

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 816 773**

51 Int. Cl.:

C07D 215/227	(2006.01)	A01N 43/76	(2006.01)
C07D 231/56	(2006.01)	A01N 43/78	(2006.01)
C07D 235/18	(2006.01)	A01N 43/88	(2006.01)
C07D 263/57	(2006.01)	A01P 7/04	(2006.01)
C07D 277/68	(2006.01)		
C07D 209/48	(2006.01)		
C07D 487/00	(2006.01)		
A01N 43/38	(2006.01)		
A01N 43/40	(2006.01)		
A01N 43/56	(2006.01)		

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **19.01.2016 PCT/EP2016/051015**
- 87 Fecha y número de publicación internacional: **28.07.2016 WO16116445**
- 96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **19.01.2016 E 16701011 (5)**
- 97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **22.04.2020 EP 3247702**

54 Título: **Derivados de semi-carbazonas y tiosemicarbazonas activos como plaguicidas**

30 Prioridad:

23.01.2015 EP 15152277

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
05.04.2021

73 Titular/es:

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

72 Inventor/es:

**JEANGUENAT, ANDRÉ;
BENFATTI, FIDES y
PITTERNA, THOMAS**

74 Agente/Representante:

LEHMANN NOVO, María Isabel

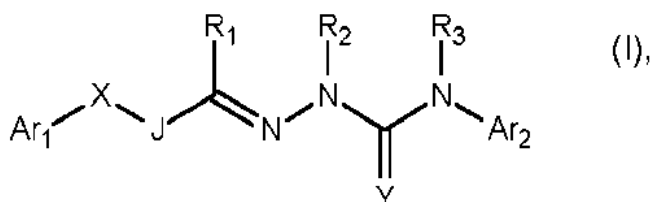
ES 2 816 773 T3

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

DESCRIPCIÓN

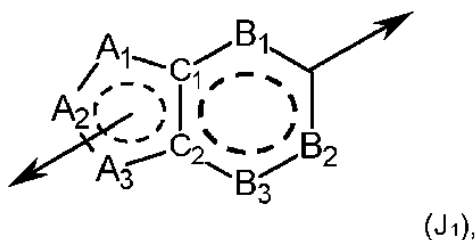
Derivados de semi-carbazonas y tiosemicarbazonas activos como plaguicidas

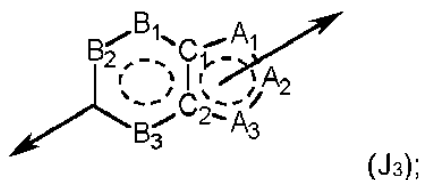
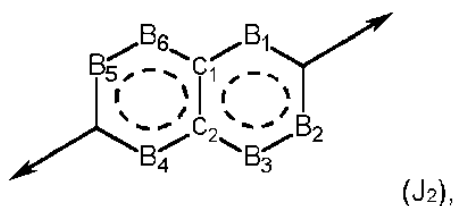
- 5 La presente invención se refiere a compuestos de fórmula (I) que figura más adelante, a procedimientos para prepararlos, a composiciones plaguicidas, en particular insecticidas, acaricidas, molusquicidas y nematocidas que las comprenden y a métodos para usarlas para combatir y controlar plagas tales como plagas de insectos, ácaros, moluscos y nematodos.
- 10 Compuestos heterocíclicos con actividad plaguicida son conocidos y describen, por ejemplo, en los documentos WO09/102736, WO11/017504, WO11/017505, WO12/109125, WO13/116052, WO13/116053 y WO14/011429. Ahora se han encontrado nuevas semi-carbazonas y tiosemicarbazonas activas como plaguicidas con sustituyentes de anillos bicíclicos.
- 15 Por consiguiente, la presente invención se refiere a compuestos de fórmula I,



en donde,

- 20 Ar₁ y Ar₂ son, independientemente uno del otro, fenilo, tienilo, piridilo, pirimidinilo, pirazinilo, piridazinilo, furanilo, en donde dicho fenilo, tienilo, piridilo, pirimidinilo, pirazinilo, piridazinilo, furanilo pueden estar sustituidos con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, haloalquil C₁-C₃-cicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halógeno, ciano, ciano-alquilo C₁-C₄ ciano-cicloalquilo C₃-C₆, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfinito, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfoximino, alquil C₁-C₄amino, dialquil C₂-C₆amino, cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₁-C₄-cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₂-C₄carbonilo, CHO, alcoxi C₂-C₆carbonilo, haloalcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, haloalquil C₂-C₆aminocarbonilo o dialquil C₂-C₆aminocarbonilo;
- 25 X es un enlace directo, O, S, SO₂, CR₄R₅ o NR₆;
- 30 Y es oxígeno o azufre;
- R₁ es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o alcoxi C₁-C₃;
- R₂ y R₃ son, independientemente uno de otro, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalquil C₁-C₄sulfinito, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfinito, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆aminocarbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆aminocarbonilo o alcoxi C₁-C₄imino-alquilo C₁-C₄; con la condición de que cuando R₂ y R₃ son diferentes de hidrógeno, R₂ y R₃ pueden estar sustituidos con uno a tres sustituyentes independientemente seleccionados del grupo que consiste en alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfinito, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfoximino, alquil C₁-C₄amino, dialquil C₂-C₆amino, cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₁-C₄-cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo y dialquil C₂-C₆aminocarbonilo;
- 35 R₄, R₅ y R₆ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o alcoxi C₁-C₃;
- 45 J es un sistema de anillo bicíclico aromático o no aromático seleccionado de J₁, J₂ y J₃,





5 en donde



10 indica que el anillo es aromático o no aromático; en el que las flechas muestran la conectividad según se representa en la fórmula (I), en donde

A₁ es nitrógeno, N-R_{7a}, azufre, oxígeno o C-R_{7b};

A₂ es nitrógeno, N-R_{8a}, azufre, oxígeno o C-R_{8b};

A₃ es nitrógeno, N-R_{9a}, azufre, oxígeno o C-R_{9b};

15 B₁ es nitrógeno o C-R₁₀;

B₂ es nitrógeno o C-R₁₁;

B₃ es nitrógeno o C-R₁₂;

B₄ es nitrógeno o C-R₁₃;

B₅ es nitrógeno o C-R₁₄;

20 B₆ es nitrógeno o C-R₁₅;

C₁ es nitrógeno C o C-R₁₆;

C₂ es nitrógeno C o C-R₁₇;

con las condiciones de que

25 a) no más de dos sustituyentes A pueden ser oxígeno o azufre,

b) cuando dos sustituyentes A son oxígeno y/o azufre, estos sustituyentes son A₁ y A₃, y A₂ es C-R_{8b}, y

c) cuando C₁ es N, entonces C₂ es C o C-R₁₆ y cuando C₂ es N, entonces C₁ es C o C-R₁₇;

