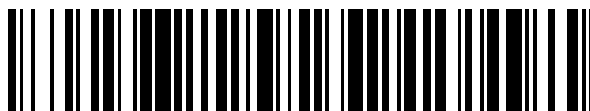


19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 786 573**

51 Int. Cl.:

**C07D 487/04** (2006.01)

**A01N 43/90** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **05.01.2017 PCT/EP2017/050181**

87 Fecha y número de publicación internacional: **20.07.2017 WO17121674**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **05.01.2017 E 17700114 (6)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **19.02.2020 EP 3402797**

54 Título: **Derivados de heterociclos como pesticidas**

30 Prioridad:

**11.01.2016 EP 16150757**

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

**13.10.2020**

73 Titular/es:

**BAYER CROPSCIENCE AG (100.0%)**

**Alfred-Nobel-Straße 50**

**40789 Monheim am Rhein, DE**

72 Inventor/es:

**WILCKE, DAVID;  
FISCHER, RÜDIGER;  
HAGER, DOMINIK;  
HOFFMEISTER, LAURA;  
KAUSCH-BUSIES, NINA;  
ILG, KERSTIN;  
WILLOT, MATTHIEU;  
MOSRIN, MARC;  
GÖRGENS, ULRICH;  
PORTZ, DANIELA;  
EILMUS, SASCHA y  
TURBERG, ANDREAS**

74 Agente/Representante:

**GONZÁLEZ PECES, Gustavo Adolfo**

ES 2 786 573 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).

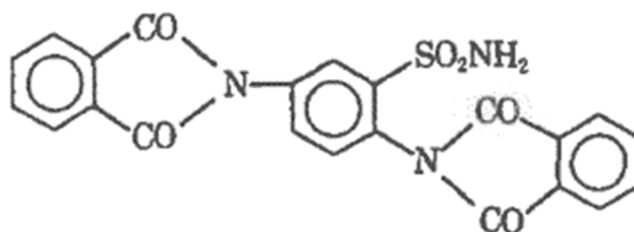




alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cianoalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), hidroxialquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), hidroxicarbonilo-alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
 alcoxicarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>),  
 cianoalqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cianoalquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
 haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cianoalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxicarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
 5 alquilhidroxiimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxiiimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxiiimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
 alcoxiiimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
 alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilsulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilsulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
 alquilsulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfonylo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilsulfonylo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
 alquilsulfonylo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfonylo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfonyloxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilcarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
 10 alquiltiocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquiltiocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilcarboniloxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxicarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
 haloalcoxicarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilaminotiocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), di-  
 alquilaminocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), di-alquilaminotiocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquencilaminocarbonilo-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), di-  
 alquencilaminocarbonilo-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilaminocarbonilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), alquilsulfonylamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilamino-(C<sub>1</sub>-  
 C<sub>6</sub>), di-alquilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), aminosulfonylo, alquilaminosulfonylo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), di-alquilaminosulfonylo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
 15 alquilsulfoximino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), aminotiocarbonilo, alquilaminotiocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), di-alquilaminotiocarbonilo-(C<sub>1</sub>-  
 C<sub>6</sub>), cicloalquilamino-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>) o -NHCO-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) (alquilcarbonilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)),

X representa un sistema de anillo bicíclico o tricíclico condensado heterocíclico o heteroaromático parcialmente  
 saturado o saturado de 8, 9, 10, 11 o 12 miembros, donde opcionalmente al menos un grupo carbonilo puede  
 estar presente y/o donde el sistema de anillo está opcionalmente mono- o polisustituido de manera igual o  
 20 distinta, y donde los sustituyentes independientemente entre sí pueden seleccionarse de ciano, halógeno, nitro,  
 acetilo, hidroxilo, amino, SCN, tri-alquilsililo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>),  
 alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), halo-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cianoalquilo-  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), hidroxialquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), hidroxicarbonilo-alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxicarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cianoalqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>),  
 25 alquinoxilo-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cianoalquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-  
 C<sub>6</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquinoxilo-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquinoxilo-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-  
 C<sub>6</sub>), cianoalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxicarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
 alquilhidroxiimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxiiimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxiiimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
 alcoxiiimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
 30 alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilsulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilsulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
 alquilsulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfonylo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilsulfonylo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
 alquilsulfonylo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfonylo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfonyloxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilcarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
 alquilcarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquiltiocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquiltiocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilcarboniloxi-  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxicarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalcoxicarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
 35 alquilaminotiocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), di-alquilaminocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), di-alquilaminotiocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
 alquencilaminocarbonilo-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), di-alquencilaminocarbonilo-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilaminocarbonilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>),  
 alquilsulfonylamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), di-alquilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), aminosulfonylo, alquilaminosulfonylo-  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), di-alquilaminosulfonylo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfoximino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), aminotiocarbonilo, alquilaminotiocarbonilo-  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), di-alquilaminotiocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilamino-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), NHCO-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)  
 40 (alquilcarbonilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)),  
 o donde los sustituyentes pueden seleccionarse independientemente entre sí de fenilo o un anillo heteroaromático  
 de 5 o 6 miembros, donde fenilo o el anillo pueden opcionalmente estar mono- o polisustituidos de manera igual  
 o distinta con alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalqueno-  
 C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquino-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>,

45 n representa 0, 1 o 2, excepto por



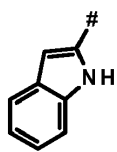
También se encontró que los compuestos de la fórmula (I) tienen muy buena eficacia como pesticidas, preferentemente como insecticidas y/o acaricidas, y adicionalmente generalmente tienen muy buena compatibilidad con las plantas, en particular con respecto a las plantas de cultivos.

50 Una definición general de los compuestos de la invención se provee por la fórmula (I). Sustituyentes o intervalos preferidos para los restos enumerados en las fórmulas mencionadas anteriormente y a continuación se ilustran más adelante.

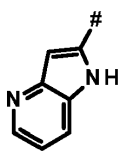
Configuración 2



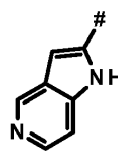




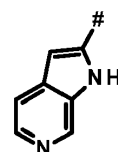
Q6



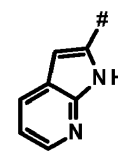
Q7



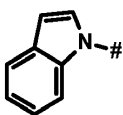
Q8



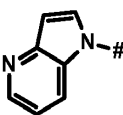
Q9



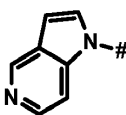
Q10



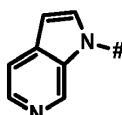
Q11



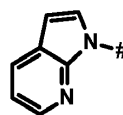
Q12



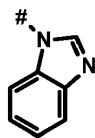
Q13



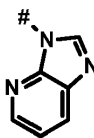
Q14



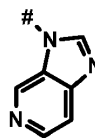
Q15



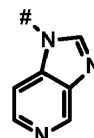
Q16



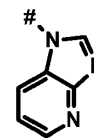
Q17



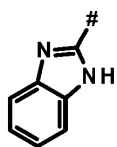
Q18



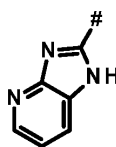
Q19



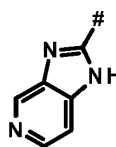
Q20



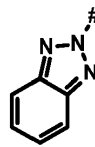
Q21



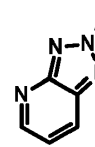
Q22



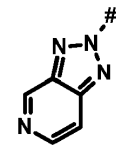
Q23



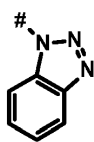
Q24



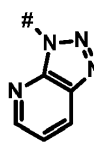
Q25



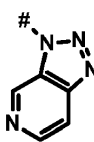
Q26



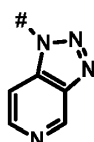
Q27



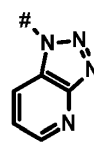
Q28



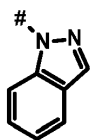
Q29



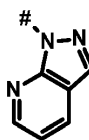
Q30



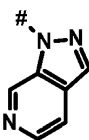
Q31



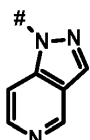
Q32



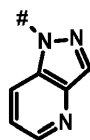
Q33



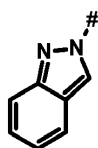
Q34



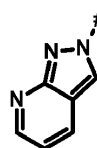
Q35



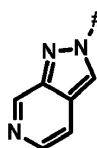
Q36



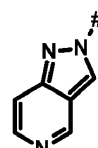
Q37



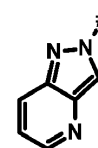
Q38



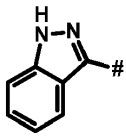
Q39



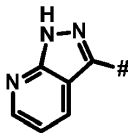
Q40



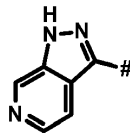
Q41



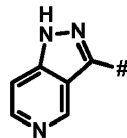
Q42



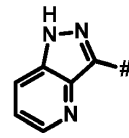
Q43



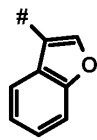
Q44



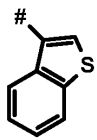
Q45



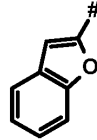
Q46



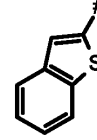
Q47



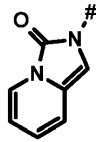
Q48



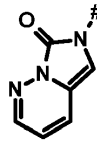
Q49



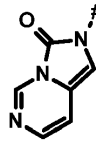
Q50



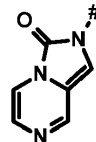
Q51



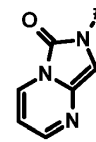
Q52



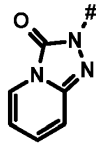
Q53



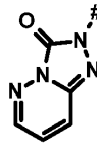
Q54



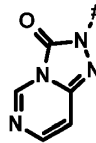
Q55



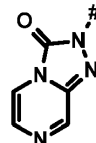
Q56



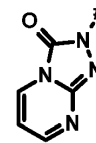
Q57



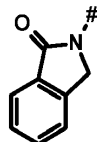
Q58



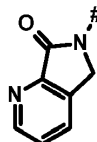
Q59



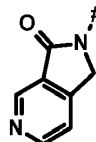
Q60



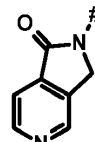
Q61



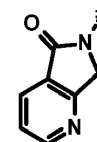
Q62



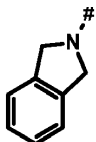
Q63



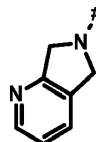
Q64



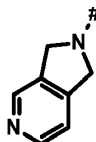
Q65



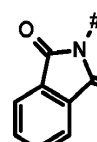
Q66



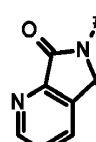
Q67



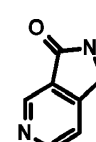
Q68



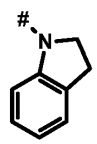
Q69



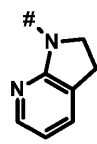
Q70



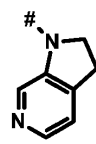
Q71



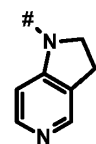
Q72



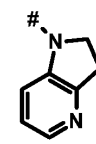
Q73



Q74

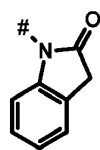


Q75

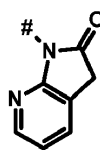


Q76

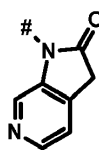




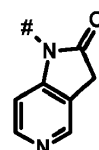
Q77



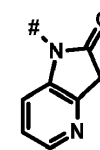
Q78



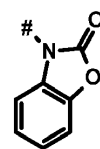
Q79



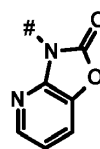
Q80



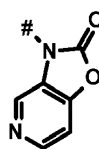
Q81



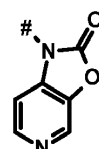
Q82



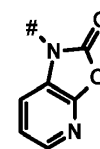
Q83



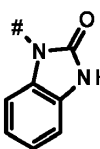
Q84



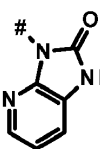
Q85



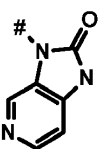
Q86



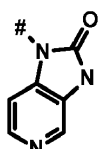
Q87



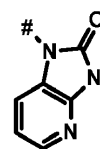
Q88



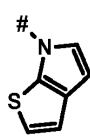
Q89



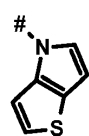
Q90



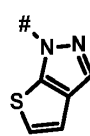
Q91



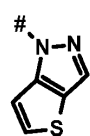
Q92



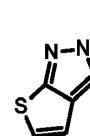
Q93



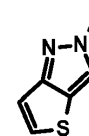
Q94



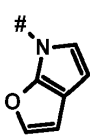
Q95



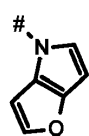
Q96



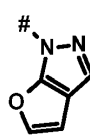
Q97



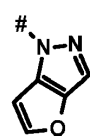
Q98



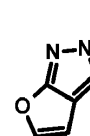
Q99



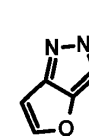
Q100



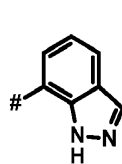
Q101



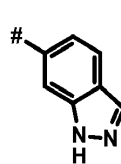
Q102



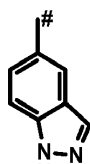
Q103



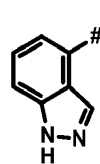
Q104



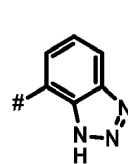
Q105



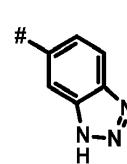
Q106



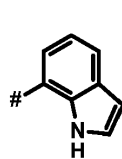
Q107



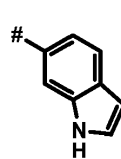
Q108



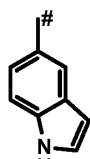
Q109



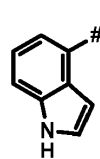
Q110



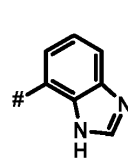
Q111



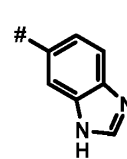
Q112



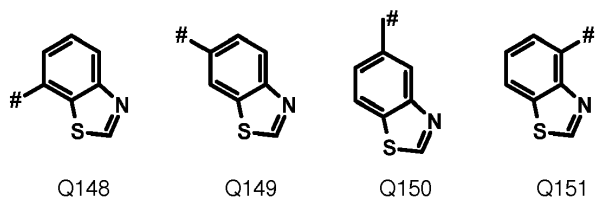
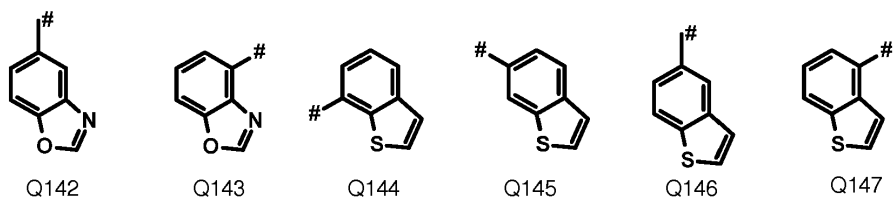
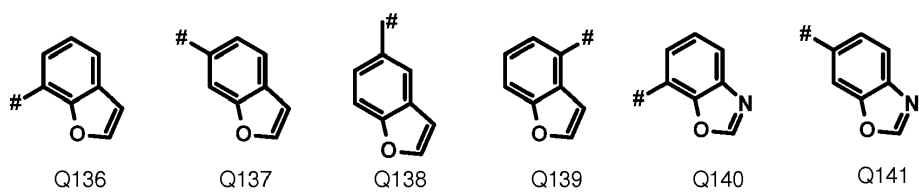
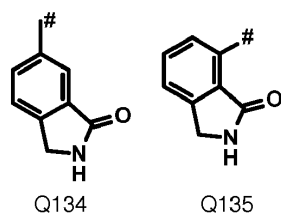
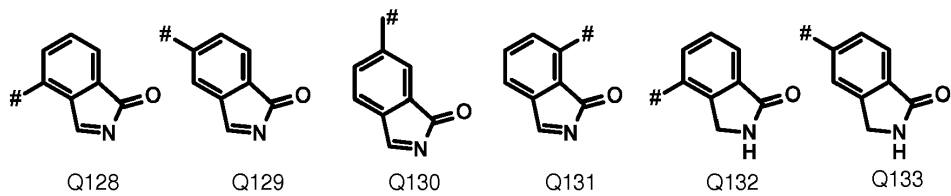
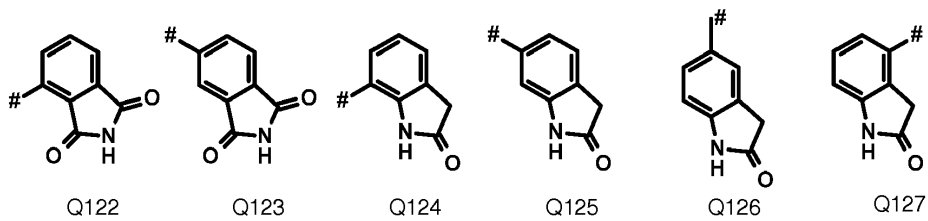
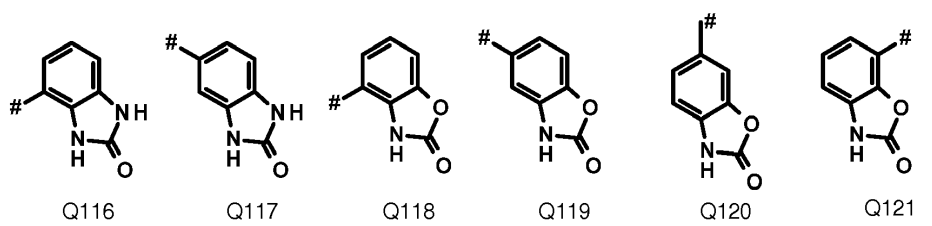
Q113



Q114



Q115

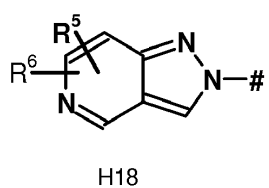
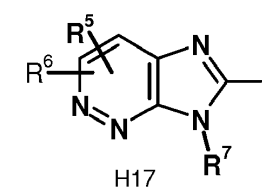
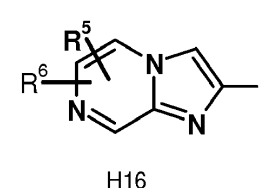
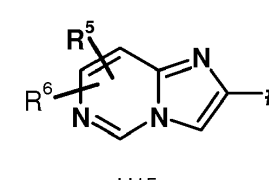
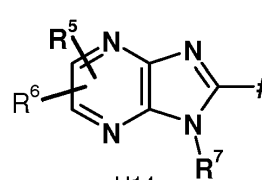
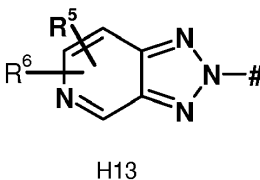
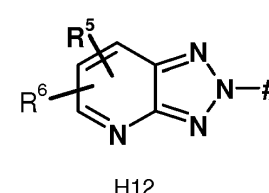
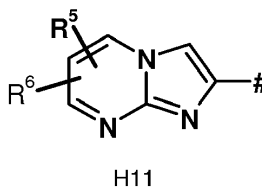
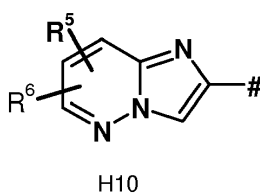
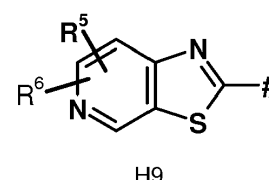
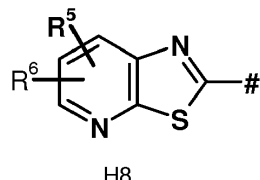
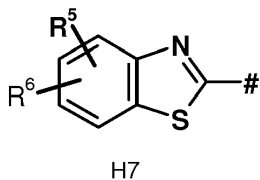
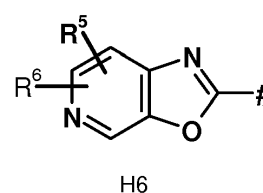
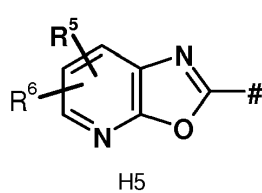
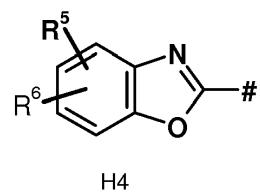
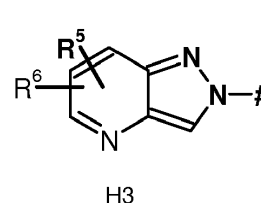
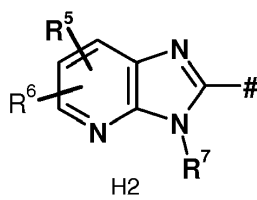
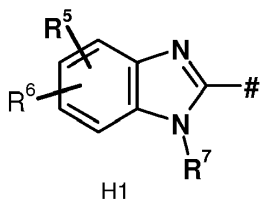


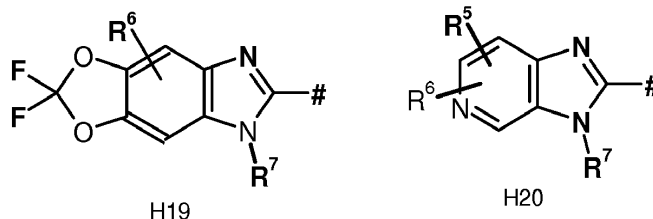
donde el enlace al resto de la molécula se identifica con una almohadilla #,

5  $R^3$  representa de manera especialmente preferente hidrógeno, ciano, halógeno, nitro, hidroxilo, amino, SCN, tri-  
 alquilsililo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-  
 C<sub>6</sub>), halo-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), cianoalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo-  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), haloalqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), cianoalqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquino-(C<sub>2</sub>-  
 C<sub>4</sub>), cianoalquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), cianoalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilhidroxiimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>),  
 10 alcoxiimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alcoxiimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilsulfinilo-  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilsulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilsulfonylo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilsulfonylo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilsulfonyloxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>),  
 alquilcarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilcarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), di-  
 alquilaminocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilsulfonylamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), di- alquilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>),  
 aminosulfonylo, alquilaminosulfonylo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), di-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)- aminosulfonylo o NHCO- alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)  
 (alquilcarbonilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)),

$R^4$  representa de manera especialmente preferente hidrógeno, halógeno, ciano o alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>),

15 X representa de manera especialmente preferente un sistema de anillo bicíclico o tricíclico condensado heteroaromático de 9 miembros o 12 miembros de la serie que consiste en H1 a H20,





5  $R^5, R^6$  independientemente entre sí preferentemente representan particularmente hidrógeno, ciano, halógeno, alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), haloalqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxiimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilsulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilsulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilsulfoniloxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilcarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilcarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), di-alquilaminocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilsulfonilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), di-alquilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), aminosulfinilo, alquilaminosulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) o di-alquilaminosulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>),

10  $R^7$  representa de manera especialmente preferente hidrógeno, alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), cianoalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), hidroxialquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alquenoiloxi-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquenoiloxi-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), cianoalqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alquinoiloxi-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), halo-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilsulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) o alquilcarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>),

n representa de manera especialmente preferente 0, 1 o 2.

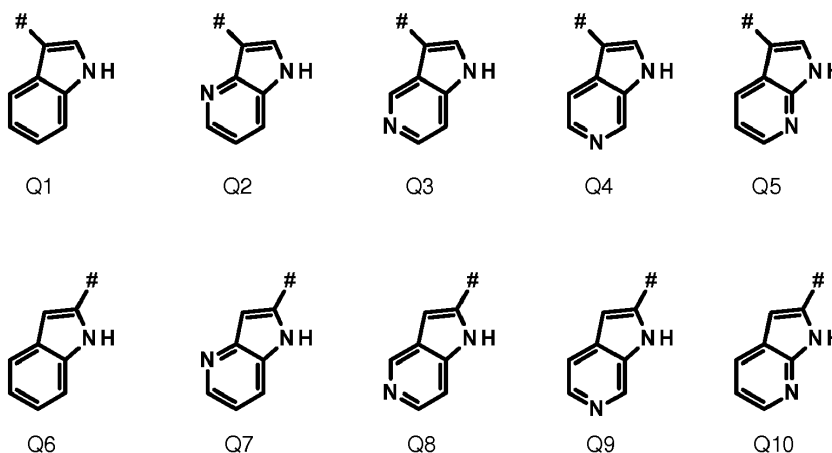
La sustitución en los anillos Q1 a Q151 puede ser por sustitución de hidrógeno en el átomo de carbono y/o en el átomo de nitrógeno. Las formas isoméricas de los anillos Q1 a Q151 se incluyen y forman parte de la invención.

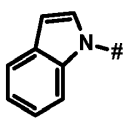
20 Configuración 3-2

$A^1$  representa de manera especialmente preferente nitrógeno o =C(R<sup>4</sup>)-,

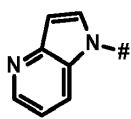
$R^1$  representa de manera especialmente preferente alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), hidroxialquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), haloalqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilsulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) o alquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>),

25  $R^2$  representa de manera especialmente preferente un sistema de anillo bicíclico condensado parcialmente saturado o heteroaromático de la serie Q1 a Q152, donde el sistema de anillo puede estar opcionalmente mono- o polisustituido de manera igual o distinta, donde los sustituyentes pueden seleccionarse independientemente entre sí de: nitro, hidroxilo, amino, ciano, halógeno, alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), cicloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) o haloalquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>),

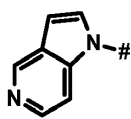




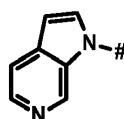
Q11



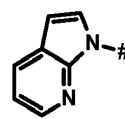
Q12



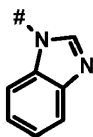
Q13



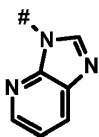
Q14



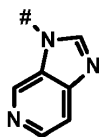
Q15



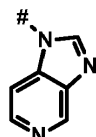
Q16



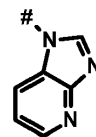
Q17



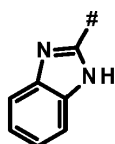
Q18



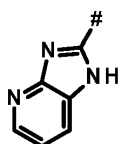
Q19



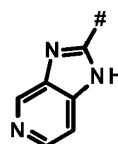
Q20



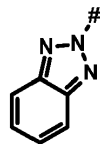
Q21



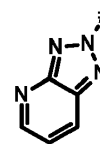
Q22



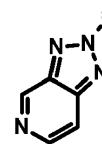
Q23



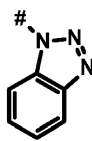
Q24



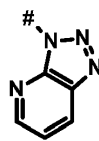
Q25



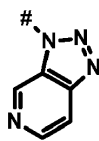
Q26



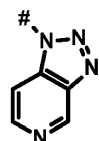
Q27



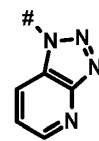
Q28



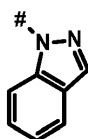
Q29



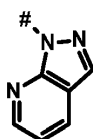
Q30



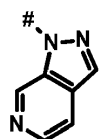
Q31



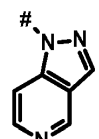
Q32



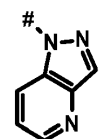
Q33



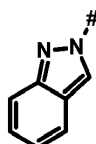
Q34



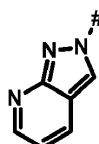
Q35



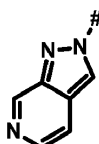
Q36



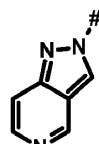
Q37



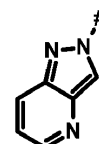
Q38



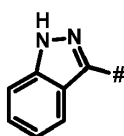
Q39



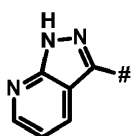
Q40



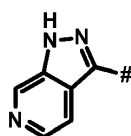
Q41



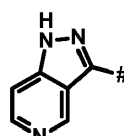
Q42



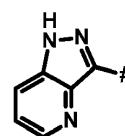
Q43



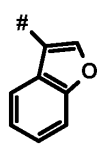
Q44



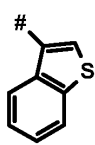
Q45



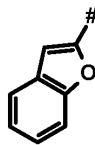
Q46



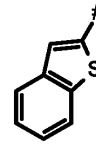
Q47



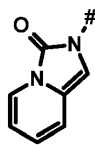
Q48



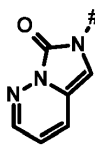
Q49



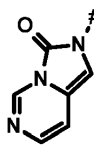
Q50



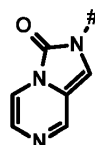
Q51



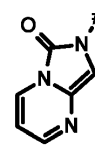
Q52



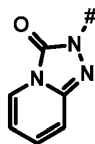
Q53



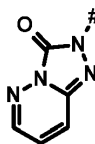
Q54



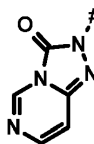
Q55



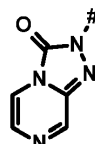
Q56



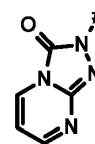
Q57



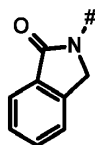
Q58



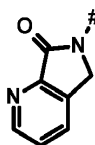
Q59



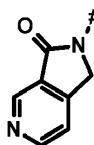
Q60



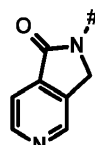
Q61



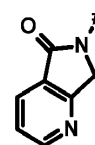
Q62



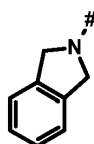
Q63



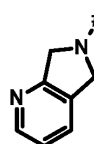
Q64



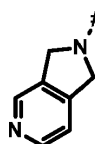
Q65



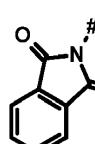
Q66



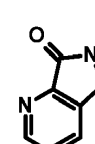
Q67



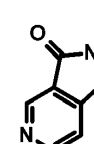
Q68



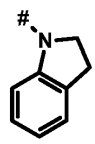
Q69



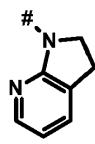
Q70



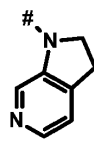
Q71



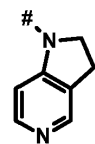
Q72



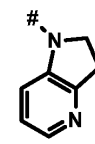
Q73



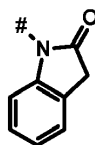
Q74



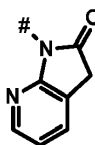
Q75



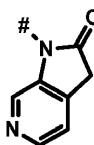
Q76



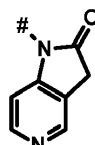
Q77



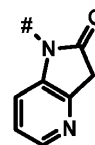
Q78



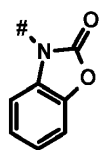
Q79



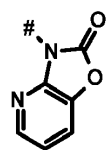
Q80



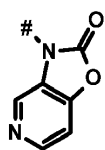
Q81



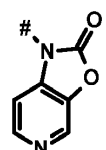
Q82



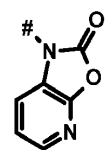
Q83



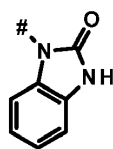
Q84



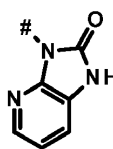
Q85



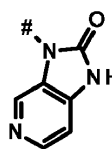
Q86



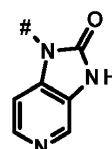
Q87



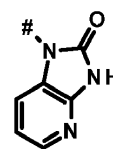
Q88



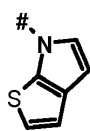
Q89



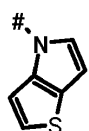
Q90



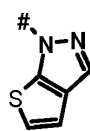
Q91



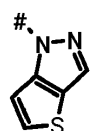
Q92



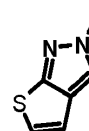
Q93



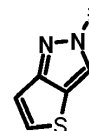
Q94



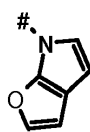
Q95



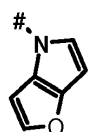
Q96



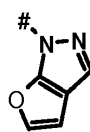
Q97



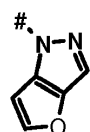
Q98



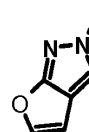
Q99



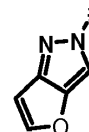
Q100



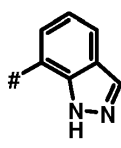
Q101



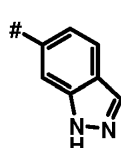
Q102



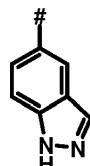
Q103



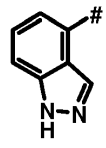
Q104



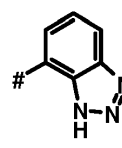
Q105



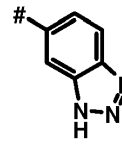
Q106



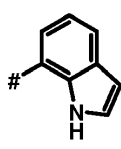
Q107



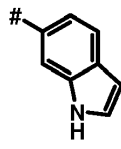
Q108



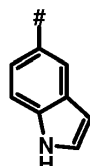
Q109



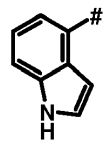
Q110



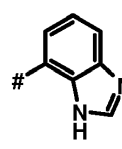
Q111



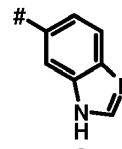
Q112



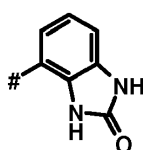
Q113



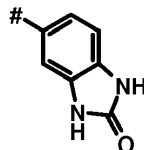
Q114



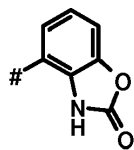
Q115



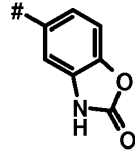
Q116



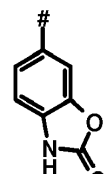
Q117



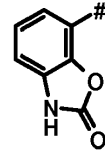
Q118



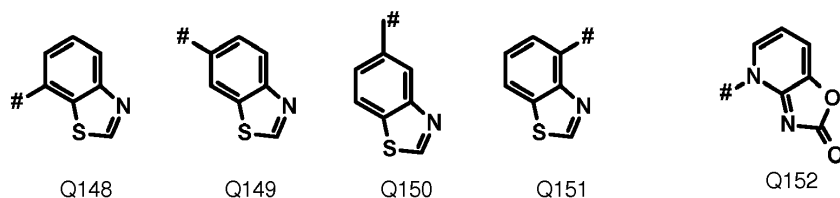
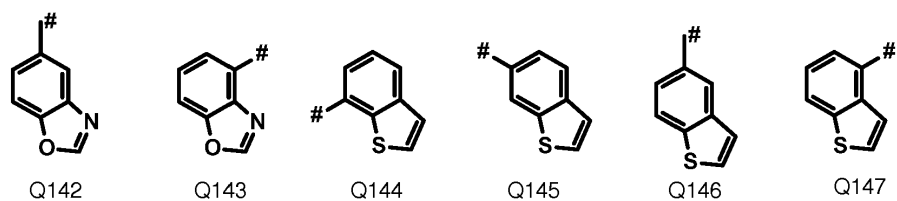
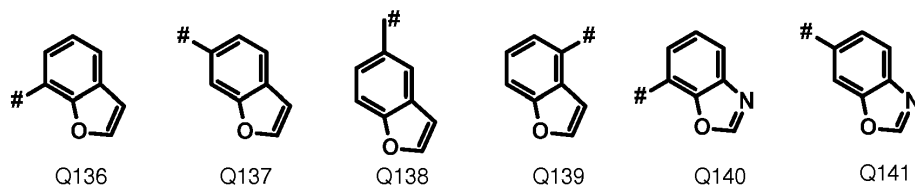
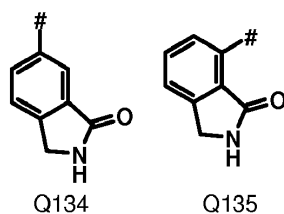
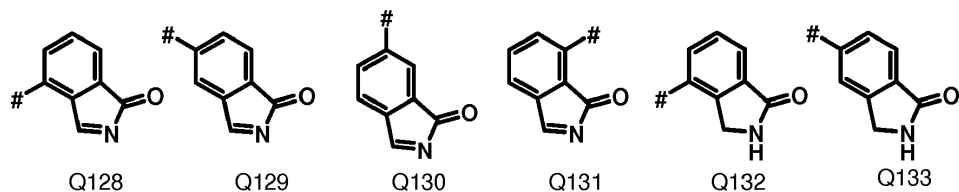
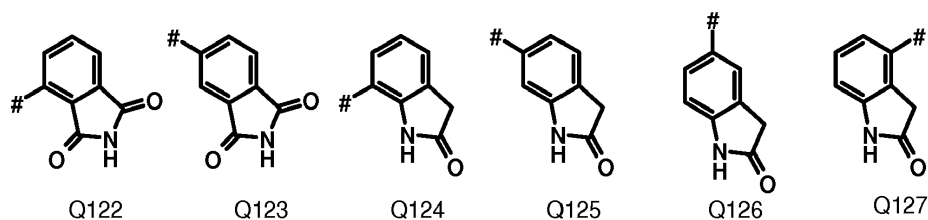
Q119



