,7)

(continuación)

LOGP_NEUTRAL	LOGP_HCOOH	RMN
2,85	2,92	Ejemplo I-11: ¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): □ = 9,291(1,7);9,274(1,8);8,314(0,4);8,094(2,6);7,930(3,2);7,907(3,4);7,688(1,4);7,685(1,4);7,663(1,2);7,633(0,9);7,630(1,0);7,616(1,1);7,613(1,2);7,607(0,9);7,593(0,9);7,590(0,9);7,243(0,9);7,241(1,0);7,226(1,7);7,224(1,8);7,209(0,9);7,206(0,9);4,329(16,0);3,714(0,8);3,696(1,0);3,681(1,2);3,662(1,2);3,644(0,4);3,559(0,4);3,540(1,1);3,522(1,3);3,507(0,9);3,489(0,8);3,317(96,6);2,675(0,9);2,671(1,2);2,666(0,9);2,524(2,9);2,510(73,1);2,506(152,3);2,501(204,3);2,497(149,3);2,493(73,0);2,333(0,8);2,328(1,2);2,324(0,9);1,388(3,8);1,369(8,3);1,351(3,7);0,146(0,4);0,008(2,9);0,000(88,7);-0,008(3,4);-0,150(0,4)
3,71	1,40	Ejemplo I-13: ¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): □ = 9,231(4,1);9,061(1,8);9,044(1,9);8,288(4,5);8,047(1,7);8,030(1,8);7,381(1,1);7,363(2,1);7,346(1,1);4,287(1,6,0);3,331(187,0);3,325(341,4);3,102(1,3);3,083(4,0);3,065(4,1);3,047(1,4);2,671(1,2);2,506(159,0);2,502(194,2);2,498(142,7);2,329(1,2);1,398(1,2);1,235(0,6);1,111(4,2);1,093(8,7);1,074(4,1);0,000(4,6);-0,086(0,5)
3,34	3,33	Ejemplo I-14: ¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): □ = 9,255(0,4);9,233(3,3);8,796(1,7);8,794(1,8);8,779(1,9);8,777(1,9);8,313(0,7);8,276(3,5);7,779(1,7);7,777(1,9);7,760(1,9);7,758(1,9);7,245(1,5);7,227(2,4);7,209(1,5);4,318(2,1);4,302(16,0);3,374(0,5);3,321(208,6);3,083(1,2);3,065(3,8);3,047(3,9);3,028(1,2);2,679(0,7);2,675(1,4);2,671(2,0);2,666(1,5);2,524(5,2);2,510(119,9);2,506(252,7);2,502(340,5);2,497(244,4);2,492(115,6);2,333(1,4);2,328(1,9);2,324(1,4);2,319(0,7);1,236(0,5);1,097(4,3);1,079(8,9);1,060(4,1);0,146(0,9);0,008(7,1);0,000(211,9);-0,009(7,6);-0,150(0,9)
3,93	3,99	Ejemplo I-15: ¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): □ = 9,233(0,5);9,215(3,1);8,592(1,7);8,577(1,7);8,575(1,7);8,314(0,5);8,275(0,5);8,260(3,3);7,395(1,5);7,379(1,7);7,227(0,3);7,207(1,5);7,190(2,2);7,172(1,2);4,302(16,0);3,316(96,3);3,244(1,0);3,226(3,2);3,208(3,3);3,189(1,0);3,070(1,1);3,066(0,8);3,052(3,6);3,033(3,7);3,015(1,1);2,675(0,9);2,671(1,2);2,666(0,9);2,524(2,6);2,519(4,1);2,510(71,3);2,506(153,0);2,501(207,6);2,497(150,8);2,493(72,9);2,333(0,9);2,328(1,2);2,324(0,9);1,375(3,5);1,356(7,7);1,338(3,4);1,098(0,7);1,091(3,9);1,079(1,5);1,072(8,4);1,061(0,8);1,054(3,8);0,146(1,1);0,008(8,4);0,000(270,2);-0,009(10,6);-0,150(1,2)
3,25	3,29	Ejemplo I-18: ¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): □ = 9,507(1,6);9,489(1,5);9,273(3,6);8,475(2,1);8,312(0,4);8,266(3,7);7,527(1,4);7,522(1,4);7,508(1,3);7,503(1,3);4,457(16,0);3,743(0,9);3,724(0,9);3,709(1,2);3,691(1,2);3,672(0,4);3,577(1,2);3,559(1,3);3,544(0,9);3,525(0,8);3,508(0,3);3,399(0,3);3,329(149,5);3,323(124,3);2,675(0,9);2,671(1,2);2,524(3,0);2,511(70,7);2,507(147,2);2,502(197,0);2,498(141,0);2,493(66,8);2,333(0,8);2,329(1,1);2,324(0,8);1,411(3,6);1,392(8,0);1,374(3,6);0,146(0,4);0,008(2,3);0,000(70,4);-0,009(2,4)
2,50	2,56	Ejemplo I-19: ¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): □ = 9,279(4,0);9,045(2,1);9,044(2,1);9,028(2,3);9,026(2,1);8,307(4,3);7,990(2,2);7,971(2,4);7,403(1,6);7,385(2,6);7,367(1,6);5,753(1,1);4,084(16,0);3,894(1,0);3,875(3,4);3,857(3,5);3,839(1,1);3,317(87,8);2,675(0,6);2,671(0,8);2,666(0,6);2,506(103,4);2,502(134,9);2,497(98,8);2,329(0,8);1,299(3,6);1,281(8,0);1,263(3,6);1,234(0,5);0,146(0,7);0,008(6,5);0,000(153,0);-0,008(6,9);-0,150(0,7)
	3,50	Ejemplo I-20: ¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): □ = 9,256(3,5);8,313(0,5);8,300(3,8);8,176(1,5);8,154(1,6);7,898(1,4);7,881(1,6);7,669(1,0);7,648(1,2);7,629(0,9);4,139(16,0);3,373(0,5);3,362(0,5);3,352(0,7);3,342(1,3);3,320(261,2);3,293(0,6);2,963(0,9);2,945(2,9);2,926(3,0);2,907(1,0);2,675(1,0);2,671(1,4);2,666(1,0);2,524(3,1);2,511(80,7);2,506(170,3);2,502(229,0);2,497(165,4);2,493(79,0);2,337(0,5);2,333(1,0);2,328(1,3);2,324(0,9);1,045(0,4);1,030(0,4);1,008(3,6);0,989(7,7);0,971(3,5);0,146(0,6);0,023(0,4);0,008(4,7);0,000(141,9);-0,008(4,4);-0,019(0,6);-0,150(0,6)