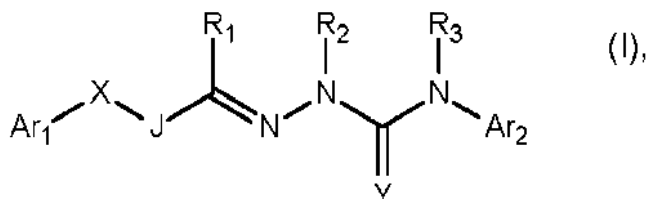
30 cada uno de R_{7a}, R_{7b}, R_{8a}, R_{8b}, R_{9a}, R_{9b}, R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₁₃, R₁₄, R₁₅, R₁₆ y R₁₇ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, hidroxilo, =O, CHO, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, haloalquil C₁-C₄tio, haloalquil C₁-C₄sulfinilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfonil-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄sulfoximino-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄amino, dialquil C₂-C₄amino, cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₁-C₆-cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆aminocarbonilo, alcoxi C₂-C₆carboniloxi, alquil C₂-C₆aminocarboniloxi, dialquil C₃-C₆aminocarboniloxi, alcoxi C₁-C₄imino-alquilo C₁-C₄, -CONHSO₂-alquilo C₁-C₆, -CONHSO₂N(alquilo C₁-C₆)₂ o trialquil C₃-C₆sililo;

35 o una sal, estereoisómero, tautómero y N-óxido agroquímicamente aceptable de los compuestos de fórmula I; con la condición de que los compuestos seleccionados de

40 (2E)-1-metil-2-[[6-(3-piridinil)imidazo[1,2-a]piridin-3-ilmetileno]-N-[4-(trifluorometil)fenil]-hidrazinacarbotoioamida, (2E)-N-(4-metoxifenil)-1-metil-2-[[6-(3-piridinil)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]metileno]-hidrazinacarbotoioamida, (2E)-N-(4-cianofenil)-1-metil-2-[[6-(3-piridinil)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]metileno]-hidrazinacarbotoioamida, (2E)-N-(5-fluoro-2-metilfenil)-1-metil-2-[[6-(3-piridinil)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]metileno]-hidrazinacarboxamida, (2E)-N-(2-fluoro-5-metilfenil)-1-metil-2-[[6-(3-piridinil)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]metileno]-hidrazinacarboxamida, (2E)-1-metil-N-(4-metilfenil)-2-[[6-(3-piridinil)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]metileno]-hidrazinacarboxamida y (2E)-1-metil-N-(fenilmetil)-2-[[6-(3-piridinil)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]metileno]-hidrazinacarboxamida estén excluidos del alcance.

50 Los compuestos no reivindicados de arriba se describen en el documento WO2011/055320.

En una realización, la presente invención se refiere a compuestos de fórmula I,



5 en donde,

Ar₁ y Ar₂ son, independientemente uno del otro, fenilo, tienilo, piridilo, pirimidinilo, pirazinilo, piridazinilo, furanilo, en donde dicho fenilo, tienilo, piridilo, pirimidinilo, pirazinilo, piridazinilo, furanilo pueden estar sustituidos con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄,
 10 alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, haloalquil C₁-C₃-cicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halógeno, ciano, ciano-alquilo C₁-C₄ ciano-cicloalquilo C₃-C₆, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfoximino, alquil C₁-C₄amino, dialquil C₂-C₆amino, cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₁-C₄-cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₂-C₄carbonilo, CHO, alcoxi C₂-C₆carbonilo, haloalcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, haloalquil C₂-C₆aminocarbonilo o dialquil C₂-C₆aminocarbonilo;

X es un enlace directo, O, S, SO₂, CR₄R₅ o NR₆;

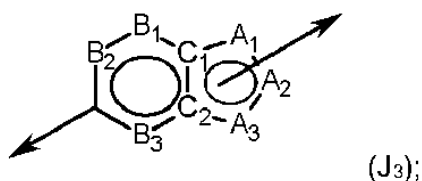
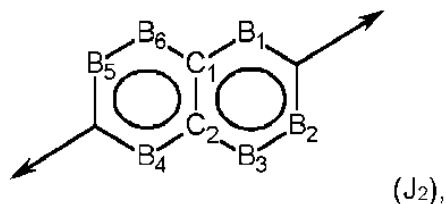
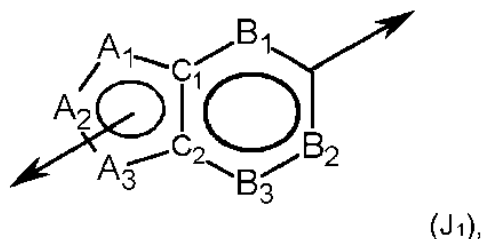
Y es oxígeno o azufre;

R₁ es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o alcoxi C₁-C₃;

R₂ y R₃ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆,
 20 halocicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalquil C₁-C₄sulfinilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆aminocarbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆aminocarbonilo, alcoxi C₁-C₄amino-alquilo C₁-C₄; con la condición de que cuando R₂ y R₃ son diferentes de hidrógeno, R₂ y R₃ pueden estar sustituidos con uno a tres sustituyentes independientemente seleccionados del grupo que consiste en alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄,
 25 cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfoximino, alquil C₁-C₄amino, dialquil C₂-C₆amino, cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₁-C₄-cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo y dialquil C₂-C₆aminocarbonilo;

R₄, R₅ y R₆ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o alcoxi C₁-C₃;

J es un sistema de anillo bicíclico aromático seleccionado de J₁, J₂ y J₃,



en donde

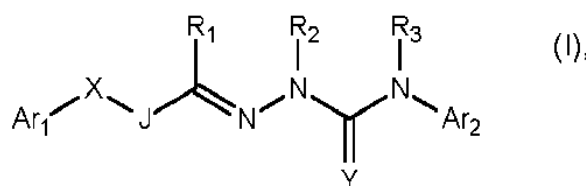


- 5 indica que el anillo es aromático;
 en el que las flechas muestran la conectividad según se representa en la fórmula (I), en donde
 A₁ es nitrógeno, N-R_{7a}, azufre, oxígeno o C-R_{7b};
 A₂ es nitrógeno, N-R_{8a}, azufre, oxígeno o C-R_{8b};
 A₃ es nitrógeno, N-R_{9a}, azufre, oxígeno o C-R_{9b};
- 10 B₁ es nitrógeno o C-R₁₀;
 B₂ es nitrógeno o C-R₁₁;
 B₃ es nitrógeno o C-R₁₂;
 B₄ es nitrógeno o C-R₁₃;
 B₅ es nitrógeno o C-R₁₄;
 B₆ es nitrógeno o C-R₁₅;
- 15 C₁ es nitrógeno o C;
 C₂ es nitrógeno o C;
 con las condiciones de que

- 20 a) no más de dos sustituyentes A pueden ser oxígeno o azufre,
 b) cuando dos sustituyentes A son oxígeno y/o azufre, estos sustituyentes son A₁ y A₃, y A₂ es C-R_{8b}, y
 c) cuando C₁ es N, entonces C₂ es C, y cuando C₂ es N, entonces C₁ es C;

- 25 cada uno de R_{7a}, R_{7b}, R_{8a}, R_{8b}, R_{9a}, R_{9b}, R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₁₃, R₁₄ y R₁₅ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, hidroxilo, =O, CHO, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, haloalquil C₁-C₄tio, haloalquil C₁-C₄sulfínico, haloalquil C₁-C₄sulfónico, alquil C₁-C₄sulfínico, alquil C₁-C₄sulfónico, alquil C₁-C₄sulfonil-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄sulfoximino-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄amino, dialquil C₂-C₄amino, cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₁-C₆-cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆aminocarbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆aminocarbonilo, alcoxi C₁-C₄imino-alquilo C₁-C₄, -CONHSO₂-alquilo C₁-C₆, -CONHSO₂N(alquilo C₁-C₆)₂ o trialquil C₃-C₆sililo;
 o una sal, estereoisómero, tautómero y N-óxido agroquímicamente aceptable de los compuestos de fórmula I.