Q120



Q121



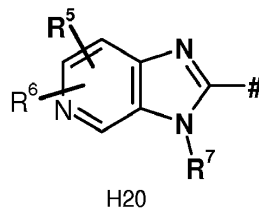
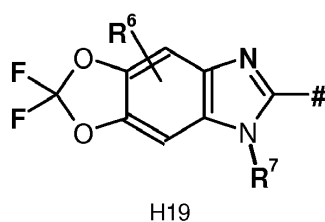
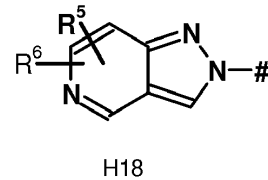
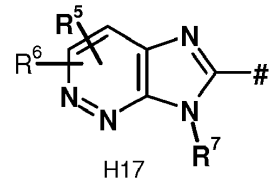
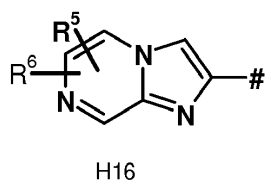
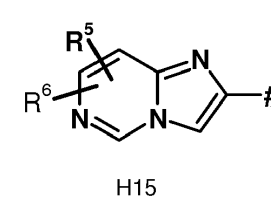
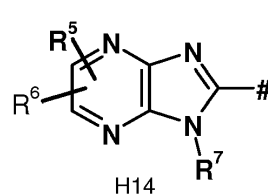
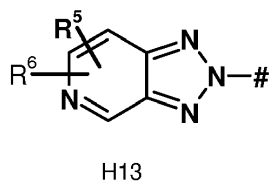
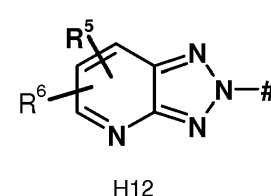
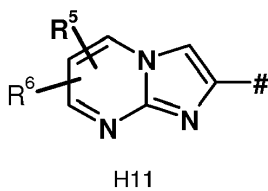
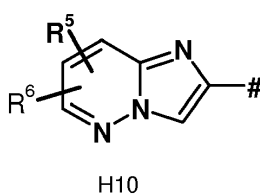
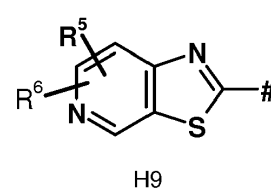
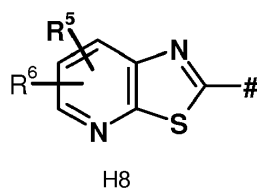
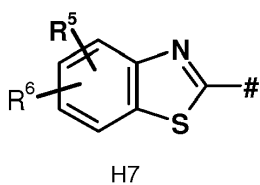
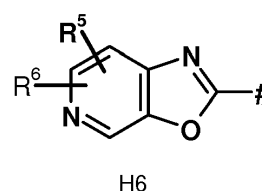
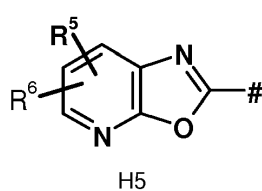
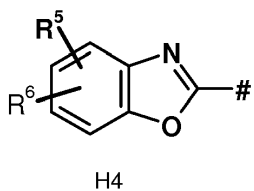
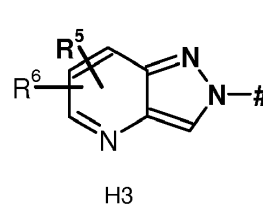
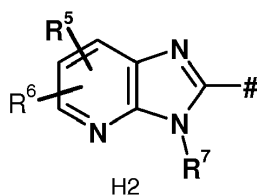
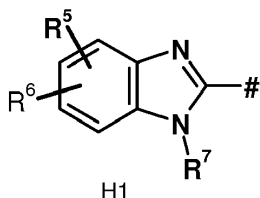
donde el enlace al resto de la molécula se identifica con una almohadilla #,

15  $R^3$  representa de manera especialmente preferente hidrógeno, ciano, halógeno, nitro, hidroxilo, amino, SCN, tri-  
alquilsililo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-  
C<sub>6</sub>), halo-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), cianoalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo-  
(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), haloalqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), cianoalqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquino-(C<sub>2</sub>-  
C<sub>4</sub>), cianoalquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), cianoalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquihidroxiimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>),  
alcoxiimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alcoxiimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilsulfonilo-



(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilsulfino-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilsulfono-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilsulfono-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilsulfonoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilcarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilcarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), di-alquilaminocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilsulfonilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), di-alquilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), aminosulfono, alquilaminosulfono-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), di-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-aminosulfono o NHCO- alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) (alquilcarbonilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)),

- 5
- R<sup>4</sup> representa de manera especialmente preferente hidrógeno, halógeno, ciano o alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>),
- X representa de manera especialmente preferente un sistema de anillo bicíclico o tricíclico condensado heteroaromático de 9 miembros o 12 miembros de la serie que consiste en H1 a H20,





isobutilo, terc-butilo, ciclobutilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, fluoroetilo, difluoroetilo, trifluoroetilo, tetrafluoroetilo o pentafluoroetilo,

- 5 R<sup>2</sup> representa de manera muy especialmente preferente un sistema de anillo bicíclico condensado, opcionalmente mono- o disustituido, de manera igual o distinta, de la serie Q1, Q2, Q3, Q4, Q5, Q6, Q7, Q8, Q9, Q10, Q11, Q12, Q13, Q14, Q15, Q16, Q17, Q18, Q19, Q20, Q21, Q22, Q23, Q27, Q28, Q29, Q30, Q31, Q32, Q33, Q34, Q35, Q36, Q37, Q38, Q39, Q40, Q41, Q42, Q43, Q44, Q45, Q46, Q51, Q52, Q53, Q54, Q55, Q56, Q57, Q58, Q59, Q60, Q61, Q62, Q63, Q64, Q65, Q66, Q67, Q68, Q77, Q78, Q79, Q80, Q81, Q82, Q83, Q84, Q85, Q86, Q87, Q88, Q89, Q90, Q91, Q92, Q93, Q94, Q95, Q96, Q97, Q104, Q105, Q106, Q107, Q108, Q109, Q114, Q115, Q116, Q117, Q118, Q119, Q120, Q121, Q124, Q125, Q126, Q127, Q128, Q129, Q130, Q131, Q132, Q133, Q134, Q135, Q136, Q137, Q138, Q139, Q140, Q141, Q142, Q143, Q144, Q145, Q146, Q147, Q148, Q149, Q150, Q151, teniéndose en cuenta como sustituyentes en cada caso: ciano, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, trifluorometilo, pentafluoroetilo, metoxi, etoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi, pentafluoroetoxi o trifluorometiltio,
- 10
- 15 R<sup>3</sup> representa de manera muy especialmente preferente hidrógeno, ciano, halógeno, alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilsulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilsulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) o NHCO-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) (alquilcarbonilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)),
- R<sup>4</sup> representa de manera muy especialmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo o ciano,
- 20 X representa de manera muy especialmente preferente un sistema de anillo bicíclico o tricíclico condensado heteroaromático de 9 miembros o 12 miembros de la serie H1, H2, H3, H4, H5, H6, H7, H8, H9, H10, H11, H12, H13, H14, H15, H16, H17, H18, H19, y H20,
- R<sup>5</sup> representa de manera muy especialmente preferente flúor, cloro, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, fluoroetilo, difluoroetilo, trifluoroetilo, tetrafluoroetilo, pentafluoroetilo, trifluorometoxi, difluoroclorometoxi, diclorofluorometoxi, trifluorometiltio, trifluorometilsulfinilo o trifluorometilsulfinilo,
- 25 R<sup>6</sup> representa de manera muy especialmente preferente hidrógeno,
- R<sup>7</sup> representa de manera muy especialmente preferente hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, terc-butilo, metoximetilo o metoxietilo,
- n representa de manera muy especialmente preferente 0, 1 o 2.

#### Configuración 4-2

- 30 A<sup>1</sup> representa de manera muy especialmente preferente nitrógeno,
- R<sup>1</sup> representa de manera muy especialmente preferente metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, n-butilo, isobutilo, terc-butilo, ciclobutilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, fluoroetilo, difluoroetilo, trifluoroetilo, tetrafluoroetilo o pentafluoroetilo,
- 35 R<sup>2</sup> representa de manera muy especialmente preferente un sistema de anillo bicíclico condensado, opcionalmente mono- o disustituido, de manera igual o distinta, de la serie Q1, Q2, Q3, Q4, Q5, Q6, Q7, Q8, Q9, Q10, Q11, Q12, Q13, Q14, Q15, Q16, Q17, Q18, Q19, Q20, Q21, Q22, Q23, Q27, Q28, Q29, Q30, Q31, Q32, Q33, Q34, Q35, Q36, Q37, Q38, Q39, Q40, Q41, Q42, Q43, Q44, Q45, Q46, Q51, Q52, Q53, Q54, Q55, Q56, Q57, Q58, Q59, Q60, Q61, Q62, Q63, Q64, Q65, Q66, Q67, Q68, Q69, Q70, Q71, Q77, Q78, Q79, Q80, Q81, Q82, Q83, Q84, Q85, Q86, Q87, Q88, Q89, Q90, Q91, Q92, Q93, Q94, Q95, Q96, Q97, Q104, Q105, Q106, Q107, Q108, Q109, Q114, Q115, Q116, Q117, Q118, Q119, Q120, Q121, Q124, Q125, Q126, Q127, Q128, Q129, Q130, Q131, Q132, Q133, Q134, Q135, Q136, Q137, Q138, Q139, Q140, Q141, Q142, Q143, Q144, Q145, Q146, Q147, Q148, Q149, Q150, Q151, Q152, teniéndose en cuenta como sustituyentes en cada caso: ciano, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, trifluorometilo, pentafluoroetilo, metoxi, etoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi, pentafluoroetoxi o trifluorometiltio,
- 40
- 45 R<sup>3</sup> representa de manera muy especialmente preferente hidrógeno, ciano, halógeno, alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilsulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilsulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) o NHCO-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) (alquilcarbonilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)),
- 50 X representa de manera muy especialmente preferente un sistema de anillo bicíclico o tricíclico condensado heteroaromático de 9 miembros o 12 miembros de la serie H1, H2, H3, H4, H5, H6, H7, H8, H9, H10, H11, H12, H13, H14, H15, H16, H17, H18, H19, y H20,
- R<sup>5</sup> representa de manera muy especialmente preferente flúor, cloro, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, fluoroetilo, difluoroetilo, trifluoroetilo, tetrafluoroetilo, pentafluoroetilo, trifluorometoxi, difluoroclorometoxi, diclorofluorometoxi, trifluorometiltio, trifluorometilsulfinilo o trifluorometilsulfinilo,

- R<sup>6</sup> representa de manera muy especialmente preferente hidrógeno,
- R<sup>7</sup> representa de manera muy especialmente preferente hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, terc-butilo, metoximetilo o metoxietilo,
- n representa de manera muy especialmente preferente 0, 1 o 2.
- 5 Configuración 4-3
- A<sup>1</sup> representa de manera muy especialmente preferente nitrógeno,
- R<sup>1</sup> representa de manera muy especialmente preferente metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, n-butilo, isobutilo, terc-butilo, ciclobutilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, fluoroetilo, difluoroetilo, trifluoroetilo, tetrafluoroetilo o pentafluoroetilo,
- 10 R<sup>2</sup> representa de manera muy especialmente preferente un sistema de anillo bicíclico condensado, opcionalmente mono- o disustituido, de manera igual o distinta, de la serie Q1, Q6, Q11, Q12, Q15, Q16, Q17, Q20, Q27, Q28, Q32, Q33, Q34, Q35, Q37, Q38, Q51, Q56, Q57, Q61, Q62, Q66, Q67, Q69, Q82, Q87, Q105, Q106, Q107 y Q152, donde como sustituyentes se tienen en cuenta en cada caso: ciano, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, trifluorometilo, pentafluoroetilo, metoxi, etoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi, pentafluoroetoxi o trifluorometiltio,
- 15 R<sup>3</sup> representa de manera muy especialmente preferente hidrógeno, ciano, halógeno, alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilsulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilsulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) o NHCO-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) (alquilcarbonilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)),
- 20 X representa de manera muy especialmente preferente un sistema de anillo bicíclico o tricíclico condensado heteroaromático de 9 miembros o 12 miembros de la serie H1, H2, H3, H4, H5, H6, H7, H8, H9, H10, H11, H12, H13, H14, H15, H16, H17, H18, H19 y H20,
- R<sup>5</sup> representa de manera muy especialmente preferente flúor, cloro, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, fluoroetilo, difluoroetilo, trifluoroetilo, tetrafluoroetilo, pentafluoroetilo, trifluorometoxi, difluoroclorometoxi, diclorofluorometoxi, trifluorometiltio, trifluorometilsulfonilo o trifluorometilsulfinilo,
- 25 R<sup>6</sup> representa de manera muy especialmente preferente hidrógeno,
- R<sup>7</sup> representa de manera muy especialmente preferente hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, terc-butilo, metoximetilo o metoxietilo,
- n representa de manera muy especialmente preferente 0, 1 o 2.
- Configuración 5-1
- 30 A<sup>1</sup> más preferentemente representa nitrógeno,
- R<sup>1</sup> más preferentemente representa etilo,
- R<sup>2</sup> representa más preferentemente un anillo de la serie Q1, Q6, Q32, Q33, Q34, Q35, Q37 y Q51 que está mono- o disustituido, de manera igual o distinta, con cloro, ciano, metilo o trifluorometilo,
- R<sup>3</sup> más preferentemente representa hidrógeno,
- 35 X más preferentemente representa un sistema de anillo heteroaromático de la serie H20,
- R<sup>5</sup> más preferentemente representa trifluorometilo,
- R<sup>6</sup> más preferentemente representa hidrógeno,
- R<sup>7</sup> más preferentemente representa metilo,
- n más preferentemente representa 2.
- 40 Configuración 5-2
- A<sup>1</sup> más preferentemente representa nitrógeno,
- R<sup>1</sup> más preferentemente representa etilo,
- R<sup>2</sup> más preferentemente representa un sistema de anillo bicíclico condensado, mono- o disustituido, de manera igual o distinta, con cloro, bromo, ciano, metilo, metoxi y trifluorometilo, de la serie Q1, Q6, Q11, Q12, Q15, Q16, Q17, Q20, Q27, Q28, Q32, Q33, Q34, Q35, Q37, Q38, Q51, Q56, Q57, Q61, Q62, Q66, Q67, Q69, Q82,
- 45



En una forma de realización preferida, la invención se refiere a compuestos de la fórmula (I) donde X representa H15 y A<sup>1</sup>, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> y n tienen los significados descritos en la configuración (3-1) o configuración (3-2) o configuración (4-1) o configuración (4-2) o configuración (4-3) o configuración (5-1) o configuración (5-2).

5 En una forma de realización preferida, la invención se refiere a compuestos de la fórmula (I) donde X representa H16 y A<sup>1</sup>, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> y n tienen los significados descritos en la configuración (3-1) o configuración (3-2) o configuración (4-1) o configuración (4-2) o configuración (4-3) o configuración (5-1) o configuración (5-2).

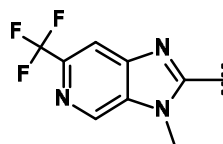
En una forma de realización preferida, la invención se refiere a compuestos de la fórmula (I) donde X representa H17 y A<sup>1</sup>, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> y n tienen los significados descritos en la configuración (3-1) o configuración (3-2) o configuración (4-1) o configuración (4-2) o configuración (4-3) o configuración (5-1) o configuración (5-2).

10 En una forma de realización preferida, la invención se refiere a compuestos de la fórmula (I) donde X representa H18 y A<sup>1</sup>, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> y n tienen los significados descritos en la configuración (3-1) o configuración (3-2) o configuración (4-1) o configuración (4-2) o configuración (4-3) o configuración (5-1) o configuración (5-2).

15 En una forma de realización preferida, la invención se refiere a compuestos de la fórmula (I) donde X representa H19 y A<sup>1</sup>, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> y n tienen los significados descritos en la configuración (3-1) o configuración (3-2) o configuración (4-1) o configuración (4-2) o configuración (4-3) o configuración (5-1) o configuración (5-2).

En una forma de realización preferida, la invención se refiere a compuestos de la fórmula (I) donde X representa H20 y A<sup>1</sup>, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> y n tienen los significados descritos en la configuración (3-1) o configuración (3-2) o configuración (4-1) o configuración (4-2) o configuración (4-3) o configuración (5-1) o configuración (5-2).

En una forma de realización preferida, la invención se refiere a compuestos de la fórmula (I) donde X representa



20 y A<sup>1</sup>, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y n tienen los significados descritos en la configuración (3-1) o configuración (3-2) o configuración (4-1) o configuración (4-2) o configuración (4-3) o configuración (5-1) o configuración (5-2).

25 En una forma de realización preferida, la invención se refiere a compuestos de la fórmula (I) donde A<sup>1</sup> representa nitrógeno y X, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> y n tienen los significados descritos en la configuración (3-1) o configuración (3-2) o configuración (4-1) o configuración (4-2) o configuración (4-3) o configuración (5-1) o configuración (5-2).

En las definiciones preferidas, a menos que se especifique de otro modo,

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

En las definiciones particularmente preferidas, a menos que se especifique de otro modo,

30 halógeno se selecciona del grupo de flúor, cloro, bromo y yodo, preferentemente a su vez del grupo de flúor, cloro y bromo,

35 En el contexto de la presente invención, a menos que se defina de forma diferente en otra parte, el término "alquilo", ya sea por sí solo o en combinación con otros términos, por ejemplo haloalquilo, se entiende que significa un resto de un grupo de hidrocarburos alifáticos saturados que tiene 1 a 12 átomos de carbono y puede ser ramificado o no ramificado. Ejemplos de restos alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> son metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, terc-butilo, n-pentilo, isopentilo, neopentilo, terc-pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 1-etilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, hexilo, n-heptilo, n-octilo, n-nonilo, n-decilo, n-undecilo y n-dodecilo. Entre estos restos alquilo, se le da particular preferencia a restos alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>. Se le da especial preferencia a restos alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>.

40 De acuerdo con la invención, a menos que se defina de forma diferente en otra parte, el término "alqueno", ya sea por sí solo o en combinación con otros términos, se entiende que significa un resto alqueno-C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> de cadena recta o ramificada que tiene al menos un enlace doble, 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. Entre estos, se da preferencia a restos alqueno-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> y particular preferencia a restos alqueno-C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>.

45 De acuerdo con la invención, a menos que se defina de forma diferente en otra parte, el término "alquino", ya sea por sí solo o en combinación con otros términos, se entiende que significa un resto alquino-C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> de cadena recta o ramificada que tiene al menos un enlace triple, por ejemplo etinilo, 1-propinilo y propargilo. Entre estos, se da preferencia a restos alquino-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> y particular preferencia a restos alquino-C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>. El resto alquino puede también

contener al menos un enlace doble.

5 De acuerdo con la invención, a menos que se defina de forma diferente en otra parte, el término "cicloalquilo", ya sea por sí solo o en combinación con otros términos, se entiende que significa un resto cicloalquilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, por ejemplo ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo y ciclooctilo. Entre estos, se da preferencia a restos cicloalquilo-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>.

El término "alcoxi", ya sea por sí solo o en combinación con otros términos, por ejemplo haloalcoxi, se entiende en el presente caso que significa un resto O-alquilo, donde el término "alquilo" es como se define anteriormente.

10 Los restos sustituidos con halógeno, por ejemplo haloalquilo, son mono- o polihalogenados, hasta el máximo número de sustituyentes posible. En el caso de polihalogenación, los átomos de halógeno pueden ser idénticos o diferentes. En este caso, halógeno es flúor, cloro, bromo o yodo, especialmente flúor, cloro o bromo.

A menos que se especifique de otro modo, los restos opcionalmente sustituidos pueden ser mono- o polisustituidos, donde los sustituyentes en el caso de las polisustituciones pueden ser los mismos o distintos.

15 Las definiciones o aclaraciones de los restos brindadas anteriormente en términos generales o dentro de las áreas de preferencia aplican a los productos finales y de manera correspondiente a los materiales de partida y productos intermedios. Estas definiciones de los restos pueden combinarse entre sí como se desee, es decir incluso entre los respectivos intervalos de preferencia.

De acuerdo con la invención se da preferencia a usar compuestos de la fórmula (I) que contienen una combinación de significados enumerados anteriormente como preferidos.

20 De acuerdo con la invención se da particular preferencia a usar compuestos de la fórmula (I) que contienen una combinación de significados enumerados anteriormente como particularmente preferidos.

De acuerdo con la invención se da muy particular preferencia a usar compuestos de la fórmula (I) que contienen una combinación de definiciones enumeradas anteriormente como muy particularmente preferidos.

De acuerdo con la invención se da la mayor preferencia a usar compuestos de la fórmula (I) que contienen una combinación de significados enumerados anteriormente como más preferidos.

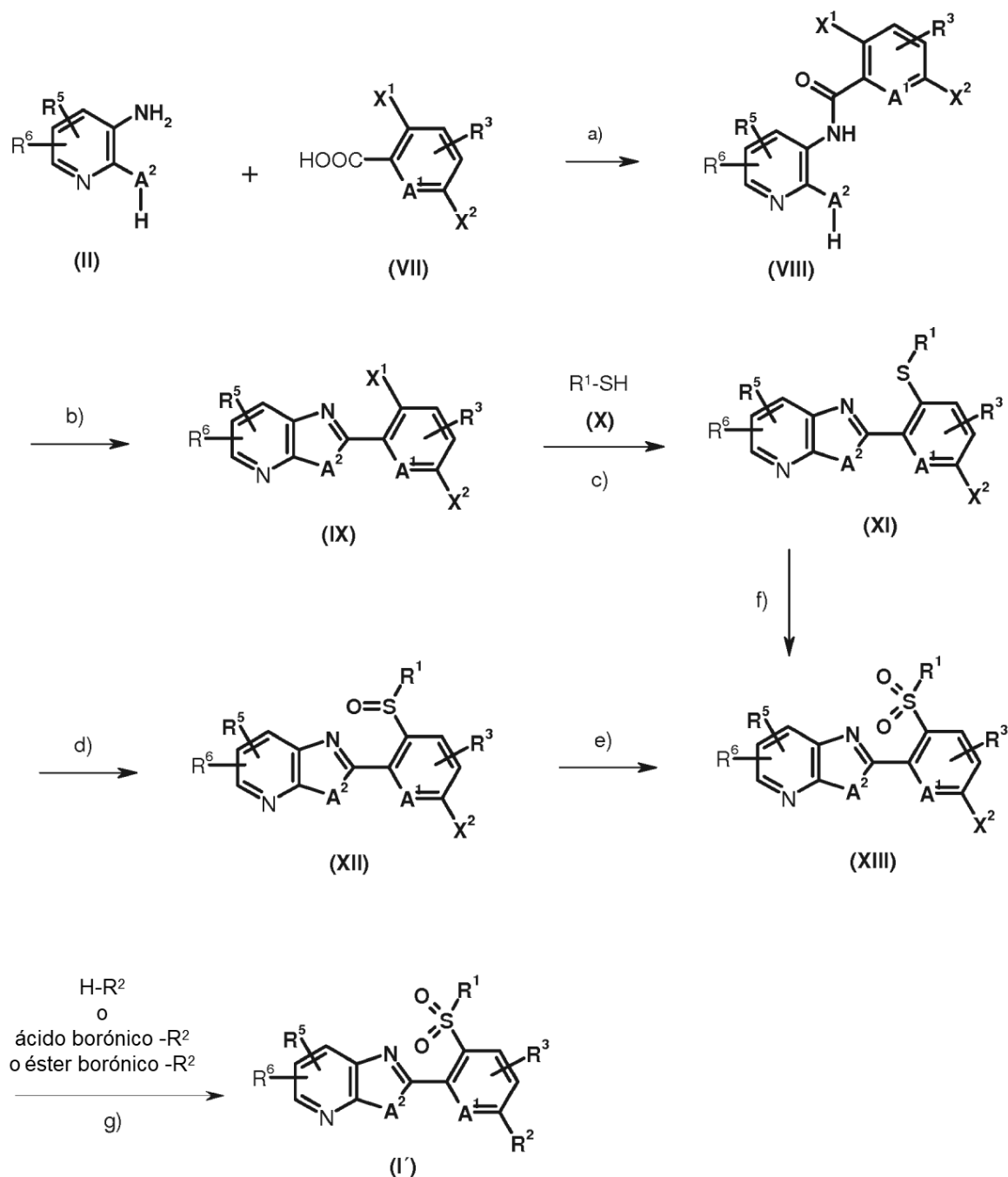
25 Dependiendo de la naturaleza de los sustituyentes, los compuestos de la fórmula (I) pueden estar en forma de isómeros geométricos y / u ópticamente activos o mezclas de isómeros correspondientes en diferentes composiciones. Estos estereoisómeros son, por ejemplo, enantiómeros, diastereómeros, atropisómeros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

30 Los compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la invención pueden obtenerse por los procedimientos mostrados en los siguientes esquemas:

#### **Procedimiento A**

35 Los compuestos de la fórmula (I) donde X representa H1, H2, H4, H5, H6, H7, H8, H9, H14, H19 o H20 pueden prepararse por métodos conocidos, por ejemplo análogamente a los procedimientos descritos en WO2009/131237, WO2010/125985, WO2011/043404, WO2011/040629, WO2012/086848, WO2013/018928, WO2015/000715 o WO2015/133603.

El procedimiento general para preparar compuestos de la fórmula (I) donde X es H1, H2, H4, H5, H6, H7, H8, H9, H14, H19 o H20 se describe más adelante por referencia a los Ejemplos H2, H5 y H8, respectivamente.



Los restos  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  y  $A^1$  tienen los significados descritos anteriormente,  $A^2$  representa  $-N-R^7$ , O o S, donde  $R^7$  tiene el significado descrito anteriormente y  $X^1$  o  $X^2$  representan halógeno.

#### Paso a)

- 5 Los compuestos de la fórmula (VIII) pueden prepararse en analogía al procedimiento descrito en US5576335 por la reacción de los compuestos de la fórmula (II) con un ácido carboxílico de la fórmula (VII) en presencia de un agente de condensación o una base.

Los compuestos de la fórmula (II) están comercialmente disponibles o pueden prepararse por procedimientos conocidos, por ejemplo análogamente a los procedimientos descritos en US2003/69257 o WO2006/65703.

- 10 Los ácidos carboxílicos de la fórmula (VII) están comercialmente disponibles o pueden prepararse por procedimientos conocidos, por ejemplo análogamente a los procedimientos descritos en US2010/234604, WO2012/61926 o Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters, 18 (2008), 5023-5026.



La reacción de los compuestos de la fórmula (II) con ácidos carboxílicos de la fórmula (VII) puede efectuarse pura o en un disolvente, donde se da preferencia a realizar la reacción en un disolvente que se selecciona de disolventes habituales que son inertes en las condiciones de reacción predominantes. Se da preferencia a éteres, por ejemplo diisopropil éter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano; hidrocarburos halogenados, por ejemplo diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; nitrilos, por ejemplo acetonitrilo o propionitrilo; hidrocarburos aromáticos, por ejemplo tolueno o xileno; disolventes polares apróticos, por ejemplo N,N-dimetilformamida o N-metilpirrolidona, o compuestos que contienen nitrógeno, por ejemplo piridina.

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

Las bases adecuadas son bases inorgánicas que se usan típicamente en tales reacciones. Se da preferencia a usar bases seleccionadas a modo de ejemplo del grupo que consiste en acetatos, fosfatos, carbonatos e hidrogenocarbonatos de metales alcalinos o metales alcalinotérreos. Se da preferencia particular a acetato de sodio, fosfato de sodio, fosfato de potasio, carbonato de cesio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, hidrogenocarbonato de sodio, hidrogenocarbonato de potasio.

La reacción puede efectuarse a presión reducida, a presión estándar o a presión elevada y a temperaturas de 0°C a 180°C; con preferencia, la reacción se lleva a cabo a presión estándar y temperaturas de 20 a 140°C.

#### Paso b)

Los compuestos de la fórmula (IX) pueden prepararse condensando los compuestos de la fórmula (VIII), por ejemplo análogamente a los procedimientos descritos en WO2012/86848.

La conversión en compuestos de la fórmula (IX) puede efectuarse pura o en un disolvente, donde se da preferencia a realizar la reacción en un disolvente que se selecciona de disolventes habituales que son inertes en las condiciones de reacción predominantes. Se da preferencia a éteres, por ejemplo diisopropil éter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, terc-butil metil éter; hidrocarburos halogenados, por ejemplo diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; nitrilos, por ejemplo acetonitrilo o propionitrilo; hidrocarburos aromáticos, por ejemplo tolueno o xileno; disolventes polares apróticos, por ejemplo N,N-dimetilformamida o N-metilpirrolidona, o compuestos de nitrógeno, por ejemplo piridina.

La reacción puede efectuarse en presencia de un agente de condensación, un ácido, una base o un agente clorante.

Ejemplos de agentes de condensación adecuados son carbodiimidas como 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida clorhidrato (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 azo diéster, por ejemplo ácido dietilazodicarboxílico.

Ejemplos de ácidos adecuados que pueden usarse en la reacción descrita son ácidos sulfónicos como ácido para-toluenosulfónico; ácidos carboxílicos como ácido acético, o ácidos polifosfóricos.

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

Un ejemplo de un agente clorante es oxicloruro de fósforo.

La reacción puede llevarse a cabo a presión reducida, a presión estándar o a presión elevada, y a temperaturas de 0°C a 200°C.

#### Paso c)

Los compuestos de la fórmula (XI) pueden prepararse haciendo reaccionar los compuestos de la fórmula (IX) con los compuestos de la fórmula (X) en presencia de una base.

Los derivados de mercaptano de la fórmula (X), por ejemplo metil mercaptano, etil mercaptano o isopropil mercaptano, están comercialmente disponibles o pueden prepararse por procedimientos conocidos, por ejemplo análogamente a los procedimientos descritos en US2006/25633, US2006/111591, US2820062, Chemical Communications, 13 (2000), 1163-1164 o Journal of the American Chemical Society, 44 (1922), p. 1329.

La conversión en compuestos de la fórmula (XI) puede efectuarse pura o en un disolvente, donde se da preferencia a realizar la reacción en un disolvente que se selecciona de disolventes habituales que son inertes en las condiciones de reacción predominantes. Se da preferencia a éteres, por ejemplo diisopropil éter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, terc-butil metil éter; nitrilos, por ejemplo acetonitrilo o propionitrilo; hidrocarburos aromáticos, por ejemplo tolueno o xileno; disolventes polares apróticos, por ejemplo N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona o dimetilsulfóxido.

Ejemplos de bases adecuadas son bases inorgánicas del grupo que consiste en acetatos, fosfatos y carbonatos de metales alcalinos o metales alcalinotérreos. Se da preferencia a carbonato de cesio, carbonato de sodio y carbonato de potasio. Otras bases adecuadas son hidruros de metales alcalinos, por ejemplo hidruro de sodio.

5 La reacción puede llevarse a cabo a presión reducida, a presión estándar o a presión elevada, y a temperaturas de 0°C a 200°C.

**Paso d)**

10 Los compuestos de la fórmula (XII) pueden prepararse oxidando los compuestos de la fórmula (XI). La oxidación se realiza generalmente en un disolvente que se selecciona de disolventes habituales que son inertes en las condiciones de reacción predominantes. Se da preferencia a hidrocarburos halogenados, por ejemplo diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; alcoholes como metanol o etanol; ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico o agua.

Ejemplos de agentes oxidantes adecuados son peróxido de hidrógeno, ácido meta-cloroperbenzoico o peryodato de sodio.

15 La reacción puede llevarse a cabo a presión reducida, a presión atmosférica o a presión elevada, y a temperaturas de -20°C a 120°C.

**Paso e)**

20 Los compuestos de la fórmula (XIII) pueden prepararse oxidando los compuestos de la fórmula (XII). La oxidación se efectúa generalmente en un disolvente. Se da preferencia a hidrocarburos halogenados, por ejemplo diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; alcoholes como metanol o etanol; ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico o agua.

Ejemplos de agentes oxidantes adecuados son peróxido de hidrógeno y ácido meta-cloroperbenzoico.

La reacción puede llevarse a cabo a presión reducida, a presión estándar o a presión elevada, y a temperaturas de -20°C a 120°C.

**Paso f)**

25 Los compuestos de la fórmula (XIII) pueden también prepararse en un procedimiento de un paso oxidando los compuestos de la fórmula (XI). La oxidación se efectúa generalmente en un disolvente. Se da preferencia a hidrocarburos halogenados, por ejemplo diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; alcoholes como metanol o etanol; ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico o agua.

Ejemplos de agentes oxidantes adecuados son peróxido de hidrógeno y ácido meta-cloroperbenzoico.

30 La reacción puede llevarse a cabo a presión reducida, a presión atmosférica o a presión elevada, y a temperaturas de -20°C a 120°C.

**Paso g)**

35 La preparación de los compuestos de la fórmula (I') donde R<sup>2</sup> representa un biclo unido al resto de la molécula mediante nitrógeno puede ocurrir por ejemplo a partir de compuestos de la fórmula (XIII) para lo cual X<sup>2</sup> representa preferentemente halógeno de la serie cloro o bromo, por procedimientos conocidos en la bibliografía (véase, por ejemplo, *Journal of Organic Chemistry* (2010), 69, 5578), por ejemplo en presencia de yoduro de cobre(I) y auxiliares de reacción básica, por ejemplo trans-N,N'-dimetilciclohexano-1,2-diamina y carbonato de potasio, en un disolvente o diluyente adecuado.

40 Los compuestos de la fórmula H-R<sup>2</sup> necesarios están comercialmente disponibles o pueden prepararse a partir de procedimientos conocidos.

45 Disolventes o diluyentes útiles incluyen todos los disolventes orgánicos inertes, por ejemplo hidrocarburos alifáticos o aromáticos. Se da preferencia a usar tolueno. Asimismo, el acoplamiento puede suceder a partir de compuestos de la fórmula (XIII), para lo cual X<sup>2</sup> representa preferentemente halógeno de la serie de flúor, cloro o bromo, sin catálisis de metal en presencia de una base adecuada como, por ejemplo, carbonato de potasio o carbonato de cesio en un disolvente o diluyente adecuado. Disolventes o diluyentes útiles incluyen todos los disolventes orgánicos inertes, por ejemplo hidrocarburos alifáticos o aromáticos. Se da preferencia aquí a usar acetonitrilo o dimetilformamida.

50 Los compuestos de la fórmula (I') para lo cual R<sup>2</sup> representa un biclo unido al resto de la molécula mediante carbono puede prepararse por ejemplo a partir de compuestos de la fórmula (XIII), para lo cual X<sup>2</sup> representa preferentemente halógeno de la serie de cloro o bromo, por procedimientos generalmente conocidos (cf. *Chem. Rev.* 1995, 95, 2457-2483; *Tetrahedron* 2002, 58, 9633-9695; *Metal-Catalyzed Cross-Coupling Reactions* (Eds.: A. de Meijere, F. Diederich), 2ª ed., Wiley-VCH, Weinheim, 2004).