(continuación)

LOGP_NEUTRAL	LOGP_HCOOH	RMN
2,66	2,69	Ejemplo I-21: ¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): □ = 9,292(4,3);8,335(1,9);8,308(5,3);8,095(1,8);8,076(2,2);7,932(1,3);7,910(1,6);7,890(1,0);4,080(16,0);3,879(0,8);3,861(2,6);3,842(2,6);3,823(0,9);3,335(217,4);3,329(279,2);2,671(1,3);2,506(172,3);2,502(227,1);2,498(172,5);2,329(1,3);2,073(0,4);1,315(3,4);1,297(7,4);1,278(3,4);0,008(0,8);0,000(25,0)
2,30	2,30	Ejemplo I-22: ¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): □ = 9,251(3,6);8,311(4,2);8,265(1,5);8,242(1,6);7,972(1,4);7,955(1,7);7,771(1,1);7,750(1,2);7,731(0,9);4,156(0,6);4,137(0,7);4,123(0,8);4,104(0,6);3,861(16,0);3,773(0,4);3,371(0,6);3,354(0,8);3,317(236,7);3,284(0,4);2,675(1,1);2,671(1,6);2,666(1,2);2,524(3,8);2,510(9,2,6);2,506(189,6);2,501(251,2);2,497(183,2);2,492(90,7);2,337(0,5);2,333(1,1);2,328(1,5);2,324(1,1);2,319(0,5);1,287(2,8);1,268(6,2);1,249(2,8);0,008(2,1);0,000(63,0);-0,008(2,7)
2,90	2,92	Ejemplo I-24: ¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): □ = 9,290(2,1);9,276(6,1);8,314(5,0);8,250(1,9);8,231(2,0);7,544(1,2);7,525(2,2);7,507(1,1);4,083(16,0);3,941(1,1);3,923(3,6);3,904(3,7);3,886(1,2);3,323(397,4);2,671(1,6);2,505(229,6);2,502(274,8);2,328(1,5);1,325(3,8);1,306(8,1);1,288(3,7);0,000(19,3)
3,21	3,29	Ejemplo I-25: ¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): □ = 9,539(1,9);9,522(2,0);9,254(4,3);8,265(4,6);8,122(1,8);8,104(1,9);7,399(1,1);7,381(2,2);7,363(1,1);4,448(16,0);3,736(0,8);3,718(1,0);3,703(1,3);3,684(1,2);3,666(0,4);3,591(0,4);3,573(1,2);3,554(1,3);3,539(1,0);3,521(0,8);3,324(241,3);2,676(0,6);2,671(0,7);2,507(101,0);2,502(127,1);2,498(96,3);2,329(0,7);1,412(3,9);1,393(8,3);1,374(3,8);0,000(10,6)
	3,35	Ejemplo I-26: ¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): □ = 8,111(4,3);7,908(2,1);7,887(2,5);7,803(0,4);7,685(2,7);7,672(2,5);7,665(2,5);7,650(2,5);7,433(1,5);7,415(2,0);7,394(1,4);7,225(0,4);6,941(2,3);6,924(2,1);4,155(2,1);3,999(16,0);3,908(2,0);3,336(185,7);3,172(14,9);3,055(0,7);3,037(0,7);2,993(1,6);2,975(4,9);2,957(5,0);2,938(1,6);2,678(0,8);2,509(146,0);2,505(111,6);2,335(0,8);1,097(0,8);1,079(1,6);1,062(6,1);1,044(11,6);1,025(5,4)
	4,09	Ejemplo I-27: ¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): □ = 8,165(1,9);8,143(5,2);7,935(1,8);7,914(2,2);7,884(1,9);7,866(2,2);7,711(1,8);7,690(1,5);7,655(1,3);7,635(1,5);7,615(1,0);4,107(0,4);4,094(0,4);4,013(16,0);3,908(2,6);3,337(150,3);3,182(2,5);3,169(2,4);2,974(1,1);2,956(3,4);2,937(3,4);2,919(1,1);2,682(0,5);2,678(0,6);2,513(85,0);2,509(111,8);2,505(86,7);2,336(0,6);1,015(4,0);0,997(8,3);0,978(3,9)
	4,47	Ejemplo I-28: ¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): □ = 9,082(2,7);8,140(3,5);8,046(1,9);8,022(2,3);7,932(1,8);7,911(2,1);7,795(1,8);7,791(1,8);7,772(1,5);7,768(1,5);7,703(2,0);7,681(1,6);7,679(1,6);4,167(16,0);3,909(1,6);3,337(159,2);3,137(1,4);3,119(4,5);3,101(4,6);3,082(1,5);2,679(0,6);2,514(80,2);2,510(107,6);2,505(84,3);2,336(0,6);1,114(4,8);1,096(10,0);1,077(4,7)
	4,12	Ejemplo I-29: ¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): □ = 8,979(1,9);8,961(2,0);8,873(1,0);8,349(3,0);8,140(3,4);8,120(1,2);7,930(1,8);7,909(2,4);7,893(0,8);7,884(0,9);7,860(0,9);7,702(2,0);7,682(2,1);7,665(0,6);7,605(0,6);7,602(0,6);7,581(0,5);7,467(1,8);7,449(1,7);4,166(16,0);4,150(5,0);3,908(1,9);3,338(175,6);3,129(1,4);3,111(4,4);3,092(4,5);3,079(1,9);3,075(1,7);3,061(1,5);3,042(0,5);2,678(0,7);2,513(89,3);2,509(114,2);2,505(88,1);2,336(0,6);1,111(5,9);1,093(12,1);1,074(5,7)