- 35 Por consiguiente, la presente invención se refiere a compuestos de fórmula I,



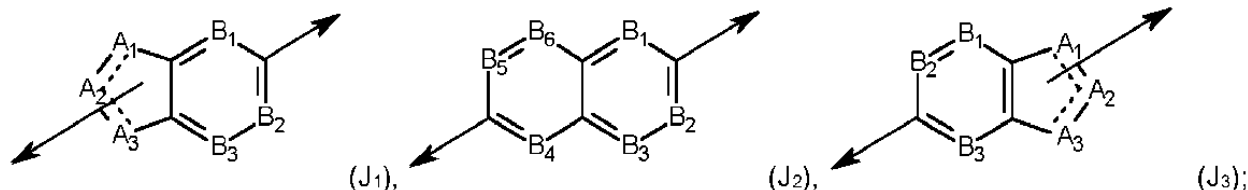
en donde

- 40 Ar₁ y Ar₂ son, independientemente uno del otro, fenilo, tienilo, piridilo, pirimidinilo, pirazinilo, piridazinilo, furanilo, en donde dicho fenilo, tienilo, piridilo, pirimidinilo, pirazinilo, piridazinilo, furanilo pueden estar sustituidos con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, haloalquil C₁-C₃-cicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halógeno, ciano, ciano-alquilo C₁-C₄, ciano-cicloalquilo C₃-C₆, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfínico, alquil C₁-C₄sulfónico, alquil C₁-C₄sulfoximino, alquil C₁-C₄amino, dialquil C₂-C₆amino, cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₁-C₄-cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₂-C₄carbonilo, CHO, alcoxi C₂-C₆carbonilo, haloalcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, haloalquil C₂-C₆aminocarbonilo o dialquil C₂-C₈aminocarbonilo;
- 50 X es un enlace directo, O, S, SO₂, CR₄R₅ o NR₆;
 Y es oxígeno o azufre;
 R₁ es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o alcoxi C₁-C₃;
 R₂ y R₃ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalquil C₁-C₄sulfínico, haloalquil C₁-C₄sulfónico, alquil C₁-C₄sulfínico, alquil C₁-C₄sulfónico, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆aminocarbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo,
- 55

alquil C₂-C₆aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆aminocarbonilo o alcoxi C₁-C₄imino-alquilo C₁-C₄; con la condición de que cuando R₂ y R₃ son diferentes de hidrógeno, R₂ y R₃ pueden estar sustituidos con uno a tres sustituyentes independientemente seleccionados del grupo que consiste en alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, haloalqueno C₂-C₄, haloalquino C₂-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfoximino, alquil C₁-C₄amino, dialquil C₂-C₆amino, cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₁-C₄-cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo y dialquil C₂-C₆aminocarbonilo;

R₄, R₅ y R₆ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o alcoxi C₁-C₃;

J es un sistema de anillo bicíclico aromático o no aromático seleccionado de J₁, J₂ y J₃,



en el que las flechas muestran la conectividad según se representa en la fórmula (I), en donde

A₁ es nitrógeno, N-R_{7a}, azufre, oxígeno o C-R_{7b};

A₂ es nitrógeno, N-R_{8a}, azufre, oxígeno o C-R_{8b};

A₃ es nitrógeno, N-R_{9a}, azufre, oxígeno o C-R_{9b};

B₁ es nitrógeno o C-R₁₀;

B₂ es nitrógeno o C-R₁₁;

B₃ es nitrógeno o C-R₁₂;

B₄ es nitrógeno o C-R₁₃;

B₅ es nitrógeno o C-R₁₄;

B₆ es nitrógeno o C-R₁₅; con las condiciones de que

a) no más de dos sustituyentes A pueden ser oxígeno o azufre, y

b) cuando dos sustituyentes A son oxígeno y/o azufre, estos sustituyentes son A₁ y A₃, y A₂ es C-R_{8b};

cada uno de R_{7a}, R_{7b}, R_{8a}, R_{8b}, R_{9a}, R_{9b}, R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₁₃, R₁₄ y R₁₅ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, hidroxilo, =O, CHO, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalqueno C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, haloalquil C₁-C₄tio, haloalquil C₁-C₄sulfinilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfoximino-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄amino, dialquil C₂-C₄amino, cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₁-C₆-cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆aminocarbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆aminocarbonilo, alcoxi C₁-C₄imino-alquilo C₁-C₄, -CONHSO₂-alquilo C₁-C₆, -CONHSO₂N(alquilo C₁-C₆)₂ o trialquil C₃-C₆sililo;

y sales y enantiómeros, estereoisómeros, tautómeros y N-óxidos agroquímicamente aceptables de los compuestos de fórmula I

Definiciones:

El término "halógeno" se refiere a flúor, cloro, bromo o yodo, preferentemente a flúor, cloro o bromo.

Los sustituyentes alquilo pueden ser de cadena lineal o ramificada. Alquilo por sí mismo o como parte de otro sustituyente es, dependiendo del número de átomos de carbono mencionados, por ejemplo, metilo, etilo, n-propilo, n-butilo, n-pentilo, n-hexilo y sus isómeros, por ejemplo, iso-propilo, iso-butilo, sec.-butilo, terc.-butilo, iso-amilo o pivaloilo.

Los sustituyentes alqueno pueden estar en forma de cadenas lineales o ramificadas y los restos alqueno pueden tener, cuando proceda, una configuración (E) o (Z). Ejemplos son vinilo y alilo. Los grupos alqueno son preferiblemente de C₂-C₆, más preferiblemente C₂-C₄ y lo más preferiblemente grupos alqueno C₂-C₃.

Los sustituyentes alquino pueden estar en forma de cadenas lineales o ramificadas. Algunos ejemplos son etinilo y propargilo. Los grupos alquino son preferiblemente de C₂-C₆, más preferiblemente C₂-C₄ y lo más preferiblemente grupos alquino C₂-C₃.

Grupos haloalquilo pueden contener uno o más átomos de halógeno idénticos o diferentes y, por ejemplo, pueden representar CH₂Cl, CHCl₂, CCl₃, CH₂F, CHF₂, CF₃, CF₃CH₂, CH₃CF₂, CF₃CF₂ o CCl₃CCl₂.