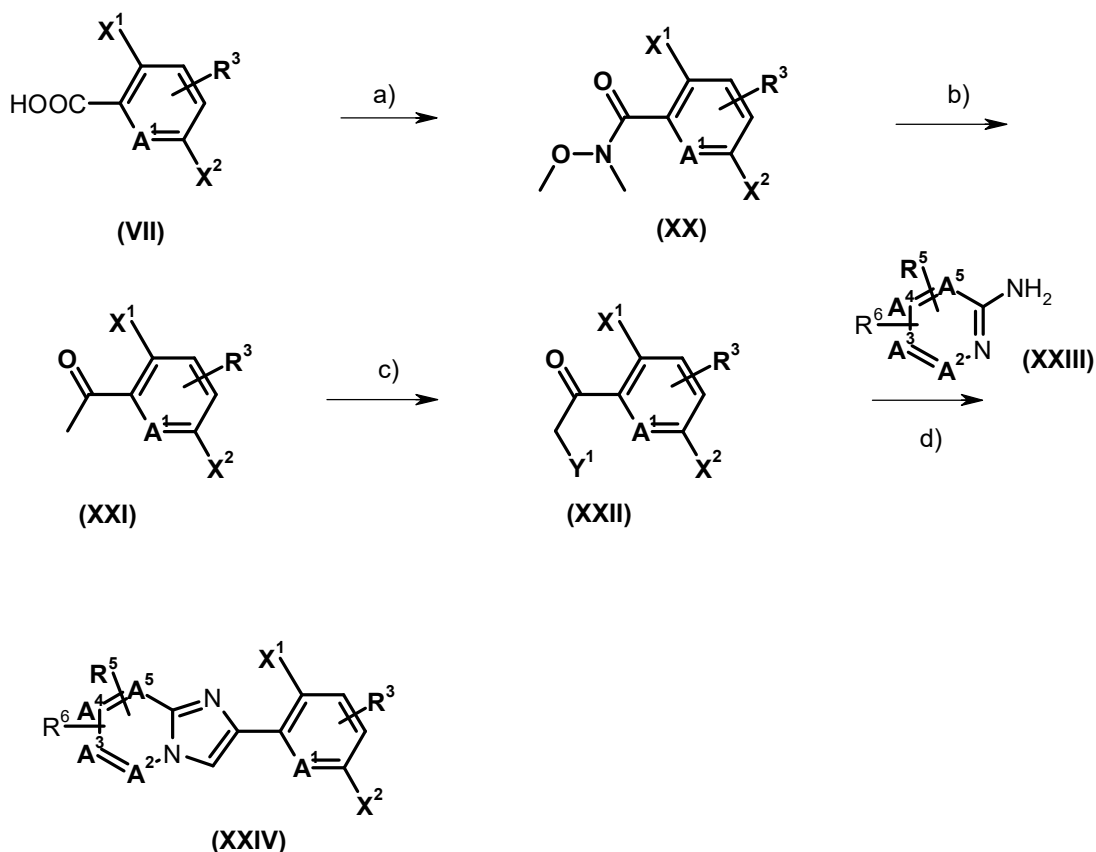
- 5 Por ejemplo, los compuestos de la fórmula (XIII) donde  $X^2$  representa preferentemente cloro o bromo puede hacerse reaccionar con ácidos arilborónicos adecuados o ésteres de estos por procedimientos conocidos (cf. WO2010071819) en presencia de catalizadores adecuados de la serie de sales de metal de transición para proporcionar compuestos de la fórmula (I'). Ejemplos de catalizadores de acoplamiento preferidos incluyen catalizadores de paladio como [1,1'-bis(difenilfosfina)ferroceno]dicloropaladio(II) o tetrakis(trifenilfosfina)paladio. Los auxiliares de reacción básicos adecuados usados para realizar los procedimientos son preferentemente carbonatos de sodio o potasio.

Algunos de los ácidos (hetero)arilborónicos o ésteres (hetero)arilborónicos necesarios son conocidos y/o están comercialmente disponibles, o pueden prepararse por procedimientos generalmente conocidos (cf. *Boronic Acids* (eds.: D. G. Hall), 2ª ed., Wiley-VCH, Weinheim, 2011).

- 10 La reacción de acuerdo con el paso g) puede también suceder a partir de compuestos de las fórmulas (XI) o (XII).

### Procedimiento B

Los compuestos de la fórmula (I) donde X representa H10, H11, H15 o H16 pueden prepararse por métodos conocidos, por ejemplo análogamente a los procedimientos descritos en US2009/203705, US2012/258951, WO2013/3298 o J. Med. Chem. 31, (1988) 1590-1595.



- 15 Los restos  $A^1$ ,  $R^3$ ,  $R^5$  y  $R^6$  tienen los significados descritos anteriormente.  $X^1$ ,  $X^2$  e  $Y^1$  representan halógeno.  $A^2$ ,  $A^3$ ,  $A^4$  y  $A^5$  independientemente entre sí representan CH o N (donde  $A^2$ ,  $A^3$ ,  $A^4$  y  $A^5$  no representan simultáneamente N).

### Paso a)

- 20 Los ácidos carboxílicos de la fórmula (VII) se convierten análogamente al procedimiento descrito en WO2011/75643 o EP-A-2671582 en presencia de O,N-dimetilhidroxilamina clorhidrato en amidas Weinreb de la fórmula (XX).

Los ácidos carboxílicos de la fórmula (VII) están comercialmente disponibles o pueden prepararse por métodos conocidos, por ejemplo análogamente a los procedimientos descritos en US2010/234604, WO2012/61926 o Bioorganic y Medicinal Chemistry Letters, 18 (2008), 5023-5026.

### Paso b, c)

- 25 Los compuestos de la fórmula (XX) pueden entonces convertirse por métodos conocidos, por ejemplo análogamente al procedimiento descrito en WO2011/75643, usando un reactivo de Grignard como, por ejemplo, bromuro de metilmagnesio en cetonas de la fórmula (XXI). Los compuestos de la fórmula (XXII) se obtienen por posterior

halogenación análogamente al procedimiento conocido descrito, por ejemplo, en US2012/302573.

**Paso d)**

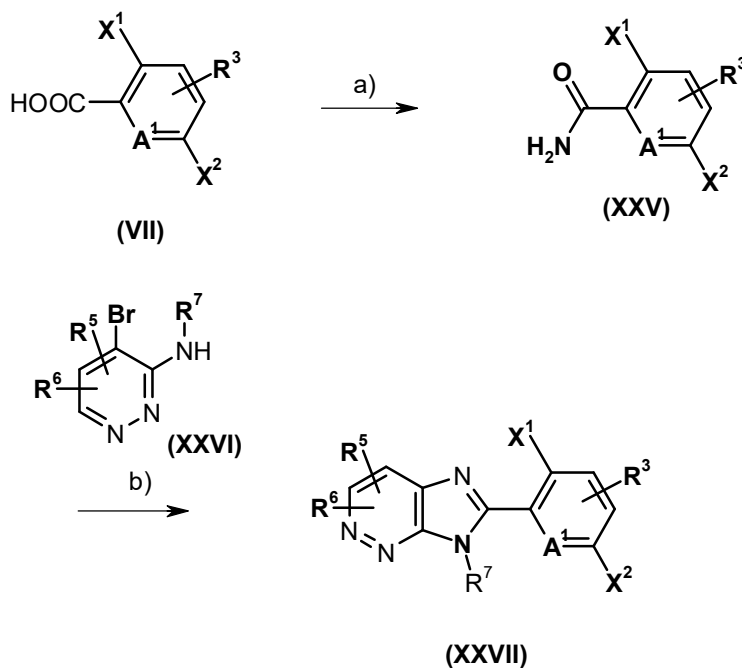
Los compuestos de la fórmula (XXIV) pueden prepararse ciclando los compuestos de la fórmula (XXII) con aminas de la fórmula (XXIII). La ciclación se efectúa, por ejemplo, en etanol, acetonitrilo o N,N-dimetilformamida por métodos conocidos en analogía a los procedimientos descritos, por ejemplo, en WO2005/66177, 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 (XXIII) están comercialmente disponibles.

La conversión adicional de compuestos de la fórmula (XXIV) en compuestos de la fórmula (I) se lleva a cabo análogamente al procedimiento A.

**Procedimiento C**

Los compuestos de la fórmula (I) donde X representa H17 pueden prepararse por métodos conocidos, por ejemplo análogamente a los procedimientos descritos en WO2014/142292.



Los restos  $A^1$ ,  $R^3$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  y  $R^7$  tienen los significados descritos anteriormente.  $X^1$  y  $X^2$  son halógeno.

**Paso a)**

Los compuestos de la fórmula (XXV) pueden prepararse en analogía al procedimiento descrito en US5374646 o Bioorganic y Medicinal Chemistry Letters 2003, 13, 1093 - 1096 haciendo reaccionar compuestos de la fórmula (VII) con una fuente de amoníaco en presencia de un agente de condensación.

Los ácidos carboxílicos de la fórmula (VII) están comercialmente disponibles o pueden prepararse por procedimientos conocidos, por ejemplo análogamente a los procedimientos descritos en US2010/234604, WO2012/61926 o Bioorganic y Medicinal Chemistry Letters, 18 (2008), 5023-5026.

La reacción de los compuestos de la fórmula (VII) con la fuente de amoníaco se lleva a cabo preferentemente en un disolvente que se selecciona de disolventes habituales que son inertes en las condiciones de reacción predominante. Se da preferencia a éteres, por ejemplo dioxano o tetrahydrofurano.

Un agente de condensación adecuado es, por ejemplo, carbonildiimidazol.

La reacción puede realizarse a presión reducida, a presión estándar o a presión elevada. Preferentemente, la reacción se lleva a cabo a presión atmosférica y temperaturas de 20 a 70°C.

**Paso b)**

Los compuestos de la fórmula (XXVII) pueden prepararse en analogía al procedimiento descrito en WO2014/142292

haciendo reaccionar los compuestos de la fórmula (XXV) con compuestos de la fórmula (XXVI) en presencia de un catalizador de paladio en medio básico.

5 Los compuestos de la fórmula (XXVI) pueden prepararse, por ejemplo, análogamente a los procedimientos descritos en WO2014/142292. Un catalizador de paladio usado puede, por ejemplo, ser [1,1'-bis-(difenílfosfina)ferrocenodichloropaldio(II)]. Frecuentemente, las bases usadas son bases inorgánicas como terc-butóxido de potasio.

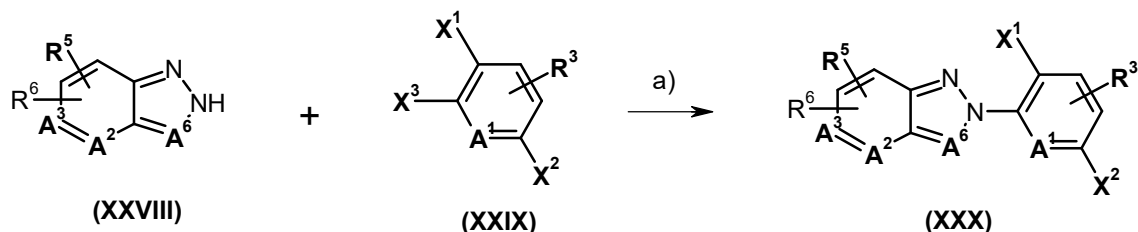
La reacción se efectúa en un disolvente. Frecuentemente, se usa tolueno.

La reacción puede realizarse a presión reducida, a presión estándar o a presión elevada. Preferentemente, la reacción se lleva a cabo a presión atmosférica y temperaturas de 20 a 110°C.

10 La conversión adicional de compuestos de la fórmula (XXVII) en compuestos de la fórmula (I) se lleva a cabo análogamente al procedimiento A.

#### Procedimiento D

15 Los compuestos de la fórmula (I) donde X representa H3, H12, H13 o H18 pueden prepararse por procedimientos conocidos, por ejemplo análogamente a los procedimientos descritos en WO2010/091310, WO 2012/66061 o WO2013/099041.



Los restos A<sup>1</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> tienen los significados descritos anteriormente. A<sup>2</sup>, A<sup>3</sup> y A<sup>6</sup> independientemente entre sí representan CH o N (donde A<sup>2</sup> y A<sup>3</sup> no pueden representar simultáneamente N). X<sup>1</sup>, X<sup>2</sup> y X<sup>3</sup> representan halógeno.

#### Paso a)

20 Los compuestos de la fórmula (XXX) pueden prepararse haciendo reaccionar compuestos de la fórmula (XXVIII) con compuestos de la fórmula (XXIX) mediante N-arilación catalizado con paladio, por ejemplo análogamente a los procedimientos descritos en Angewandte Chemie Int. Ed. 2011, 50, 8944-8947.

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

Los compuestos de la fórmula (XXIX) están comercialmente disponibles o pueden prepararse por procedimientos conocidos, por ejemplo análogamente a los procedimientos descritos en WO2013/43518, EP-A-2168965 o en Journal of Medicinal Chemistry 2003, 46, 1449 - 1455.

30 La conversión adicional de compuestos de la fórmula (XXX) en compuestos de la fórmula (I) se efectúa análogamente al procedimiento A.

#### Procedimientos y usos

35 La invención también se refiere a procedimientos para controlar plagas de animales, en los que se permiten compuestos de la fórmula (I) para actuar sobre las plagas animales y / o su hábitat. El control de las plagas de animales se lleva a cabo preferentemente en la agricultura y la silvicultura y en la protección del material. Esto excluye preferentemente procedimientos de tratamiento quirúrgico o terapéutico del cuerpo humano o animal y los procedimientos de diagnóstico realizados en el cuerpo humano o animal.

La invención se refiere además al uso de los compuestos de la fórmula (I) como pesticidas, especialmente, a los agentes de protección de cultivos.

40 En el contexto de la presente solicitud, el término "pesticida" en cada caso también siempre abarca el término "agente de protección de cultivos".

Los compuestos de la fórmula (I), dada la buena tolerancia de las plantas, toxicidad endotérmica favorable y una buena compatibilidad medioambiental, son adecuados para la protección de plantas y órganos de las plantas contra los factores de estrés bióticos y abióticos, para aumentar el rendimiento de las cosechas, para mejorar la calidad del material cosechado y para el control de plagas de animales, especialmente insectos, arácnidos, helmintos,

especialmente nematodos y moluscos, que se presentan en la agricultura, en la horticultura, en la cría de animales, en cultivos acuáticos, en los bosques, en jardines e instalaciones de esparcimiento, en la protección de productos y materiales almacenados, y en el sector de la higiene.

5 En el contexto de la presente solicitud de patente, debería entenderse que el término "higiene" significa cualquiera y todas las medidas, disposiciones y procedimientos que tienen como objetivo prevenir enfermedades, especialmente enfermedades infecciosas, y que sirven para proteger la salud de los seres humanos y los animales y/o para proteger el medio ambiente, y/o que mantienen la limpieza. De acuerdo con la invención, ésta incluye especialmente medidas de limpieza, desinfección y esterilización, por ejemplo, de textiles o superficies duras, especialmente superficies de  
10 vidrio, madera, hormigón, porcelana, cerámica, plástico o también de metal(es), y para asegurar que éstas se mantengan exentas de plagas de higiene y/o sus heces. El alcance de la protección de la invención en este respecto excluye preferentemente procedimientos de tratamiento quirúrgico o terapéutico aplicados al cuerpo humano o al de los animales y los procedimientos de diagnóstico que se llevan a cabo en el cuerpo humano o en el de los animales.

15 El término "sector de la higiene" cubre todas las áreas, campos técnicos y aplicaciones industriales en las que estas medidas de higiene, disposiciones y procedimientos son importantes, por ejemplo respecto a la higiene en las cocinas, panaderías, aeropuertos, baños, piscinas, tiendas de departamento, hoteles, hospitales, establos, custodia de animales, etc.

20 Por lo tanto, debe entenderse que el término "plaga de la higiene" significa una o más plagas de animales cuya presencia en el sector de la higiene es problemática, especialmente por razones sanitarias. Un objetivo principal es por lo tanto evitar, o limitar a un grado mínimo, la presencia de plagas de higiene y/o la exposición a estas en el sector de higiene. Esto puede lograrse especialmente mediante el uso de un pesticida que puede usarse tanto para la prevención de infecciones como para la prevención de una infección existente. También es posible usar formulaciones que evitan o reducen la exposición a plagas. Plagas de higiene incluyen, por ejemplo, los organismos mencionados a continuación.

25 El término "protección de higiene" cubre por lo tanto todos los actos por los cuales estas medidas de higiene, disposiciones y procedimientos se mantienen y/o mejoran.

Los compuestos de la fórmula (I) pueden utilizarse preferentemente como pesticidas. Son activos frente a especies normalmente sensibles y resistentes y también contra todos o algunos estadios de desarrollo. Las plagas antemencionadas incluyen:

30 plagas del filo de Arthropoda, en particular 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 hicoriae*, *Epitrimerus pyri*, *Eutetranychus* spp., por ejemplo *Eutetranychus banksi*,  
35 *Eriophyes* spp., por ejemplo *Eriophyes pyri*, *Glycyphagus domesticus*, *Halotydeus destructor*, *Hemitarsonemus* spp., por ejemplo *Hemitarsonemus latus* (=Polyphagotarsonemus latus), *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Latrodectus* spp., *Loxosceles* spp., *Neutrombicula autumnalis*, *Nuphessa* spp., *Oligonychus* spp., por ejemplo *Oligonychus coffeae*, *Oligonychus coniferarum*, *Oligonychus ilicis*, *Oligonychus indicus*, *Oligonychus mangiferus*, *Oligonychus pratensis*, *Oligonychus punicae*, *Oligonychus yothersi*, *Ornithodoros* spp., *Ornithonyssus* spp., *Panonychus* spp.,  
40 por ejemplo *Panonychus citri* (=Metatetranychus citri), *Panonychus ulmi* (=Metatetranychus ulmi), *Phyllocoptruta oleivora*, *Platytranychus multidigituli*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psoroptes* spp., *Rhipicephalus* spp., *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., *Scorpio maurus*, *Steneotarsonemus* spp., *Steneotarsonemus spinki*, *Tarsonemus* spp., por ejemplo *Tarsonemus confusus*, *Tarsonemus pallidus*, *Tetranychus* spp., por ejemplo *Tetranychus canadensis*, *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus 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*;

50 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*, *Panchlora* spp., *Parcoblatta* spp., *Periplaneta* spp., por ejemplo *Periplaneta americana*, *Periplaneta australasiae*, *Pycnoscelus surinamensis*, *Supella longipalpa*;

55 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*, *Ceutorrhynchus* spp., por ejemplo *Ceutorrhynchus assimilis*, *Ceutorrhynchus quadridens*, *Ceutorrhynchus rapae*, *Chaetocnema* spp., por ejemplo *Chaetocnema confinis*, *Chaetocnema denticulata*, *Chaetocnema ectypa*, *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp., por ejemplo *Cosmopolites sordidus*, *Costelytra zealandica*, *Ctenicera* spp., *Curculio* spp., por ejemplo *Curculio caryae*, *Curculio caryatrypes*, *Curculio obtusus*, *Curculio sayi*, *Cryptolestes ferrugineus*, *Cryptolestes pusillus*, *Cryptorhynchus lapathi*, *Cryptorhynchus mangiferae*, *Cylindrocopturus* spp., *Cylindrocopturus adpersus*, *Cylindrocopturus furnissi*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., por ejemplo *Diabrotica balteata*, *Diabrotica barberi*, *Diabrotica undecimpunctata howardi*, *Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata*, *Diabrotica virgifera virgifera*, *Diabrotica virgifera zeae*, *Dichocrocis* spp., *Dicladisma armigera*, *Diloboderus* spp., *Epicaerus* spp., *Epilachna* spp., por ejemplo *Epilachna borealis*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix* spp., por ejemplo *Epitrix cucumeris*, *Epitrix fuscata*, *Epitrix hirtipennis*, *Epitrix subcrinita*, *Epitrix tuberis*, *Faustinus* spp., *Gibbium psylloides*, *Gnathocerus cornutus*, *Hellula undalis*, *Heteronychus arator*, *Heteronyx* spp., *Hylamorphia elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypomeces squamosus*, *Hypothenemus* spp., por ejemplo *Hypothenemus hampei*, *Hypothenemus obscurus*, *Hypothenemus pubescens*, *Lachnosterna consanguinea*, *Lasioderma serricornis*, *Latheticus oryzae*, *Lathridius* spp., *Lema* spp., *Leptinotarsa decemlineata*, *Leucoptera* spp., por ejemplo *Leucoptera coffeella*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Listronotus (=Hyperodes)* spp., *Lixus* spp., *Luperodes* spp., *Luperomorpha xanthodera*, *Lyctus* spp., *Megascelis* spp., *Melanotus* spp., por ejemplo *Melanotus longulus oregonensis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha* spp., por ejemplo *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp., *Naupactus xanthographus*, *Necrobia* spp., *Neogalerucella* spp., *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Oryzaphagus oryzae*, *Otiorhynchus* spp., por ejemplo *Otiorhynchus cribricollis*, *Otiorhynchus ligustici*, *Otiorhynchus ovatus*, *Otiorhynchus rugosostriatus*, *Otiorhynchus sulcatus*, *Oulema* spp., por ejemplo *Oulema melanopus*, *Oulema oryzae*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllophaga* spp., *Phyllophaga helleri*, *Phyllotreta* spp., por ejemplo *Phyllotreta armoraciae*, *Phyllotreta pusilla*, *Phyllotreta ramosa*, *Phyllotreta striolata*, *Popillia japonica*, *Premnotrypes* spp., *Prostephanus truncatus*, *Psylliodes* spp., por ejemplo *Psylliodes affinis*, *Psylliodes chrysocephala*, *Psylliodes punctulata*, *Ptinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizophora dominica*, *Rhynchophorus* spp., *Rhynchophorus ferrugineus*, *Rhynchophorus palmarum*, *Sinoxylon perforans*, *Sitophilus* spp., por ejemplo *Sitophilus granarius*, *Sitophilus linearis*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Sphenophorus* spp., *Stegobium paniceum*, *Sternechus* spp., por ejemplo *Sternechus paludatus*, *Symphyletes* spp., *Tanymecus* spp., por ejemplo *Tanymecus dilaticollis*, *Tanymecus indicus*, *Tanymecus palliatus*, *Tenebrio molitor*, *Tenebrioides mauretanicus*, *Tribolium* spp., por ejemplo *Tribolium audax*, *Tribolium castaneum*, *Tribolium confusum*, *Trogoderma* spp., *Tychius* spp., *Xylotrechus* spp., *Zabrus* spp., por ejemplo *Zabrus tenebrioides*;

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

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

del orden de Hemiptera por ejemplo *Acizzia acaciaebaileyanae*, *Acizzia dodonaeae*, *Acizzia uncatoides*, *Acrida turrita*, *Acyrtosiphon* spp., por ejemplo *Acyrtosiphon pisum*, *Acrogonia* spp., *Aeneolamia* spp., *Agonoscena* spp., *Aleurocanthus* spp., *Aleyrodes proletella*, *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus floccosus*, *Allocaudata 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 *Aphis citricola*, *Aphis craccivora*, *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis glycines*, *Aphis gossypii*, *Aphis hederiae*, *Aphis illinoisensis*, *Aphis middletoni*, *Aphis nasturtii*, *Aphis nerii*, *Aphis pomi*, *Aphis spiraeicola*, *Aphis viburniphila*, *Arboridia apicalis*, *Arytainilla* spp., *Aspidiella* spp., *Aspidiotus* spp., por ejemplo *Aspidiotus nerii*, *Atanus* spp., *Aulacorthum solani*, *Bemisia tabaci*, *Blastopsylla occidentalis*, *Boreioglycaspis melaleucae*, *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycolus* spp., *Brevicoryne brassicae*, *Cacopsylla* spp., por ejemplo *Cacopsylla pyricola*, *Calligypona marginata*, *Capulinia* spp., *Carneoccephala fulgida*, *Ceratovacuna lanigera*, *Cercopidae*, *Ceroplastes* spp.,

- Chaetosiphon fragaefolii, Chionaspis tegalensis, Chlorita onukii, Chondracris rosea, Chromaphis juglandicola, Chrysomphalus aonidum, Chrysomphalus ficus, Cicadulina mbila, Coccoxylus halli, Coccus spp., por ejemplo Coccus hesperidum, Coccus longulus, Coccus pseudomagnoliarum, Coccus viridis, Cryptomyzus ribis, Cryptoneossa spp., Ctenarytaina spp., Dalbulus spp., Dialeurodes chittendeni, Dialeurodes citri, Diaphorina citri, Diaspis spp., Diuraphis spp., Doralis spp., Drosicha spp., Dysaphis spp., por ejemplo Dysaphis apiifolia, Dysaphis plantaginea, Dysaphis tulipae, Dysmicoccus spp., Empoasca spp., por ejemplo Empoasca abrupta, Empoasca fabae, Empoasca maligna, Empoasca solana, Empoasca stevensi, Eriosoma spp., por ejemplo Eriosoma americanum, Eriosoma lanigerum, Eriosoma pyricola, Erythroneura spp., Eucalyptolyma spp., Euphyllura spp., Euscelis bilobatus, Ferrisia spp., Fiorinia spp., Furcaspis oceanica, Geococcus coffeae, Glycaspis spp., Heteropsylla cubana, Heteropsylla spinulosa, Homalodisca coagulata, Hyalopterus arundinis, Hyalopterus pruni, Icerya spp., por ejemplo Icerya purchasi, Idiocerus spp., Idioscopus spp., Laodelphax striatellus, Lecanium spp., por ejemplo Lecanium corni (=Parthenolecanium corni), Lepidosaphes spp., por ejemplo Lepidosaphes ulmi, Lipaphis erysimi, Lopholeucaspis japonica, Lycorma delicatula, Macrosiphum spp., por ejemplo Macrosiphum euphorbiae, Macrosiphum lillii, 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., Nephrotettix spp., por ejemplo Nephrotettix cincticeps, Nephrotettix nigropictus, Nettigoniclla spectra, Nilaparvata lugens, Oncometopia spp., Orthezia praelonga, Oxya chinensis, Pachypsylla spp., Parabemisia myricae, Paratrioza spp., por ejemplo Paratrioza cockerelli, Parlatoria spp., Pemphigus spp., por ejemplo Pemphigus bursarius, Pemphigus populivenae, Peregrinus maidis, Perkinsiella spp., Phenacoccus spp., por ejemplo Phenacoccus madeirensis, Phloeomyzus passerinii, Phorodon humuli, Phylloxera spp., por ejemplo Phylloxera devastatrix, Phylloxera notabilis, Pinnaspis aspidistrae, Planococcus spp., por ejemplo Planococcus citri, Prosopidopsylla flava, Protopulvinaria pyriformis, Pseudaulacaspis pentagona, Pseudococcus spp., por ejemplo Pseudococcus calceolariae, Pseudococcus comstocki, Pseudococcus longispinus, Pseudococcus maritimus, Pseudococcus viburni, Psyllopsis spp., Psylla spp., por ejemplo Psylla buxi, Psylla mali, Psylla pyri, Pteromalus spp., Pulvinaria spp., Pyrilla spp., Quadraspidiotus spp., por ejemplo Quadraspidiotus juglansregiae, Quadraspidiotus ostreaeformis, Quadraspidiotus perniciosus, Quesada gigas, Rastrococcus spp., Rhopalosiphum spp., por ejemplo Rhopalosiphum maidis, Rhopalosiphum oxyacanthae, Rhopalosiphum padi, Rhopalosiphum rufiabdominale, Saissetia spp., por ejemplo Saissetia coffeae, Saissetia miranda, Saissetia neglecta, Saissetia oleae, Scaphoideus titanus, Schizaphis graminum, Selenaspis articulatus, Siphia flava, Sitobion avenae, Sogatata spp., Sogatella furcifera, Sogatodes spp., Stictocephala festina, Siphoninus phillyrae, Tenalaphara malayensis, Tetragonocephala spp., Tinocallis caryaefoliae, Tomaspis spp., Toxoptera spp., por ejemplo Toxoptera aurantii, Toxoptera citricidus, Trialeurodes vaporariorum, Trioza spp., por ejemplo Trioza diospyri, Typhlocyba spp., Unaspis spp., Viteus vitifolii, Zyginia 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 perseae, 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 cookei, Hoplocampa testudinea, Lasius spp., Linepithema (Iridomyrmex) 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;
- del orden de Isoptera por ejemplo Coptotermes spp., por ejemplo Coptotermes formosanus, Cornitermes cumulans, Cryptotermes spp., Incisitermes spp., Kaloterms spp., Microtermes obesi, Nasutitermes spp., Odontotermes spp., Porotermes spp., Reticulitermes spp., por ejemplo Reticulitermes flavipes, Reticulitermes hesperus;
- 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 gemmatalis, Argyroplote spp., Autographa spp., Barathra brassicae, Blastodacna atra, Borbo cinnara, Bucculatrix thurberiella, Bupalus piniarius, Busseola spp., Cacoecia spp., Caloptilia theivora, Capua reticulana, Carpocapsa pomonella, Carposina niponensis, Cheimantobia brumata, Chilo spp., por ejemplo Chilo plejadellus, Chilo suppressalis, Choreutis pariana, Choristoneura spp., Chrysodeixis chalcites, Clysia ambiguella, Cnaphalocerus spp.,



- 5 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., Grapholita spp., por ejemplo Grapholita molesta, Grapholita prunivora, Hedylepta spp., Helicoverpa spp., por ejemplo Helicoverpa armigera, Helicoverpa zea, Heliothis spp., por ejemplo Heliothis virescens Hofmannophila pseudospretella, Homoeosoma spp., Homona spp., Hyponomeuta padella, Kakivoria flavofasciata, Lampides spp., Laphygma spp., Laspeyresia molesta, Leucinodes orbonalis, Leucoptera spp., por ejemplo Leucoptera coffeella, Lithocolletis spp., por ejemplo Lithocolletis blancardella, Lithophane antennata, Lobesia spp., por ejemplo Lobesia botrana, Loxagrotis albicosta, Lymantria spp., por ejemplo Lymantria dispar, Lyonetia spp., por ejemplo Lyonetia clerkella, Malacosoma neustria, Maruca testulalis, Mamestra brassicae, Melanitis leda, Mocis spp., Monopis obviella, Mythimna separata, Nemapogon cloacellus, Nymphula spp., Oiketiscus spp., Omphisa spp., Operophtera spp., Oria spp., Orthaga spp.,
- 10 Ostrinia spp., por ejemplo Ostrinia nubilalis, Panolis flammea, Parnara spp., Pectinophora spp., por ejemplo Pectinophora gossypiella, Perileucoptera spp., Phthorimaea spp., por ejemplo Phthorimaea operculella, Phyllocnistis citrella, Phyllonorycter spp., por ejemplo Phyllonorycter blancardella, Phyllonorycter crataegella, Pieris spp., por ejemplo Pieris rapae, Platynota stultana, Plodia interpunctella, Plusia spp., Plutella xylostella (=Plutella maculipennis), Prays spp., Prodenia spp., Protoparce spp., Pseudaletia spp., por ejemplo Pseudaletia unipuncta,
- 15 Pseudoplusia includens, Pyrausta nubilalis, Rachiplusia nu, Schoenobius spp., por ejemplo Schoenobius bipunctifer, Scirpophaga spp., por ejemplo Scirpophaga innotata, Scotia segetum, Sesamia spp., por ejemplo Sesamia inferens, Sparganothis spp., Spodoptera spp., por ejemplo Spodoptera eradiana, Spodoptera exigua, Spodoptera frugiperda, Spodoptera praefica, Stathmopoda spp., Stenoma spp., Stomopteryx subsecivella, Synanthedon spp., Tecia solanivora, Thaumetopoea spp., Thermesia gemmatilis, Tinea cloacella, Tinea pellionella, Tineola bisselliella, Tortrix spp., Trichophaga tapetzella, Trichoplusia spp., por ejemplo Trichoplusia ni, Tryporyza incertulas, Tuta absoluta, Virachola spp.;
- 20 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;
- 25 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.;
- del orden de Siphonaptera por ejemplo Ceratophyllus spp., Ctenocephalides spp., por ejemplo Ctenocephalides canis, Ctenocephalides felis, Pulex irritans, Tunga penetrans, Xenopsylla cheopis;
- 35 del orden de Thysanoptera por ejemplo Anaphothrips obscurus, Baliothrips biformis, Chaetanaphothrips leeuweni, Drepanothrips reuteri, Enneothrips flavens, Frankliniella spp., por ejemplo Frankliniella fusca, Frankliniella occidentalis, Frankliniella schultzei, Frankliniella tritici, Frankliniella vaccinii, Frankliniella williamsi, Haplothrips spp., Heliethrips spp., Hercinothrips femoralis, Kakothrips spp., Rhipiphorothrips cruentatus, Scirtothrips spp., Taeniothrips cardamomi, Thrips spp., por ejemplo Thrips palmi, Thrips tabaci;
- 40 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;
- plagas del filo de Mollusca, por ejemplo de la clase de Bivalvia, por ejemplo Dreissena spp.;
- 45 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 plagas vegetales del filo de Nematoda, es decir nematodos parasitarios de plantas, en particular Aglenchus spp., por ejemplo Aglenchus agricola, Anguina spp., por ejemplo Anguina tritici, Aphelenchoides spp., por ejemplo Aphelenchoides arachidis, Aphelenchoides fragariae, Belonolaimus spp., por ejemplo Belonolaimus gracilis, Belonolaimus longicaudatus, Belonolaimus nortoni, Bursaphelenchus spp., por ejemplo Bursaphelenchus cocophilus, Bursaphelenchus eremus, Bursaphelenchus xylophilus, Cacopaurus spp., por ejemplo Cacopaurus pestis, Criconemella spp., por ejemplo Criconemella curvata, Criconemella onoensis, Criconemella ornata, Criconemella rusium, Criconemella xenoplax (= Mesocriconema xenoplax), Criconemoides spp., por ejemplo Criconemoides ferniae, Criconemoides onoense, Criconemoides ornatum, Ditylenchus spp., por ejemplo Ditylenchus dipsaci, Dolichodorus spp., Globodera spp., por ejemplo Globodera pallida, Globodera rostochiensis, Helicotylenchus spp., por ejemplo Helicotylenchus dihystra, Hemicrotonemoides spp., Hemicyclophora spp., Heterodera spp., por ejemplo Heterodera avenae, Heterodera glycines, Heterodera schachtii, Hirschmaniella spp.,
- 55

Hoplolaimus spp., Longidorus spp., por ejemplo Longidorus africanus, Meloidogyne spp., por ejemplo Meloidogyne chitwoodi, Meloidogyne fallax, Meloidogyne hapla, Meloidogyne incognita, Meloinema spp., Nacobbus spp., Neotylenchus spp., Paralongidorus spp., Paraphelenchus spp., Paratrichodorus spp., por ejemplo Paratrichodorus minor, Paratylenchus spp., Pratylenchus spp., por ejemplo Pratylenchus penetrans, Pseudohalenchus spp., Psilenchus spp., Punctodera spp., Quinisulcius spp., Radopholus spp., por ejemplo Radopholus citrophilus, Radopholus similis, Rotylenchulus spp., Rotylenchus spp., Scutellonema spp., Subanguina spp., Trichodorus spp., por ejemplo Trichodorus obtusus, Trichodorus primitivus, Tylenchorhynchus spp., por ejemplo Tylenchorhynchus annulatus, Tylenchulus spp., por ejemplo Tylenchulus semipenetrans, Xiphinema spp., por ejemplo Xiphinema index.

Los compuestos de la fórmula (I) también pueden utilizarse, opcionalmente, a determinadas concentraciones o cantidades de aplicación, como herbicidas, protectores, reguladores del crecimiento o agentes para mejorar las propiedades de las plantas, como microbicidas o gametocidas, por ejemplo como fungicidas, antimicóticos, bactericidas, virucidas (incluidos agentes contra viroides) o como agentes contra MLO (organismos similares a micoplasmas) y RLO (organismos similares a rickettsia). También se pueden utilizar, según el caso, como intermedios o precursores para la síntesis de otros principios 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 remojo, goteo y pulverización, que comprenden al menos un compuesto de la fórmula (I). Opcionalmente, las formas de uso comprenden además pesticidas y/o adyuvantes que mejoran la acción, como penetrantes, por ejemplo aceites vegetales, por ejemplo aceite de colza, aceite de girasol, aceites minerales, por ejemplo aceites 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 difusores, por ejemplo alquilsiloxanos y/o sales, por ejemplo sales de amonio o fosfonio orgánicas o inorgánicas, por ejemplo sulfato de amonio o diamonio hidrogenofosfato y/o promotores de retención, por ejemplo dioctil 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 de formulaciones posibles se describen, por ejemplo, en Crop Life International y en Pesticide Specifications, Manual on development y use of FAO y WHO specifications for pesticides, FAO Plant Production y Protection Papers – 173, preparado por FAO/WHO Joint Meeting on Pesticide Specifications, 2004, ISBN: 9251048576. Las formulaciones, además de uno o más compuestos de la fórmula (I), comprenden opcionalmente otros principios activos agroquímicos.