(continuación)

LOGP_NEUTRAL	LOGP_HCOOH	RMN
	4,50	Ejemplo I-30: ^1H -RMN(400,0 MHz, d_6 -DMSO): $\square = 8,980(1,9); 8,962(2,0); 8,873(1,7); 8,350(3,0); 8,140(3,4); 8,120(2,0); 7,930(1,9); 7,910(2,6); 7,892(1,3); 7,885(1,5); 7,861(1,5); 7,702(2,0); 7,683(2,5); 7,665(1,0); 7,607(1,0); 7,602(1,0); 7,583(0,9); 7,579(0,8); 7,469(1,7); 7,465(1,7); 7,451(1,7); 7,447(1,7); 4,166(16,0); 4,150(8,2); 3,908(2,9); 3,338(300,3); 3,130(1,4); 3,111(4,2); 3,093(4,5); 3,079(2,7); 3,075(2,0); 3,061(2,4); 3,043(0,8); 2,678(1,0); 2,513(134,3); 2,509(176,3); 2,505(139,6); 2,336(1,0); 1,111(6,2); 1,093(12,4); 1,075(5,9)$
	3,95	Ejemplo I-31: ^1H -RMN(400,0 MHz, d_6 -DMSO): $\square = 8,116(4,9); 7,909(2,1); 7,888(2,5); 7,686(3,0); 7,665(2,5); 7,607(2,6); 7,585(3,5); 7,484(1,9); 7,465(2,7); 7,444(1,5); 7,310(1,3); 7,289(2,6); 7,267(2,6); 7,245(1,0); 7,067(3,4); 7,049(3,0); 4,150(0,4); 4,005(16,0); 3,908(4,6); 3,341(289,7); 3,228(1,7); 3,210(5,1); 3,191(5,2); 3,173(1,8); 3,005(1,7); 2,987(5,2); 2,968(5,3); 2,950(1,8); 2,678(0,9); 2,571(0,4); 2,509(159,2); 2,335(0,9); 1,657(3,1); 1,406(5,6); 1,387(11,5); 1,369(5,4); 1,264(0,4); 1,239(0,7); 1,065(6,2); 1,047(12,4); 1,028(5,8)$
	4,23	Ejemplo I-32: ^1H -RMN(400,0 MHz, d_6 -DMSO): $\square = 8,630(2,6); 8,612(2,7); 8,320(0,4); 8,105(5,6); 7,898(2,2); 7,877(2,5); 7,675(3,6); 7,653(2,9); 7,572(4,5); 7,089(3,3); 7,086(3,2); 7,071(3,2); 7,068(3,1); 4,151(15,5); 3,908(6,8); 3,516(0,4); 3,458(0,4); 3,337(473,1); 3,214(2,4); 3,196(7,3); 3,178(7,5); 3,159(2,4); 3,060(2,0); 3,041(6,2); 3,023(6,3); 3,005(2,2); 2,678(1,9); 2,513(252,5); 2,509(333,0); 2,505(259,0); 2,336(1,8); 1,367(7,8); 1,349(16,0); 1,331(7,5); 1,305(0,3); 1,256(0,5); 1,239(0,5); 1,097(7,6); 1,079(15,4); 1,060(7,3); 0,006(0,6)$
	3,01	Ejemplo I-33: ^1H -RMN(400,0 MHz, d_6 -DMSO): $\square = 8,970(2,1); 8,952(2,1); 8,123(2,8); 7,943(1,7); 7,922(2,1); 7,776(2,6); 7,724(1,6); 7,721(1,6); 7,703(1,3); 7,700(1,3); 7,258(1,5); 7,254(1,5); 7,240(1,5); 7,236(1,5); 3,969(16,0); 3,922(1,0); 3,909(2,9); 3,903(3,2); 3,885(3,2); 3,867(1,0); 3,337(104,5); 2,683(0,4); 2,678(0,5); 2,514(58,2); 2,509(78,4); 2,505(61,2); 2,500(37,7); 2,336(0,5); 1,291(3,4); 1,273(7,6); 1,254(3,3)$
	3,72	Ejemplo I-34: ^1H -RMN(400,0 MHz, d_6 -DMSO): $\square = 9,272(1,8); 9,253(1,9); 8,550(2,6); 8,157(3,0); 7,964(1,7); 7,943(2,1); 7,748(1,7); 7,727(1,4); 7,665(1,5); 7,647(1,5); 4,018(1,1); 3,998(16,0); 3,982(3,2); 3,964(1,0); 3,908(1,6); 3,336(143,8); 2,678(0,6); 2,509(106,9); 2,335(0,6); 1,332(3,2); 1,314(6,8); 1,296(3,1)$
	2,98	Ejemplo I-35: ^1H -RMN(400,0 MHz, d_6 -DMSO): $\square = 8,867(2,8); 8,121(3,1); 7,941(1,8); 7,919(2,3); 7,910(2,2); 7,887(2,4); 7,721(1,7); 7,700(1,4); 7,639(1,7); 7,636(1,8); 7,616(1,5); 7,613(1,5); 3,954(16,0); 3,918(1,0); 3,908(2,1); 3,900(3,4); 3,881(3,3); 3,863(1,0); 3,336(88,8); 2,678(0,4); 2,513(51,9); 2,509(68,8); 2,505(55,0); 2,454(10,4); 2,336(0,4); 1,305(3,5); 1,287(7,7); 1,268(3,4)$
	3,70	Ejemplo I-36: ^1H -RMN(400,0 MHz, d_6 -DMSO): $\square = 9,422(3,3); 8,213(2,0); 8,189(2,5); 8,160(3,8); 8,031(2,2); 8,007(1,7); 7,967(2,1); 7,945(2,5); 7,749(2,1); 7,727(1,7); 4,088(1,2); 4,070(3,5); 4,051(3,6); 4,033(1,3); 4,005(16,0); 3,908(2,0); 3,335(209,2); 2,678(0,9); 2,509(145,5); 2,335(0,8); 1,352(3,8); 1,333(7,9); 1,315(3,7)$
	3,41	Ejemplo I-37: ^1H -RMN(400,0 MHz, d_6 -DMSO): $\square = 8,664(2,3); 8,647(2,3); 8,100(4,9); 7,896(1,9); 7,875(2,2); 7,670(3,2); 7,649(2,6); 7,587(4,0); 7,075(3,0); 7,058(2,9); 4,139(13,9); 3,908(1,9); 3,339(213,0); 3,183(0,4); 3,170(0,4); 3,047(1,7); 3,029(5,0); 3,010(5,0); 2,992(1,8); 2,679(0,8); 2,509(125,8); 2,457(16,0); 2,336(0,7); 1,084(5,8); 1,066(11,7); 1,047(5,7)$
	3,57	Ejemplo I-38: ^1H -RMN(400,0 MHz, d_6 -DMSO): $\square = 8,578(2,9); 8,102(4,1); 7,898(1,6); 7,877(1,9); 7,733(2,3); 7,710(2,6); 7,672(2,6); 7,651(2,1); 7,410(2,1); 7,387(1,8); 4,142(12,6); 3,908(2,4); 3,342(304,3); 3,061(1,6); 3,042(4,8); 3,024(4,9); 3,006(1,6); 2,679(0,8); 2,675(0,7); 2,514(108,0); 2,510(145,7); 2,505(113,6); 2,436(16,0); 2,336(0,8); 1,095(5,9); 1,077(12,2); 1,058(5,8)$