Los grupos haloalqueno son grupos alqueno, respectivamente, que están sustituidos con uno o más átomos de halógeno iguales o diferentes y son, por ejemplo, 2,2-difluorovinilo o 1,2-dicloro-2-fluorovinilo.

Los grupos haloalquínilo son grupos alquínilo, respectivamente, que están sustituidos con uno o más átomos de halógeno iguales o diferentes y son, por ejemplo, 1-cloroprop-2-ínilo.

5 El término "alcoxi" se refiere a un radical -OR, donde R es alquilo, p. ej., como se ha definido anteriormente. Los grupos alcoxi incluyen, sin carácter limitante, metoxi, etoxi, 1-metiletoxi, propoxi, butoxi, 1-metilpropoxi y 2-metilpropoxi.

Ciano significa un grupo -CN.

10 Amino significa un grupo NH₂.

Hidroxilo o hidroxí representa un grupo -OH.

15 La presencia de uno o más dobles enlaces C=N en un compuesto de fórmula I significa que los compuestos pueden aparecer en formas isoméricas E o Z. Se pretende que la fórmula I incluya todas estas formas isoméricas posibles y sus mezclas.

20 La presencia de uno o más átomos de carbono asimétricos posibles en un compuesto de fórmula I quiere decir que los compuestos pueden existir en formas ópticamente isoméricas, es decir, formas enantioméricas o diastereoméricas. También pueden existir atropoisómeros como resultado de la rotación restringida alrededor de un enlace sencillo. Se pretende que la fórmula I incluya todas estas formas isoméricas posibles y sus mezclas. La presente invención incluye todas estas formas isoméricas posibles y sus mezclas para un compuesto de fórmula I. Asimismo, se pretende que la fórmula I incluya todos los tautómeros posibles. La presente invención incluye todas las formas tautoméricas posibles para un compuesto de fórmula I.

25 En cada caso, los compuestos de fórmula I de acuerdo con la invención están en forma libre, en forma oxidada como un N-óxido o en forma de sal, p. ej., una forma de sal agronómicamente utilizable.

30 La siguiente lista proporciona definiciones, incluyendo definiciones preferidas, para los sustituyentes A₁, A₂, A₃, B₁, B₂, B₃, B₄, B₅, B₆, Ar₁, Ar₂, R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R_{7a}, R_{7b}, R_{8a}, R_{8b}, R_{9a}, R_{9b}, R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₁₃, R₁₄, R₁₅, X, Y y J con referencia a compuestos de fórmula I y otros compuestos de la invención que llevan los mismos sustituyentes. Para uno cualquiera de estos sustituyentes, cualquiera de las definiciones dadas a continuación puede combinarse con cualquier definición de cualquier sustituyente dado a continuación o en otra parte en este documento.

35 Ar₁ y Ar₂ son, independientemente uno del otro, fenilo, tienilo, piridilo, pirimidinilo, pirazinilo, piridazinilo, furanilo, en donde dicho fenilo, tienilo, piridilo, pirimidinilo, pirazinilo, piridazinilo, furanilo pueden estar sustituidos con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, alquénilo C₂-C₄, alquínilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, haloalquénilo C₂-C₄, haloalquínilo C₂-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, haloalquil C₁-C₃-cicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halógeno, ciano, ciano-alquilo C₁-C₄, ciano-cicloalquilo C₃-C₆, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfínilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfoximino, alquil C₁-C₄amino, dialquil C₂-C₆amino, cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₁-C₄-cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₂-C₄carbonilo, CHO, alcoxi C₂-C₆carbonilo, haloalcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, haloalquil C₂-C₆aminocarbonilo o dialquil C₂-C₈aminocarbonilo.

45 Preferiblemente, Ar₁ es fenilo o fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, alquénilo C₂-C₄, alquínilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, haloalquil C₁-C₃-cicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfínilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfoximino, alquil C₂-C₄carbonilo, CHO, alcoxi C₂-C₆carbonilo y haloalcoxi C₂-C₆carbonilo. Más preferiblemente, Ar₁ es fenilo o fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, haloalquil C₁-C₃-cicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halógeno, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄. Incluso más preferiblemente, Ar₁ es fenilo sustituido con haloalcoxi C₁-C₄.

55 Preferiblemente, Ar₂ es fenilo o fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, alquénilo C₂-C₄, alquínilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, haloalquil C₁-C₃-cicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfínilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfoximino, alquil C₂-C₄carbonilo, CHO, alcoxi C₂-C₆carbonilo y haloalcoxi C₂-C₆carbonilo. Más preferiblemente, Ar₂ es fenilo o fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, alquénilo C₂-C₄, alquínilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, haloalquil C₁-C₃-cicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halógeno, ciano, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio. Incluso más preferiblemente, Ar₂ es fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, halógeno, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄.

65 X es un enlace directo, O, S, SO₂, CR₄R₅ o NR₆. Preferiblemente, X es un enlace directo u O.

Y es oxígeno o azufre.

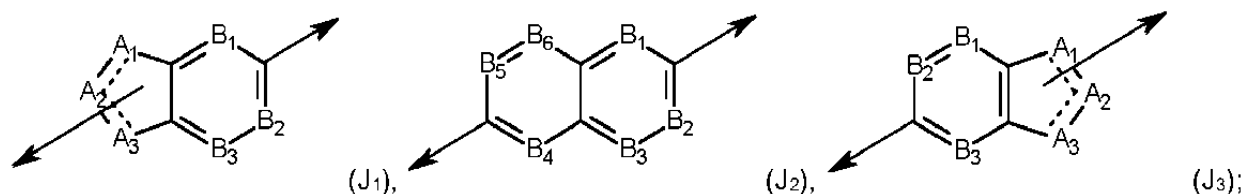
R₁ es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o alcoxi C₁-C₃. Preferiblemente, R₁ es hidrógeno o alquilo C₁-C₆.

5 R₂ y R₃ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalquil C₁-C₄sulfinilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆aminocarbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆aminocarbonilo, alcoxi C₁-C₄imino-alquilo C₁-C₄; con la condición de que cuando R₂ y R₃ son diferentes de hidrógeno, R₂ y R₃ pueden estar sustituidos con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en alquilo, C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, haloalqueno C₂-C₄, haloalquino C₂-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfoximino, alquil C₁-C₄amino, dialquil C₂-C₆amino, cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₁-C₄-cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo y dialquil C₂-C₆aminocarbonilo;

20 Preferiblemente, R₂ y R₃ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆aminocarbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆aminocarbonilo, con la condición de que cuando los grupos R₂ y R₃ son diferentes de hidrógeno, dichos grupos R₂ y R₃ pueden estar sustituidos con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ y alquil C₁-C₄tio. Más preferiblemente, R₂ y R₃ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆.

R₄, R₅ y R₆ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o alcoxi C₁-C₃. Preferiblemente, R₄, R₅ y R₆ son, independientemente uno de otro, hidrógeno o alquilo C₁-C₆.