Se le da preferencia a formulaciones o formas de uso que comprenden auxiliares, por ejemplo extensores, disolventes, promotores de espontaneidad, portadores, emulsionantes, dispersantes, agentes protectores contra heladas, biocidas, espesantes y/o otros auxiliares, por ejemplo adyuvantes. Un adyuvante en este contexto es un componente que potencia el efecto biológico de la formulación, sin tener el propio componente ningún efecto biológico. Ejemplos de adyuvantes son agentes que promueven la retención, diseminación, unión de la superficie de la hoja o penetración.

Estas formulaciones se producen de un modo conocido, por ejemplo mezclando los compuestos de la fórmula (I) con auxiliares, por ejemplo, extensores, disolventes y/o portadores sólidos y/u otros auxiliares, por ejemplo, tensioactivos. Las formulaciones se producen ya sea en instalaciones adecuadas o de otro modo antes o durante la aplicación.

Los auxiliares usados pueden ser sustancias adecuadas para impartir propiedades especiales, como determinadas propiedades físicas, técnicas y/o biológicas, a la formulación de los compuestos de la fórmula (I), o a las formas de uso preparadas a partir de estas formulaciones (por ejemplo pesticidas listos para usar como licores de pulverización o productos de tratamiento de semillas).

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 (como parafinas, alquilbencenos, alquilnaftalenos, clorobencenos), los alcoholes y polioles (que, de ser adecuado, se pueden también sustituir, esterificar y/o esterificar), las cetonas (como acetona, ciclohexanona), ésteres (incluyendo grasas y aceites) y poli(éteres), las aminas simples y sustituidas, amidas, lactamas (como N-alkilpirrolidonas) y lactonas, las sulfonas y sulfóxidos (como dimetilsulfóxido).

Si el extensor utilizado es agua, también es posible usar, por ejemplo, disolventes orgánicos como disolventes auxiliares. Los disolventes líquidos útiles son esencialmente: aromáticos como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, hidrocarburos aromáticos clorinados o alifáticos clorinados como clorobencenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos como ciclohexano o parafinas, por ejemplo fracciones de aceite mineral, aceites minerales y vegetales, alcoholes como butanol o glicol o sus éteres y ésteres, cetonas como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona o ciclohexanona, disolventes fuertemente polares como dimetilformamida y dimetilsulfóxido, y también agua.

En principio, es posible usar todos los disolventes adecuados. Ejemplos de disolventes adecuados son hidrocarburos aromáticos, por ejemplo xileno, tolueno o alquilnaftalenos, hidrocarburos aromáticos clorinados o alifáticos clorinados, por ejemplo clorobenceno, cloroetileno o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos, por ejemplo ciclohexano,

parafinas, fracciones de petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoholes por ejemplo metanol, etanol, isopropanol, butanol o glicol y sus éteres y ésteres, cetonas por ejemplo acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona o ciclohexanona, disolventes fuertemente polares, por ejemplo dimetilsulfóxido, y agua.

5 En principio, es posible usar todos los portadores adecuados. Portadores útiles incluyen especialmente, por ejemplo, sales de amonio y piedras naturales y finamente molidas, como caolines, alúminas, talco, tiza, cuarzo, atapulgita, montmorillonita o tierra diatomácea, y piedras sintéticas y finamente molidas, como sílice muy disperso, óxido de aluminio y silicatos naturales o sintéticos, resinas, ceras y/o fertilizantes sólidos. Del mismo modo es posible usar mezclas de tales portadores. Portadores adecuados para gránulos incluyen: por ejemplo rocas naturales fraccionadas y rotas como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita, y gránulos sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas, y también gránulos de material orgánico como aserrín, papel, cáscaras de coco, mazorca de maíz y tallo de tabaco.

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

15 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 policarílico, sales de ácido lignosulfónico, sales de ácido fenolsulfónico o ácido naftalenosulfónico, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o con ácidos grasos o con aminas grasas, con fenoles sustituidos (preferentemente alquilfenoles o arilfenoles), sales de ésteres sulfosuccínicos, derivados de taurina (preferentemente tauratos de alquilo), ésteres fosfóricos de alcoholes o fenoles polietoxilados, ésteres de ácidos grasos de polioles, y derivados de los compuestos que contienen sulfatos, sulfonatos y fosfatos, por ejemplo alquilaril poliglicol éteres, alquilsulfonatos, alquil sulfatos, arilsulfonatos, hidrolisatos de proteína, licores de residuo de lignosulfito y metilcelulosa. La presencia de un tensioactivo es ventajosa si uno de los compuestos de la fórmula (I) y/o uno de los portadores inertes es insoluble en agua y cuando la aplicación se realiza en agua.

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

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

35 Asimismo, las formulaciones y las formas de uso derivadas de estas pueden también comprender, como auxiliares adicionales, adhesivos como carboximetilcelulosa y polímeros naturales y sintéticos en forma de polvos, gránulos o redes, como goma arábiga, polivinil alcohol y polivinil acetato, o fosfolípidos naturales como cefalinas y lecitinas y fosfolípidos sintéticos. Otros auxiliares pueden ser aceites minerales y vegetales.

40 Es posible de ser adecuado que otros auxiliares estén presentes en las formulaciones y las formas de uso derivadas de estas. Ejemplos de tales aditivos son fragancias, coloides protectores, aglutinantes, adhesivos, espesantes, agentes tixotrópicos, penetrantes, promotores de retención, estabilizantes, secuestrantes, agentes formadores de complejos, humectantes, difusores. En general, los compuestos de la fórmula (I) se pueden combinar con cualquier aditivo sólido o líquido usado comúnmente a efectos de la formulación.

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

45 Los penetrantes útiles en el presente contexto son todas las sustancias que se usan típicamente para mejorar la penetración de principios activos agroquímicos en las plantas. Los penetrantes se definen en este contexto por su capacidad de penetrar del licor de aplicación (generalmente acuoso) y/o del recubrimiento por pulverización en la cutícula de la planta y así aumentar la movilidad de los principios activos en la cutícula.

50 El procedimiento descrito en la bibliografía (Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152) puede usarse para determinar esta propiedad. Ejemplos incluyen alcohol alcoxilatos como etoxilato graso de coco (10) o etoxilato de isotridecilo (12), ésteres de ácidos grasos, por ejemplo metil éster de aceite de colza o metil éster de aceite de soja, alcoxilatos de amina grasos, por ejemplo etoxilato seboamina (15), o sales de amonio y/o fosfonio, por ejemplo sulfato de amonio o diamonio hidrogenofosfato.

Las formulaciones preferentemente comprenden entre 0,0000001% y 98% en peso del compuesto de la fórmula (I), más preferentemente entre 0,01% y 95% en peso del compuesto de la fórmula (I), más preferentemente entre 0,5% y 90% en peso del compuesto de la fórmula (I), en función del peso de la formulación.

55 El contenido del compuesto de la fórmula (I) en las formas de uso preparadas a partir de las formulaciones (en particular pesticidas) pueden variar dentro de intervalos amplios. La concentración del compuesto de la fórmula (I) en

las formas de uso puede estar típicamente entre 0,00000001% y 95% en peso del compuesto de la fórmula (I), preferentemente entre 0,00001% y 1% en peso, en función del peso de la forma de uso. La aplicación se lleva a cabo de forma habitual y adecuada para las formas de uso.

### Mezclas

- 5 Los compuestos de la fórmula (I) pueden también emplearse en una mezcla con uno o más fungicidas, bactericidas, acaricidas, molusquicidas, nematocidas, insecticidas, agentes microbiológicos, organismos beneficiosos, herbicidas, fertilizantes, repelentes de aves, fitotónicos, esterilizantes, protectores, semioquímicos y/o reguladores de crecimiento de plantas adecuados, para, por ejemplo, ampliar el espectro de acción, prolongar el período de acción, potenciar la tasa de acción, evitar repelencia o evitar la evolución de la resistencia. Asimismo, las combinaciones de principios activos de este tipo pueden mejorar el crecimiento de las plantas y/o tolerancia a factores abióticos, por ejemplo temperaturas altas o bajas, sequías o elevado contenido de agua o salinidad del suelo. También es posible mejorar el rendimiento de la floración y la fructificación, optimizar la capacidad de germinación y desarrollo de las raíces, facilitar la cosecha y mejorar rendimientos, influir en la maduración, mejorar la calidad y/o el valor nutricional de los productos cosechados, prolongar la vida del almacenamiento y/o mejorar la procesabilidad de los productos cosechados.
- 10
- 15 Asimismo, los compuestos de la fórmula (I) pueden estar presentes en una mezcla con otros principios activos o semioquímicos como atrayentes y/o repelentes de aves y/o activadores de plantas y/o reguladores del crecimiento y/o fertilizantes. Del mismo modo, los compuestos de la fórmula (I) pueden usarse para mejorar las propiedades de las plantas, por ejemplo crecimiento, rendimiento y calidad del material cosechado.

- 20 En una forma de realización particular de acuerdo con la invención, los compuestos de la fórmula (I) están presentes en las formulaciones o las formas de uso preparadas a partir de estas formulaciones en una mezcla con otros compuestos, preferentemente aquellos según se describe más adelante.

- 25 Si uno de los compuestos mencionados a continuación puede ocurrir en formas tautoméricas diferentes, estas formas también se incluyen incluso si no se mencionan explícitamente en cada caso. Todos los componentes de mezcla mencionados, según el caso, pueden también formar sales con bases o ácidos adecuados si son capaces de hacerlo sobre la base de sus grupos funcionales.

### Insecticidas/acaricidas/nematocidas

- 30 Los principios activos especificados en la presente por sus nombres comunes se conocen y describen por ejemplo en "The Pesticide Manual" 16ª ed., British Crop Protection Council 2012, o se pueden encontrar en Internet (por ejemplo, <http://www.alanwood.net/pesticides>). La clasificación se basa en IRAC Mode of Action Classification Scheme aplicable al momento de presentar esta solicitud de patente.

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

- 40 (2) Bloqueadores del canal de cloruro controlado con GABA, por ejemplo, ciclodieno-organocloros, por ejemplo clordano y endosulfan o fenilpirazoles (fiproles), por ejemplo etiprol y fipronil.

- 45 (3) Moduladores del canal de sodio, por ejemplo piretroides, por ejemplo acrinatrina, aletrina, d-cis-trans aletrina, d-trans aletrina, bifentrina, bioaletrina, isómero de bioaletrina S-ciclopentenilo, bioresmetrina, cicloprotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cialotrina, lambda-cialotrina, gamma-cialotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, beta-cipermetrina, theta-cipermetrina, zeta-cipermetrina, cifenotrina [(1R)-trans-isómero], deltametrina, empentrina [(EZ)-(1R)-isómero], esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flumetrina, tau-fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, kadetrina, momfluorotrina, permetrina, fenotrina [(1R)-trans-isómero], praletrina, piretrinas (piretrum), resmetrina, silafluofen, teflutrina, tetrametrina, tetrametrina [(1R) isómero]], tralometrina y transflutrina o DDT o metoxiclor.
- 50

- (4) Moduladores competitivos del receptor acetilcolina nicotínico (nAChR), por ejemplo, neonicotinoides, por ejemplo acetamiprid, clotianidina, dinotefuran, imidacloprid, nitenpiram, tiacloprid y tiametoxam o nicotina o sulfoxaflor o flupiradifurona.

- 55 (5) Moduladores alostéricos del receptor acetilcolina nicotínico (nAChR) por ejemplo, espinosinas, por ejemplo espinetoram y espinosad.

- (6) Moduladores alostéricos del canal de cloruro controlados por glutamato (GluCl), por ejemplo, avermectinas/milbemicinas, por ejemplo abamectina, emamectina benzoato, lepimectina y milbemectina.
- (7) Miméticos de la hormona juvenil, por ejemplo, análogos de la hormona juvenil, por ejemplo hidropreno, kinopreno y metopreno o fenoxicarb o piriproxifen.
- 5 (8) Inhibidores no específicos diversos (multisitio), por ejemplo alquil haluros, por ejemplo metil bromuro y otros alquil haluros; o cloropicrina o sulfúrico fluoruro o bórax o tártaro emético o generador de metil isocianato, por ejemplo diazomet y metam.
- (9) Moduladores de órganos cordotoniales, por ejemplo pimetrozina o flonicamida.
- (10) Inhibidores del crecimiento de ácaros, por ejemplo clofentezina, hexitiazox y diflovidazin o etoxazol.
- 10 (11) Disruptores microbianos de la membrana del intestino medio 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 planta *B.t.*: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry1A.105, Cry2Ab, VIP3A, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34Ab1/35Ab1.
- 15 (12) Inhibidores de ATP sintasa mitocondrial, como disruptores de ATP, por ejemplo, compuestos de diafentiuron u organoestánicos, por ejemplo óxido de azociclotina, cihexatina y fenbutatina o propargita o tetradifon.
- (13) Desacopladores de fosforilación oxidativa por interrupción del gradiente de protones, por ejemplo clorfenapir, DNOC y sulfluramid.
- (14) Bloqueadores del canal del receptor de acetilcolina nicotérgica por ejemplo, bensultap, cartap clorhidrato, tiocilam, y tiosultap-sodio.
- 20 (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 buprofezina.
- (17) Alteradores de muda (especialmente en el caso de Diptera), por ejemplo ciromazina.
- (18) Agonistas del receptor de ecdisona por ejemplo cromafenoizida, halofenoizida, metoxifenoizida y tebufenoizida.
- 25 (19) Agonistas del receptor de octopamina, por ejemplo amitraz.
- (20) Inhibidores del transporte de electrones de complejo III mitocondriano, por ejemplo hidrametilnon o acequinocilo o fluacripirim.
- (21) Inhibidores del transporte de electrones complejo I mitocondriano, por ejemplo acaricidas METI, por ejemplo fenazaquina, fenpiroximato, pirimidifen, piridaben, tebufenpirad y tolfenpirad o rotenona (Derris).
- 30 (22) Bloqueadores del canal de sodio dependientes del voltaje, por ejemplo indoxacarb o metaflumizona.
- (23) Inhibidores de acetil CoA carboxilasa, por ejemplo derivados de ácidos tetrónicos y tetrámicos, por ejemplo espirodiclofeno, espiromesifeno y spirotetramat.
- 35 (24) Inhibidores del transporte de electrones del complejo IV mitocondrial, por ejemplo fosfinas, por ejemplo fosfuro de aluminio, fosfuro de calcio, fosfina y fosfuro de zinc, o cianuros, cianuro de calcio, cianuro de potasio y cianuro de sodio.
- (25) Inhibidores del transporte de electrones del complejo II mitocondrial, por ejemplo derivados de beta-ceto nitrilo, por ejemplo cienopirafen y ciflumetofen y carboxanilida, por ejemplo piflubumida.
- (28) Moduladores del receptor de rianodina, por ejemplo diamidas, por ejemplo clorantraniliprol, ciantraniliprol y flubendiamida,
- 40 otros principios activos por ejemplo, afidopiropen, afoxolaner, azadiractina, benclotiaz, benzoximato, bifenazato, broflanilida, bromopropilato, quinometionat, cloropraletina, criolito, ciclaniliprol, cicloxaprid, cihalodiamida, dicloromezotiaz, dicofol, epsilon metoflutrina, epsilon momflutrina, flometoquina, fluazaindolizina, fluensulfona, flufenerim, flufenoxistrobin, flufiprol, fluhexafon, fluopiram, fluralaner, fluxametamida, fufenoizida, guadipir, heptaflutrina, imidaclotiz, iprodiona, kappa-bifentrina, kappa-teflutrina, lotilaner, meperflutrina, paichongding, piridalilo,
- 45 pirifluquinazon, piriminostrobina, espirobudiclofen, tetrametilflutrina, traniliprol, tetraclorantraniliprol, tioazafen, tiofluoximato, triflumezopirim y yodometano; asimismo preparaciones basadas en *Bacillus firmus* (I-1582, BioNeem, Votivo), y los siguientes compuestos: 1-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil}-3-(trifluorometil)-1H-1,2,4-triazolo-5-amina (conocido del documento WO2006/043635) (CAS 885026-50-6), {1'-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]-5-fluoro-espiro[indol-3,4'-piperidina]-1(2H)-il]}(2-cloropiridin-4-il)metanona (conocido del documento

WO2003/106457) (CAS 637360-23-7), 2-cloro-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]piperidin-4-il}-4-(trifluorometil)fenil]isonicotinamida (conocido del documento WO2006/003494) (CAS 872999-66-1), 3-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-4-hidroxi-8-metoxi-1,8-diazaespiro[4.5]dec-3-en-2-ona (conocido del documento WO 2010052161) (CAS 1225292-17-0), 3-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1,8-diazaespiro[4.5]dec-3-en-4-il etil carbonato (conocido de EP 2647626) (CAS-1440516-42-6), 4-(but-2-in-1-iloxi)-6-(3,5-dimetilpiperidin-1-il)-5-fluoropirimidina (conocido del documento WO2004/099160) (CAS 792914-58-0), PF1364 (conocido de JP2010/018586) (n.º de reg. de CAS 1204776-60-2), N-[(2E)-1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]piridin-2(1H)-ilideno]-2,2,2-trifluoroacetamida (conocido del documento WO2012/029672) (CAS 1363400-41-2), (3E)-3-[1-[(6-cloro-3-piridinil)metil]-2-piridilideno]-1,1,1-trifluoropropan-2-ona (conocido del documento WO2013/144213) (CAS 1461743-15-6), N-[3-(bencilcarbamoil)-4-clorofenil]-1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazolo-5-carboxamida (conocido del documento WO2010/051926) (CAS 1226889-14-0), 5-bromo-4-cloro-N-[4-cloro-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-2-(3-cloro-2-piridinil)pirazolo-3-carboxamida (conocido de CN103232431) (CAS 1449220-44-3), 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-metil-N-(cis-1-oxido-3-tietanil)benzamida, 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-metil-N-(trans-1-oxido-3-tietanil)benzamida y 4-[(5S)-5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-metil-N-(cis-1-oxido-3-tietanil)benzamida (conocido del documento WO 2013/050317 A1) (CAS 1332628-83-7), N-[3-cloro-1-(3-piridinil)-1H-pirazol-4-il]-N-etil-3-[(3,3,3-trifluoropropil)sulfonil]propanamida, (+)-N-[3-cloro-1-(3-piridinil)-1H-pirazol-4-il]-N-etil-3-[(3,3,3-trifluoropropil)sulfonil]propanamida y (-)-N-[3-cloro-1-(3-piridinil)-1H-pirazol-4-il]-N-etil-3-[(3,3,3-trifluoropropil)sulfonil]propanamida (conocido del documento WO 2013/162715 A2, WO 2013/162716 A2, US 2014/0213448 A1) (CAS 1477923-37-7), 5-[[[(2E)-3-cloro-2-propen-1-il]amino]-1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-4-[(trifluorometil)sulfonil]-1H-pirazolo-3-carbonitrilo (conocido de CN 101337937 A) (CAS 1105672-77-2), 3-bromo-N-[4-cloro-2-metil-6-[(metilamino)tioxometil]fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazolo-5-carboxamida, (Liudaibenjiaxuanan, conocido de CN 103109816 A) (CAS 1232543-85-9); N-[4-cloro-2-[[[(1,1-dimetiletil)amino]carbonil]-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(fluorometoxi)-1H-pirazolo-5-carboxamida (conocido del documento WO 2012/034403 A1) (CAS 1268277-22-0), N-[2-(5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-il)-4-cloro-6-metilfenil]-3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazolo-5-carboxamida (conocido del documento WO 2011/085575 A1) (CAS 1233882-22-8), 4-[3-[2,6-dicloro-4-[(3,3-dicloro-2-propen-1-il)oxi]fenoxi]propoxi]-2-metoxi-6-(trifluorometil)pirimidina (conocido de CN 101337940 A) (CAS 1108184-52-6); (2E)- y 2(Z)-2-[2-(4-cianofenil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etilideno]-N-[4-(difluorometoxi)fenil]hidrazinacarboxamida (conocido de CN 101715774 A) (CAS 1232543-85-9); ácido ciclopropanocarboxílico 3-(2,2-dicloroetenil)-2,2-dimetil-4-(1H-benzimidazol-2-il)fenil éster (conocido de CN 103524422 A) (CAS 1542271-46-4); ácido (4aS)-7-cloro-2,5-dihidro-2-[[[(metoxicarbonil)[4-[(trifluorometil)tio]fenil]amino]carbonil]indeno[1,2-e][1,3,4]oxadiazina-4a(3H)-carboxílico metil éster (conocido de CN 102391261 A) (CAS 1370358-69-2); 6-desoxi-3-O-etil-2,4-di-O-metil-1-[N-[4-[1-[4-(1,1,2,2,2-pentafluoroetoxi)fenil]-1H-1,2,4-triazolo-3-il]fenil]carbamata]-α-L-mannopiranososa (conocido de US 2014/0275503 A1) (CAS 1181213-14-8); 8-(2-ciclopropilmetoxi-4-trifluorometilfenoxi)-3-(6-trifluorometilpiridazin-3-il)-3-azabicyclo[3.2.1]octano (CAS 1253850-56-4), (8-anti)-8-(2-ciclopropilmetoxi-4-trifluorometilfenoxi)-3-(6-trifluorometilpiridazin-3-il)-3-azabicyclo[3.2.1]octano (CAS 933798-27-7), (8-sin)-8-(2-ciclopropilmetoxi-4-trifluorometilfenoxi)-3-(6-trifluorometilpiridazin-3-il)-3-azabicyclo[3.2.1]octano (conocido del documento WO 2007040280 A1, WO 2007040282 A1) (CAS 934001-66-8) y N-[3-cloro-1-(3-piridinil)-1H-pirazol-4-il]-N-etil-3-[(3,3,3-trifluoropropil)tio]propanamida (conocido del documento WO 2015/058021 A1, WO 2015/058028 A1) (CAS 1477919-27-9).

#### 40 Fungicidas

Los principios activos especificados en la presente por su nombre común se conocen y describen, por ejemplo, en "Pesticide Manual" (16ª Ed. British Crop Protection Council) o se encuentran en Internet (por ejemplo: <http://www.alanwood.net/pesticides>).

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

1) Inhibidores de la biosíntesis de ergosterol, por ejemplo (1.001) ciproconazol, (1.002) difenoconazol, (1.003) epoxiconazol, (1.004) fenhexamid, (1.005) fenpropidin, (1.006) fenpropimorph, (1.007) fenpirazamina, (1.008) fluquinconazol, (1.009) flutriafol, (1.010) imazalil, (1.011) imazalil sulfato, (1.012) ipconazol, (1.013) metconazol, (1.014) miclobutanil, (1.015) paclobutrazol, (1.016) procloraz, (1.017) propiconazol, (1.018) protioconazol, (1.019) pirisoxazol, (1.020) spiroxamina, (1.021) tebuconazol, (1.022) tetraconazol, (1.023) triadimenol, (1.024) tridemorph, (1.025) triticonazol, (1.026) (1R,2S,5S)-5-(4-clorobencil)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetil)ciclopentanol, (1.027) (1S,2R,5R)-5-(4-clorobencil)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetil)ciclopentanol, (1.028) (2R)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1R)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol (1.029) (2R)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1S)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.030) (2R)-2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1.031) (2S)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1R)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.032) (2S)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1S)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.033) (2S)-2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1.034) (R)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (1.035) (S)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (1.036) [3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (1.037) 1-(((2R,4S)-2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-4-metil-1,3-dioxolan-2-il]metil)-1H-1,2,4-triazolo, (1.038) 1-(((2S,4S)-2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-4-metil-1,3-dioxolan-2-il]metil)-1H-1,2,4-triazolo, (1.039) 1-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-

- difluorofenil]oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-il tiocianato, (1.040) 1-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil]oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-il tiocianato, (1.041) 1-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil]oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-il tiocianato, (1.042) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazolo-3-tiona, (1.043) 2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazolo-3-tiona, (1.044) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazolo-3-tiona, (1.045) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazolo-3-tiona, (1.046) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazolo-3-tiona, (1.047) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazolo-3-tiona, (1.048) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazolo-3-tiona, (1.049) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazolo-3-tiona, (1.050) 2-[1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazolo-3-tiona, (1.051) 2-[2-cloro-4-(2,4-diclorofenil]fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il]propan-2-ol, (1.052) 2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxi]fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il]butan-2-ol, (1.053) 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil]fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il]butan-2-ol, (1.054) 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil]fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il]pentan-2-ol, (1.055) 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil]fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il]propan-2-ol, (1.056) 2-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil]oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazolo-3-tiona, (1.057) 2-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil]oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazolo-3-tiona, (1.058) 2-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil]oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazolo-3-tiona, (1.059) 5-(4-clorobencil)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il]metil]ciclopentanol, (1.060) 5-(alilsulfanil)-1-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil]oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazolo, (1.061) 5-(alilsulfanil)-1-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil]oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazolo, (1.062) 5-(alilsulfanil)-1-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil]oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazolo, (1.063) N'-(2,5-dimetil-4-[[3-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi]fenil]sulfanil]fenil)-N-etil-N-metilimidoforamida, (1.064) N'-(2,5-dimetil-4-[[3-(2,2,2-trifluoroetoxi]fenil]sulfanil]fenil)-N-etil-N-metilimidoforamida, (1.065) N'-(2,5-dimetil-4-[[3-(2,2,3,3-tetrafluoropropoxi]fenil]sulfanil]fenil)-N-etil-N-metilimidoforamida, (1.066) N'-(2,5-dimetil-4-[[3-(pentafluoroetoxi]fenil]sulfanil]fenil)-N-etil-N-metilimidoforamida, (1.067) N'-(2,5-dimetil-4-[[3-[(1,1,2,2-tetrafluoroetil]sulfanil]fenoxi]fenil)-N-etil-N-metilimidoforamida, (1.068) N'-(2,5-dimetil-4-[[3-[(2,2,2-trifluoroetil]sulfanil]fenoxi]fenil)-N-etil-N-metilimidoforamida, (1.069) N'-(2,5-dimetil-4-[[3-[(2,2,3,3-tetrafluoropropil]sulfanil]fenoxi]fenil)-N-etil-N-metilimidoforamida, (1.070) N'-(2,5-dimetil-4-[[3-[(pentafluoroetil]sulfanil]fenoxi]fenil)-N-etil-N-metilimidoforamida, (1.071) N'-(2,5-dimetil-4-fenoxifenil)-N-etil-N-metilimidoforamida, (1.072) N'-(4-[[3-(difluorometoxi]fenil]sulfanil]-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidoforamida, (1.073) N'-(4-[[3-[(difluorometil]sulfanil]fenoxi]-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidoforamida, (1.074) N'-(5-bromo-6-(2,3-dihidro-1H-inden-2-iloxi)-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoforamida, (1.075) N'-(4-[[4,5-dicloro-1,3-tiazol-2-il]oxi]-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidoforamida, (1.076) N'-(5-bromo-6-[(1R)-1-(3,5-difluorofenil]etoxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoforamida, (1.077) N'-(5-bromo-6-[(1S)-1-(3,5-difluorofenil]etoxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoforamida, (1.078) N'-(5-bromo-6-[(cis-4-isopropilciclohexil]oxi)-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoforamida, (1.079) N'-(5-bromo-6-[(trans-4-isopropilciclohexil]oxi)-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoforamida, (1.080) N'-(5-bromo-6-[[1-(3,5-difluorofenil]etoxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoforamida.
- 2) Inhibidores de la cadena respiratoria en el complejo I o II, por ejemplo (2.001) benzovindiflupir, (2.002) bixafen, (2.003) boscalid, (2.004) carboxin, (2.005) fluopiram, (2.006) flutolanil, (2.007) fluxaproxad, (2.008) furametpir, (2.009) isofetamid, (2.010) isopirazam (enantiómero anti-epimérico 1R,4S,9S), (2.011) isopirazam (enantiómero anti-epimérico 1S,4R,9R), (2.012) isopirazam (racemato anti-epimérico 1RS,4SR,9SR), (2.013) isopirazam (mezcla del racemato syn-epimérico 1RS,4SR,9RS y racemato anti-epimérico 1RS,4SR,9SR), (2.014) isopirazam (enantiómero syn-epimérico 1R,4S,9R), (2.015) isopirazam (enantiómero syn-epimérico 1S,4R,9S), (2.016) isopirazam (racemato syn-epimérico 1RS,4SR,9RS), (2.017) penflufen, (2.018) pentiopirad, (2.019) pidflumetofen, (2.020) piraziflumid,
- (2.021) sedaxano, (2.022) 1,3-dimetil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.023) 1,3-dimetil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.024) 1,3-dimetil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.025) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[2-(trifluorometil]bifenil-2-il]-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.026) 2-fluoro-6-(trifluorometil)-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]benzamida, (2.027) 3-(difluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.028) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.029) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.030) 3-(difluorometil)-N-(7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.031) 3-(difluorometil)-N-[(3R)-7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.032) 3-(difluorometil)-N-[(3S)-7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.033) 5,8-difluoro-N-[2-(2-fluoro-4-[[4-(trifluorometil]piridin-2-il]oxi]fenil]etil]quinazolin-4-amina, (2.034) N-(2-ciclopentil-5-fluorobencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.035) N-(2-terc-butil-5-metilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.036) N-(2-terc-butilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.037) N-(5-cloro-2-etilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.038) N-(5-cloro-2-isopropilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.039) N-[(1R,4S)-9-(diclorometileno)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-

metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.040) N-[(1S,4R)-9-(diclorometileno)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.041) N-[1-(2,4-diclorofenil)-1-metoxipropan-2-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.042) N-[2-cloro-6-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.043) N-[3-cloro-2-fluoro-6-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.044) N-[5-cloro-2-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.045) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-N-[5-metil-2-(trifluorometil)benzyl]-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.046) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-fluoro-6-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.047) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropil-5-metilbencil)-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.048) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.049) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.050) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(5-fluoro-2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.051) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-4,5-dimetilbencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.052) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-5-fluorobencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.053) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-5-metilbencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.054) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropil-5-fluorobencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.055) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropil-5-metilbencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.056) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropilbencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida.

3) Inhibidores de la cadena respiratoria en el complejo III, por ejemplo (3.001) ametotradin, (3.002) amisulbrom, (3.003) azoxistrobin, (3.004) coumetoxistrobin, (3.005) coumoxistrobin, (3.006) ciazofamid, (3.007) dimoxistrobin, (3.008) enoxastrobin, (3.009) famoxadon, (3.010) fenamidon, (3.011) flufenoxistrobin, (3.012) fluoxastrobin, (3.013) kresoxim-metilo, (3.014) metominostrobin, (3.015) orisastrobin, (3.016) picoxistrobin, (3.017) piraclostrobin, (3.018) pirametostrobin, (3.019) piraoxistrobin, (3.020) trifloxistrobin (3.021) (2E)-2-2-[[[(1E)-1-(3-[[[E)-1-fluoro-2-fenilvinil]oxi]fneil]etilideno]amino]oxo]netil]fenil]-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida, (3.022) (2E,3Z)-5-[[1-(4-clorofenil)-1H-pirazol-3-il]oxi]-2-(metoxiimino)-N,3-dimetilpent-3-enamida, (3.023) (2R)-2-{2-[(2,5-dimetilfenoxi)metil]fenil}-2-metoxi-N-metilacetamida, (3.024) (2S)-2-2-{2-[(2,5-dimetilfenoxi)metil]fenil}-2-metoxi-N-metilacetamida, (3.025) (3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[[3-[(isobutiriloxi)metoxi]-4-metoxipiridin-2-il]carbonil]amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-il 2-metilpropanoato, (3.026) 2-{2-[(2,5-dimetilfenoxi)metil]fneil}-2-metoxi-N-metilacetamida, (3.027) N-(3-etil-3,5,5-trimetilciclohexil)-3-formamido-2-hidroxibenzamida, (3.028) (2E,3Z)-5-[[1-(4-cloro-2-fluorofenil)-1H-pirazol-3-il]oxi]-2-(metoxiimino)-N,3-dimetilpent-3-enamida.

4) Mitosis e inhibidores de división celular, por ejemplo (4.001) carbendazim, (4.002) dietofencarb, (4.003) etaboxam, (4.004) fluopicolid, (4.005) pencicuron, (4.006) tiabendazol, (4.007) tiofanato-metilo, (4.008) zoxamida, (4.009) 3-cloro-4-(2,6-difluorofenil)-6-metil-5-fenilpiridazina, (4.010) 3-cloro-5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluoroefneil)-6-metilpiidazina, (4.011) 3-cloro-5-(6-cloropiridin-3-il)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)piridazina, (4.012) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.013) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-bromo-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.014) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-bromofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.015) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-cloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.016) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-clorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.017) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.018) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.019) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2-cloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.020) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2-clorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.021) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.022) 4-(4-clorofenil)-5-(2,6-difluorofenil)-3,6-dimetilpiridazina, (4.023) N-(2-bromo-6-fluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.024) N-(2-bromofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.025) N-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina.

5) Compuestos con la capacidad de actividad de multisitio, por ejemplo (5.001) mezcla Bordeaux, (5.002) captafol, (5.003) captan, (5.004) clortalonil, (5.005) hidróxido de cobre (5.006) naffenato de cobre, (5.007) óxido de cobre, (5.008) oxiclورو de cobre, (5.009) sulfato de cobre(2+), (5.010) ditianon, (5.011) dodin, (5.012) folpet, (5.013) mancozeb, (5.014) maneb, (5.015) metiram, (5.016) metiram zinc, (5.017) oxina de cobre, (5.018) propineb, (5.019) azufre y preparaciones de azufre que incluyen polisulfuro de calcio, (5.020) tiram, (5.021) zineb, (5.022) ziram.

6) Compuestos capaces de activar una defensa de hospedador, por ejemplo (6.001) acibenzolar-S-metilo, (6.002) isotianilo, (6.003) probenazol, (6.004) tiadinil.

7) Inhibidores de la biosíntesis de aminoácidos y/o proteínas, por ejemplo (7.001) ciprodinil, (7.002) kasugamicina, (7.003) kasugamicina clorhidrato hidrato, (7.004) oxitetraciclina, (7.005) pirimetanilo, (7.006) 3-(5-fluoro-3,3,4,4-tetrametil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina.

(8) Inhibidores de la producción de ATP, por ejemplo (8.001) siltiofam.

9) Inhibidores de la síntesis de la pared celular, por ejemplo (9.001) benthiavalicarb, (9.002) dimethormorf, (9.003) flumorf, (9.004) iprovalicarb, (9.005) mandipropamid, (9.006) pirimorf, (9.007) valifenalato, (9.008) (2E)-3-(4-terc-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona, (9.009) (2Z)-3-(4-terc-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-



il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona.

10) Inhibidores de la síntesis de membrana y lípidos, por ejemplo (10.001) propamocarb, (10.002) propamocarb clorhidrato, (10.003) tolclifos-metilo.

5 11) inhibidores de la biosíntesis de melanina, por ejemplo (11.001) triciclazol, (11.002) 2,2,2-trifluoroetil {3-metil-1-[(4-metilbenzoil)amino]butan-2-il}carbamato.

12) Inhibidores de la síntesis de ácido nucleico, por ejemplo (12.001) benalaxil, (12.002) benalaxil-M (kiralaxil), (12.003) metalaxil, (12.004) metalaxil-M (mefenoxam).

13) Inhibidores de la transducción de señal, por ejemplo (13.001) fludioxonil, (13.002) iprodiona, (13.003) procimidona, (13.004) proquinazid, (13.005) quinoxifen, (13.006) vinclozolin.

10 14) Compuestos que pueden actuar como desacopladores, por ejemplo (14.001) fluazinam, (14.002) meptildinocap.