(continuación)

LOGP_NEUTRAL	LOGP_HCOOH	RMN
2,29	2,30	Ejemplo I-39: ¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): □ = 9,343(2,2);9,325(2,2);9,290(4,5);9,279(0,6);8,322(4,7);8,306(2,8);8,287(2,3);7,605(1,7);7,587(3,1);7,569(1,6);4,105(16,0);4,083(1,9);3,982(1,0);3,963(3,5);3,945(3,6);3,926(1,1);3,875(0,4);3,857(0,4);3,792(1,0);3,774(3,4);3,755(3,5);3,737(1,1);3,319(170,9);2,675(0,6);2,671(0,8);2,667(0,6);2,506(102,2);2,502(137,0);2,497(105,1);2,333(0,6);2,329(0,8);2,324(0,6);2,073(1,5);1,353(3,7);1,335(8,1);1,316(3,6);1,299(0,5);1,281(0,9);1,262(0,4);1,211(3,7);1,193(8,0);1,174(3,6);0,146(0,6);0,000(115,2);-0,008(5,8);-0,150(0,6)
2,59	2,51	Ejemplo I-40: ¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): □ = 19,785(0,6);18,114(0,6);13,547(5,4);10,632(1,0);9,399(0,5);9,227(4,7);9,209(5,2);9,138(0,6);8,314(1,9);7,915(4,3);7,892(5,2);7,865(0,6);7,840(0,7);7,768(11,2);7,721(2,8);7,704(3,8);7,684(2,7);7,526(11,2);7,353(0,7);7,343(2,9);7,325(4,8);7,308(2,6);4,201(2,3);4,183(7,0);4,165(7,1);4,147(2,3);3,821(0,6);3,818(0,6);3,801(0,9);3,781(0,8);3,503(0,5);3,456(0,6);3,414(0,7);3,398(0,9);3,317(812,1);3,024(0,6);2,897(0,5);2,754(0,6);2,741(0,9);2,726(0,8);2,670(8,9);2,620(1,3);2,504(1263,4);2,501(1446,2);2,328(8,0);1,294(7,8);1,275(16,0);1,257(8,4);1,235(3,1);1,192(1,1);1,175(1,8);1,155(1,1);0,856(0,7);0,146(5,2);0,117(0,6);0,003(638,7);0,000(1099,3);-0,009(118,6);-0,150(5,2);-3,158(0,5)
2,62	2,59	Ejemplo I-41: ¹ H-RMN(601,6 MHz, CD ₃ CN): □ = 9,118(0,9);9,117(1,5);9,115(0,9);9,107(0,9);9,105(1,5);9,103(0,9);7,803(0,8);7,801(1,4);7,788(1,0);7,786(1,6);7,635(0,8);7,633(0,9);7,624(0,9);7,622(1,1);7,621(0,9);7,618(0,8);7,609(0,8);7,607(0,8);7,500(3,8);7,423(4,0);7,230(0,8);7,228(0,8);7,218(1,4);7,216(1,4);7,206(0,7);7,204(0,7);5,444(1,5);3,917(16,0);3,842(1,1);3,830(3,5);3,818(3,6);3,806(1,2);2,118(25,1);1,962(0,9);1,954(2,3);1,950(3,0);1,946(15,0);1,942(25,6);1,938(37,5);1,933(25,8);1,929(13,1);1,341(0,5);1,333(3,7);1,321(7,7);1,308(3,7);1,285(0,7);1,270(0,6);0,000(4,6)
	3,34	Ejemplo I-42: ¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): □ = 9,115(2,6);9,112(2,6);8,140(2,7);8,060(1,9);8,036(2,4);7,953(1,6);7,931(2,0);7,852(1,7);7,847(1,6);7,828(1,4);7,823(1,3);7,736(1,5);7,714(1,2);4,021(0,9);4,002(3,1);3,986(16,0);3,966(1,0);3,908(1,9);3,339(121,9);2,678(0,5);2,674(0,4);2,513(66,4);2,509(86,8);2,505(66,0);2,340(0,4);2,336(0,5);2,332(0,4);1,336(3,1);1,318(6,9);1,299(3,1)
3,22	3,20	Ejemplo I-45: ¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): □ = 9,212(3,8);8,587(2,3);8,314(0,5);8,249(4,1);7,750(1,9);7,727(2,1);7,430(1,5);7,426(1,5);7,407(1,3);7,403(1,4);6,837(0,4);4,276(16,0);3,316(184,0);3,058(1,3);3,040(3,9);3,022(4,0);3,003(1,3);2,811(0,5);2,798(0,5);2,675(1,2);2,671(1,6);2,666(1,2);2,524(3,4);2,510(94,0);2,506(199,6);2,501(280,0);2,497(209,5);2,434(9,2);2,366(0,9);2,333(1,3);2,328(1,7);2,324(1,3);1,458(0,3);1,138(0,3);1,128(0,3);1,091(4,2);1,072(8,9);1,054(4,1);0,146(0,9);0,008(6,1);0,000(194,1);-0,008(6,6);-0,150(0,9)
	2,73	Ejemplo I-46: ¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): □ = 8,092(3,0);7,924(1,8);7,902(2,2);7,861(1,5);7,839(2,0);7,733(1,5);7,715(1,9);7,707(2,0);7,693(1,4);7,685(1,4);7,273(1,7);7,256(1,6);3,909(2,2);3,836(16,0);3,824(3,7);3,805(3,4);3,787(1,1);3,335(97,7);3,051(11,2);2,678(0,7);2,674(0,5);2,513(82,6);2,509(109,3);2,505(84,8);2,336(0,6);1,347(3,7);1,329(8,1);1,310(3,6)
2,36	2,43	Ejemplo I-48: ¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): □ = 9,267(3,9);8,849(2,4);8,284(4,1);7,922(1,9);7,899(2,2);7,654(1,6);7,651(1,6);7,631(1,4);7,628(1,4);4,056(16,0);3,876(1,0);3,857(3,3);3,839(3,3);3,820(1,0);3,319(146,9);2,675(0,5);2,671(0,7);2,666(0,5);2,524(1,6);2,511(37,9);2,506(78,9);2,502(109,4);2,497(81,1);2,493(38,6);2,456(9,2);2,333(0,5);2,329(0,6);2,324(0,5);2,073(0,6);1,296(3,5);1,277(7,7);1,259(3,4);0,146(0,3);0,008(2,6);0,000(79,4);-0,008(2,6);-0,150(0,4)