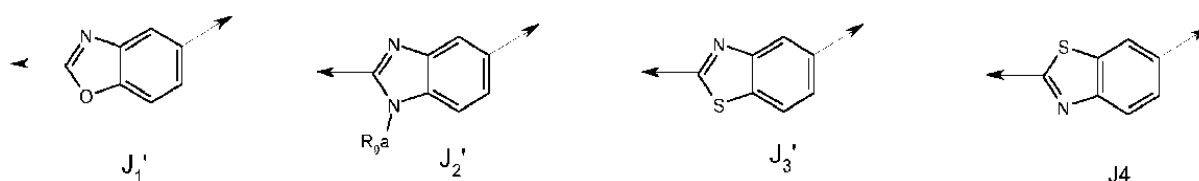
30 J es un sistema de anillo bicíclico aromático o no aromático seleccionado de J₁, J₂ y J₃,

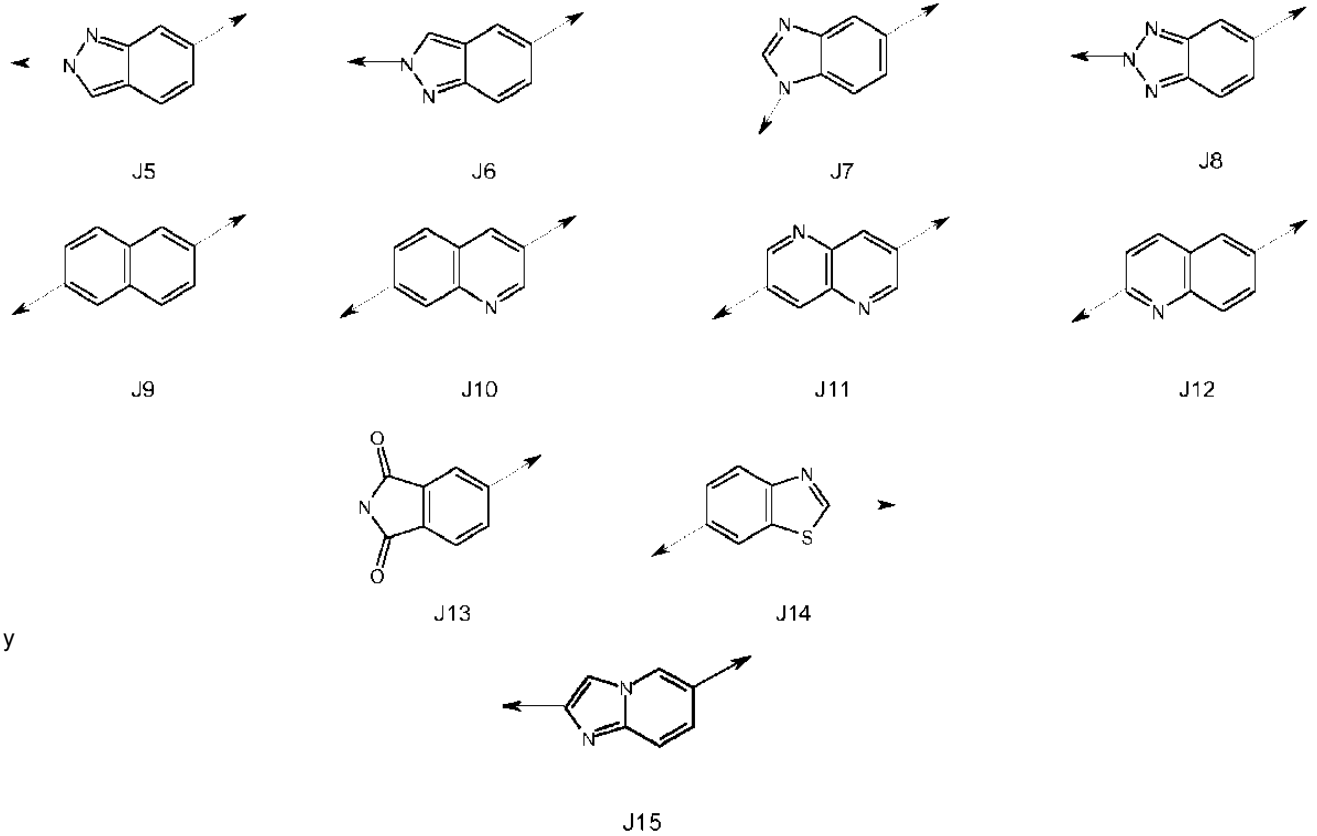


en el que las flechas muestran la conectividad según se representa en la fórmula (I), en donde

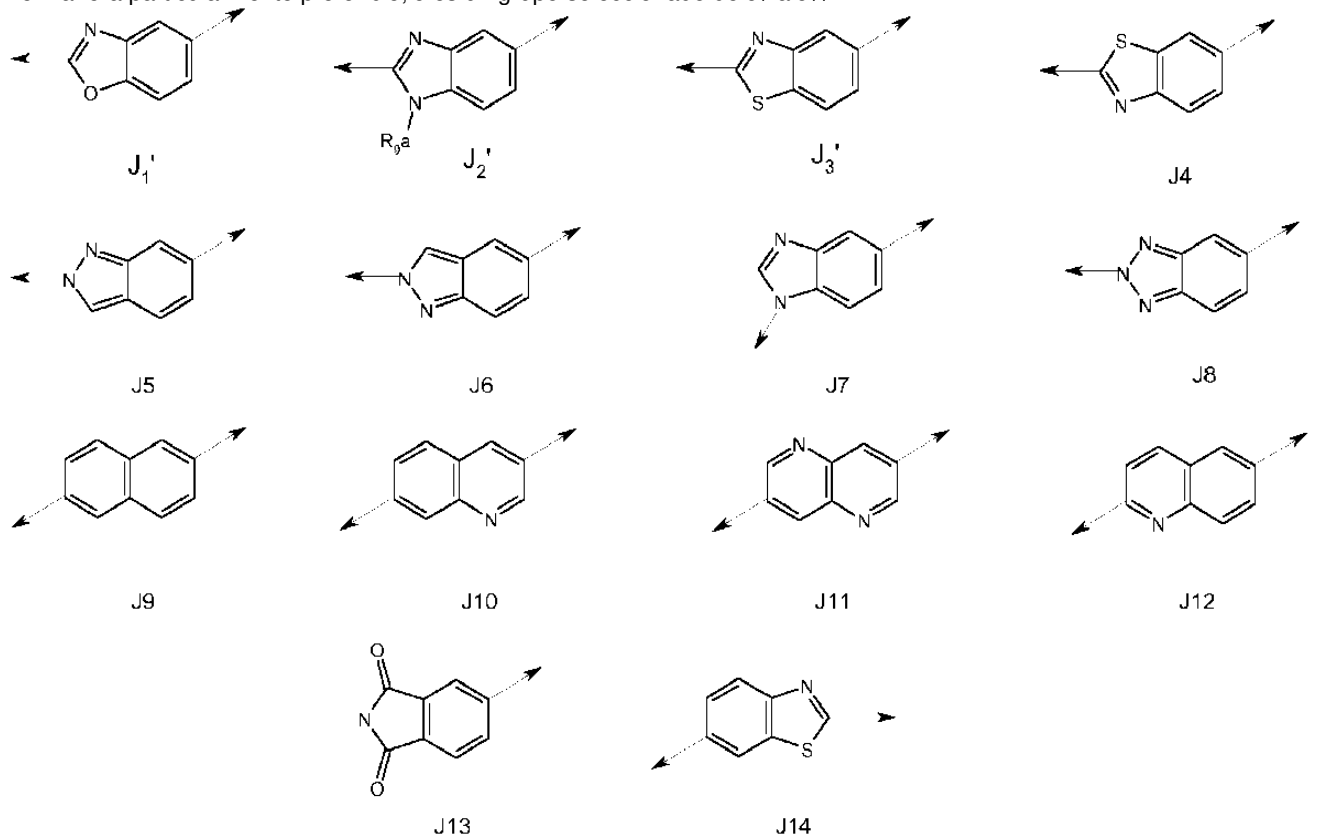
- 35 A₁ es nitrógeno, N-R_{7a}, azufre, oxígeno o C-R_{7b};
 A₂ es nitrógeno, N-R_{8a}, azufre, oxígeno o C-R_{8b};
 A₃ es nitrógeno, N-R_{9a}, azufre, oxígeno o C-R_{9b};
 B₁ es nitrógeno o C-R₁₀;
 B₂ es nitrógeno o C-R₁₁;
 40 B₃ es nitrógeno o C-R₁₂;
 B₄ es nitrógeno o C-R₁₃;
 B₅ es nitrógeno o C-R₁₄;
 B₆ es nitrógeno o C-R₁₅; con las condiciones de que
 a) no más de dos sustituyentes A pueden ser oxígeno o azufre, y
 45 b) cuando dos sustituyentes A son oxígeno y/o azufre, estos sustituyentes son A₁ y A₃, y A₂ es C-R_{8b};