15) Compuestos adicionales, por ejemplo (15.001) ácido abscísico, (15.002) bentiazol, (15.003) betoxazina, (15.004) capsimicina, (15.005) carvona, (15.006) quinometionat, (15.007) cufraneb, (15.008) ciflufenamid, (15.009) cimoxanil, (15.010) ciprosulfamida, (15.011) flutianilo, (15.012) fosetil-aluminio, (15.013) fosetil-calcio, (15.014) fosetil-sodio, (15.015) metil isotiocianato, (15.016) metrafenon, (15.017) mildiomicina, (15.018) natamicina, (15.019) níquel dimetilditiocarbamato, (15.020) nitrotral-isopropilo, (15.021) oxamocarb, (15.022) oxatiapiprolina, (15.023) oxifentiina, (15.024) pentaclorofenol y sales, (15.025) ácido fosfónico y sales de este, (15.026) propamocarb-fosetilato, (15.027) pirofenona (clazafenona) (15.028) tebufloquina, (15.029) tecloftalam, (15.030) tolnifanida, (15.031) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, (15.032) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, (15.033) 2-(6-bencilpiperidin-2-il)quinazolina, (15.034) 2,6-dimetil-1H,5H-[1,4]ditiino[2,3-c:5,6-c']dipirrolo-1,3,5,7(2H,6H)-tetrona, (15.035) 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, (15.036) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-cloro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il]etanona, (15.037) 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, (15.038) 2-[6-(3-fluoro-4-metoxifenil)-5-metilpiperidin-2-il]quinazolina, (15.039) 2-[(5R)-3-[2-(1-[[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]-3-clorofenil metanosulfonato, (15.040) 2-[(5S)-3-[2-(1-[[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]-3-clorofenil metanosulfonato, (15.041) 2-[2-[(7,8-difluoro-2-metilquinolin-3-il)oxi]-6-fluorofenil]propan-2-ol, (15.042) 2-[2-fluoro-6-[(8-fluoro-2-metilquinolin-3-il)oxi]fenil]propan-2-ol, (15.043) 2-[3-[2-(1-[[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]-3-clorofenil metanosulfonato, (15.044) 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, (15.045) 2-fenilfenol y sales de este, (15.046) 3-(4,4,5-trifluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina, (15.047) 3-(4,4-difluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina, (15.048) 4-amino-5-fluoropirimidin-2-ol (forma tautomérica: 4-amino-5-fluoropirimidin-2(1H)-ona), (15.049) ácido 4-oxo-4-[(2-feniletil)amino]butírico, (15.050) 5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-tiol, (15.051) 5-cloro-N'-fenil-N'-(prop-2-in-1-il)tiofeno 2-sulfonohidrazida, (15.052) 5-fluoro-2-[(4-fluorobencil)oxi]pirimidin-4-amina, (15.053) 5-fluoro-2-[(4-metilbencil)oxi]pirimidin-4-amina, (15.054) 9-fluoro-2,2-dimetil-5-(quinolin-3-il)-2,3-dihidro-1,4-benzoxazepina, (15.055) but-3-in-1-ilo {6-[[[(Z)-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metileno]amino]oxi]metil]piperidin-2-il}carbamato, (15.056) (2Z)-3-amino-2-ciano-3-fenilacrilato de etilo, (15.057) ácido fenazina-1-carboxílico, (15.058) 3,4,5-trihidroxibenzoato de propilo, (15.059) quinolin-8-ol, (15.060) quinolin-8-ol sulfato (2:1), (15.061) {6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metileno]amino]oxi]metil]piperidin-2-il}carbamato de terc-butilo.

#### Pesticidas biológicos como componentes de mezcla

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

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

Los pesticidas biológicos incluyen bacterias como bacterias formadoras de esporas, bacterias colonizadoras de raíces y bacterias que actúan como insecticidas biológicos, fungicidas o nematocidas.

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

*Bacillus amyloliquefaciens*, cepa FZB42 (DSM 231179), o *Bacillus cereus*, en particular *B. cereus* cepa CNCM I-1562 o *Bacillus firmus*, cepa I-1582 (número de acceso CNCM I-1582) o *Bacillus pumilus*, en particular cepa GB34 (número de acceso ATCC 700814) y cepa QST2808 (número de acceso NRRL B-30087), o *Bacillus subtilis*, en particular cepa GB03 (número de acceso ATCC SD-1397), o *Bacillus subtilis* cepa QST713 (número de acceso NRRL B-21661) o *Bacillus subtilis* cepa OST 30002 (número de acceso NRRL B-50421), *Bacillus thuringiensis*, en particular *B. thuringiensis* subespecies *israelensis* (serotipado H-14), cepa AM65-52 (número de acceso ATCC 1276), o *B. thuringiensis subsp. aizawai*, en particular cepa ABTS-1857 (SD-1372), o *B. thuringiensis subsp. kurstaki* cepa HD-1,

o *B. thuringiensis subsp. tenebrionis* cepa NB 176 (SD-5428), *Pasteuria penetrans*, *Pasteuria spp.* (nematodo *Rotylenchulus reniformis*)-PR3 (número de 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:

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

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

- 15 *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 las plantas y la salud de las plantas. Los ejemplos incluyen:

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

Ejemplos de extractos y productos de plantas formados por microorganismos que incluyen proteínas y metabolitos secundarios que se usan o se pueden usar como pesticidas biológicos son:

- 30 *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 semilla de colza en polvo o mostaza en polvo.

#### Protectores como componentes de mezcla

- 35 Los compuestos de la fórmula (I) se pueden combinar con protectores, por ejemplo, benoxacor, cloquintocet (-mexilo), ciometrinilo, cipro sulfamida, diclormid, fenclorazol (-etilo), fenclorim, flurazol, fluxofenim, furilazol, isoxadifen (-etilo), mefenpir (-dietilo), 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

- 40 Todas las plantas y partes de plantas se pueden tratar de acuerdo con la invención. Aquí, se entiende que plantas significa todas las plantas y poblaciones de plantas, 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, patatas, remolacha azucarera, caña de azúcar, tomates, pimientos, pepinos, melones, zanahorias, sandías, cebollas, lechuga, espinaca, puerros, porotos, *Brassica oleracea* (por ejemplo, repollo) y otras especies vegetales, algodón, tabaco, semilla de colza y también plantas frutales (donde las frutas manzanas, peras, frutas cítricas y uvas). 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 están protegidas o no protegidas por derechos de cultivadores de plantas. Debe entenderse que plantas significa todas las etapas del desarrollo como semillas, plántulas, plantas jóvenes (inmaduras) hasta e incluyendo plantas maduras. Se entiende que partes de plantas significa todas las partes y órganos de las plantas por encima y debajo de la tierra, como tallo, hoja, flor y raíz, ejemplos de los cuales pueden mencionarse hojas, agujas, tallos, troncos, flores, cuerpos de frutas, frutas y semillas y también raíces, tubérculos y rizomas. Partes de plantas también incluye plantas cosechadas o partes de plantas cosechadas y material de propagación vegetativo y generativo, por ejemplo, esquejes, tubérculos, rizomas, plántulas y semillas.

El tratamiento de 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 los 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, especialmente en el caso de semillas, también aplicando una o más capas.

5 Como ya se mencionó anteriormente, es posible tratar todas las plantas y sus partes de acuerdo con la invención. En una forma de realización preferida, se tratan las especies de planta salvaje y variedades cultivadas de planta, o las obtenidas por procedimientos de cruzamiento biológico convencional, tales como cruzamiento o fusión de protoplastos, y partes de estos. En una forma de realización preferida adicional, 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. Los términos "partes" o  
10 "partes de planta" se explicaron anteriormente. Se le da particular preferencia de acuerdo con la invención a tratar plantas de los respectivos cultivares de plantas comercialmente habituales o los que están en uso. Se entiende que las variedades de plantas cultivadas son plantas que tienen nuevas propiedades ("rasgos") y que se obtuvieron por cruzamiento convencional, por mutagénesis o por técnicas de ADN recombinante. Estas pueden ser variedades cultivadas, variedades, biotipos o genotipos.

15 **Plantas transgénicas, tratamiento de semillas y eventos de integración**

Las plantas transgénicas o variedades cultivadas de plantas 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  
20 sequías o a niveles de agua o salinidad del suelo, mejor rendimiento de floración, cosecha más fácil, maduración acelerada, mayores rendimientos de cosecha, mejor calidad y/o mayor valor nutricional de los productos cosechados, mejor tiempo de 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, como insectos, arácnidos, nemátodos, ácaros, babosas y caracoles que se deben, por ejemplo, a toxinas  
25 formadas en las plantas, en particular las formadas 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 además mayor resistencia de las plantas contra hongos, bacterias y/o virus fitopatogénicos que se deben, por ejemplo, a resistencia adquirida sistémica (SAR), sistemina, fitoalexinas, provocadores y genes de resistencia y proteínas y toxinas expresadas conforme a esto, y también mayor tolerancia  
30 de las plantas a determinados compuestos herbicidamente activos, por ejemplo, imidazolinonas, sulfonilureas, glifosato o fosfotricina (por ejemplo el gen "PAT"). Los genes que imparten las propiedades deseadas ("rasgos") en cuestión pueden también estar presentes en combinación con los demás en las plantas transgénicas. Ejemplos de plantas transgénicas mencionadas incluyen las plantas de cultivo importantes, como cereales (trigo, arroz, triticale, cebada, centeno, avena), maíz, semillas de soja, patata, remolacha azucarera, caña de azúcar, tomates, frijoles y  
35 otros tipos de vegetales, algodón, tabaco, semilla de colza y también plantas frutales (donde las frutas son manzanas, peras, frutas cítricas y uvas), dando énfasis particular al maíz, semillas de soja, trigo, arroz, patatas, algodón, caña de azúcar, tabaco y semilla de colza. Las propiedades ("rasgos") que son particularmente enfatizados son la mayor resistencia de las plantas a insectos, arácnidos, nematodos y babosas y caracoles.

**Protección de cultivos – tipos de tratamiento**

40 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 goteo, pulverización, atomización, irrigación, evaporación, espolvoreo, niebla, transmisión, formación de espuma, pintada, aplicación, inyección, riego (empapado), irrigación por goteo y, en el caso de material de propagación, en particular en el caso de semillas, adicionalmente por tratamiento de semilla en seco, tratamiento de semilla líquido,  
45 tratamiento de suspensión, mediante incrustación, recubrimiento con una o más capas, etc. También es posible aplicar los compuestos de la fórmula (I) por el procedimiento de volumen ultra bajo o inyectar 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 que los compuestos de la fórmula (I) se aplican al follaje, en cuyo caso la frecuencia de tratamiento y la tasa de aplicación se deberían ajustar de acuerdo con  
50 el nivel de infestación con la plaga en cuestión.

En el caso de compuestos sistémicamente activos, los compuestos de la fórmula (I) también acceden a las plantas por el sistema radicular. Las plantas se tratan luego por 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 en el suelo o la solución de nutriente, lo que significa que el locus de la planta (por ejemplo, sistemas hidropónicos o de suelo) se impregnan con una forma líquida  
55 de los compuestos de la fórmula (I), o por aplicación en el suelo, lo 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 arrozal, esto también se puede lograr midiendo el compuesto de la fórmula (I) en una forma de aplicación sólida (por ejemplo, como gránulos) en un campo de arrozal inundado.

**Tratamiento de semillas**

El control de plagas animales por el tratamiento de la semilla de plantas se conoce hace mucho tiempo y es objeto de constantes mejoras. No obstante, el tratamiento de semillas implica una serie de problemas que no siempre puede resolverse de forma satisfactoria. Por lo tanto, se desea desarrollar procedimientos para proteger la semilla y la planta germinada que prescinda de, o al menos reduce considerablemente, la aplicación adicional de pesticidas durante el almacenamiento, después de la siembra o después de la emergencia de las plantas. También se desea optimizar la cantidad de principio activo usado de forma de proveer la mejor protección posible para las semillas y la planta de germinación contra el ataque de plagas animales, pero sin dañar la planta en sí misma por el principio activo usado. En particular, los procedimientos para el tratamiento de semillas también deberían considerar las propiedades insecticidas o nematicidas intrínsecas de plantas transgénicas resistentes o tolerantes a las plagas para lograr la protección óptima de la semilla y también la planta germinada con un mínimo gasto en pesticidas.

La presente invención por lo tanto en particular también se refiere a un procedimiento para la protección de las plantas de germinación y semillas del ataque por plagas, tratando la semilla con uno de los compuestos de la fórmula (I). El procedimiento de acuerdo con la invención para proteger las plantas de germinación y semillas contra el ataque por plagas comprende además un procedimiento donde la semilla se trata simultáneamente en una operación o secuencialmente con un compuesto de la fórmula (I) y un componente de mezcla. También comprende un procedimiento donde la semilla se trata en momentos diferentes con un compuesto de la fórmula (I) y un componente de mezcla.

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

La invención también se refiere a la semilla que se trató con un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la invención para la protección de plagas animales. La invención también se refiere a la semilla que se trató simultáneamente con un compuesto de la fórmula (I) y un componente de mezcla. La invención también se refiere a la semilla que se trató en momentos diferentes con un compuesto de la fórmula (I) y un componente de mezcla. En el caso de semillas que se trataron en diferentes momentos 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 componentes de mezcla pueden separarse opcionalmente por una capa intermedia. La invención también se refiere a la semilla donde 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 de un recubrimiento.

La invención se refiere además a la semilla que, después del tratamiento con un compuesto de la fórmula (I), se somete a un procedimiento de recubrimiento de película para evitar la abrasión con polvo sobre la semilla.

Una de las ventajas que ocurren cuando un compuesto de la fórmula (I) actúa sistémicamente es que el tratamiento de la semilla protege no solo la propia semilla sino también las plantas que resultan de esta, después de la emergencia, contra plagas animales. De este modo, se puede prescindir del tratamiento intermedio del cultivo al momento de la siembra o poco después.

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

Del mismo modo se considera ventajoso que los compuestos de la fórmula (I) puedan también ser especialmente útiles para semillas transgénicas.

Asimismo, los compuestos de la fórmula (I) pueden emplearse en combinación con composiciones de tecnología de señalización, provocando una mejor colonización por simbiosis como, por ejemplo, rizobios, micorrizas y/o bacteria endofítica u hongos, y/o a fijación de nitrógeno optimizada.

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 invernaderos, en bosques o en horticultura. Más particularmente, esta es la semilla de cereales (por ejemplo trigo, cebada, centeno, mijo y avena), maíz, algodón, soja, arroz, papas, girasoles, café, tabaco, canola, semilla de colza, remolachas (por ejemplo remolacha azucarera y remolacha forrajera), cacahuete, vegetales (por ejemplo tomates, pepinos, frijoles, vegetales crucíferos, cebollas y lechuga), plantas frutales, céspedes y plantas ornamentales. Es de particular importancia el tratamiento de semillas de cereales (tales como trigo, cebada, centeno y avena), maíz, semillas de sojas, algodón, canola, semilla de colza, vegetales y arroz.

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

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 lo suficientemente estable para que no ocurra un daño en el transcurso del

- tratamiento. En general, las semillas se pueden 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 a un contenido de humedad que permite el almacenamiento. De manera alternativa, también es posible usar semillas que, después del secado, fueron tratadas con, por ejemplo, agua y luego se volvieron a secar, por ejemplo se cebaron. En el caso de la semilla de arroz, es también posible usar la semilla que se remojó, por ejemplo en agua, hasta que alcance una determinada etapa del embrión de arroz ("etapa pecho de paloma") que resulta en la estimulación de la germinación y una emergencia más uniforme.
- Al tratar las semillas, se debe tener cuidado con la cantidad de compuesto de la fórmula (I) aplicada a la semilla y/o la cantidad de otros aditivos que se elige en tal modo que la germinación de la semilla no se vea afectado negativamente, o que la planta resultante no se dañe. Eso se debe asegurar particularmente en el caso de principios activos que pueden presentar efectos fitotóxicos en determinadas tasas de aplicación.
- En general, los compuestos de la fórmula (I) se aplican a la semilla en forma de una formulación adecuada. Formulaciones y procedimientos adecuados para el tratamiento de semillas son conocidos por los expertos en la técnica.
- Los compuestos de la fórmula (I) pueden convertirse a las formulaciones de recubrimiento de semilla habituales, como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, espumas, lechadas u otras composiciones de recubrimiento para la semilla, y también formulaciones ULV.
- Estas formulaciones se preparan de forma conocida, mezclando los compuestos de la fórmula (I) con aditivos habituales, por ejemplo, extensores habituales y disolventes o diluyentes, colorantes, agentes humectantes, dispersantes, emulsionantes, antiespumantes, conservantes, espesantes secundarios, adhesivos, giberelinas y también agua.
- Colorantes que pueden estar presentes en las formulaciones de revestimiento útiles de acuerdo con la invención son todos los colorantes que son habituales a tales efectos. 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. Disolvente rojo 1.
- 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. Son útiles preferentemente los alquil naftalenosulfonatos, como diisopropil o diisobutil naftalenosulfonatos.
- 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 que son habituales para la formulación de los compuestos agroquímicos activos. Los dispersantes no iónicos o aniónicos o mezclas de dispersantes no iónicos o aniónicos pueden usarse con preferencia. Dispersantes no iónicos adecuados incluyen especialmente polímeros de bloque de óxido de etileno/óxido de propileno, éteres de alquifol poliglicol y éteres de tristrilfenol poliglicol, y los derivados fosfatados o sulfatados de estos. Dispersantes aniónicos adecuados son especialmente lignosulfonatos, sales de ácido poliacrílico y condensados de arilsulfonato-formaldehído.
- 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 que son habituales para la formulación de los compuestos agroquímicos activos. Antiespumantes de silicona y estearato de magnesio se pueden usar preferentemente.
- Los conservantes que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semilla útiles de acuerdo con la invención son todas las sustancias útiles a tales efectos en 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 a tales efectos en las composiciones agroquímicas. Ejemplos preferidos incluyen derivados de celulosa, derivados de ácido acrílico, xantano, arcillas modificadas y sílice dividido finamente.
- 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.
- Las giberelinas que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semilla 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).

5 Las formulaciones de recubrimiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención se pueden usar para tratar una amplia variedad de diferentes tipos de semilla ya 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 revestir las semillas de cereales tales como trigo, cebada, centeno, avena y triticale, y también semillas de maíz, arroz, colza, guisantes, frijoles, algodón, girasol, soja y remolachas, o también una amplia variedad de diferentes semillas vegetales. Las formulaciones de recubrimiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención, o las formas de uso diluidas a partir de estas, también se pueden usar para recubrir semillas de plantas transgénicas.

10 Para el tratamiento de semillas con las formulaciones de recubrimiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención, o las formas de uso preparadas a partir de estas por la adición de agua, son útiles todas las unidades de mezcla que se pueden usar habitualmente para el recubrimiento de semillas. Específicamente, el procedimiento de recubrimiento de semilla es colocar la semilla en un mezclador, que funciona por lotes o continuamente, agregar la cantidad deseada particular 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. Si corresponde, después de esto se realiza una operación de secado.

15 La tasa de aplicación de las formulaciones de recubrimiento de semilla útiles de acuerdo con la invención puede variar dentro de un intervalo relativamente amplio. Se guía por el contenido particular de los compuestos de la fórmula (I) en las formulaciones y por la semilla. Las tasas de aplicación del compuesto de la fórmula (I) son generalmente entre 0,001 y 50 g por kilogramo de semilla, preferentemente entre 0,01 y 15 g por kilogramo de semilla.

20 **Salud animal**

En el campo de la salud animal, es decir, en el campo de medicina veterinaria, los compuestos de la fórmula (I) están activos contra parásitos animales, en particular ectoparásitos o endoparásitos. El término "endoparásito" incluye especialmente helmintos y protozoos, como coccidia. Los ectoparásitos son típicamente y preferentemente artrópodos, especialmente insectos o acáridos.

25 En el campo de la medicina veterinaria, los compuestos de la fórmula (I) que tiene toxicidad endotérmica favorable son adecuados para controlar parásitos que ocurren en la cría de animales y reproducción de animales en ganadería, animales de cría, 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.

30 Ganadería incluye, por ejemplo, mamíferos, como ovejas, cabras, caballos, asnos, camellos, búfalos, conejos, reno, gamo y especialmente ganado y cerdos; o aves como pavos, patos, gansos y especialmente pollos; o pescado o crustáceos, por ejemplo en acuicultura; o, según el caso, insectos 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 o peces de acuario.

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

35 En otra forma de realización específica, los compuestos de la fórmula (I) se administran a aves, a saber aves enjauladas o particularmente aves de corral.

40 Se pretende que el uso de los compuestos de la fórmula (I) para controlar parásitos de animales reduzca o evite enfermedades, casos de muerte y reducciones de rendimiento (en el caso de carne, leche, lana, pieles, huevos, miel y similares), de modo de posibilitar la cría de animales más económica y simple y que se logre un mejor bienestar animal.

Con relación al campo de la salud animal, el término "control" o "controlar" en el presente contexto significa que los compuestos de la fórmula (I) son eficaces para reducir la incidencia del parásito particular en un animal infectado con tales parásitos a un grado inocuo. Más específicamente, "controlar" en el presente contexto significa que los compuestos de la fórmula (I) matan el respectivo parásito, inhiben su crecimiento o inhiben su proliferación.

45 Los artrópodos incluyen, de modo no taxativo, por ejemplo del orden de Anoplurida, por ejemplo, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp. y *Solenopotes* spp.;

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

50 del orden de Diptera y los subórdenes *Nematocera* y *Brachycera*, por ejemplo *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Atylotus* spp., *Braula* spp., *Calliphora* spp., *Chrysomyia* spp., *Chrysops* spp., *Culex* spp., *Culicoides* spp., *Eusimulium* spp., *Fannia* spp., *Gasterophilus* spp., *Glossina* spp., *Haematobia* spp., *Haematopota* spp., *Hippobosca* spp., *Hybomitra* spp., *Hydrotaea* spp., *Hypoderma* spp., *Lipoptena* spp.,

55 *Lucilia* spp., *Lutzomyia* spp., *Melophagus* spp., *Morellia* spp., *Musca* spp., *Odagmia* spp., *Oestrus* spp., *Philipomyia* spp., *Phlebotomus* spp., *Rhinoestrus* spp., *Sarcophaga* spp., *Simulium* spp., *Stomoxys* spp., *Tabanus* spp., *Tipula* spp., *Wilhelmia* spp., *Wohlfahrtia* spp.;

del orden de Siphonapterida, por ejemplo, *Ceratophyllus* spp., *Ctenocephalides* spp., *Pulex* spp., *Tunga* spp., *Xenopsylla* spp.;

del orden de Heteropterida, por ejemplo *Cimex* spp., *Panstrongylus* spp., *Rhodnius* spp., *Triatoma* spp.; y también molestia y plagas de higiene del orden Blattarida.

5 Asimismo, en el caso de los artrópodos, debería mencionarse a modo de ejemplo, de modo no taxativo, los siguientes Acari:

De la subclase de acari (acarina) y del orden de Metastigmata, por ejemplo de la familia de Argasidae, como *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., de la familia de Ixodidae, como *Amblyomma* spp., *Dermacentor* spp.,

10 original de polyxenous ticks); del orden de Mesostigmata, como *Dermanyssus* spp., *Ornithonyssus* spp., *Pneumonyssus* spp., *Raillietia* spp., *Sternostoma* spp., *Tropilaelaps* spp., *Varroa* spp.; del orden de Actiniedida (Prostigmata), por ejemplo *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Demodex* spp., *Listrophorus* spp., *Myobia* spp.,

15 *Neotrombicula* spp., *Ornithocheyletia* spp., *Psorergates* spp., *Trombicula* spp.; y del orden de Acaridida (Astigmata), por ejemplo *Acarus* spp., *Caloglyphus* spp., *Chorioptes* spp., *Cytodites* spp., *Hypodectes* spp., *Knemidocoptes* spp.,

15 *Laminosioptes* spp., *Notoedres* spp., *Otodectes* spp., *Psoroptes* spp., *Pterolichus* spp., *Sarcoptes* spp., *Trixacarus* spp., *Tyrophagus* spp.

Ejemplos de protozoos parasíticos incluyen, de modo no taxativo:

*Mastigophora* (Flagellata), como:

Metamonada: del orden de Diplomonadida, por ejemplo *Giardia* spp., *Spironucleus* spp.

20 Parabasala: del orden de Trichomonadida, por ejemplo *Histomonas* spp., *Pentatrichomonas* spp., *Tetratrichomonas* spp., *Trichomonas* spp., *Tritrichomonas* spp.

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

*Sarcomastigophora* (Rhizopoda) como Entamoebidae, por ejemplo *Entamoeba* spp., Centramoebidae, por ejemplo *Acanthamoeba* sp., Euamoebidae, por ejemplo *Hartmanella* sp.

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

30 Microspora como *Encephalitozoon* spp., *Enterocytozoon* spp., *Globidium* spp., *Nosema* spp., y también, por ejemplo, *Myxozoa* spp.

Los helmintos que son patógenos a humanos o animales incluyen, por ejemplo, *Acanthocephala*, Nematoden, *Pentastoma* y *Platyhelminthes* (por ejemplo *Monogenea*, cestodos y trematodos).

Los ejemplos de helmintos incluyen, de modo no taxativo:

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

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

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

45 Trematodos: de la clase de Digenea, por ejemplo: *Austrobilharzia* spp., *Brachylaima* spp., *Calicophoron* spp., *Catantropis* spp., *Clonorchis* spp., *Collyricium* spp., *Cotylophoron* spp., *Cyclocoelum* spp., *Dicrocoelium* spp., *Diplostomum* spp., *Echinochasmus* spp., *Echinoparyphium* spp., *Echinostoma* spp., *Eurytrema* spp., *Fasciola* spp., *Fasciolides* spp., *Fasciolopsis* spp., *Fischoederius* spp., *Gastrothylacus* spp., *Gigantobilharzia* spp., *Gigantocotyle* spp., *Heterophyes* spp., *Hypoderaeum* spp., *Leucochloridium* spp., *Metagonimus* spp., *Metorchis* spp., *Nanophyetus* spp., *Notocotylus* spp., *Opisthorchis* spp., *Ornithobilharzia* spp., *Paragonimus* spp., *Paramphistomum* spp., *Plagiorchis* spp., *Posthodiplostomum* spp., *Prosthogonimus* spp., *Schistosoma* spp., *Trichobilharzia* spp., *Trogloctrema* spp.,

50 *Typhlocoelum* spp.

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

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

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

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

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

Del orden de *Polymorphida*, por ejemplo: *Filicollis* spp.; del orden de *Echinorhynchida*, por ejemplo *Acanthocephalus* spp., *Echinorhynchus* spp., *Leptorhynchoides* spp.

*Pentastoma*: del orden de *Porocephalida*, por ejemplo, *Linguatula* spp.

En el sector veterinario y cría de animales, los compuestos de la fórmula (I) se administran por procedimientos generalmente conocidos en la técnica, como por vía enteral, parenteral, dérmico o nasal en forma de preparaciones adecuadas. La administración puede ser profiláctica, metafiláctica o terapéutica.

Por lo tanto, una forma de realización de la presente invención se refiere a los compuestos de la fórmula (I) para el uso de un medicamento.

Otro aspecto se refiere a los compuestos de la fórmula (I) para usar como agente antiendoparasitario.

Otro aspecto específico de la invención se refiere a los compuestos de la fórmula (I) para usar como un agente antihelmíntico, especialmente para usar como nematocida, platihelmíntico, acantocefalocida o pentastomicida.

Otro aspecto específico de la invención se refiere a los compuestos de la fórmula (I) para usar como agente antiprotozoico.

Otro aspecto adicional se refiere a los compuestos de la fórmula (I) para usar como agente antiectoparasitario, especialmente un artropodocida, muy particularmente un insecticida o un acaricida.

Otros aspectos de la invención son formulaciones de medicina veterinaria que comprenden una cantidad eficaz de al menos un compuesto de la fórmula (I) y al menos uno de lo siguiente: un excipiente farmacéuticamente compatible (por ejemplo diluyente sólido o líquido), un auxiliar farmacéuticamente compatible (por ejemplo tensioactivos), especialmente un excipiente farmacéuticamente compatible usado convencionalmente en formulaciones de medicina veterinaria y/o auxiliar farmacéuticamente compatible usadas convencionalmente en formulaciones de medicina veterinaria.

Un aspecto relacionado de la invención es un procedimiento para la producción de una formulación de medicina veterinaria como se describe en la presente, que comprende el paso de mezclar al menos un compuesto de la fórmula (I) con excipientes y auxiliares farmacéuticamente compatibles, especialmente con excipientes farmacéuticamente compatibles usados convencionalmente en formulaciones de medicina veterinaria y/o auxiliares usados convencionalmente en formulaciones de medicina veterinaria.

Otro aspecto específico de la invención son las formulaciones de medicina veterinaria que se seleccionan del grupo de formulaciones ectoparasitocidas y endoparasitocidas, especialmente seleccionadas del grupo de formulaciones antihelmínticas, antiprotozoicas y artropodocidas, muy particularmente seleccionadas del grupo de formulaciones nematocidas, platihelmínticas, acantocefalocidas, pentastomicidas, insecticidas y acaricidas, de acuerdo con los aspectos anteriores, y procedimientos para la producción de estas.

Otro aspecto se refiere a un procedimiento para el tratamiento de una infección parasítica, especialmente una infección provocada por un parásito que se selecciona del grupo de ectoparásitos y endoparásitos mencionados en la presente, por el uso de una cantidad eficaz de un compuesto de la fórmula (I) en un animal, especialmente un animal no humano,



que lo necesita.

Otro aspecto se refiere a un procedimiento para el tratamiento de una infección parasítica, especialmente una infección provocada por un parásito que se selecciona del grupo de ectoparásitos y endoparásitos mencionados en la presente, por el uso de una formulación de medicina veterinaria como se define en la presente en un animal, especialmente un animal no humano, que lo necesita.

Otro aspecto se refiere al uso de los compuestos de la fórmula (I) en el tratamiento de una infección parasítica, especialmente una infección provocada por un parásito que se selecciona del grupo de ectoparásitos y endoparásitos mencionados en la presente, en un animal, especialmente un animal no humano.

En el presente contexto de salud animal o medicina veterinaria, el término "tratamiento" se refiere a tratamiento profiláctico, metafiláctico y terapéutico.

En una forma de realización particular, de este modo, mezclas de al menos un compuesto de la fórmula (I) con otros principios activos, especialmente con endo- y ectoparásitos, se proveen para el campo de la medicina veterinaria.

En el campo de la salud animal, "mezcla" significa no solo que dos (o más) principios activos diferentes se formulan en una formulación común y que en consecuencia se emplean juntos, sino también se refiere a productos que comprenden formulaciones separadas para cada principio activo. Por lo tanto, cuando más de dos principios activos deben emplearse, todos los principios activos pueden formularse en una formulación común o todos los principios activos pueden formularse en formulaciones separadas; del mismo modo son posibles formas mixtas donde algunos de los principios activos se formulan juntos y algunos de los principios activos se formulan por separado. Las formulaciones separadas permiten la aplicación separada o sucesiva de los principios activos en cuestión.

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

Ejemplos de principios activos del grupo de los ectoparasiticidas como componentes de mezcla, sin ninguna intención de que constituya una restricción, incluyen los insecticidas y acaricidas enumerados en detalle anteriormente. Otros principios activos que pueden emplearse se enumeran más adelante de acuerdo con la clasificación mencionada anteriormente basada en el actual de Esquema de Clasificación de Modos de Acción IRAC: (1) inhibidores de acetilcolinesterasa (AChE); (2) bloqueadores del canal de cloruro controlado por GABA; (3) moduladores del canal de sodio; (4) moduladores competitivos del receptor de acetilcolina nicotínico (nAChR); (5) moduladores alostéricos del receptor de acetilcolina nicotínico (nAChR); (6) moduladores alostéricos del canal de cloruro controlado por glutamato (GluCl); (7) miméticos de la hormona juvenil; (8) inhibidores no específicos varios (multi-sitio); (9) moduladores de órganos cordotonales; (10) inhibidores del crecimiento de ácaros; (12) inhibidores de ATP sintasa mitocondrial, como disruptores de ATP; (13) desacopladores de la fosforilación oxidativa por interrupción del gradiente de protones; (14) bloqueadores del canal del receptor de acetilcolina nicotínica; (15) inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 0; (16) inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 1; (17) disruptores de muda (especialmente en Diptera); (18) agonistas del receptor de ecdisona; (19) agonistas del receptor de octopamina; (21) inhibidores de transporte de electrones de complejo mitocondrial I; (25) inhibidores de transporte de electrones de complejo mitocondrial II; (20) inhibidores de transporte de electrones de complejo mitocondrial III; (22) bloqueadores del canal de sodio dependiente del voltaje; (23) inhibidores de acetil CoA carboxilasa; (28) moduladores del receptor de rianodina;

principios activos con mecanismos de acción desconocidos o no específicos, por ejemplo fentripanil, fenoxacrim, ciclopreno, clorobenzilato, clordimeform, flubenzimin, diciclanil, amidoflumet, quinometionat, triaratenol, clotiazoben, tetrasul, oleato de potasio, petróleo, metoxadiazona, gossiplur, flutenzina, brompropilato, criolito;

compuestos de otras clases, por ejemplo butacarb, dimetilan, cloetocarb, fosfocarb, pirimifos(-etilo), paration(-etilo), metacrifos, o-salicilato de isopropilo, triclorfon, sulprofos, propafos, sebufos, piridation, protoato, diclofention, demeton-S-metil sulfona, isazofos, cianofenfos, dialifos, carbofenotion, autatiofos, aromfenvinfos(-metilo), azinphos(-etilo), clorpirifos(-etilo), fosmetilan, iodofenfos, dioxabenzofos, formotion, fonofos, flupirazofos, fensulfotion, etrimfos;

compuestos organoclorina, por ejemplo camfeclor, lindano, heptaclor; o fenilpirazoles, por ejemplo acetoprol, pirafloprol, piriprol, vaniliprol, sisapronil; o isoxazolininas, por ejemplo sarolaner, afoxolaner, lotilaner, fluralaner;

piretroides, por ejemplo (cis-, trans-)metoflutrina, proflutrina, flufenprox, flubrocitrinato, fubfenprox, fenflutrina, protrifenbut, piresmetrina, RU15525, teralletrina, cis-resmetrina, heptaflutrina, bioetanometrina, biopermetrina, fenpiritrina, cis-cipermetrina, cis-permetrina, clocitrina, cihalotrina (lambda-), clovaportrina, o compuestos de hidrocarburo halogenado (HCH),

neonicotinoides, por ejemplo nitiazina

dicloromezotiaz, triflumezopirim

lactonas macrocíclicas, por ejemplo nemadectina, ivermectina, latidectina, moxidectina, selamectina, eprinomectina, doramectina, emamectina benzoato; milbemicina oxima

tripreno, epofenonana, diofenolan;

biológicos, hormonas o feromonas, por ejemplo productos naturales, por ejemplo turingiensina, codlemona o componentes de neem

dinitrofenoles, por ejemplo dinocap, dinobuton, binapacrilol;

benzoilureas, por ejemplo fluazuron, penfluron,

derivados de amidina, por ejemplo clor mebiform, cimiazol, demiditraz  
acaricidas varroa de colmena de abejas, por ejemplo, ácidos orgánicos, por ejemplo ácido fórmico, ácido oxálico.

Ejemplos de principios activos del grupo de los endoparasiticidas, como componentes de mezcla, incluyen, de modo no taxativo, compuestos antihelmínticamente activos y compuestos antiprotozoicamente activos.

5 Los compuestos antihelmínticamente activos incluyen de modo no taxativo los siguientes principios activos desde el punto de vista nematocida, trematocida y/o cestocida:

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

10 de la clase de los bencimidazoles y probencimidazoles, por ejemplo: oxibendazol, mebendazol, triclabendazol, tiofanato, parbendazol, oxfendazol, netobimina, fenbendazol, febantel, tiabendazol, ciclobendazol, cambendazol, albendazol sulfóxido, albendazol, flubendazol;

de la clase de los depsipéptidos, preferentemente depsipéptidos cíclicos, especialmente depsipéptidos cíclicos de 24 miembros, por ejemplo: emodepsido, PF1022A;

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

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

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

de la clase de los aminoacetónitrilos, por ejemplo: monepantel;

de la clase de las paraherquamidas, por ejemplo: paraherquamida, derquantel;

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

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

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

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

de la clase de las piperazinas, por ejemplo: piperazina, hidroxizina;

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

30 de varias otras clases, por ejemplo: bunamidina, niridazol, resorantel, omfalotin, oltipraz, nitroscanato, nitroxinil, oxamniquin, mirasan, miracil, lucanton, hicanton, hetolin, emetin, dietilcarbamazina, diclorofen, diamfenetida, clonazepam, befenio, amoscanato, clorsulon.

Los compuestos antiprotozoicamente activos incluyen, de modo no taxativo, los siguientes principios activos:

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

de la clase de los ionóforos de poliléter, por ejemplo: monensina, salinomicina, maduramicina, narasina;

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

35 de la clase de las quinolonas, por ejemplo: enrofloxacin, pradofloxacin;

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

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

de la clase de las sulfonamidas, por ejemplo: sulfaquinoxalina, trimetoprim, sulfaclozin;

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

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

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

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

de la clase de los quinazolinona alcaloides, por ejemplo: halofuginona;

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

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

Todos los componentes de mezcla mencionados, según el caso, pueden también formar sales con bases o ácidos adecuados si son capaces de hacerlo sobre la base de sus grupos funcionales.