(continuación)

LOGP_NEUTRAL	LOGP_HCOOH	RMN
2,37	2,41	Ejemplo I-54: ¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): □ = 9,265(3,8);8,582(2,4);8,576(2,4);8,314(0,5);8,283(4,1);7,948(2,3);7,923(2,6);7,587(1,9);7,581(1,9);7,563(1,6);7,557(1,7);4,425(0,4);4,069(16,0);3,917(16,0);3,903(3,4);3,885(3,2);3,866(1,3);3,315(56,6);2,675(0,9);2,670(1,3);2,666(1,0);2,524(3,5);2,510(71,9);2,506(152,7);2,501(215,5);2,497(165,6);2,492(83,1);2,333(0,9);2,328(1,2);2,324(1,0);1,988(0,3);1,308(3,3);1,290(7,7);1,271(3,3);0,008(2,2);0,000(65,1);-0,008(2,7)
2,48	2,54	Ejemplo I-55: ¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): □ = 9,575(0,4);9,235(4,7);9,145(0,6);8,869(2,7);8,863(2,7);8,607(0,6);8,314(1,4);8,222(5,0);8,183(0,7);7,888(2,7);7,863(3,0);7,454(1,7);7,448(1,7);7,429(1,6);7,423(1,6);4,425(16,0);4,070(0,8);4,018(2,3);3,917(1,2);3,901(0,9);3,867(15,8);3,848(0,4);3,804(0,8);3,736(0,5);3,718(1,0);3,699(1,0);3,685(1,5);3,666(1,3);3,648(0,6);3,565(0,5);3,547(1,3);3,528(1,6);3,513(0,9);3,495(1,0);3,487(0,5);3,476(0,6);3,380(0,5);3,317(383,6);2,890(0,4);2,743(0,4);2,671(5,4);2,655(0,7);2,650(0,6);2,630(1,1);2,574(1,0);2,556(1,3);2,505(702,5);2,501(918,0);2,498(711,7);2,409(0,4);2,347(0,6);2,328(5,4);1,395(3,9);1,376(8,1);1,358(3,8);1,236(0,9);1,179(0,6);1,161(0,6);0,147(1,2);0,000(216,8);-0,149(1,1)

Ejemplos de aplicación**Ctenocephalides felis – ensayo de contacto in-vitro con pulgas adultas de gatos**

- 5 Para recubrir el tubo de ensayo se disuelven primeramente 9 mg de principio activo en 1 ml de acetona p.a. y a continuación se diluye con acetona p.a. hasta la concentración deseada. 250 µl de la solución se distribuyen de forma homogénea en las paredes interiores y en la parte inferior de un tubo de vidrio de 25 ml mediante rotación e inclinación en un agitador rotatorio (2 h de oscilación en rotación a 30 rpm). Con 900 ppm de principio activo y 44,7 cm² de superficie interior y una distribución homogénea se logra una dosis de área de 5 µg/cm².

- 10 Después de que se haya evaporado el disolvente se infestan los tubitos con 5-10 pulgas adultas de gatos (*Ctenocephalides felis*), se cierran con una tapa de plástico perforada y se dejan incubar en posición horizontal a temperatura ambiente y humedad ambiental. Después de 48 h se determina la eficacia. Para ello se colocan los tubitos en posición vertical y se dejan caer las pulgas al fondo del tubito. Las pulgas que permanecen inmóviles en el suelo o si su movimiento es descoordinado, se consideran muertas o resentidas.