Preferiblemente, J es un grupo seleccionado de J₁' a J₁₅:

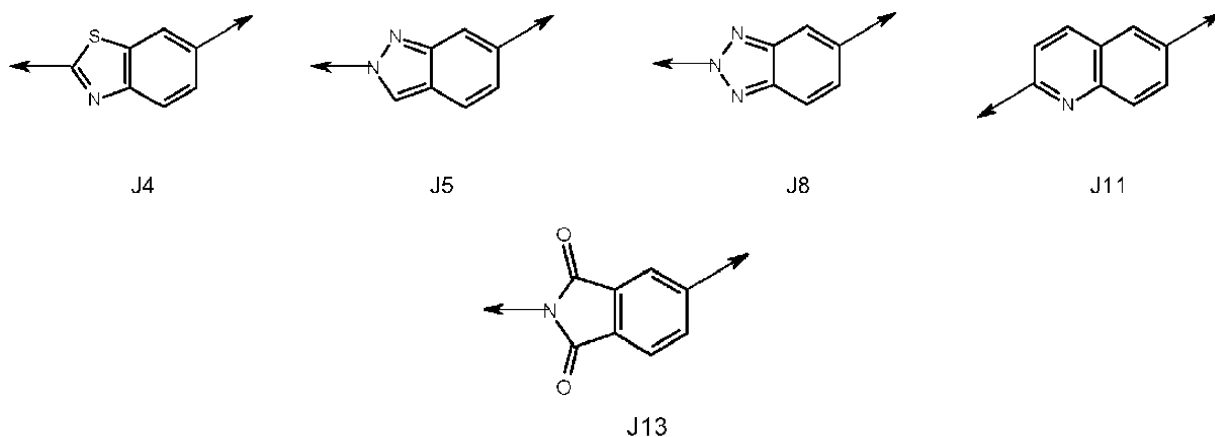




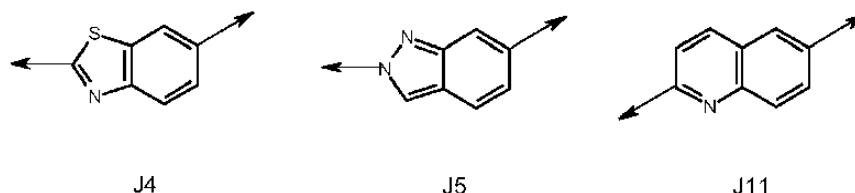
De manera particularmente preferible, J es un grupo seleccionado de J_{1'} a J₁₄:



Más preferiblemente, J es un grupo seleccionado de:

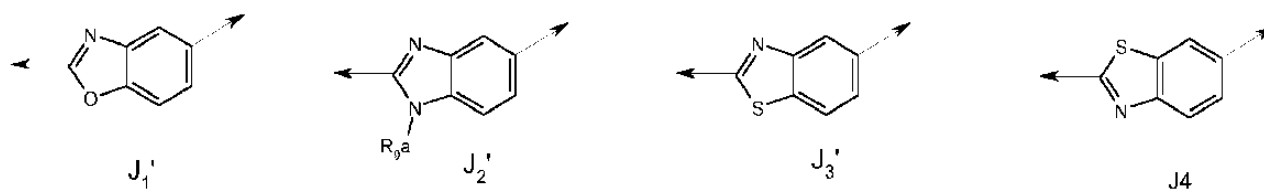


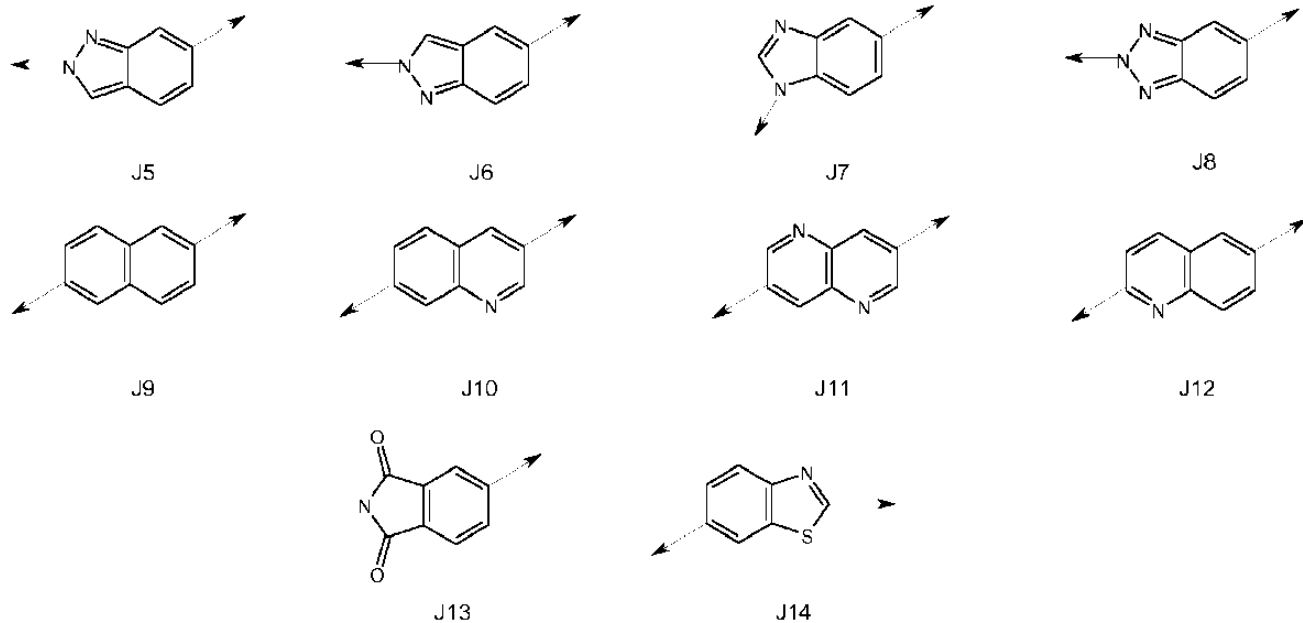
5 Incluso más preferiblemente, J es un grupo seleccionado de:



Preferiblemente, el compuesto de fórmula I es un compuesto, en donde:

- 10 Ar₁ es fenilo o fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, haloalquil C₁-C₃-cicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfínilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfoximino, alquil C₂-C₄carbonilo, CHO, alcoxi C₂-C₆carbonilo o haloalcoxi C₂-C₆carbonilo;
- 15 Ar₂ es fenilo o fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, haloalquil C₁-C₃-cicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfínilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfoximino, alquil C₂-C₄carbonilo, CHO, alcoxi C₂-C₆carbonilo o haloalcoxi C₂-C₆carbonilo;
- 20 X es un enlace directo, O, S, SO₂, CR₄R₅ o NR₆;
Y es oxígeno o azufre;
- R₁ es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o alcoxi C₁-C₃;
- R₂ y R₃ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalquil C₁-C₄sulfínilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfínilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆aminocarbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆aminocarbonilo o alcoxi C₁-C₄amino-alquilo C₁-C₄; con la condición de que cuando R₂ y R₃ son diferentes de hidrógeno, R₂ y R₃ pueden estar sustituidos con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfínilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfoximino, alquil C₁-C₄amino, dialquil C₂-C₆amino, cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₁-C₄-cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo y dialquil C₂-C₆aminocarbonilo;
- 30 R₄, R₅ y R₆ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o alcoxi C₁-C₃;
- 35 J es un grupo seleccionado de J₁' a J₁₄:





5

en donde R_{9a} es hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, hidroxilo, =O, CHO, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalqueno C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, haloalquil C₁-C₄tio, haloalquil C₁-C₄sulfinilo, haloalquil C₁-C₄sulfonylo, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonylo, alquil C₁-C₄sulfonyl-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄sulfoximino-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄amino, dialquil C₂-C₄amino, cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₁-C₆-cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆aminocarbonilo, alcoxi C₂-C₆carboniloxi, alquil C₂-C₆aminocarboniloxi, dialquil C₃-C₆aminocarboniloxi, alcoxi C₁-C₄imino-alquilo C₁-C₄, -CONHSO₂-alquilo C₁-C₆, -CONHSO₂N(alquilo C₁-C₆)₂ o trialquil C₃-C₆sililo; y sales y enantiómeros agroquímicamente aceptables de los mismos.

10

15

Preferiblemente, el compuesto de fórmula I es un compuesto, en donde:

Ar₁ es fenilo o fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, haloalquil C₁-C₃-cicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonylo, alquil C₁-C₄sulfoximino, alquil C₂-C₄carbonilo, CHO, alcoxi C₂-C₆carbonilo o haloalcoxi C₂-C₆carbonilo;

20

Ar₂ es fenilo o fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, haloalquil C₁-C₃-cicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonylo, alquil C₁-C₄sulfoximino, alquil C₂-C₄carbonilo, CHO, alcoxi C₂-C₆carbonilo o haloalcoxi C₂-C₆carbonilo;

25

X es un enlace directo, O, S, SO₂, CR₄R₅ o NR₆;

Y es oxígeno o azufre;

30

R₁ es hidrógeno o alquilo C₁-C₆,

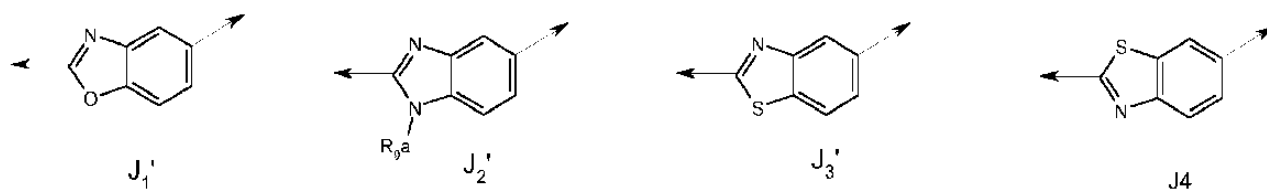
R₂ y R₃ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆aminocarbonilo, alcoxi C₂-C₆carboniloxi, alquil C₂-C₆aminocarboniloxi, dialquil C₃-C₆aminocarboniloxi, con la condición de que cuando los grupos R₂ y R₃ son diferentes de hidrógeno, dichos grupos R₂ y R₃ pueden estar sustituidos con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ y alquil C₁-C₄tio;