### Control de vectores

10 Los compuestos de la fórmula (I) también pueden utilizarse en el control de vectores. En el contexto de la presente invención, un vector es un artrópodo, especialmente un insecto o arácnido, capaz de transmitir patógenos, por ejemplo virus, gusanos, organismos unicelulares y bacterias, desde un depósito (planta, animal, humano, etc.) a un hospedador. Los patógenos pueden transmitirse tanto de forma mecánica (por ejemplo tracoma por moscas no picadoras) a un hospedador o después de una inyección (por ejemplo de parásitos de malaria por mosquitos) en un hospedador.

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

1) mosquitos

- Anopheles: malaria, filariasis;

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

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

20 - Simúlidos: transmisión de gusanos, especialmente *Onchocerca volvulus*;

- Psychodidae: transmisión de leishmaniasis

2) Piojos: infecciones de la piel, tifus epidémico;

3) Pulgas: peste, tifus endémico, tenia;

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

25 5) Ácaros: acariosis, tifus endémico, rickettsiosis, tularemia, encefalitis de San Luis, encefalitis transmitida por garrapatas (TBE), la fiebre hemorrágica de Crimean-Congo, borreliosis;

6) Garrapatas: borreliosis como *Borrelia burgdorferi sensu lato.*, *Borrelia duttoni*, encefalitis transmitida por garrapatas, fiebre Q (*Coxiella burnetii*), babesiosis (*Babesia canis canis*), ehrlichiosis.

30 Ejemplos de vectores en el contexto de la presente invención son insectos, por ejemplo pulgones, moscas, chicharritas o trips que pueden transmitir virus de plantas a las 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 contexto de la presente invención son insectos y arácnidos como mosquitos, especialmente del género *Aedes*, *Anopheles*, por ejemplo *A. gambiae*, *A. arabiensis*, *A. funestus*, *A. dirus* (malaria) y *Cluex*, *Psychodidae* tal como *Phlebotomus*, *Lutzomyia*, piojos, pulgas, moscas, ácaros y garrapatas que pueden transmitir patógenos a animales y/o humanos.

El control de vectores también es posible si los compuestos de la fórmula (I) son inhibidores de resistencia.

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

### Protección de materiales industriales

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

45 Se entiende que materiales industriales en el presente contexto significa materiales inanimados, como preferentemente plásticos, adhesivos, tamaños, papeles y cartones, cuero, madera, productos de madera procesada

y composiciones de recubrimiento. Se prefiere particularmente el uso de la invención para la protección de la madera.

En una forma de realización adicional, los compuestos de la fórmula (I) se usan juntos con al menos otro insecticida y/o al menos un fungicida.

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

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

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

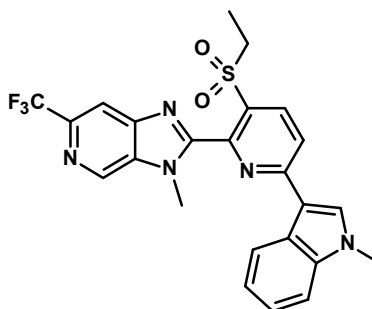
15 Los compuestos de la fórmula (I) son adecuados para combatir plagas animales en el sector de higiene. Más particularmente, la invención puede usarse en el sector de protección doméstica, en el sector de protección de higiene y en la protección de productos almacenados, particularmente para el control de insectos, arácnidos, garrapatas y ácaros encontrados en espacios cerrados, por ejemplo viviendas, naves industriales, oficinas, cabinas de vehículos, instalaciones de cría de animales. Para controlar las plagas animales, los compuestos de la fórmula (I) se usan solos o en combinación con otros principios activos y/o 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.

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

25 La aplicación se efectúa, por ejemplo, en aerosoles, productos con aerosol despresurizado, por ejemplo aerosoles de bomba y con atomizador, sistemas de nebulización automático, nebulizadores, espumas, geles, productos evaporadores con comprimidos evaporadores de celulosa o plástico, evaporadores líquidos, evaporadores de gel y membrana, evaporadores accionados por propulsor, sistemas de evaporación sin energía o pasivos, papeles polilla, bolsas polilla y geles polilla, como gránulos o polvos, en cebos para dispersión o estaciones de cebo.

### Ejemplos de preparación:

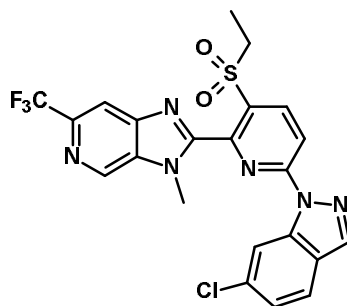
30 **2-[3-(etilsulfonil)-6-(1-metil-1H-indol-3-il)piridin-2-il]-3-metil-6-(trifluorometil)-3H-imidazo[4,5-c]piridina (Ejemplo I-1)**



35 100 mg (0,24 mmol) de 2-(6-cloro-3-etilsulfonil-2-piridil)-3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridina, 64 mg (0,24 mmol) de 1-metil-3-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1H-indol y 9 mg (0,01 mmol) de tetrakis(trifenilfosfina)paladio(0) se cargaron inicialmente en una mezcla de dioxano desgasificado (2 ml) y solución de carbonato de sodio desgasificado (1 M, 1 ml), y la mezcla se agitó a 96°C durante 14 h. La mezcla de reacción se enfrió luego hasta temperatura ambiente y se concentró a presión reducida, y el residuo se absorbió en agua y diclorometano. Las fases se separaron, la fase acuosa se extrajo tres veces con diclorometano y las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se filtraron. El disolvente se destiló a presión reducida y el residuo se purificó por purificación de cromatografía en columna usando un gradiente de agua / acetonitrilo como fase móvil.

40 logP (neutro): 3,45; MH<sup>+</sup>: 500; <sup>1</sup>H-NMR(400 MHz, D<sub>6</sub>-DMF) δ ppm: 1,23 (t, 3H), 3,74 (q, 2H), 3,92 (s, 3H), 3,97 (s, 3H), 7,16-7,19 (m, 1H), 7,26-7,29 (m, 1H), 7,57 (d, 1H), 8,25-8,32 (m, 3H), 8,38 (d, 1H), 8,51 (s, 1H), 9,33 (s, 1H),

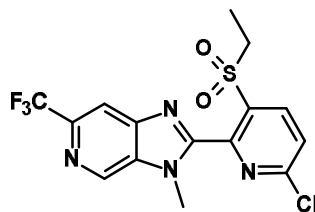
**2-[6-(6-cloroindazol-1-il)-3-etilsulfonil-2-piridil]-3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridina (Ejemplo I-2)**



100 mg (0,24 mmol) de 2-(6-cloro-3-etilsulfonil-2-piridil)-3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridina se disolvieron en 8 ml de acetonitrilo, se agregaron 120,7 mg de carbonato de cesio (0,37 mmol), 20,5 mg de yoduro de potasio (0,12 mmol) y 75,4 mg (0,49 mmol) de 6-cloro-1H-indazol. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 1 h y a 65-70°C durante 17 h. Posteriormente, la mezcla de reacción se filtró y el disolvente se destiló a presión reducida. El residuo se purificó por purificación de cromatografía en columna por HPLC preparativa con un gradiente de agua/acetonitrilo como eluyente.

logP (neutro): 3,92; MH<sup>+</sup>: 521; <sup>1</sup>H-NMR(600 MHz, D<sub>7</sub>-DMF) δ ppm: 1,33 (t, 3H), 3,88 (q, 2H), 4,22 (s, 3H), 7,47 (d, 1H), 8,05 (d, 1H), 8,35 (s, 1H), 8,57 (d, 1H), 8,66 (s, 1H), 8,72 (s, 1H), 8,76 (d, 1H), 9,46 (s, 1H),

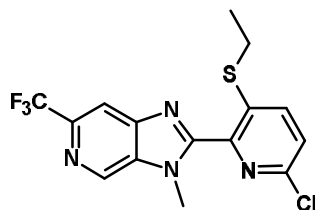
#### 10 2-(6-cloro-3-etilsulfonil-2-piridil)-3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridina



900 mg (2,41 mmol) de 2-(6-cloro-3-etilsulfonil-2-piridil)-3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridina se disolvieron en 50 ml de diclorometano, 555,6 mg (12,0 mmol) de ácido fórmico y 1,64 g (16,8 mmol) de 35% de peróxido de hidrógeno fuerte se agregaron a temperatura ambiente y la mezcla se agitó luego a temperatura ambiente durante 5 h. La mezcla se diluyó con agua y se agregó solución de bisulfito de sodio, la mezcla se agitó durante 1 h y se agregó luego solución de hidrogenocarbonato de sodio saturado. La fase orgánica se separó, la fase acuosa se extrajo dos veces con diclorometano y las fases orgánicas combinadas se liberaron del disolvente a presión reducida. El residuo se purificó por purificación de cromatografía en columna por HPLC preparativa con un gradiente de agua/acetonitrilo como eluyente.

(logP (neutro): 2,54; MH<sup>+</sup>: 405; <sup>1</sup>H-NMR(400 MHz, D<sub>6</sub>-DMSO) δ ppm: 1,20 (t, 3H), 3,77 (q, 2H), 3,91 (s, 3H), 8,13 (d, 1H), 8,32 (s, 1H), 8,56 (d, 1H), 9,30 (s, 1H),

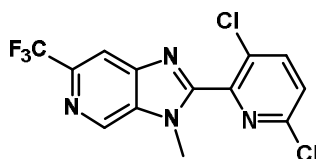
#### 2-(6-cloro-3-etilsulfonil-2-piridil)-3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridina



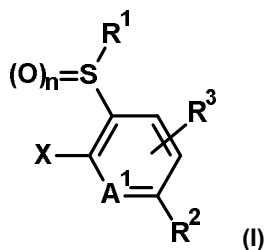
4,00 g (10,7 mmol) de 2-(3,6-dicloro-2-piridil)-3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridina se disolvieron en 60 ml de tetrahidrofurano, se agregaron 446 mg (11,1 mmol) de hidruro de sodio a -5°C y la mezcla se agitó a 0°C durante 30 minutos. Luego, se agregaron 733 mg (11,8 mmol) de etanotiol gota a gota durante 30 minutos a -5°C, el baño de frío se retiró y la mezcla se agitó luego durante 2 h a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se hidrolizó con agua, la fase orgánica se separó y la fase acuosa se extrajo dos veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas se combinaron, se lavaron con solución de cloruro de sodio y se secaron sobre sulfato de sodio, y el disolvente se destiló luego a presión reducida. El residuo se purificó por trituración con metil terc-butil cetona / diclorometano 25:1.

(logP (neutro): 3,06; MH<sup>+</sup>: 373

#### 2-(3,6-dicloro-2-piridil)-3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridina



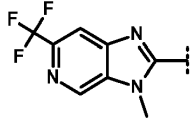
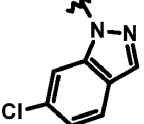
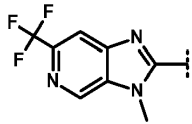
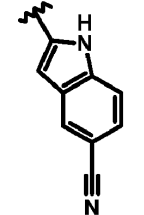
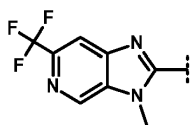
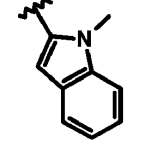
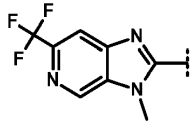
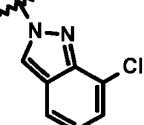
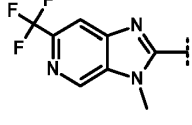
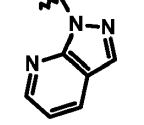
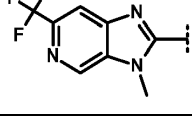
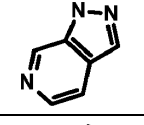
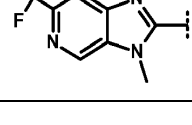
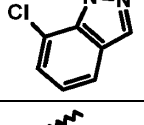
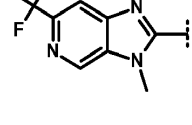
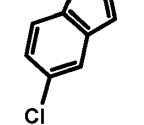
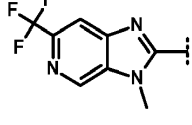
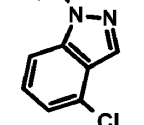
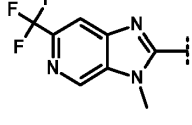
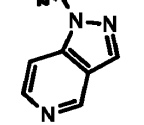
- 20 g (104,6 mmol) de N<sup>3</sup>-metil-6-(trifluorometil)piridina-3,4-diamina, 25,11 g (130,8 mmol) de ácido 3,6-dicloropiridina-2-carboxílico y 20,06 g (104,6 mmol) de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida clorhidrato (EDCI) se agitaron en 200 ml de piridina a 120°C durante 8 h. La mezcla de reacción se liberó de disolvente a presión reducida, se agregó agua y la mezcla se extrajo tres veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas se combinaron y se secaron sobre sulfato de sodio, y el disolvente se destiló luego a presión reducida. El residuo se purificó por purificación de cromatografía en columna con gradiente de ciclohexano/acetato de etilo como eluyente.
- 5 (logP (neutro): 2,81; MH<sup>+</sup>: 347; <sup>1</sup>H-NMR(400 MHz, D<sub>6</sub>-DMSO) δ ppm: 3,99 (s, 3H), 7,89 (d, 1H), 8,32 (s, 1H), 8,35 (d, 1H), 9,28 (s, 1H).
- 10 En analogía a los ejemplos y de acuerdo con los procedimientos de preparación descritos anteriormente, pueden obtenerse los siguientes compuestos de la fórmula (I):



donde los sustituyentes R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, A<sup>1</sup>, X y n tienen los significados dados en la tabla a continuación y donde el enlace de X o R<sup>2</sup> al resto de la molécula se caracterizan por una línea punteada o una línea ondulada:

Ej. n.º	R <sup>1</sup>	n	A <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	X	R <sup>2</sup>
I-1	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		

(continuación)

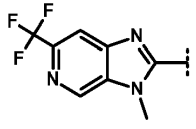
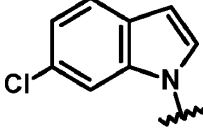
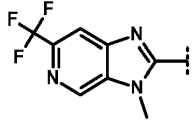
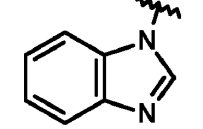
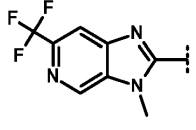
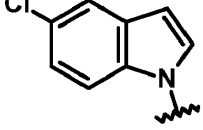
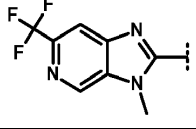
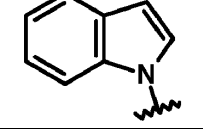
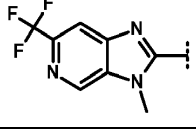
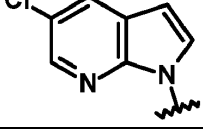
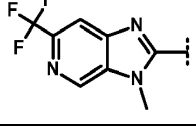
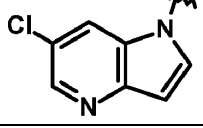
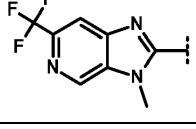
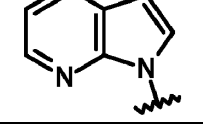
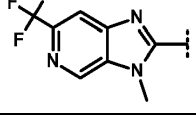
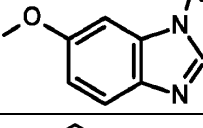
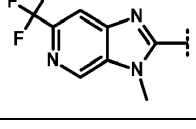
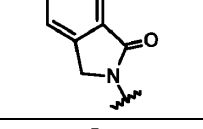
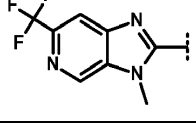
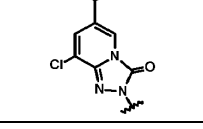
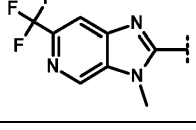
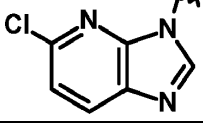
Ej. n.º	R <sup>1</sup>	n	A <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	X	R <sup>2</sup>
I-2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-4	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-6	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-7	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-8	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-9	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-10	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-11	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		

(continuación)

Ej. n.º	R <sup>1</sup>	n	A <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	X	R <sup>2</sup>
I-12	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-13	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	1	N	-H		
I-14	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-15	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-16	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-17	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-18	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-19	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-20	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-21	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-22	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		



(continuación)

Ej. n.º	R <sup>1</sup>	n	A <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	X	R <sup>2</sup>
I-23	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-24	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-25	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-26	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-27	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-28	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-29	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-30	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-31	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-32	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-33	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		

(continuación)

Ej. n.º	R <sup>1</sup>	n	A <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	X	R <sup>2</sup>
I-34	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-35	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-36	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-37	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-38	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-39	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-40	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-41	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-42	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-43	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-44	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		

(continuación)

Ej. n.º	R <sup>1</sup>	n	A <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	X	R <sup>2</sup>
I-45	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-46	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-47	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-48	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-49	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-50	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		
I-51	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2	N	-H		

LOGP_NEUTRAL	LOGP_HCOOH	NMR
3,45	3,55	Ejemplo I-1: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,332(4,1);8,511(5,7);8,389(2,7);8,368(4,0);8,318(4,4);8,306(1,8);8,286(2,0);8,275(3,7);8,253(2,6);7,581(1,9);7,561(2,2);7,294(0,9);7,276(1,7);7,258(1,0);7,256(1,1);7,193(1,2);7,175(1,8);7,155(0,8);5,754(14,4);3,970(16,0);3,917(14,6);3,769(0,9);3,751(3,3);3,732(3,3);3,714(1,0);3,319(57,8);2,676(0,3);2,671(0,5);2,667(0,4);2,524(1,0);2,519(1,7);2,511(27,7);2,507(58,8);2,502(79,5);2,497(57,3);2,493(27,3);2,333(0,3);2,329(0,5);2,324(0,3);2,086(0,3);1,246(3,5);1,228(8,1);1,209(3,5);0,146(0,5);0,008(3,9);0,000(115,3);-0,008(4,2);-0,150(0,5)

ES 2 786 573 T3

(continuación)

LOGP_NEUTRAL	LOGP_HCOOH	NMR
3,92	4,01	Ejemplo I-2: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,381(4,0);8,700(4,7);8,681(3,2);8,659(4,0);8,491(3,0);8,489 (3,0);8,484(4,2);8,461(3,3);8,363(4,2);8,313(1,2);8,014(2,7);7,992(2,9);7,459(1,8);7,4 54(1,8);7,438(1,7);7,433 (1,7);4,351(1,0);4,073(0,4);4,056(0,3);4,038(0,9);4,026(16,0);3,988(0,5);3,807(0,9);3, 789(3,2);3,771(3,2);3,75 2(1,0);3,318(348,2);2,675(2,0);2,671(2,7);2,666(2,0);2,524(7,1);2,510(169,4);2,506(35 3,3);2,502(472,8);2,49 7(337,5);2,493(159,8);2,333(2,0);2,328(2,7);2,324(2,0);2,073(2,1);1,988(2,5);1,329(0, 5);1,253(3,7);1,235(8,4) ;1,216(3,6);1,193(0,7);1,175(1,4);1,157(0,7);0,146(1,0);0,008(8,0);0,000(242,5);- 0,008(9,1);-0,150(1,1)
3,08	3,18	Ejemplo I-3: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 20,001(0,3);12,365(2,3);9,375(5,0);9,340(0,4);8,577(12,5);8, 338(5,0);8,313(3,0);8,254(3,7);7,672(3,0);7,630(2,0);7,609(3,1);7,555(2,8);7,552(2,6); 7,531(1,5);5,753(0,4);4, 093(0,6);3,980(16,0);3,963(0,8);3,897(0,4);3,809(1,3);3,790(3,5);3,772(3,6);3,754(1,1 );3,455(0,4);3,315(599, 2);2,756(0,4);2,670(6,4);2,666(4,8);2,620(0,7);2,505(743,7);2,501(1022,3);2,497(795, 1);2,328(6,0);2,324(4,6) ;2,086(1,8);1,250(3,9);1,232(8,4);1,213(3,7);0,146(1,6);0,008(11,2);0,000(339,4);- 0,008(15,3);-0,150(1,6)
3,83	3,90	Ejemplo I-4: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,314(4,0);8,546(2,4);8,525(4,0);8,462(3,9);8,441(2,5);8,317 (4,3);7,701(1,8);7,681(2,0);7,577(1,7);7,556(2,0);7,420(4,6);7,320(1,0);7,302(1,6);7,2 84(1,0);7,282(1,0);7,151 (1,3);7,132(1,9);7,113(1,0);5,754(6,1);4,048(16,0);3,978(14,8);3,815(0,9);3,796(3,2);3 ,778(3,2);3,759(1,0);3,3 19(78,6);2,675(0,4);2,671(0,5);2,666(0,4);2,524(1,3);2,511(28,5);2,506(60,2);2,502(84 ,5);2,497(64,0);2,493(3 1,5);2,333(0,4);2,329(0,5);2,324(0,4);1,260(3,3);1,242(7,4);1,223(3,2);0,000(7,7)
3,92	3,94	Ejemplo I-5: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,569(1,4);9,506(7,0);9,430(1,6);9,371(4,0);9,351(0,5);8,821 (3,1);8,799(4,9);8,727(4,5);8,715(1,0);8,705(3,1);8,693(0,7);8,529(0,8);8,513(0,7);8,3 81(0,9);8,365(0,6);8,355 (4,2);8,312(0,5);7,873(0,5);7,852(0,5);7,791(0,4);7,783(2,3);7,771(0,4);7,763(2,5);7,5 53(2,5);7,535(2,6);7,509 (0,4);7,184(0,4);7,159(1,9);7,150(0,4);7,141(1,9);7,138(2,0);7,129(0,4);7,120(1,7);4,4 88(3,4);4,141(2,1);4,052 (16,0);3,911(0,9);3,893(3,3);3,874(3,4);3,856(1,0);3,362(0,3);3,322(167,8);3,320(187, 8);2,676(0,7);2,671(1,0) ;2,666(0,8);2,662(0,4);2,524(2,5);2,520(3,9);2,511(59,2);2,507(123,3);2,502(165,7);2, 497(123,1);2,493(61,5); 2,333(0,7);2,329(1,0);2,324(0,8);2,073(3,2);1,358(0,8);1,340(1,8);1,321(0,8);1,281(3,6 );1,262(8,3);1,244(3,6); 0,008(1,3);0,000(42,4);-0,008(1,7)
2,63	2,67	Ejemplo I-6: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,335(4,2);9,277(0,5);8,957(3,2);8,935(4,2);8,790(1,9);8,786 (2,1);8,778(6,0);8,775(2,4);8,756(3,4);8,666(7,8);8,485(1,8);8,481(1,9);8,465(2,0);8,4 61(2,0);8,358(0,4);8,341 (4,5);8,314(0,6);7,900(0,4);7,878(0,3);7,529(1,9);7,518(1,8);7,509(1,8);7,498(1,8);4,0 70(16,0);3,988(1,9);3,89 1(1,0);3,873(3,2);3,855(3,2);3,836(1,0);3,342(134,3);3,336(178,0);3,329(143,1);3,326( 150,9);2,676(0,9);2,67 2(1,2);2,667(0,9);2,525(2,6);2,520(4,0);2,511(75,2);2,507(161,7);2,502(220,3);2,498(1 59,3);2,494(76,6);2,33 3(0,9);2,329(1,3);2,325(0,9);2,074(0,6);1,280(3,7);1,262(8,5);1,243(3,6);0,146(0,4);0, 008(2,9);0,000(100,5);-0,008(3,5);-0,150(0,4)

ES 2 786 573 T3

(continuación)

LOGP_NEUTRAL	LOGP_HCOOH	NMR
2,59	2,40	Ejemplo I-7: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,826(3,7);9,347(4,1);9,048(0,8);8,808(5,5);8,711(3,2);8,689(4,0);8,518(3,2);8,506(5,2);8,484(3,4);8,349(4,3);8,347(4,3);8,224(0,7);8,216(0,9);8,210(0,9);7,986(2,2);7,983(2,3);7,972(2,1);7,969(2,1);7,764(0,5);7,750(0,4);4,317(0,8);4,020(16,0);3,823(0,9);3,805(3,2);3,786(3,2);3,768(1,0);3,320(72,5);2,677(0,4);2,672(0,5);2,668(0,4);2,525(1,3);2,521(2,1);2,512(32,8);2,508(69,7);2,503(94,5);2,499(69,3);2,494(34,4);2,334(0,4);2,330(0,6);2,325(0,4);1,324(0,4);1,261(3,6);1,243(8,1);1,224(3,5);0,146(0,5);0,008(4,0);0,000(114,8);-0,008(5,1);-0,149(0,5)
3,34	3,44	Ejemplo I-8: <sup>1</sup> H-NMR(601,6 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,268(3,1);8,780(3,6);8,765(3,9);8,696(7,0);8,384(3,9);8,370(3,7);8,316(3,5);8,315(3,4);7,963(2,1);7,962(2,0);7,950(2,2);7,948(2,0);7,621(2,0);7,620(1,9);7,609(2,3);7,608(2,1);7,379(2,1);7,366(3,1);7,353(1,9);3,865(16,0);3,748(1,0);3,736(3,3);3,724(3,3);3,711(0,9);3,315(117,3);2,616(0,6);2,613(0,8);2,610(0,5);2,523(1,3);2,520(1,6);2,516(1,4);2,508(39,4);2,505(88,1);2,502(123,1);2,499(87,9);2,496(40,3);2,389(0,6);2,386(0,8);2,383(0,6);1,238(3,6);1,226(8,2);1,214(3,6);0,005(1,1);0,000(46,2);-0,006(1,7)
4,03	4,03	Ejemplo I-9: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,350(4,1);8,670(3,2);8,647(8,3);8,523(2,3);8,500(2,4);8,483(4,1);8,460(3,4);8,354(4,4);8,353(4,4);8,312(0,7);8,065(3,1);8,060(3,3);7,569(2,0);7,564(2,0);7,546(1,9);7,541(1,9);3,999(16,0);3,815(0,9);3,797(3,1);3,778(3,2);3,760(1,0);3,339(95,5);3,332(117,9);3,327(119,6);2,676(0,6);2,671(0,8);2,667(0,6);2,525(2,1);2,511(51,6);2,507(109,4);2,502(147,9);2,498(106,6);2,493(51,0);2,334(0,6);2,329(0,8);2,325(0,6);2,073(0,8);1,989(1,0);1,255(3,5);1,236(8,0);1,218(3,5);1,175(0,6);0,008(1,1);0,000(33,1);-0,008(1,3)
4,24	4,27	Ejemplo I-10: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,345(4,0);8,753(4,4);8,751(4,8);8,696(0,5);8,690(3,5);8,668(4,3);8,512(4,3);8,502(2,3);8,490(3,6);8,481(2,4);8,350(4,2);7,565(1,4);7,546(2,5);7,525(2,4);7,489(3,3);7,472(1,7);7,470(1,7);4,301(0,8);4,060(0,4);4,053(0,7);4,006(16,0);3,823(0,9);3,805(3,1);3,786(3,2);3,768(0,9);3,323(64,4);3,321(60,7);2,676(0,3);2,672(0,5);2,667(0,3);2,525(1,2);2,512(25,5);2,508(53,1);2,503(71,7);2,498(53,9);2,494(27,3);2,330(0,5);2,325(0,3);2,074(10,0);1,321(0,5);1,259(3,7);1,241(8,3);1,222(3,5);0,008(0,6);0,000(21,3);-0,009(0,9)
2,47	1,75	Ejemplo I-11: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,354(2,9);9,277(2,9);9,274(3,1);8,859(3,3);8,857(3,6);8,713(2,5);8,691(3,2);8,551(2,3);8,536(2,9);8,511(3,2);8,489(2,7);8,384(1,7);8,370(1,5);8,367(1,0);8,355(3,0);8,353(3,1);4,019(11,8);3,837(0,7);3,818(2,3);3,800(2,4);3,781(0,7);3,322(42,7);2,526(0,7);2,521(1,1);2,512(13,8);2,508(28,6);2,503(38,4);2,499(28,5);2,494(14,3);2,075(16,0);1,262(2,6);1,244(6,0);1,225(2,6);0,008(0,3);0,000(10,0);-0,009(0,5)
4,18	4,27	Ejemplo I-12: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,322(4,3);8,918(3,1);8,895(4,3);8,767(3,9);8,745(3,1);8,326(4,6);8,313(0,7);8,134(2,5);7,701(4,9);7,099(3,7);3,963(16,0);3,824(0,9);3,818(1,1);3,800(3,3);3,781(3,4);3,763(1,1);3,317(250,3);2,675(1,4);2,670(2,0);2,666(1,5);2,524(4,5);2,510(119,0);2,506(251,6);2,501(340,8);2,497(247,8);2,493(120,6);2,333(1,4);2,328(2,0);2,324(1,5);2,073(2,7);1,243(3,7);1,224(8,1);1,206(3,5);1,132(0,4);0,000(3,4)

ES 2 786 573 T3

(continuación)

LOGP_NEUTRAL	LOGP_HCOOH	NMR
2,45	2,46	Ejemplo I-13: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,507(7,0);9,434(3,8);8,818(2,6);8,796(6,1);8,792(2,1);8,78 6(2,0);8,781(1,9);8,735(4,4);8,714(2,8);8,385(4,1);8,378(1,8);8,373(1,8);8,356(1,9);8, 352(1,7);8,314(1,5);7,26 3(1,8);7,253(1,7);7,242(1,7);7,231(1,8);4,492(16,0);4,339(0,7);3,624(1,0);3,605(1,0);3, 591(1,2);3,572(1,0);3,5 52(0,3);3,318(544,2);3,153(1,2);3,135(1,3);3,120(1,0);3,102(1,0);3,083(0,4);2,680(1,5 );2,675(3,1);2,671(4,2); 2,666(3,0);2,524(9,1);2,519(14,2);2,511(249,2);2,506(531,5);2,502(716,9);2,497(513, 2);2,493(241,8);2,333(3, 0);2,328(4,2);2,324(3,1);1,360(3,7);1,342(8,2);1,323(3,7);1,232(0,5);0,146(4,2);0,020( 0,8);0,008(32,3);0,000( 985,7);-0,009(33,6);-0,054(0,4);-0,150(4,2)
2,65	2,71	Ejemplo I-14: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,321(4,2);8,637(2,2);8,616(3,9);8,566(4,3);8,545(4,9);8,42 9(4,4);8,322(4,4);8,314(0,3);7,913(0,9);7,910(0,9);7,891(2,8);7,887(3,0);7,871(3,5);7, 849(1,1);5,754(3,6);4,22 4(14,5);3,985(16,0);3,842(1,0);3,823(3,3);3,805(3,4);3,786(1,0);3,319(29,7);2,675(0,4 );2,671(0,5);2,667(0,4); 2,524(1,5);2,511(29,2);2,507(59,8);2,502(82,5);2,498(62,7);2,493(31,1);2,334(0,4);2,3 29(0,5);2,324(0,4);1,26 0(3,6);1,242(8,2);1,223(3,6);0,008(1,7);0,000(43,4);- 0,009(1,8)
2,58	2,62	Ejemplo I-15: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,324(4,6);8,709(3,7);8,561(0,3);8,539(13,0);8,516(0,3);8,3 82(0,6);8,320(4,9);8,110(1,9);8,106(1,8);8,087(2,2);8,083(2,0);7,950(0,6);7,744(2,6);7, 721(2,3);7,696(0,5);7,6 78(0,8);7,660(0,5);7,570(0,4);7,566(0,3);7,477(0,3);7,458(0,6);7,438(0,3);5,754(14,2); 4,209(14,3);4,186(3,0); 3,972(16,0);3,816(1,1);3,798(3,5);3,779(3,5);3,761(1,1);3,317(20,5);2,671(0,8);2,506( 105,6);2,502(132,4);2,4 97(101,1);2,328(0,8);1,252(3,7);1,233(8,2);1,215(3,6);0,000(29,9)
2,67	2,73	Ejemplo I-16: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 10,196(0,5);9,340(4,5);8,801(0,4);8,699(4,7);8,656(2,1);8,6 35(4,0);8,589(4,2);8,568(2,4);8,342(4,9);8,097(0,4);8,039(2,4);8,021(2,7);7,866(2,2);7, 844(2,5);7,479(1,8);7,4 61(1,9);7,458(1,8);7,440(1,5);5,754(11,0);4,197(1,4);4,185(16,0);4,132(1,1);3,973(16, 0);3,923(1,1);3,848(1,0) ;3,829(3,4);3,811(3,5);3,792(1,1);3,317(43,2);2,675(0,6);2,671(0,8);2,667(0,6);2,524(2 ,2);2,506(92,9);2,502(1 27,0);2,497(95,3);2,333(0,6);2,329(0,8);2,324(0,6);1,264(3,7);1,245(8,2);1,227(3,6);0, 008(1,2);0,000(33,7);-0,009(1,3)
3,12	3,19	Ejemplo I-17: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,362(0,4);9,339(6,4);9,265(0,4);8,736(1,8);8,724(0,4);8,71 4(2,3);8,555(2,1);8,532(1,7);8,351(3,2);8,283(1,8);8,261(1,9);7,901(1,9);7,897(2,2);7, 411(1,1);7,407(1,1);7,38 9(1,0);7,385(1,1);4,011(1,2);3,989(10,2);3,841(0,7);3,822(2,3);3,804(2,4);3,785(0,7);3, 321(18,4);2,671(0,4);2, 502(64,3);2,329(0,4);2,075(16,0);1,267(2,6);1,248(5,7);1,230(2,6);0,000(15,0)
3,99	4,03	Ejemplo I-18: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,286(4,6);8,273(5,0);8,160(3,2);8,137(3,4);7,536(0,6);7,49 2(0,8);7,460(0,6);7,408(2,1);7,389(0,8);6,994(1,9);6,971(1,8);4,883(4,2);3,914(16,0);3, 623(0,8);3,604(2,7);3,5 86(2,8);3,568(0,9);3,318(67,9);2,675(1,0);2,670(1,4);2,666(1,1);2,506(177,4);2,501(23 5,3);2,497(179,6);2,33 2(1,0);2,328(1,4);2,323(1,1);1,194(3,8);1,175(8,5);1,157(3,7);0,146(0,7);0,008(6,8);0, 000(148,3);-0,150(0,7)

ES 2 786 573 T3

(continuación)