- 15 Una sustancia muestra buena eficacia contra *Ctenocephalides felis*, si en este ensayo, con una cantidad de concentración de 5 µg/cm², se logra al menos el 80 % de eficacia. A este respecto, el 100 % de eficacia representa que todas las pulgas se resintieron o murieron; el 0 % representa que ninguna pulga se resintió.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de producción muestran una eficacia del 100 % en una cantidad de aplicación de 5 µg/cm² (= 500 g/ha): I-1, I-18, I-33, I-34, I-35

Rhipicephalus sanguineus - ensayo de contacto in-vitro con garrapatas caninas marrones adultas

- 20 Para recubrir el tubo de ensayo se disuelven primeramente 9 mg de principio activo en 1 ml de acetona p.a. y a continuación se diluye con acetona p.a. hasta la concentración deseada. 250 µl de la solución se distribuyen de forma homogénea en las paredes interiores y en la parte inferior de un tubo de vidrio de 25 ml mediante rotación e inclinación en un agitador rotatorio (2 h de oscilación en rotación a 30 rpm). Con 900 ppm de principio activo y 44,7 cm² de superficie interior y una distribución homogénea se logra una dosis de área de 5 µg/cm².

- 25 Después de que se haya evaporado el disolvente los tubitos se infestan con 5-10 garrapatas caninas adultas (*Rhipicephalus sanguineus*), se cierran con una tapa de plástico perforada y se dejan incubar en posición horizontal a oscuras, a temperatura ambiente y humedad ambiental. Después de 48 h se determina la eficacia. Para ello se dejan caer las garrapatas al fondo del tubito y se incuban durante máximo 5 minutos sobre una placa calefactora a 45-50 °C. Las garrapatas que permanecen inmóviles en el suelo o su movimiento es tan descoordinado que no pueden trepar hacia arriba esquivando el calor, se consideran muertas o resentidas.

- 30 Una sustancia muestra buena eficacia contra *Rhipicephalus sanguineus*, si en este ensayo, con una cantidad de concentración de 5 µg/cm², se logra al menos el 80 % de eficacia. A este respecto, el 100 % de eficacia representa que todas las garrapatas se resintieron o murieron; el 0 % representa que ninguna garrapata se resintió.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de producción muestran una eficacia del 80 % en una cantidad de aplicación de 5 µg/cm² (= 500 g/ha): I-35

Boophilus microplus – Ensayo de inyección

Disolvente: dimetilsulfóxido

- 5 Para producir una preparación adecuada del compuesto activo se mezclan 10 mg de principio activo con 0,5 ml de disolvente y se diluye el concentrado con disolvente hasta la concentración deseada.

Se inyecta 1 µl de una preparación de principio activo en el abdomen de 5 garrapatas de bovino (*Boophilus microplus*) hembras, empapadas y adultas. Los animales se transfieren a los platos y se mantienen en una habitación climatizada.

- 10 Después de 7 días se controla la eficacia en busca de deposición de huevos fértiles. Los huevos, cuya fertilidad no es visible desde el exterior, se mantienen en una cámara climática hasta que salen de la larva aprox. después de 42 días. Una eficacia del 100 % representa que ninguna de las garrapatas ha puesto huevos fértiles, el 0 % representa que todos los huevos son fértiles.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de producción muestran una eficacia del 95 % en una cantidad de aplicación de 20 µg/animal: I-18

Ctenocephalides felis – Ensayo oral

Disolvente: dimetilsulfóxido

Para producir una preparación adecuada del compuesto activo se mezclan 10 mg de principio activo con 0,5 ml de dimetilsulfóxido. Diluyendo con sangre de ganado citradas se obtiene la concentración deseada.

- 20 Se colocan aprox. 20 pulgas de gato (*Ctenocephalides felis*) adultas sobrias en una cámara que está sellada arriba y abajo con gasa. Sobre la cámara se coloca un cilindro de metal, cuya parte inferior está cubierta con parafilm. El cilindro contiene la preparación de principio activo de sangre que puede ser absorbida por las pulgas a través de la membrana de parafilm.

Después de 2 días se determina la muerte en %. A este respecto, el 100 % representa que todas las pulgas habían muerto; el 0 % representa que ninguna de las pulgas había muerto.

- 25 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de producción muestran una eficacia del 100 % en una cantidad de aplicación de 100 ppm: I-18

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de producción muestran una eficacia del 98 % en una cantidad de aplicación de 100 ppm: I-1

Lucilia cuprina – Ensayo

- 30 Disolvente: dimetilsulfóxido

Para producir una preparación adecuada del compuesto activo se mezclan 10 mg de principio activo con 0,5 ml de dimetilsulfóxido y se diluye el concentrado con disolvente hasta la concentración deseada.

Aprox. 20 larvas-L1 de moscardones de oveja australiana (*Lucilia cuprina*) se transfieren a un tubo de ensayo que contiene carne de caballo picada y la preparación del producto activo en la concentración deseada.

- 35 Después de 2 días se determina la muerte en %. A este respecto el 100 % representa que todas las larvas habían muerto; el 0 % representa que ninguna de las larvas había muerto.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de producción muestran una eficacia del 100 % en una cantidad de aplicación de 100 ppm: I-1, I-10, I-18

Musca domestica – Ensayo

- 40 Disolvente: dimetilsulfóxido

Para producir una preparación adecuada del compuesto activo se mezclan 10 mg de principio activo con 0,5 ml de dimetilsulfóxido y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

Se infestan recipientes que contienen una esponja tratada con una solución azucarada y una preparación de principio activo en la concentración deseada, con 10 moscas domésticas adultas (*Musca domestica*).

- 45 Después de 2 días se determina la muerte en %. A este respecto, el 100 % representa que todas las moscas habían muerto; el 0 % representa que ninguna de las moscas había muerto.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de producción muestran una eficacia del 95 % en una cantidad de aplicación de 4 ppm: I-18

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de producción muestran una eficacia del 85 % en una cantidad de aplicación de 4 ppm: I-1

5 **Myzus persicae - ensayo de pulverización**

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

10 Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, se disuelve 1 parte en peso de compuesto activo utilizando las partes establecidas en peso de solvente y se diluye con agua, que contiene una concentración emulsionante de 1000 ppm, hasta que se obtiene la concentración deseada. Para producir concentraciones de prueba adicionales, la preparación se diluye con agua que contiene emulsionante.