LOGP_NEUTRAL	LOGP_HCOOH	NMR
2,69	2,51	Ejemplo I-19: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,284(2,5);8,755(2,4);8,734(2,7);8,455(2,7);8,442(2,8);8,317(2,6);8,315(2,7);8,232(2,8);8,223(2,3);8,214(2,5);8,211(2,9);7,422(2,4);7,409(2,4);7,042(2,8);7,033(2,8);3,93 1(10,9);3,821(0,7);3,803(2,2);3,784(2,2);3,766(0,7);3,317(40,9);2,679(0,4);2,675(0,8);2,670(1,1);2,666(0,8);2,661(0,4);2,524(2,5);2,519(3,5);2,510(62,9);2,506(133,9);2,501(179,8);2,497(128,6);2,492(61,4);2,337(0,4);2,332(0,8);2,328(1,1);2,323(0,8);2,319(0,4);2,074(16,0);1,260(2,4);1,242(5,6);1,223(2,3);0,146(0,7);0,008(5,2); 0,000(176,1);-0,009(6,2);-0,150(0,7)
2,47	1,75	Ejemplo I-20: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,334(4,0);8,699(1,7);8,678(1,7);8,646(3,0);8,636(3,1);8,626(3,0);8,604(3,7);8,489(1,8);8,485(2,0);8,477(2,0);8,474(2,0);8,402(3,3);8,379(2,8);8,345(4,4);7,274(1,6);7,263(1,6);7,253(1,6);7,242(1,6);7,049(2,5);7,040(2,5);3,984(16,0);3,801(1,0);3,782(3,3);3,764(3,3);3,745(1,0);3,320(17,3);2,676(0,3);2,671(0,5);2,667(0,4);2,525(1,2);2,520(1,8);2,511(26,4);2,507(55,6);2,502(75,0);2,498(54,9);2,493(27,1);2,329(0,5);2,324(0,4);1,256(3,6);1,238(8,1);1,219(3,5);0,000(6,7)
3,63	3,59	Ejemplo I-21: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,285(4,3);8,272(4,5);8,150(3,2);8,128(3,5);7,435(0,8);7,394(0,8);7,348(2,0);7,337(1,6);7,010(2,9);6,987(2,8);4,904(5,8);3,926(16,0);3,631(0,9);3,613(3,2);3,594(3,2);3,576(1,0);3,320(13,2);2,675(0,4);2,671(0,6);2,666(0,4);2,524(1,4);2,511(33,0);2,506(69,3);2,502(96,5);2,497(71,9);2,493(34,5);2,333(0,4);2,329(0,6);2,324(0,4);2,074(0,4);1,201(3,4);1,182(7,8);1,164(3,3);0,008(0,7);0,000(20,9);-0,008(0,7)
2,46	2,44	Ejemplo I-22: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,325(1,1);9,288(6,7);8,901(1,0);8,880(1,2);8,574(1,2);8,554(1,1);8,519(2,4);8,508(2,4);8,348(1,3);8,278(7,5);8,167(1,5);8,145(1,5);7,837(0,7);7,377(1,3);7,364(1,5);7,347(1,2);7,069(0,8);4,940(3,1);4,900(2,2);4,873(1,1);3,951(5,3);3,932(16,0);3,915(1,4);3,896(1,1);3,878(0,3);3,645(1,0);3,626(2,6);3,605(3,2);3,587(1,9);3,569(0,4);3,317(84,8);2,675(1,5);2,670(2,1);2,666(1,6);2,524(5,2);2,519(8,1);2,510(122,9);2,506(257,9);2,501(344,6);2,497(250,0);2,492(121,9);2,333(1,5);2,328(2,1);2,323(1,5);2,074(1,1);1,260(1,2);1,249(1,4);1,241(2,7);1,231(3,2);1,223(1,3);1,212(1,6);1,202(5,5);1,184(12,5);1,165(5,3);0,008(0,9);0,000(31,0);-0,009(1,2)
4,04	4,04	Ejemplo I-23: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,366(4,1);8,619(3,2);8,597(3,8);8,413(2,8);8,409(2,8);8,354(7,0);8,331(3,1);8,324(3,3);8,315(3,8);7,715(2,9);7,694(3,2);7,294(2,1);7,289(2,1);7,273(1,9);7,268(2,0);6,956(2,5);6,948(2,5);5,755(2,4);4,013(16,0);3,796(1,0);3,778(3,3);3,759(3,3);3,741(1,0);3,320(51,3);2,676(0,8);2,671(1,1);2,667(0,9);2,524(3,6);2,511(64,2);2,507(134,6);2,502(188,5);2,498(144,2);2,493(73,3);2,333(0,8);2,329(1,1);2,324(0,8);1,258(3,5);1,239(8,2);1,221(3,5);0,146(0,3);0,008(2,9);0,000(82,0);-0,009(4,0);-0,150(0,3)

ES 2 786 573 T3

(continuación)

LOGP_NEUTRAL	LOGP_HCOOH	NMR
2,64	2,66	Ejemplo I-24: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,339(4,2);9,251(6,6);8,718(3,1);8,696(4,0);8,545(3,7);8,52 2(2,9);8,351(4,3);8,349(4,4);8,315(0,4);8,284(1,3);8,278(1,0);8,270(1,3);8,261(1,3);7, 820(1,3);7,811(1,2);7,80 3(1,0);7,798(1,5);7,397(0,4);7,393(0,3);7,385(3,0);7,378(1,8);7,375(1,9);7,371(1,8);7, 367(1,6);7,361(2,8);7,34 9(0,4);4,001(16,0);3,838(0,9);3,820(3,3);3,801(3,3);3,783(1,0);3,320(49,6);2,676(0,6); 2,671(0,8);2,667(0,6);2, 525(2,1);2,511(46,0);2,507(97,4);2,502(136,2);2,498(102,0);2,493(49,1);2,333(0,6);2, 329(0,8);2,324(0,6);1,269(3,5);1,251(7,9);1,232(3,4);0,008(1,9);0,000(57,6);- 0,008(2,1)
4,09	4,10	Ejemplo I-25: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,333(4,4);8,599(3,0);8,576(3,7);8,419(2,5);8,396(2,7);8,38 2(2,9);8,373(2,9);8,346(6,0);8,325(2,8);8,315(0,8);7,750(3,3);7,744(3,3);7,286(1,7);7, 280(1,7);7,263(1,7);7,25 8(1,7);6,922(2,7);6,913(2,7);3,981(16,0);3,798(1,0);3,780(3,3);3,761(3,4);3,743(1,0);3, 320(132,9);2,675(1,3); 2,671(1,8);2,667(1,4);2,524(5,2);2,511(108,2);2,506(223,6);2,502(309,6);2,497(232,6) ;2,493(113,7);2,333(1,3 );2,329(1,8);2,324(1,3);1,254(4,0);1,236(9,1);1,217(3,6);0,146(0,6);0,008(4,7);0,000(1 30,6);-0,008(4,8);-0,150(0,6)
3,65	3,72	Ejemplo I-26: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,334(4,4);8,580(3,0);8,558(3,7);8,414(1,5);8,395(1,6);8,34 3(4,7);8,334(3,5);8,312(2,9);8,290(3,0);8,281(3,1);7,684(1,4);7,677(1,0);7,667(1,7);7, 662(1,5);7,275(0,6);7,26 1(1,4);7,257(1,4);7,247(1,6);7,242(2,8);7,237(1,6);7,229(1,6);7,226(1,6);7,211(0,6);6, 931(2,6);6,922(2,6);3,99 0(16,0);3,790(1,0);3,772(3,3);3,753(3,4);3,735(1,0);3,319(40,3);2,675(0,7);2,671(0,9); 2,667(0,7);2,524(2,4);2, 511(52,8);2,506(110,4);2,502(154,2);2,497(118,0);2,333(0,6);2,329(0,9);2,324(0,7);1, 256(3,5);1,237(7,9);1,219(3,5);0,146(0,5);0,008(3,7);0,000(102,7);-0,008(4,4);- 0,150(0,4)
4,39	4,41	Ejemplo I-27: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,359(3,5);9,336(7,6);8,772(3,7);8,749(3,5);8,540(3,4);8,53 4(3,6);8,519(3,3);8,509(3,3);8,340(4,1);8,333(5,3);8,331(5,4);8,315(0,4);6,870(3,7);6, 860(3,7);4,002(16,0);3,8 33(1,0);3,814(3,3);3,796(3,4);3,777(1,0);3,320(60,7);2,676(0,8);2,671(1,1);2,667(0,8); 2,524(3,0);2,511(67,2); 2,507(136,5);2,502(186,8);2,498(140,9);2,333(0,8);2,329(1,1);2,325(0,8);2,074(1,2);1, 260(3,6);1,242(8,1);1,223(3,5);0,146(0,4);0,008(3,5);0,000(92,5);-0,008(3,6);- 0,150(0,4)
3,05	3,13	Ejemplo I-28: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,358(4,0);8,687(2,8);8,681(4,6);8,671(3,4);8,663(3,2);8,64 1(3,8);8,532(3,9);8,526(3,6);8,427(3,3);8,405(2,8);8,355(4,3);7,088(2,5);7,078(2,5);3, 998(16,0);3,802(0,9);3,7 84(3,3);3,765(3,3);3,747(1,0);3,318(57,2);2,675(1,0);2,670(1,4);2,666(1,1);2,524(3,5); 2,510(88,3);2,506(179, 0);2,501(234,7);2,497(168,2);2,493(81,1);2,333(1,0);2,328(1,4);2,324(1,0);2,074(2,1); 1,255(3,6);1,236(8,3);1,218(3,6);0,146(0,8);0,008(6,2);0,000(176,0);-0,009(6,7);- 0,150(0,8)
3,74	3,76	Ejemplo I-29: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,513(3,2);9,491(3,4);9,488(2,0);9,334(5,0);8,753(3,3);8,73 1(3,2);8,520(2,4);8,508(2,6);8,446(3,2);8,436(3,4);8,329(5,2);8,194(2,4);8,174(2,5);7, 410(1,7);7,398(1,8);7,39 1(1,8);7,379(1,7);6,886(3,3);6,883(2,2);6,876(3,4);4,005(16,0);3,828(1,2);3,810(3,7);3, 791(3,7);3,773(1,2);3,3 20(53,6);2,671(1,3);2,502(212,3);2,498(195,6);2,329(1,2);2,325(1,1);1,262(3,8);1,244( 8,2);1,226(3,9);0,000(37,4);-0,004(22,4)



ES 2 786 573 T3

(continuación)

LOGP_NEUTRAL	LOGP_HCOOH	NMR
2,67	2,69	Ejemplo I-30: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,348(3,1);9,336(3,3);9,216(4,7);9,080(4,9);8,712(2,3);8,690(3,0);8,685(2,7);8,663(3,2);8,511(3,8);8,489(3,0);8,348(6,5);8,161(2,4);8,138(2,6);7,745(2,2);7,739(2,2);7,713(2,2);7,691(2,3);7,339(2,4);7,332(2,4);7,024(1,4);7,017(1,2);7,002(1,3);6,995(1,2);6,983(1,4);6,977(1,3);6,961(1,2);6,955(1,2);4,038(0,6);4,013(11,9);3,988(13,3);3,832(0,8);3,814(3,3);3,808(16,0);3,796(3,1);3,784(2,9);3,766(0,9);3,702(14,0);3,318(186,2);2,679(1,2);2,675(2,2);2,670(3,2);2,666(2,4);2,556(0,5);2,524(7,0);2,510(191,2);2,506(398,5);2,501(531,3);2,497(385,7);2,492(188,5);2,332(2,3);2,328(3,1);2,323(2,3);1,988(2,6);1,268(2,9);1,260(3,2);1,249(6,5);1,242(7,2);1,231(3,0);1,223(3,0);1,192(0,7);1,174(1,3);1,157(0,7);0,146(1,6);0,008(13,1);0,000(375,2);-0,009(13,7);-0,150(1,6)
3,28	3,32	Ejemplo I-31: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,337(4,2);8,980(3,4);8,958(4,0);8,604(3,7);8,582(3,4);8,320(4,4);7,916(2,0);7,897(2,2);7,775(0,7);7,757(1,8);7,740(1,6);7,738(1,5);7,709(2,4);7,690(1,2);7,613(1,2);7,594(1,8);7,576(0,8);5,170(6,3);3,988(16,0);3,808(1,1);3,789(3,4);3,771(3,4);3,752(1,1);3,319(37,6);2,675(0,5);2,671(0,7);2,666(0,5);2,524(2,0);2,510(44,8);2,506(90,1);2,501(118,3);2,497(86,3);2,493(43,1);2,333(0,5);2,328(0,7);2,324(0,6);2,074(0,6);1,243(3,7);1,225(8,3);1,206(3,6);0,008(0,4);0,000(11,0);-0,008(0,5)
3,39	3,37	Ejemplo I-32: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,329(4,3);8,778(3,1);8,756(4,0);8,593(2,1);8,589(3,0);8,586(2,2);8,580(4,3);8,558(3,4);8,342(4,5);7,999(3,5);7,996(3,5);3,996(16,0);3,861(1,0);3,843(3,3);3,825(3,4);3,806(1,0);3,318(31,8);2,675(1,0);2,670(1,4);2,666(1,0);2,523(3,4);2,510(87,0);2,506(180,9);2,501(241,3);2,497(174,4);2,492(85,3);2,333(1,0);2,328(1,5);2,324(1,1);1,254(3,7);1,235(8,3);1,217(3,6);0,008(0,6);0,000(18,1);-0,008(0,8)
3,20	3,25	Ejemplo I-33: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,354(4,8);9,350(8,1);9,022(2,8);9,000(4,3);8,916(4,0);8,894(2,8);8,389(3,4);8,368(3,6);8,346(4,6);7,634(3,8);7,613(3,5);4,041(16,0);3,977(0,7);3,893(1,0);3,875(3,4);3,856(3,5);3,838(1,1);3,318(109,4);2,675(1,8);2,670(2,5);2,666(2,0);2,506(306,8);2,501(413,1);2,497(327,4);2,332(1,8);2,328(2,4);2,324(2,0);1,278(3,7);1,260(8,3);1,241(3,9);0,146(1,0);0,008(9,8);0,000(222,4);-0,150(1,0)
3,79	3,83	Ejemplo I-34: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,338(4,3);8,954(3,1);8,931(3,7);8,620(3,5);8,598(3,2);8,322(4,8);7,929(2,9);7,924(3,1);7,825(1,4);7,820(1,3);7,805(2,3);7,800(2,2);7,748(2,8);7,728(1,7);5,158(6,5);3,979(16,0);3,806(1,0);3,788(3,3);3,769(3,3);3,751(1,1);3,622(0,4);3,319(82,3);3,106(0,3);2,675(1,2);2,670(1,6);2,666(1,2);2,524(4,1);2,506(212,2);2,501(271,8);2,497(193,3);2,332(1,2);2,328(1,6);2,324(1,1);2,074(1,6);1,240(3,7);1,221(8,2);1,203(3,7);0,008(0,7);0,000(21,4)
2,53	2,55	Ejemplo I-35: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,615(5,2);9,343(3,8);8,787(2,4);8,765(3,1);8,653(2,8);8,632(3,0);8,608(2,9);8,585(2,3);8,350(4,0);7,464(2,9);7,443(2,9);7,317(0,5);7,296(0,5);4,045(0,5);4,039(0,4);4,021(0,4);3,981(13,1);3,851(0,8);3,832(2,8);3,814(2,8);3,795(0,8);3,323(22,7);2,525(0,7);2,512(15,9);2,507(32,7);2,503(45,3);2,499(34,3);2,075(16,0);1,989(1,5);1,268(3,0);1,249(6,7);1,231(3,0);1,194(0,4);1,176(0,8);1,158(0,4);0,007(0,7);0,000(20,1);-0,008(0,8)

ES 2 786 573 T3

(continuación)

LOGP_NEUTRAL	LOGP_HCOOH	NMR
2,72	2,70	Ejemplo I-36: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,320(4,5);8,720(2,9);8,698(4,0);8,571(3,9);8,549(3,1);8,330(5,0);7,280(2,3);7,256(3,2);7,140(1,9);7,122(2,1);7,116(1,4);7,099(1,6);6,876(2,9);6,859(2,6);3,972(16,0);3,843(1,1);3,825(3,4);3,806(3,5);3,788(1,1);3,329(32,6);2,675(1,0);2,670(1,3);2,523(3,3);2,506(173,0);2,501(223,6);2,497(160,3);2,328(1,3);2,324(1,0);2,074(7,2);1,249(3,8);1,230(8,3);1,212(3,8);0,146(0,5);0,008(4,1);0,000(102,4);-0,150(0,5)
3,00	2,96	Ejemplo I-37: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,339(4,9);8,907(1,3);8,886(5,2);8,872(5,1);8,850(1,4);8,763(3,2);8,740(3,4);8,364(5,5);7,769(3,4);7,747(3,3);4,144(0,4);4,014(16,0);3,908(1,2);3,891(3,7);3,872(3,7);3,853(1,2);3,319(19,1);2,671(1,0);2,502(174,9);2,328(1,0);2,075(1,0);1,280(4,0);1,262(8,5);1,243(4,0);0,000(59,8)
3,32	3,29	Ejemplo I-38: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,336(3,9);8,942(3,2);8,920(3,8);8,569(3,5);8,546(3,3);8,317(4,4);7,830(2,6);7,808(2,8);7,236(2,1);7,232(2,4);7,145(1,5);7,140(1,3);7,124(1,4);7,119(1,3);5,101(5,5);3,984(15,0);3,871(16,0);3,800(0,9);3,781(3,0);3,763(3,1);3,745(0,9);3,319(91,4);2,675(1,8);2,670(2,5);2,666(1,8);2,524(5,5);2,519(8,8);2,510(155,2);2,506(324,0);2,501(430,0);2,497(306,5);2,492(146,1);2,333(1,9);2,328(2,5);2,323(1,9);2,074(1,8);1,239(3,5);1,220(7,7);1,202(3,3);0,146(0,6);0,008(4,8);0,000(154,4);-0,009(5,6);-0,150(0,7)
3,21	3,17	Ejemplo I-39: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,354(4,3);8,855(0,3);8,821(0,6);8,799(7,6);8,796(6,9);8,773(0,5);8,442(2,1);8,421(2,3);8,369(4,5);8,290(2,1);8,269(2,2);7,716(1,0);7,696(1,8);7,678(1,3);7,615(1,4);7,595(1,9);7,577(0,9);4,028(16,0);4,008(0,4);3,888(1,0);3,869(3,3);3,851(3,4);3,832(1,0);3,318(111,9);2,674(2,8);2,670(3,8);2,666(2,9);2,523(9,2);2,505(502,9);2,501(657,9);2,497(471,0);2,332(2,8);2,328(3,9);2,324(2,8);2,074(0,5);1,281(3,7);1,262(8,4);1,244(3,7);0,146(0,5);0,008(3,1);0,000(111,2);-0,008(4,4);-0,150(0,6)
2,96	2,92	Ejemplo I-40: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,322(4,4);8,826(3,5);8,805(3,8);8,338(4,8);8,316(0,6);8,274(0,4);8,140(3,8);8,119(3,8);8,080(0,4);8,071(2,8);8,063(3,2);8,057(3,0);8,049(4,4);8,039(0,7);7,996(0,6);7,986(4,1);7,979(2,9);7,973(2,9);7,965(2,7);4,363(1,1);4,022(16,0);3,953(2,0);3,935(3,5);3,917(3,6);3,899(1,5);3,319(52,7);2,671(1,5);2,666(1,1);2,524(4,0);2,506(202,1);2,502(260,0);2,497(187,7);2,333(1,2);2,329(1,5);1,292(3,8);1,273(8,5);1,255(3,8);1,237(0,6);1,205(0,4);1,188(0,5);1,170(0,6);0,147(1,5);0,008(15,8);0,000(351,5);-0,008(18,0);-0,149(1,5)
3,26	3,25	Ejemplo I-41: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,330(4,2);8,786(2,5);8,763(4,7);8,715(4,6);8,693(2,7);8,354(4,4);8,018(1,8);8,000(1,9);7,511(1,7);7,509(1,8);7,489(2,1);7,317(0,8);7,314(0,8);7,298(1,9);7,295(1,9);7,278(1,3);7,275(1,2);7,253(1,3);7,250(1,3);7,234(1,8);7,231(1,8);7,214(0,8);3,963(16,0);3,813(1,0);3,795(3,4);3,776(3,5);3,758(1,1);3,721(0,5);3,319(43,8);2,890(0,3);2,675(0,9);2,670(1,3);2,666(0,9);2,510(85,6);2,506(171,8);2,501(226,5);2,497(165,7);2,493(83,3);2,333(1,0);2,328(1,3);2,324(1,0);2,074(0,6);1,245(3,7);1,227(8,3);1,208(3,7);0,146(1,3);0,008(11,6);0,000(277,7);-0,008(14,3);-0,150(1,2)

ES 2 786 573 T3

(continuación)

LOGP_NEUTRAL	LOGP_HCOOH	NMR
2,38	2,42	Ejemplo I-42: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,330(1,4);9,323(4,3);8,787(0,3);8,759(2,9);8,745(1,0);8,737(4,3);8,695(0,9);8,673(0,6);8,643(4,1);8,621(3,1);8,332(4,5);8,316(0,4);8,168(0,5);8,142(0,9);8,117(0,8);8,092(0,8);8,081(1,0);8,074(3,6);8,049(4,0);7,695(0,4);7,670(0,4);7,478(0,9);7,453(1,0);7,448(4,1);7,423(3,8);3,979(4,1);3,964(16,0);3,838(1,2);3,820(3,7);3,802(3,7);3,783(1,3);3,622(0,4);3,604(0,4);3,318(135,3);2,675(2,7);2,670(3,6);2,666(2,7);2,523(9,4);2,510(232,4);2,506(471,9);2,501(623,0);2,497(449,8);2,493(220,9);2,332(2,6);2,328(3,5);2,323(2,7);1,337(0,5);1,301(0,7);1,283(1,0);1,247(4,3);1,235(5,1);1,228(9,2);1,210(3,8);1,166(0,4);0,853(0,4);0,146(3,7);0,008(32,8);0,000(837,7);-0,008(38,6);-0,061(0,4);-0,150(3,8)
2,31	2,26	Ejemplo I-43: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,322(4,1);8,726(2,8);8,704(4,3);8,619(4,2);8,596(3,0);8,333(4,4);7,984(2,0);7,967(2,1);7,389(0,6);7,387(0,6);7,374(0,6);7,371(0,6);7,365(1,3);7,363(1,4);7,350(1,5);7,348(1,5);7,324(2,8);7,300(1,2);6,700(1,0);6,697(1,1);6,682(1,9);6,667(1,0);6,664(1,0);3,981(16,0);3,843(0,9);3,825(3,3);3,806(3,4);3,788(1,0);3,319(25,5);2,675(0,6);2,670(0,8);2,666(0,6);2,524(1,7);2,510(47,1);2,506(99,5);2,501(134,0);2,497(96,8);2,493(47,1);2,333(0,6);2,328(0,8);2,324(0,6);1,249(3,6);1,231(8,1);1,212(3,6);0,008(1,7);0,000(57,7);-0,008(2,2)
3,06	3,10	Ejemplo I-44: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,320(4,6);8,846(2,9);8,823(4,1);8,711(3,9);8,688(2,9);8,343(4,9);8,033(2,2);8,014(2,3);7,322(1,6);7,303(2,6);7,260(1,4);7,241(2,2);7,222(1,0);7,099(1,2);7,081(2,0);7,062(1,0);3,956(16,0);3,782(1,1);3,763(3,6);3,745(3,6);3,726(1,1);3,452(16,2);3,323(49,1);3,270(0,8);2,671(0,5);2,507(73,8);2,502(95,4);2,498(72,0);2,329(0,5);1,243(3,8);1,225(8,3);1,206(3,7);0,000(37,8)
2,62	2,59	Ejemplo I-45: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 11,621(2,6);9,553(1,2);9,321(5,1);9,212(1,3);9,148(1,2);8,837(3,1);8,814(4,0);8,683(3,5);8,661(3,0);8,342(5,9);8,316(1,4);8,279(1,3);7,991(3,0);7,970(2,8);7,171(1,4);7,154(2,9);7,136(2,5);7,114(3,4);7,097(1,7);7,032(1,7);7,016(2,8);6,998(1,5);3,975(1,2);3,955(16,0);3,770(3,5);3,751(3,8);3,733(3,8);3,718(1,6);3,585(2,3);3,399(1,1);3,322(962,1);2,671(8,3);2,502(1476,0);2,328(8,4);2,073(3,3);1,237(4,6);1,220(8,9);1,201(4,0);1,161(2,0);1,143(2,0);0,146(5,7);0,000(1153,4);-0,150(6,0)
2,30	2,26	Ejemplo I-46: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,343(4,2);9,016(3,2);8,994(3,7);8,840(1,6);8,831(1,7);8,640(3,6);8,617(3,3);8,328(4,4);8,316(0,4);8,179(1,6);8,161(1,8);7,733(1,7);7,721(1,7);7,713(1,6);7,701(1,6);5,170(6,4);3,989(16,0);3,951(0,3);3,914(1,3);3,818(1,0);3,800(3,3);3,782(3,3);3,763(1,0);3,318(66,2);2,675(1,7);2,670(2,4);2,666(1,7);2,523(5,8);2,510(151,5);2,506(305,5);2,501(398,2);2,497(282,7);2,493(135,2);2,332(1,7);2,328(2,3);2,323(1,7);2,074(2,4);1,247(3,9);1,228(8,6);1,210(3,7);1,203(1,0);1,184(0,4);0,008(2,1);0,000(71,4);-0,009(2,7);-0,150(0,3)
	3,05	Ejemplo I-47: <sup>1</sup> H-NMR(600,1 MHz, DMF): δ= 9,379(3,8);8,969(3,0);8,954(3,5);8,765(3,4);8,750(3,0);8,328(4,0);8,245(2,8);8,230(2,9);8,025(8,7);7,246(3,1);7,242(3,1);7,093(1,8);7,089(1,7);7,078(1,7);7,074(1,6);4,183(0,7);4,146(16,0);3,890(1,1);3,877(3,5);3,865(3,6);3,853(1,1);3,482(1,7);2,952(0,7);2,922(4,6);2,919(8,8);2,916(1,8);2,913(8,4);2,910(4,1);2,784(0,6);2,751(4,8);2,748(9,1);2,745(12,5);2,742(8,8);2,738(4,4);1,333(3,9);1,321(8,2);1,309(3,8);1,280(0,5);0,000(6,6)

(continuación)

LOGP_NEUTRAL	LOGP_HCOOH	NMR
	2,97	Ejemplo I-48: <sup>1</sup> H-NMR(601,6 MHz, DMF): δ= 9,446(3,4);8,909(2,9);8,894(3,9);8,786(3,7);8,771(3,1);8,337(3,7);8,336(3,5);8,140(2,7);8,137(2,9);8,024(4,9);7,259(0,9);7,255(0,8);7,245(2,7);7,242(2,9);7,232(4,1);7,219(1,4);4,180(16,0);3,871(1,0);3,859(3,5);3,847(3,7);3,834(1,3);3,461(4,7);2,951(0,4);2,921(2,5);2,918(5,2);2,915(7,5);2,912(5,8);2,909(3,3);2,784(0,4);2,751(2,8);2,748(5,6);2,745(8,1);2,741(6,1);2,738(3,6);1,333(3,6);1,320(8,2);1,308(4,0);1,281(0,5);1,269(0,4);1,257(0,3);0,000(5,5);-0,006(0,5)
3,74	3,74	Ejemplo I-49: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,359(4,6);9,334(0,7);8,859(0,8);8,842(0,9);8,830(1,4);8,819(0,5);8,808(5,6);8,796(5,5);8,774(1,4);8,469(3,3);8,464(3,4);8,437(2,8);8,415(3,0);8,371(4,9);8,359(0,9);8,313(0,5);8,193(0,4);8,170(0,4);7,712(1,9);7,707(1,9);7,690(1,9);7,685(1,9);7,634(0,3);4,012(16,0);3,998(2,9);3,888(1,1);3,870(3,6);3,852(3,8);3,833(1,3);3,321(138,4);2,671(1,8);2,506(229,8);2,502(300,0);2,498(230,5);2,333(1,3);2,328(1,7);2,075(0,4);1,277(4,0);1,259(8,7);1,240(4,3);0,146(0,4);0,000(61,3)
3,77	3,72	Ejemplo I-50: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,359(4,0);9,335(0,8);8,860(1,0);8,842(1,0);8,830(1,2);8,820(0,4);8,808(5,1);8,796(5,0);8,774(1,2);8,468(2,9);8,464(3,0);8,437(2,5);8,414(2,7);8,370(4,4);8,358(0,9);8,308(0,6);8,193(0,5);8,170(0,5);7,712(1,7);7,707(1,8);7,689(1,7);7,685(1,7);7,638(0,4);7,634(0,4);7,615(0,3);7,611(0,4);4,012(14,5);3,998(3,2);3,888(1,0);3,870(3,3);3,852(3,3);3,833(1,1);3,318(25,9);2,671(1,3);2,666(1,0);2,506(163,2);2,502(216,6);2,497(163,0);2,332(0,9);2,328(1,2);2,324(1,0);2,074(16,0);1,277(3,5);1,259(7,8);1,240(3,6);0,146(0,7);0,008(7,1);0,000(169,2);-0,150(0,8)
2,08	2,09	Ejemplo I-51: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9,337(4,2);8,985(1,5);8,963(5,7);8,950(5,5);8,928(1,5);8,395(2,2);8,378(2,3);8,353(4,4);7,607(2,3);7,591(2,4);7,056(1,8);7,037(3,4);7,019(1,7);4,012(16,0);3,907(1,0);3,889(3,3);3,871(3,4);3,852(1,0);3,323(148,3);2,671(1,1);2,666(0,8);2,510(74,0);2,506(150,5);2,502(200,7);2,497(145,6);2,493(71,1);2,333(0,8);2,328(1,1);2,323(0,8);1,278(3,6);1,260(8,1);1,241(3,6);0,008(1,1);0,000(28,5);-0,008(1,3)

Los valores logP se miden de acuerdo con EEC Directive 79/831 Annex V.A8 por HPLC (cromatografía líquida de alto rendimiento) en una columna de fase inversa (C 18). Temperatura: 55°C.

- 5 La determinación de LC-MS en el intervalo ácido se efectúa a pH 2,7 usando 0,1% ácido fórmico acuoso y acetonitrilo (contiene 0,1% ácido fórmico) como eluyentes; gradiente lineal de 10% acetonitrilo a 95% acetonitrilo. logP llamado (HCOOH) en la tabla.

La determinación de LC-MS en el intervalo neutro se efectúa a pH 7,8 con solución de hidrogenocarbonato de amonio acuosa 0,001 molar y acetonitrilo como eluyentes; gradiente lineal de 10% acetonitrilo a 95% acetonitrilo. logP llamado (neutro) en la tabla.

- 10 La calibración se lleva a cabo usando alcan-2-onas no ramificadas (con 3 a 16 átomos de carbono) con valores logP conocidos (valores logP determinados según los tiempos de retención por interpolación lineal entre dos alcanonas sucesivas).

Los datos de NMR de ejemplo seleccionados se enumeran ya sea en forma convencional (δ valores, división de multipletes, cantidad de átomos de hidrógeno) o como listas de picos NMR.

- 15 En cada caso, se especifica el disolvente donde el espectro NMR se registró.

Procedimiento de lista de picos NMR

Los datos <sup>1</sup>H NMR de ejemplos seleccionados se enumeran en la forma de listas de picos <sup>1</sup>H NMR. Para cada pico de

señal, se enumera primero el  $\delta$  valor en ppm y luego la intensidad de señal en paréntesis. Los pares de  $\delta$  números de valor-intensidad de señal para diferentes picos de señal se enumeran con separación entre sí por punto y coma.

La lista de picos para un ejemplo de este tiene la forma:

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

5 La intensidad de señales agudas se correlaciona con la altura de las señales en un ejemplo impreso de un espectro de NMR en cm y muestra las relaciones reales de las intensidades de señal. En el caso de señales anchas, los varios picos o la mitad de la señal y la intensidad relativa de esta pueden mostrarse en comparación con la señal más intensa del espectro.

10 La calibración del cambio químico de los espectros  $^1\text{H}$  NMR se logra usando tetrametilsilano y/o el cambio químico del disolvente, particularmente en el caso de los espectros que se miden en DMSO. Por lo tanto, el pico de tetrametilsilano puede pero no necesita ocurrir en listas de picos NMR.

Las listas de los picos  $^1\text{H}$  NMR son similares a las impresiones  $^1\text{H}$ -NMR convencionales y por lo tanto contienen generalmente todos los picos enumerados en una interpretación NMR convencional.

15 Asimismo, como las impresiones  $^1\text{H}$  NMR convencionales, pueden mostrar señales de disolvente, señales de estereoisómeros de los compuestos diana que se proveen del mismo modo por la invención, y/o picos de impurezas.

En el reporte de señales de compuesto dentro del intervalo delta de disolventes y/o agua, nuestras listas de picos  $^1\text{H}$  NMR muestran los picos de disolvente estándar, por ejemplo picos de DMSO en DMSO- $\text{D}_6$  y el pico de agua, que tiene generalmente una alta intensidad en promedio.

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

Tales estereoisómeros y/o impurezas pueden ser habituales para el procedimiento de preparación particular. Sus picos pueden entonces ayudar a identificar la reproducción de nuestro procedimiento de preparación con referencia a "huellas digitales de derivados".

25 Un experto que calcula los picos de los compuestos diana por procedimientos conocidos (MestreC, simulación ACD, pero también con valores de expectativa evaluados empíricamente) puede, de ser necesario, aislar los picos de los compuestos diana, usando opcionalmente filtros de intensidad adicionales. Este aislamiento sería similar a la selección de picos en cuestión en la interpretación de  $^1\text{H}$  NMR convencional.

Otros detalles de las listas de picos  $^1\text{H}$  NMR pueden encontrarse en la Base de Datos de la Descripción de Investigación Número 564025.

### 30 **Ejemplos de aplicación**

#### **Ctenocephalides felis – pruebas de contacto in vitro con pulgas de gato adulto**

35 Para el recubrimiento de los tubos de prueba, se disuelve primero 9 mg de principio activo en 1 ml de acetona p.a. y luego se diluyen a la concentración deseada con acetona p.a. 250  $\mu\text{l}$  de la solución se distribuyen de forma homogénea en las paredes internas y la base de un tubo de prueba de 25 ml girando y balanceando en un agitador orbital (rotación de balanceo a 30 rpm durante 2 h). Con 900 ppm de solución de principio activo y área de superficie interna 44,7  $\text{cm}^2$ , dada la distribución homogénea, se logra una dosis basada en el área de 5  $\mu\text{g}/\text{cm}^2$ .

40 Luego el disolvente se evaporó, los tubos se rellenaron con 5-10 pulgas de gato adulto (*Ctenocephalides felis*), se cerró con una tapa plástica perforada y se incubó en una posición horizontal a temperatura ambiente y humedad ambiente. Después de 48 h, se determina la eficacia. A estos efectos, los tubos de prueba se irguen derechos y las polillas se golpean a la base del tubo. Las polillas que permanecen sin movimiento en la base o se mueven de forma descoordinada se consideran muertas o moribundas.

Una sustancia muestra buena eficacia contra *Ctenocephalides felis* si al menos 80% de eficacia se logró en esta prueba a una tasa de aplicación de 5  $\mu\text{g}/\text{cm}^2$ . 100% de eficacia significa que todas las polillas están muertas o moribundas. 0% de eficacia significa que no se dañó ninguna polilla.

45 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 100% a una tasa de aplicación de 5  $\mu\text{g}/\text{cm}^2$ : I-6, I-18, I-22, I-24, I-31, I-34, I-35

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los Ejemplos de Preparación muestran una eficacia de 80% a una tasa de aplicación de 5  $\mu\text{g}/\text{cm}^2$ : I-21

#### **Boophilus microplus – prueba de inyección**

Disolvente: dimetilsulfóxido

Para producir una formulación de principio activo adecuado, se mezcló 10 mg de principio activo con 0,5 ml de disolvente y el concentrado se diluye con disolvente a la concentración deseada.

5 1 µl de la solución de principio activo se inyecta en el abdomen de 5 garrapatas llenas de sangre de ganado hembra adulto (*Boophilus microplus*). Los animales se transfieren a platos y se mantienen en una habitación con clima controlado.

La eficacia se evalúa después de 7 días de anidado huevos fértiles. Los huevos que no son visiblemente fértiles se almacenan en un gabinete con clima controlado hasta que las larvas eclosionan después de alrededor de 42 días.

10 Una eficacia del 100% significa que ninguna de las garrapatas puso huevos fértiles; 0% significa que todos los huevos son fértiles.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 90% a una tasa de aplicación de 20 µg/animal: I-6, I-11

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 80% a una tasa de aplicación de 20 µg/animal: I-5, I-10

15 **Ctenocephalides felis - prueba oral**

Disolvente: dimetilsulfóxido

A los efectos de producción de una formulación de principio activo adecuado, 10 mg de principio activo se mezcla con 0,5 ml de dimetilsulfóxido. La dilución con sangre de ganado citrada proporciona la concentración deseada.

20 Alrededor de 20 pulgas de gato adulto no alimentadas (*Ctenocephalides felis*) se colocan en una cámara que se cierra en la parte superior e inferior con gasa. Un cilindro de metal cuyo extremo inferior se cierra con parafilm se coloca sobre la cámara. El cilindro contiene la formulación de sangre/principio activo, que puede beberse por las pulgas a través de la membrana de parafina.

Después de 2 días, se determina la muerte en %. 100% significa que se mataron todas las pulgas; 0% significa que no se mató ninguna pulga.

25 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100% a una tasa de aplicación de 100 ppm: I-17, I-18, I-22, I-32

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 95% a una tasa de aplicación de 100 ppm: I-3, I-24, I-34, I-35

30 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 90% a una tasa de aplicación de 100 ppm: I-6, I-21

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 80% a una tasa de aplicación de 100 ppm: I-28

**Prueba Lucilia cuprina**

Disolvente: dimetilsulfóxido

35 Para producir una formulación de principio activo adecuado, se mezcló 10 mg de principio activo con 0,5 ml de dimetilsulfóxido y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Se transfieren aproximadamente 20 larvas L1 de la mosca califórica australiana (*Lucilia cuprina*) a un recipiente de prueba que contiene carne de caballo molida y la formulación de principio activo de la concentración deseada.

40 Después de 2 días, se determina la muerte en %. 100% significa que se mataron todas las larvas; 0% significa que no se mató ninguna larva.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100% a una tasa de aplicación de 100 ppm: I-3, I-5, I-6, I-10, I-15, I-18, I-21, I-22, I-28, I-29, I-31, I-32, I-34

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 90% a una tasa de aplicación de 100 ppm: I-4

45 **Prueba de Musca domestica**

Disolvente: dimetilsulfóxido

Para producir una formulación de principio activo adecuado, se mezcló 10 mg de principio activo con 0,5 ml de dimetilsulfóxido y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Los recipientes que contienen una esponja tratada con solución de azúcar y la formulación de principio activo de la concentración deseada se pueblan con 10 moscas domésticas adultas (*Musca domestica*).

- 5 Después de 2 días, se determina la muerte en %. 100% significa que se mataron todas las moscas; 0% significa que no se mató ninguna mosca.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100% a una tasa de aplicación de 100 ppm: I-6, I-10, I-32

- 10 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 80% a una tasa de aplicación de 100 ppm: I-18

**Prueba *Meloidogyne incognita***

Disolvente: 125,0 partes en peso de acetona

Para producir una preparación adecuada del componente activo, se mezcló 1 parte en peso de principio activo con la cantidad establecida de disolvente y el concentrado se diluyó con agua a la concentración deseada.

- 15 Los recipientes se llenan con arena, solución de principio activo, una suspensión de huevo/larvas del nematodo nodulador de la raíz sureño (*Meloidogyne incognita*) y semillas de lechuga. Las semillas de lechuga germinan y las plantas crecen. Las agallas se desarrollan en las raíces.

- 20 Después de 14 días, la eficacia nematocida en % se determina por la formación de agallas. 100% significa que no se encontró ninguna agalla; 0% significa que la cantidad de agallas en las plantas tratadas corresponde al control no tratado.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100% a una tasa de aplicación de 20 ppm: I-27, I-36

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 90% a una tasa de aplicación de 20 ppm: I-28

- 25 **Myzus persicae – prueba de aerosol**

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

- 30 Para producir una formulación de principio activo adecuado, 1 parte en peso de principio activo se disuelve con las partes establecidas en peso de disolvente y se llena de agua que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm hasta lograr la concentración deseada. Para producir otras concentraciones de prueba, la formulación se diluye con agua que contiene emulsionante.

Discos de hojas de repollo chino (*Brassica pekinensis*) infectados por todas las etapas del pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*) se rocía con una formulación de principio activo de la concentración deseada.

- 35 Después de 5 días, se determina la eficacia en %. 100% significa que se mataron todos los pulgones; 0% significa que no se mató ningún pulgón.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 100% a una tasa de aplicación de 500 g/ha: I-6

- 40 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 90% a una tasa de aplicación de 500 g/ha: I-5, I-12, I-23, I-24, I-33

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 70% a una tasa de aplicación de 500 g/ha: I-14, I-19

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 100% a una tasa de aplicación de 100 g/ha: I-6, I-24

- 45 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 90% a una tasa de aplicación de 100 g/ha: I-12, I-19, I-37, I-43

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 70% a una tasa de aplicación de 100 g/ha: I-5

**Phaedon cochleariae – prueba de aerosol**

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

5 Para producir una formulación de principio activo adecuado, 1 parte en peso de principio activo se disuelve con las partes establecidas en peso de disolvente y se llena de agua que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm hasta lograr la concentración deseada. Para producir otras concentraciones de prueba, la formulación se diluye con agua que contiene emulsionante.

10 Discos de hojas de repollo chino (*Brassica pekinensis*) se rocían con una formulación de principio activo de la concentración deseada y, después de secarse, se pueblan con larvas de escarabajo de la mostaza (*Phaedon cochleariae*).

Después de 7 días, se determina la eficacia en %. 100% significa que se mataron todas las larvas de escarabajo; 0% significa que no se mató ninguna larva de escarabajo.

15 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 100% a una tasa de aplicación de 500 g/ha: I-3, I-5, I-6, I-7, I-10, I-12, I-15, I-17, I-18, I-19, I-22, I-27, I-28, I-31, I-32, I-33, I-34, I-35, I-40

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 83% a una tasa de aplicación de 500 g/ha: I-11, I-16, I-21, I-24

20 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 100% a una tasa de aplicación de 100 g/ha: I-3, I-6, I-7, I-10, I-12, I-15, I-17, I-18, I-19, I-22, I-27, I-28, I-31, I-32, I-33, I-34, I-40, I-42, I-49, I-50

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 83% a una tasa de aplicación de 100 g/ha: I-35

**Spodoptera frugiperda – prueba de aerosol**

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

30 Para producir una formulación de principio activo adecuado, 1 parte en peso de principio activo se disuelve con las partes establecidas en peso de disolvente y se llena de agua que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm hasta lograr la concentración deseada. Para producir otras concentraciones de prueba, la formulación se diluye con agua que contiene emulsionante.

Los discos de hoja de maíz (*Zea mays*) se rocían con una preparación de principio activo de la concentración deseada y, después de secarse, se pueblan con orugas del gusano cogollero (*Spodoptera frugiperda*).

35 Después de 7 días, se determina la eficacia en %. 100% significa que se mataron todas las orugas; 0% significa que no se mató ninguna oruga.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 100% a una tasa de aplicación de 500 g/ha: I-5, I-6, I-10, I-12, I-14, I-15, I-17, I-18, I-21, I-22, I-24, I-27, I-28, I-29, I-31, I-32, I-33, I-34

40 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 83% a una tasa de aplicación de 500 g/ha: I-3

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 100% a una tasa de aplicación de 100 g/ha: I-3, I-6, I-5, I-10, I-12, I-14, I-17, I-18, I-21, I-22, I-27, I-29, I-31, I-33, I-34, I-38, I-49, I-50

45 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 83% a una tasa de aplicación de 100 g/ha: I-24, I-32

**Tetranychus urticae – Prueba de aerosol, resistente a OP**

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

50 Para producir una formulación de principio activo adecuado, 1 parte en peso de principio activo se disuelve con las



partes establecidas en peso de disolvente y se llena de agua que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm hasta lograr la concentración deseada. Para producir otras concentraciones de prueba, la formulación se diluye con agua que contiene emulsionante.

- 5 Los discos de hojas de frijoles (*Phaseolus vulgaris*) infestados con todas las etapas del ácaro araña roja de invernadero (*Tetranychus urticae*) se rocían con una formulación de principio activo de la concentración deseada.

Después de 6 días, se determina la eficacia en %. 100% significa que se mataron todos los ácaros araña; 0% significa que no se mató ningún ácaro araña.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 90% a una tasa de aplicación de 500 g/ha: I-15, I-31

- 10 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 70% a una tasa de aplicación de 500 g/ha: I-2

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 90% a una tasa de aplicación de 100 g/ha: I-43

- 15 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 70% a una tasa de aplicación de 100 g/ha: I-39

**Prueba de aerosol *Myzus persicae***

Disolvente:	14 partes en peso de dimetilformamida
Emulsionante:	alquilaril poliglicol éter

- 20 Para producir una formulación de principio activo adecuado, 1 parte en peso de principio activo se disuelve con las partes establecidas en peso de disolvente y se llena de agua que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm hasta lograr la concentración deseada. Para producir otras concentraciones de prueba, la formulación se diluye con agua que contiene emulsionante. Si la adición de sales de amoníaco y/o penetrantes es necesaria, estas se agregan en una concentración de 1000 ppm a la solución de formulación.

- 25 Las plantas de pimentón (*Capsicum annuum*) gravemente infestadas con el pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*) se tratan rociando con la formulación de principio activo en la concentración deseada.

Después de 6 días, se determina la muerte en %. 100% significa que se mataron todos los áfidos; 0% significa que no se mató ningún áfido.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100% a una tasa de aplicación de 20 ppm: I-21, I-34

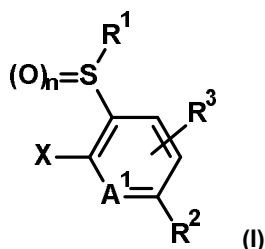
- 30 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 99% a una tasa de aplicación de 20 ppm: I-22

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 98% a una tasa de aplicación de 20 ppm: I-18

- 35 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 90% a una tasa de aplicación de 20 ppm: I-17

## REIVINDICACIONES

## 1. Compuestos de la fórmula (I)



en la que

- 5 A<sup>1</sup> representa nitrógeno, =N<sup>+</sup>(O)- o =C(R<sup>4</sup>)-,  
 R<sup>1</sup> representa alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cianoalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), hidroxialquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
 alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquenilo-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquenilo-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
 haloalquenilo-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquenilo-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
 haloalquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cianoalquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>),  
 10 cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), halo-cicloalquilo-  
 (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), amino, alquilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), di-alquilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilamino-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), alquilcarbonilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
 alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfinito-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
 haloalquilsulfinito-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-  
 15 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilsulfinito-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilcarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilcarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
 alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxycarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalcoxycarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
 alquilsulfonilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), aminosulfonil-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilaminosulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), di-  
 alquilaminosulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
 20 o representa alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquenilo-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), en cada caso  
 opcionalmente mono- o polisustituido, de manera igual o distinta, con arilo, hetarilo o heterociclilo, donde cada uno  
 de arilo, hetarilo y heterociclilo puede estar opcionalmente mono- o polisustituido, de manera igual o distinta con  
 halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, amino, carboxi, carbamoilo, aminosulfonilo, alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>),  
 alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfinito-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-  
 25 C<sub>6</sub>), alquilsulfimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilcarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
 alquilsulfoximino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfoximino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfoximino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilcarbonilo-(C<sub>2</sub>-  
 C<sub>6</sub>), alcoxycarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilcarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), trialquilsililo-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) y bencilo, o  
 R<sup>1</sup> representa arilo, hetarilo o heterociclilo, en cada caso opcionalmente mono- o polisustituido, de manera igual o  
 distinta, con halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, amino, carboxi, carbamoilo, cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), alcoxi-  
 30 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfinito-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
 alquilsulfimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilcarbonilo-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>),  
 alquilsulfoximino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfoximino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfoximino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilcarbonilo-(C<sub>2</sub>-  
 C<sub>6</sub>), alcoxycarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilcarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), trialquilsililo-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), (=O) (solo en el caso de heterociclilo) o  
 (=O)<sub>2</sub> (solo en el caso de heterociclilo),  
 35 R<sup>2</sup> representa un sistema de anillo bicíclico condensado heterocíclico o heteroaromático parcialmente saturado o  
 saturado de 8, 9, 10, 11 o 12 miembros, donde opcionalmente al menos un grupo carbonilo puede estar presente  
 y/o donde el sistema de anillo puede estar opcionalmente mono- o polisustituido de manera igual o distinta, y donde  
 los sustituyentes independientemente entre sí pueden seleccionarse de ciano, carboxi, halógeno, nitro, acetilo,  
 hidroxilo, amino, SCN, tri-alquilsililo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cianoalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), hidroxialquilo-  
 40 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), hidroxycarbonilo-alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxycarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
 alquenilo-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquenilo-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cianoalquenilo-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>),  
 cianoalquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-  
 C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cianoalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxycarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
 alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoximinio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), -N=C(H)-Oalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), -C(H)=N-Oalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
 alcoxiimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-  
 45 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfinito-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilsulfinito-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilsulfinito-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfinito-(C<sub>1</sub>-  
 C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
 alquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxycarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
 alquilcarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilcarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilcarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilcarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
 alquilcarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxycarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalcoxycarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), aminocarbonilo,  
 alquilaminocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), di-alquilaminocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquenilaminocarbonilo-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), di-  
 50 alquenilaminocarbonilo-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilaminocarbonilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), alquilsulfonilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
 di-alquilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), aminosulfonilo, alquilaminosulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), di-alquilaminosulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
 alquilsulfoximino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), aminotiocarbonilo, alquilaminotiocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), di-alquilaminotiocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
 cicloalquilamino-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), alquilcarbonilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
 R<sup>3</sup> representa hidrógeno, ciano, halógeno, nitro, acetilo, hidroxilo, amino, SCN, tri-alquilsililo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-

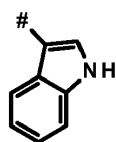
C<sub>8</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), halo-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cianoalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), hidroxialquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), hidroxicarbonilo-alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxicarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cianoalqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cianoalquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cianoalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxicarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilhidroxiimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxiiimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxiiimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxiiimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilsulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilsulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfoniloxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilcarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquiltiocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilcarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilcarboniloxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxicarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalcoxicarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilaminotiocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), di-alquilaminocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), di-alquilaminotiocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquenilaminocarbonilo-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), di-alquenilaminocarbonilo-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilaminocarbonilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), alquilsulfonilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), di-alquilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), aminosulfonilo, alquilaminosulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), di-alquilaminosulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfoximino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), aminotiocarbonilo, alquilaminotiocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), di-alquilaminotiocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilamino-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), NHCO-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) (alquilcarbonilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)), representa arilo o hetarilo, en cada caso opcionalmente mono- o polisustituidos, de manera igual o distinta, donde (en el caso de hetarilo) opcionalmente al menos un grupo carbonilo puede estar presente y/o donde como sustituyentes se tienen en cuenta en cada caso: ciano, carboxi, halógeno, nitro, acetilo, hidroxilo, amino, SCN, tri-alquilsililo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), halo-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cianoalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), hidroxialquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), hidroxicarbonilo-alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxicarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cianoalqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cianoalquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cianoalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxicarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilhidroxiimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxiiimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxiiimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxiiimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilsulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilsulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfoniloxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilcarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilcarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilcarboniloxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxicarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalcoxicarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), di-alquilaminocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquenilaminocarbonilo-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), di-alquenilaminocarbonilo-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilaminocarbonilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), alquilsulfonilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), di-alquilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), aminosulfonilo, alquilaminosulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), di-alquilaminosulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfoximino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), aminotiocarbonilo, alquilaminotiocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), di-alquilaminotiocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilamino-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), alquilcarbonilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), R<sup>4</sup> representa hidrógeno, ciano, halógeno, nitro, acetilo, hidroxilo, amino, SCN, tri-alquilsililo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), halo-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cianoalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), hidroxialquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), hidroxicarbonilo-alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxicarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cianoalqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cianoalquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cianoalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxicarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilhidroxiimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxiiimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxiiimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxiiimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilsulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilsulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfoniloxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilcarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquiltiocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilcarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilcarboniloxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxicarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalcoxicarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilaminotiocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), di-alquilaminocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), di-alquilaminotiocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquenilaminocarbonilo-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), di-alquenilaminocarbonilo-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilaminocarbonilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), alquilsulfonilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), di-alquilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), aminosulfonilo, alquilaminosulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), di-alquilaminosulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilsulfoximino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), aminotiocarbonilo, alquilaminotiocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), di-alquilaminotiocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilamino-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>) o -NHCO-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) (alquilcarbonilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)), X representa un sistema de anillo bicíclico o tricíclico condensado heterocíclico o heteroaromático parcialmente saturado o saturado de 8, 9, 10, 11 o 12 miembros, donde opcionalmente al menos un grupo carbonilo puede estar presente y/o donde el sistema de anillo está opcionalmente mono- o polisustituido de manera igual o distinta, y donde los sustituyentes independientemente entre sí pueden seleccionarse de ciano, halógeno, nitro, acetilo, hidroxilo, amino, SCN, tri-alquilsililo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), halo-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>), alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cianoalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), hidroxialquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), hidroxicarbonilo-alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxicarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cianoalqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquinoxi-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquinoxi-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cianoalquinoxi-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquenoxi-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquenoxi-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cianoalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxicarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilhidroxiimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxiiimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxiiimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxiiimino-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),



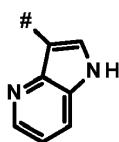


R<sup>2</sup> representa un sistema de anillo bicíclico condensado parcialmente saturado o heteroaromático de la serie Q1 a Q152, donde el sistema de anillo puede estar opcionalmente mono- o polisustituido de manera igual o distinta, donde los sustituyentes pueden seleccionarse independientemente entre sí de: nitro, hidroxilo, amino, ciano, halógeno, alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), cicloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) o haloalquilitio-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>),

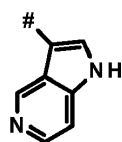
5



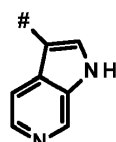
Q1



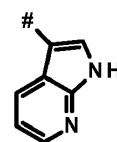
Q2



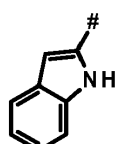
Q3



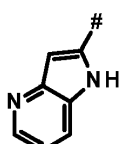
Q4



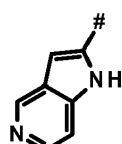
Q5



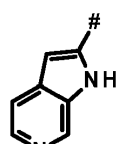
Q6



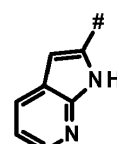
Q7



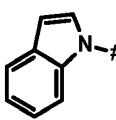
Q8



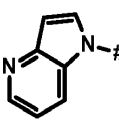
Q9



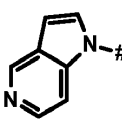
Q10



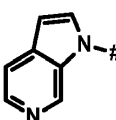
Q11



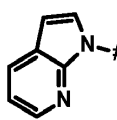
Q12



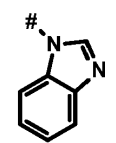
Q13



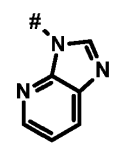
Q14



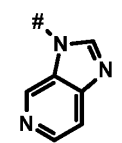
Q15



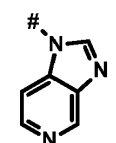
Q16



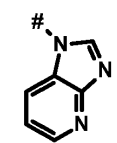
Q17



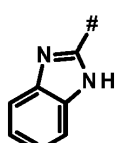
Q18



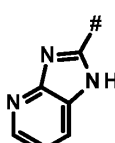
Q19



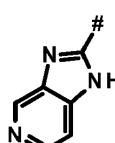
Q20



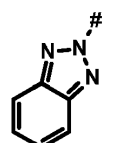
Q21



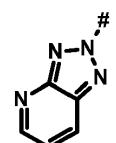
Q22



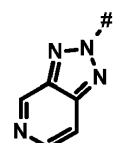
Q23



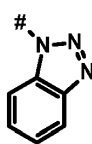
Q24



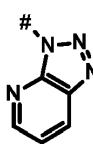
Q25



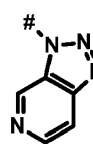
Q26



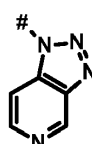
Q27



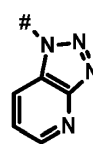
Q28



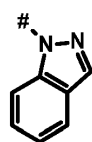
Q29



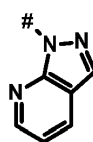
Q30



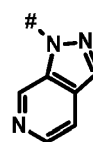
Q31



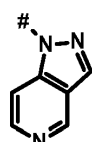
Q32



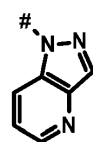
Q33



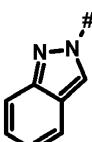
Q34



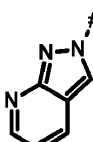
Q35



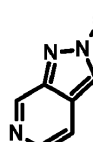
Q36



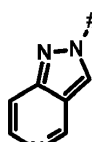
Q37



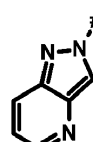
Q38



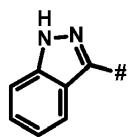
Q39



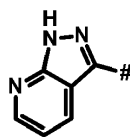
Q40



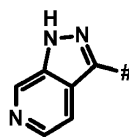
Q41



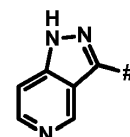
Q42



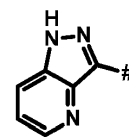
Q43



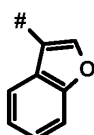
Q44



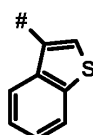
Q45



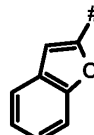
Q46



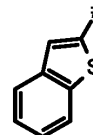
Q47



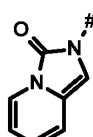
Q48



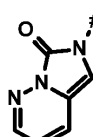
Q49



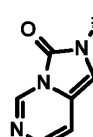
Q50



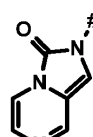
Q51



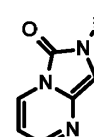
Q52



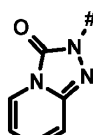
Q53



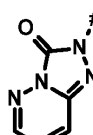
Q54



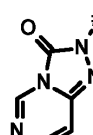
Q55



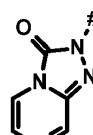
Q56



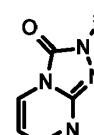
Q57



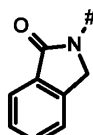
Q58



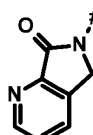
Q59



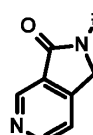
Q60



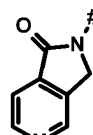
Q61



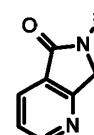
Q62



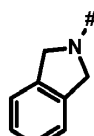
Q63



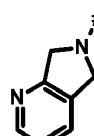
Q64



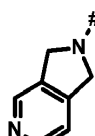
Q65



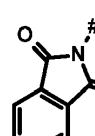
Q66



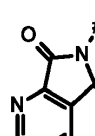
Q67



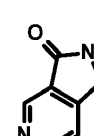
Q68



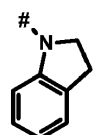
Q69



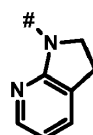
Q70



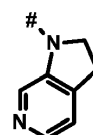
Q71



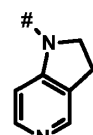
Q72



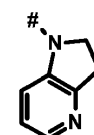
Q73



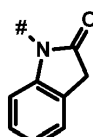
Q74



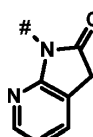
Q75



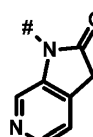
Q76



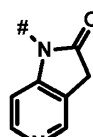
Q77



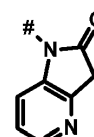
Q78



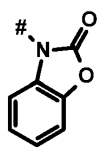
Q79



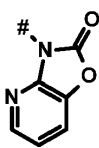
Q80



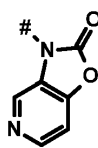
Q81



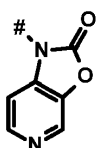
Q82



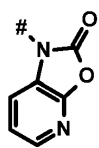
Q83



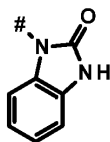
Q84



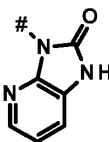
Q85



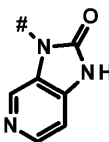
Q86



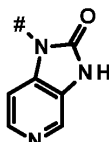
Q87



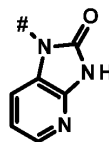
Q88



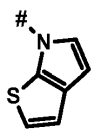
Q89



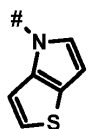
Q90



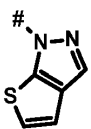
Q91



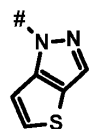
Q92



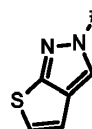
Q93



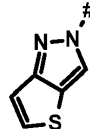
Q94



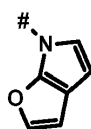
Q95



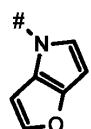
Q96



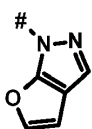
Q97



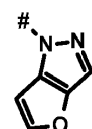
Q98



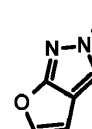
Q99



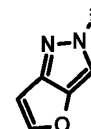
Q100



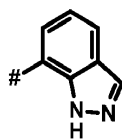
Q101



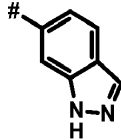
Q102



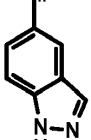
Q103



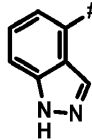
Q104



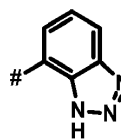
Q105



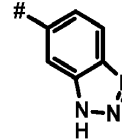
Q106



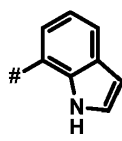
Q107



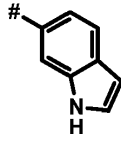
Q108



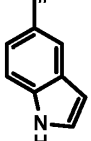
Q109



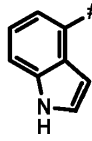
Q110



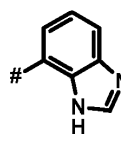
Q111



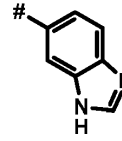
Q112



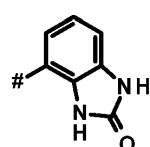
Q113



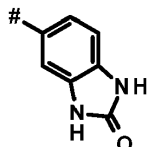
Q114



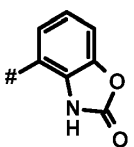
Q115



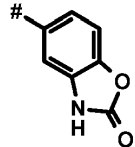
Q116



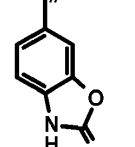
Q117



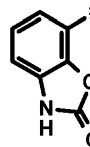
Q118



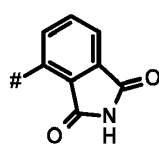
Q119



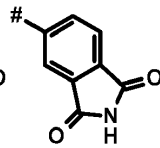
Q120



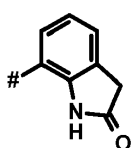
Q121



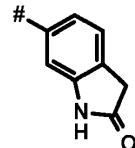
Q122



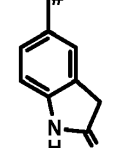
Q123



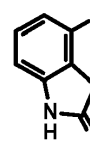
Q124



Q125

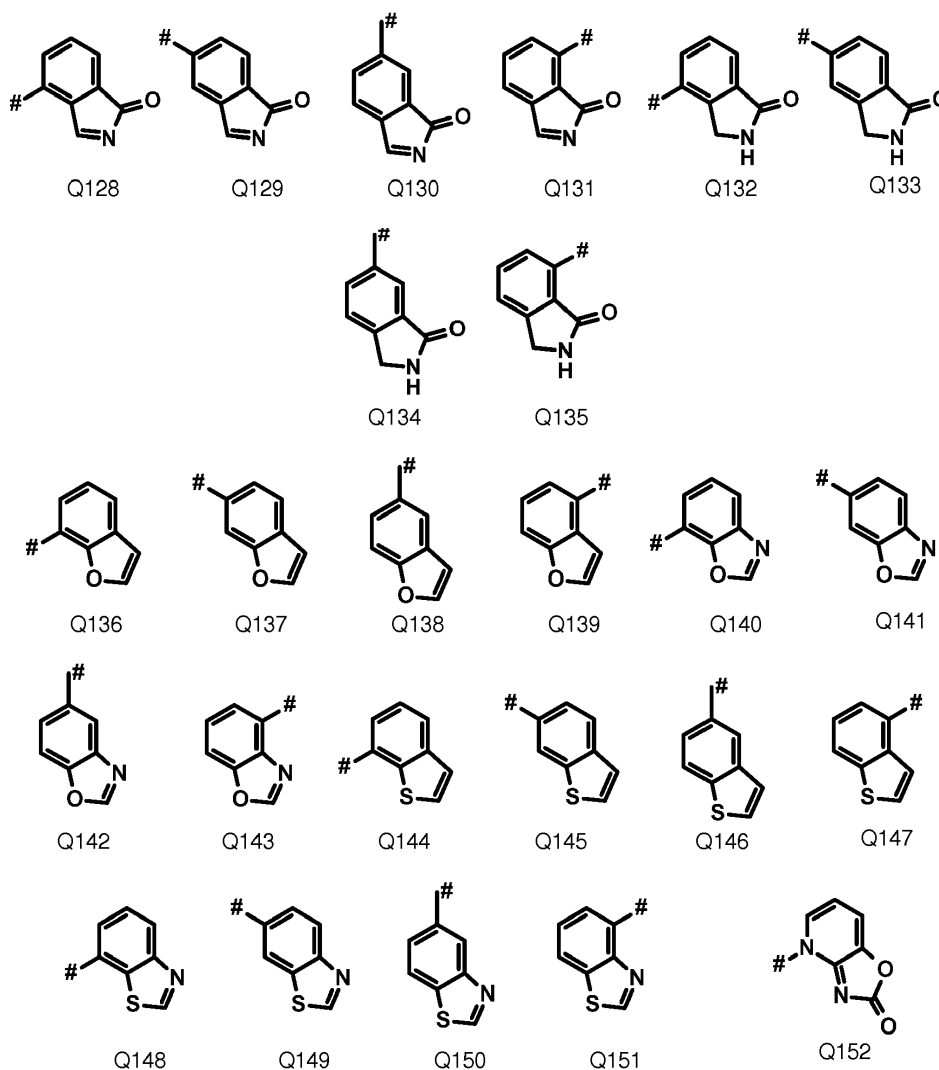


Q126



Q127





5

10

donde el enlace al resto de la molécula se identifica por una almohadilla #,

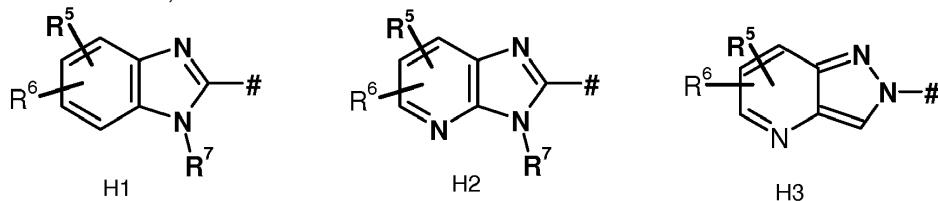
R<sup>3</sup> representa hidrógeno, ciano, halógeno, nitro, hidroxilo, amino, SCN, tri-alkilsililo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), halo-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), cianoalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), haloalqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), cianoalqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), cianoalquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), cianoalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilhidroximino-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoximino-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alcoximino-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilsulfino-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilsulfino-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilsulfoniloxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilcarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilcarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), di-alquilaminocarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilsulfonilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), di-alquilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), aminosulfonilo, alquilaminosulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), di-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-aminosulfonilo o NHCO-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) (alquilcarbonilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)),

15

20

R<sup>4</sup> representa hidrógeno, halógeno, ciano o alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>),

X representa un sistema de anillo bicíclico o tricíclico condensado heteroaromático de 9 miembros o 12 miembros de la serie H1 a H20,





haloalqueniloxi-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquenilo-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), cianoalquenilo-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alquinilo-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alquiniloxi-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquinilo-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), halo-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilsulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) o alquilcarbonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>),  
n representa 0, 1 o 2.

4. Compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, en los que

A<sup>1</sup> representa nitrógeno,

R<sup>1</sup> representa metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, n-butilo, isobutilo, terc-butilo, ciclobutilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, fluoroetilo, difluoroetilo, trifluoroetilo, tetrafluoroetilo o pentafluoroetilo,

R<sup>2</sup> representa un sistema de anillo bicíclico condensado, opcionalmente mono- o disustituido, de manera igual o distinta, de la serie Q1, Q2, Q3, Q4, Q5, Q6, Q7, Q8, Q9, Q10, Q11, Q12, Q13, Q14, Q15, Q16, Q17, Q18, Q19, Q20, Q21, Q22, Q23, Q27, Q28, Q29, Q30, Q31, Q32, Q33, Q34, Q35, Q36, Q37, Q38, Q39, Q40, Q41, Q42, Q43, Q44, Q45, Q46, Q51, Q52, Q53, Q54, Q55, Q56, Q57, Q58, Q59, Q60, Q61, Q62, Q63, Q64, Q65, Q66, Q67, Q68, Q69, Q70, Q71, Q77, Q78, Q79, Q80, Q81, Q82, Q83, Q84, Q85, Q86, Q87, Q88, Q89, Q90, Q91, Q92, Q93, Q94, Q95, Q96, Q97, Q104, Q105, Q106, Q107, Q108, Q109, Q114, Q115, Q116, Q117, Q118, Q119, Q120, Q121, Q124, Q125, Q126, Q127, Q128, Q129, Q130, Q131, Q132, Q133, Q134, Q135, Q136, Q137, Q138, Q139, Q140, Q141, Q142, Q143, Q144, Q145, Q146, Q147, Q148, Q149, Q150, Q151, Q152 donde como sustituyentes se tienen en cuenta en cada caso: ciano, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, trifluorometilo, pentafluoroetilo, metoxi, etoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi, pentafluoroetoxi o trifluorometiltio,

R<sup>3</sup> representa hidrógeno, ciano, halógeno, alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilsulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilsulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) o NHCO-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) (alquilcarbonilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)),

X representa un sistema de anillo bicíclico o tricíclico condensado heteroaromático de 9 miembros o 12 miembros de la serie H1, H2, H3, H4, H5, H6, H7, H8, H9, H10, H11, H12, H13, H14, H15, H16, H17, H18, H19 o H20,

R<sup>5</sup> representa flúor, cloro, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, fluoroetilo, difluoroetilo, trifluoroetilo, tetrafluoroetilo, pentafluoroetilo, trifluorometoxi, difluoroclorometoxi, diclorofluorometoxi, trifluorometiltio, trifluorometilsulfonilo o trifluorometilsulfinilo,

R<sup>6</sup> representa hidrógeno,

R<sup>7</sup> representa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, terc-butilo, metoximetilo o metoxietilo, n representa 0, 1 o 2.

5. Compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, en los que

A<sup>1</sup> representa nitrógeno,

R<sup>1</sup> representa metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, n-butilo, isobutilo, terc-butilo, ciclobutilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, fluoroetilo, difluoroetilo, trifluoroetilo, tetrafluoroetilo o pentafluoroetilo,

R<sup>2</sup> representa un sistema de anillo bicíclico condensado, opcionalmente mono- o disustituido, de manera igual o distinta, de la serie Q1, Q6, Q11, Q12, Q15, Q16, Q17, Q20, Q27, Q28, Q32, Q33, Q34, Q35, Q37, Q38, Q51, Q56, Q57, Q61, Q62, Q66, Q67, Q69, Q82, Q87, Q105, Q106, Q107 o Q152, donde como sustituyentes se tienen en cuenta en cada caso: ciano, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, trifluorometilo, pentafluoroetilo, metoxi, etoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi, pentafluoroetoxi o trifluorometiltio,

R<sup>3</sup> representa hidrógeno, ciano, halógeno, alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilsulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilsulfinilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilsulfonilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) o NHCO-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) (alquilcarbonilamino-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)),

X representa un sistema de anillo bicíclico o tricíclico condensado heteroaromático de 9 miembros o 12 miembros de la serie H1, H2, H3, H4, H5, H6, H7, H8, H9, H10, H11, H12, H13, H14, H15, H16, H17, H18, H19 o H20,

R<sup>5</sup> representa flúor, cloro, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, fluoroetilo, difluoroetilo, trifluoroetilo, tetrafluoroetilo, pentafluoroetilo, trifluorometoxi, difluoroclorometoxi, diclorofluorometoxi, trifluorometiltio, trifluorometilsulfonilo o trifluorometilsulfinilo,

R<sup>6</sup> representa hidrógeno,

R<sup>7</sup> representa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, terc-butilo, metoximetilo o metoxietilo, n representa 0, 1 o 2.

6. Compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, en los que

A<sup>1</sup> representa nitrógeno,

R<sup>1</sup> representa etilo,

R<sup>2</sup> representa un sistema de anillo bicíclico condensado, mono- o disustituido, de manera igual o distinta, con cloro, bromo, ciano, metilo, metoxi y trifluorometilo, de la serie Q1, Q6, Q11, Q12, Q15, Q16, Q17, Q20, Q27, Q28, Q32, Q33, Q34, Q35, Q37, Q38, Q51, Q56, Q57, Q61, Q62, Q66, Q67, Q69, Q82, Q87, Q105, Q106, Q107 o Q152,

R<sup>3</sup> representa hidrógeno,

X representa un sistema de anillo heteroaromático de la serie H20,

R<sup>5</sup> representa trifluorometilo,

R<sup>6</sup> representa hidrógeno,

R<sup>7</sup> representa metilo,

n representa 1 o 2.

7. Formulación agroquímica que contiene compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 así como extensores y/o sustancias tensioactivas.
- 5 8. Formulación agroquímica de acuerdo con la reivindicación 7, que contiene adicionalmente otro principio activo agroquímico.
9. Procedimiento para combatir plagas animales, **caracterizado porque** un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 o una formulación agroquímica de acuerdo con una de las reivindicaciones 7 u 8 se deja actuar sobre las plagas animales y/o su hábitat.
- 10 10. Uso de compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 o de formulaciones agroquímicas de acuerdo con una de las reivindicaciones 7 u 8 para combatir plagas animales.