Discos de hojas de col china (*Brassica pekinensis*), infestados con todos los estadios de pulgón del melocotonero (*Myzus persicae*) se pulverizan con una preparación del compuesto activo de la concentración deseada.

15 Después de 5 o 6 días, se determina la eficacia en %. El 100 % significa que murieron todos los pulgones; el 0 % significa que no murió ningún pulgón.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de producción muestran una eficacia del 100 % en una cantidad de aplicación de 500 g/ha: I-21

20 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de producción muestran una eficacia del 90 % en una cantidad de aplicación de 500 g/ha: I-1, I-2, I-7, I-11, I-19, I-22, I-35, I-41, I-46, I-48, I-54

Phaedon cochleariae - prueba de pulverización

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

25 Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, se disuelve 1 parte en peso de compuesto activo utilizando las partes establecidas en peso de solvente y se diluye con agua, que contiene una concentración emulsionante de 1000 ppm, hasta que se obtiene la concentración deseada. Para producir concentraciones de prueba adicionales, la preparación se diluye con agua que contiene emulsionante.

30 Se pulverizan discos de hojas de col china (*Brassica pekinensis*) con una preparación de compuesto activo en la concentración deseada y después del secado, se infesta con larvas del escarabajo de la mostaza (*Phaedon cochleariae*).

Después de 7 se determina la eficacia en %. A este respecto, el 100 % significa que murieron todas las larvas del escarabajo; el 0 % significa que no murió ninguna larva del escarabajo.

35 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de producción muestran una eficacia del 100 % a una cantidad de aplicación de 500 g/ha: I-8, I-9, I-10, I-11, I-13, I-18, I-19, I-21, I-22, I-24, I-25, I-29, I-34, I-36, I-39, I-40, I-41, I-42

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de producción muestran una eficacia del 83 % a una velocidad de aplicación de 500 g/ha: I-1, I-26, I-30, I-46

Spodoptera frugiperda - prueba de pulverización

40	Disolvente:	78,0	partes en peso de acetona
		1,5	partes en peso de dimetilformamida
	Emulsionante:	alquilaril poliglicol éter	

45 Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, se disuelve 1 parte en peso de compuesto activo utilizando las partes establecidas en peso de solvente y se diluye con agua, que contiene una concentración emulsionante de 1000 ppm, hasta que se obtiene la concentración deseada. Para producir concentraciones de prueba adicionales, la preparación se diluye con agua que contiene emulsionante.

Se pulverizan discos de hojas de maíz (*Zea mays*) con una preparación de compuesto activo en la concentración deseada y después del secado, se infesta con orugas del gusano cogollero (*Spodoptera frugiperda*).

Después de 7 se determina la eficacia en %. A este respecto, el 100 % significa que murieron todas las orugas; el 0 % significa que no murió ninguna oruga.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de producción muestran una eficacia del 100 % en una cantidad de aplicación de 500 g/ha: I-1, I-7, I-8, I-10, I-11, I-13, I-18, I-19, I-21, I-24, I-25, I-28, I-29, I-30, I-34, I-35, I-36, I-39, I-42, I-48, I-54

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de producción muestran una eficacia del 83 % en una cantidad de aplicación de 500 g/ha: I-33, I-41

Myzus persicae – prueba de pulverización

Disolvente: 14 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: alquilaril poliglicol éter

Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, se disuelve 1 parte en peso de compuesto activo utilizando las partes establecidas en peso de solvente y se llena con agua, que contiene una concentración emulsionante de 1000 ppm, hasta que se obtiene la concentración deseada. Para producir concentraciones de prueba adicionales, la preparación se diluye con agua que contiene emulsionante. Si se necesita la adición de sales de amonio y/o penetrantes, cada uno de estos se agrega en una concentración de 1000 ppm a la solución de la formulación.

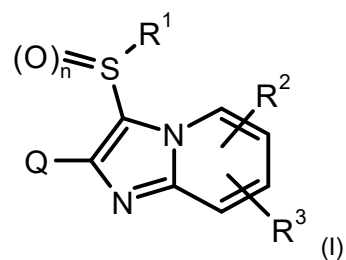
Plantas de pimiento morrón (*Capsicum annuum*) severamente infestadas con la pulga del melocotonero (*Myzus persicae*) se tratan pulverizando la preparación del compuesto activo en la concentración deseada.

Después de 6 días, se determina la muerte en %. A este respecto, el 100 % significa que murieron todos los áfidos; el 0 % significa que no murió ningún áfido.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de producción muestran una eficacia del 100 % en una cantidad de aplicación de 100 ppm: I-10

REIVINDICACIONES

1. Compuestos de la fórmula (I)



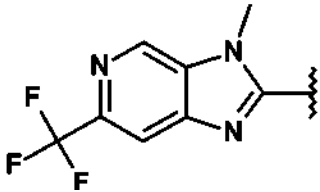
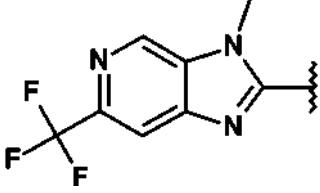
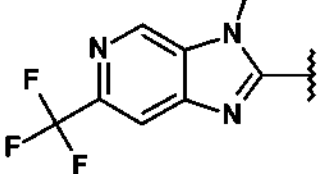
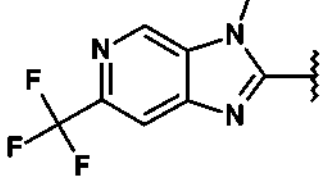
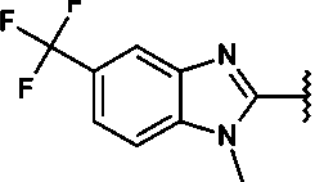
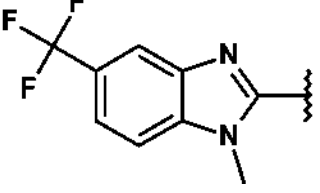
5 donde R³ representa hidrógeno y donde R¹, R², Q y n tienen los significados indicados en la siguiente tabla y donde el enlace de Q a la molécula radical está caracterizado con una línea ondulada:

	R ¹	n	R ²	Q
I-1	C ₂ H ₅	2	H	
I-2	C ₂ H ₅	0	H	
I-7	C ₂ H ₅	1	6-Cl	
I-8	C ₂ H ₅	1	6-CF ₃	
I-9	C ₂ H ₅	0	H	

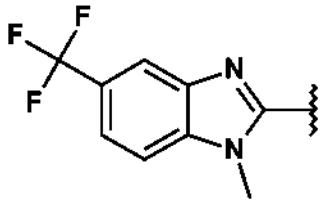
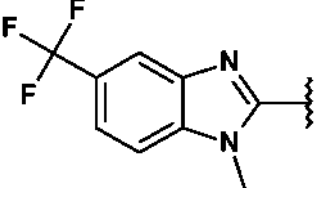
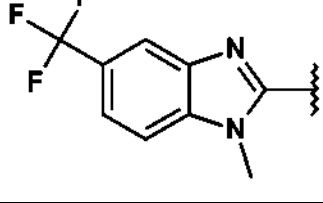
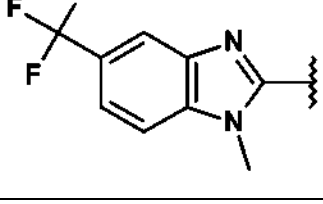
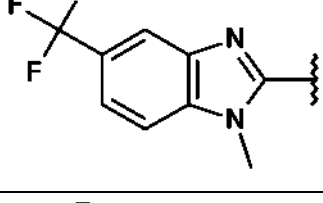
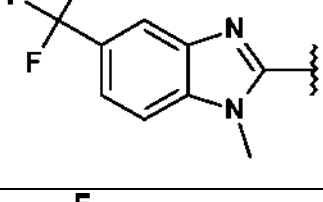
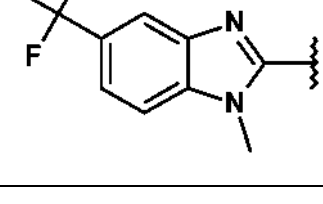
(continuación)

	R ¹	n	R ²	Q
I-10	C ₂ H ₅	2	H	
I-11	C ₂ H ₅	1	H	
I-13	C ₂ H ₅	0	8-CF ₃	
I-14	C ₂ H ₅	0	8-Cl	
I-15	C ₂ H ₅	0	8-SC ₂ H ₅	
I-18	C ₂ H ₅	1	7-CF ₃	
I-19	C ₂ H ₅	2	8-Cl	

(continuación)

	R ¹	n	R ²	Q
I-20	C ₂ H ₅	0	5-CF ₃	
I-21	C ₂ H ₅	2	5-CF ₃	
I-22	C ₂ H ₅	1	5-CF ₃	
I-24	C ₂ H ₅	2	8-CF ₃	
I-25	C ₂ H ₅	1	8-CF ₃	
I-26	C ₂ H ₅	0	5-CH ₃	
I-27	C ₂ H ₅	0	5-CF ₃	

(continuación)

	R ¹	n	R ²	Q
I-28	C ₂ H ₅	0	6-CF ₃	
I-29	C ₂ H ₅	0	6-Cl	
I-30	C ₂ H ₅	0	7-CF ₃	
I-31	C ₂ H ₅	0	5-SC ₂ H ₅	
I-32	C ₂ H ₅	0	7-SC ₂ H ₅	
I-33	C ₂ H ₅	2	7-CH ₃	
I-34	C ₂ H ₅	2	7-CF ₃	

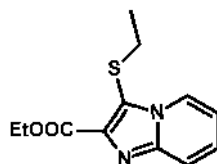
(continuación)

	R ¹	n	R ²	Q
I-35	C ₂ H ₅	2	6-CH ₃	
I-36	C ₂ H ₅	2	6-CF ₃	
I-37	C ₂ H ₅	0	7-CH ₃	
I-38	C ₂ H ₅	0	6-CH ₃	
I-39	C ₂ H ₅	2	8-SO ₂ C ₂ H ₅	
I-40	C ₂ H ₅	2	H	
I-41	C ₂ H ₅	2	H	
I-42	C ₂ H ₅	2	6-Cl	

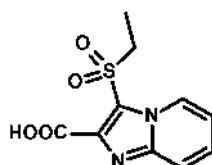
(continuación)

	R ¹	n	R ²	Q
I-45	C ₂ H ₅	0	6-CH ₃	
I-46	C ₂ H ₅	2	5-CH ₃	
I-48	C ₂ H ₅	2	6-CH ₃	
I-54	C ₂ H ₅	2	6-OCH ₃	
I-55	C ₂ H ₅	1	6-OCH ₃	

2. Compuestos de la fórmula (XXII)

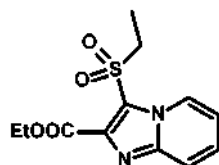


3. Compuestos de la fórmula (XXIII)

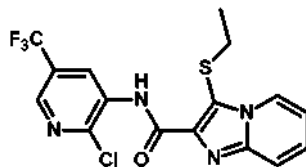


5

4. Compuestos de la fórmula (XXIV)



5. Compuestos de la fórmula (XXVI)



6. Formulaci3n agroquímica que comprende compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicaci3n 1, así como extensores y/o sustancias tensioactivas.

7. Formulaci3n agroquímica de acuerdo con la reivindicaci3n 6 que comprende adicionalmente un compuesto agroquímicamente activo adicional.

8. Procedimiento para controlar plagas animales, **caracterizado porque** se deja actuar un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicaci3n 1 o una formulaci3n agroquímica de acuerdo con una de las reivindicaciones 6 o 7 sobre plagas animales y/o su hábitat, estando excluidos procedimientos para el tratamiento quirúrgico o terapéutico del cuerpo humano o animal.

9. Uso de compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicaci3n 1 o de formulaciones agroquímicas de acuerdo con una de las reivindicaciones 6 y 7 para controlar plagas animales.