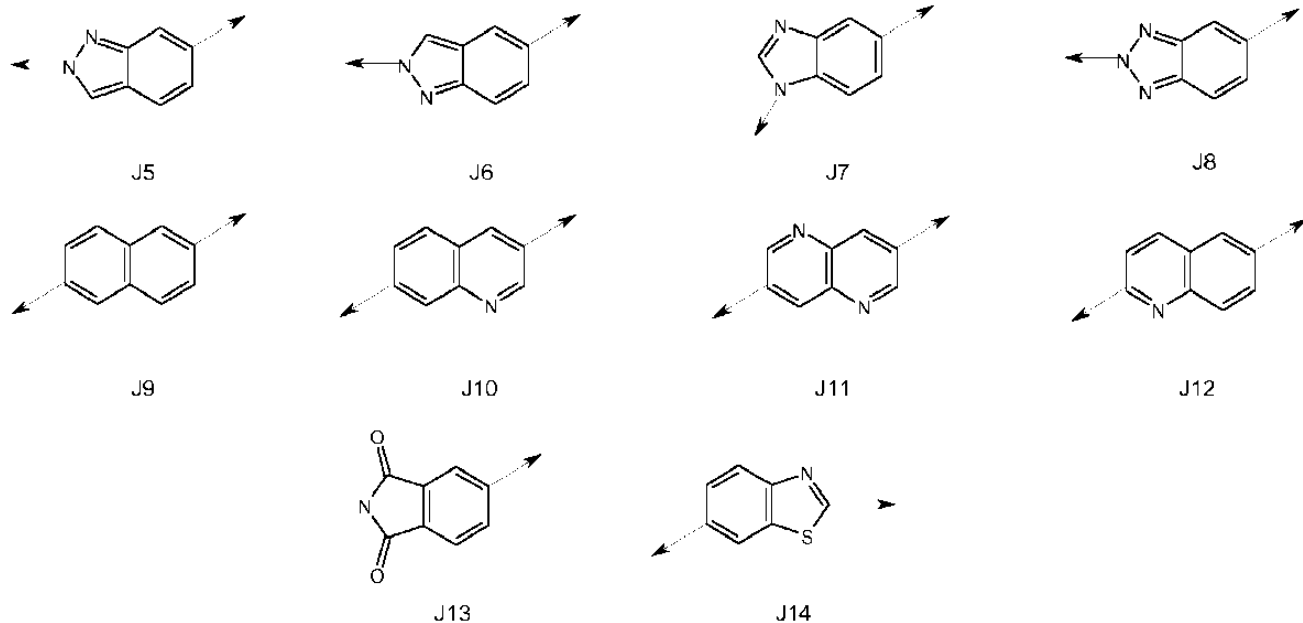
35

R₄, R₅ y R₆ son, independientemente uno de otro, hidrógeno o alquilo C₁-C₆;

J es un grupo seleccionado de J₁' a J₁₄;

40





5

en donde R_{9a} es alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆,
 , y sales y enantiómeros agroquímicamente aceptables de los mismos.

10

Preferiblemente, el compuesto de fórmula I es un compuesto, en donde:
 Ar₁ es fenilo o fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, haloalquil C₁-C₃-cicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfino, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfoximino, alquil C₂-C₄carbonilo, CHO, alcoxi C₂-C₆carbonilo, haloalcoxi C₂-C₆carbonilo;

15

Ar₂ es fenilo o fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, haloalquil C₁-C₃-cicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfino, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfoximino, alquil C₂-C₄carbonilo, CHO, alcoxi C₂-C₆carbonilo y haloalcoxi C₂-C₆carbonilo;

20

X es un enlace directo u O;

Y es oxígeno o azufre;

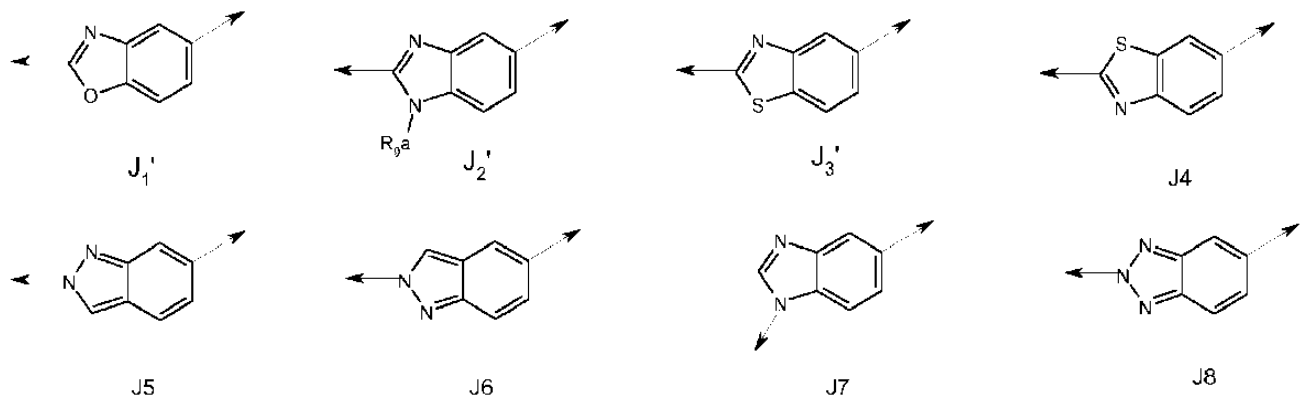
R₁ es hidrógeno o alquilo C₁-C₆,

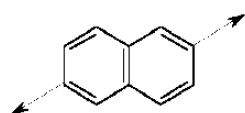
25

R₂ y R₃ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆aminocarbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆aminocarbonilo, con la condición de que cuando los grupos R₂ y R₃ son diferentes de hidrógeno, dichos grupos R₂ y R₃ pueden estar sustituidos con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ y alquil C₁-C₄tio;

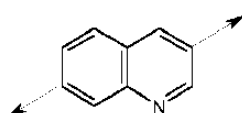
30

J es un grupo seleccionado de J₁' a J₁₄:

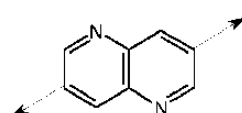




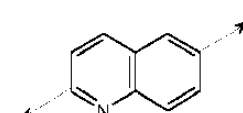
J9



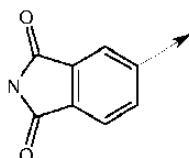
J10



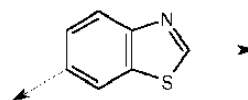
J11



J12



J13



J14

- 5 cada uno de R_{7a}, R_{7b}, R_{8a}, R_{8b}, R_{9a}, R_{9b}, R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₁₃, R₁₄ y R₁₅ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, hidroxilo, =O, CHO, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, haloalquil C₁-C₄tio, haloalquil C₁-C₄sulfinilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfoximino-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄amino, dialquil C₂-C₄amino, cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₁-C₆-cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆aminocarbonilo, alcoxi C₂-C₆carboniloxi, alquil C₂-C₆aminocarboniloxi, dialquil C₃-C₆aminocarboniloxi, alcoxi C₁-C₄imino-alquilo C₁-C₄, -CONHSO₂-alquilo C₁-C₆, -CONHSO₂N(alquilo C₁-C₆)₂ o trialquil C₃-C₆sililo; y sales y enantiómeros agroquímicamente aceptables de los mismos.

15 Preferiblemente, el compuesto de fórmula I es un compuesto, en donde:
Ar₁ es fenilo o fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, haloalquil C₁-C₃-cicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halógeno, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

20 Ar₂ es fenilo o fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, haloalquil C₁-C₃-cicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halógeno, ciano, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio.

25 X es un enlace directo, O, S, SO₂, CR₄R₅ o NR₆;

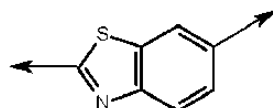
Y es oxígeno o azufre;

R₁ es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o alcoxi C₁-C₃;

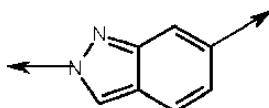
R₂ y R₃ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalquil C₁-C₄sulfinilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆aminocarbonilo, alcoxi C₂-C₆carboniloxi, alquil C₂-C₆aminocarboniloxi, dialquil C₃-C₆aminocarboniloxi o alcoxi C₁-C₄imino-alquilo C₁-C₄; con la condición de que cuando R₂ y R₃ son diferentes de hidrógeno, R₂ y R₃ pueden estar sustituidos con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfoximino, alquil C₁-C₄amino, dialquil C₂-C₆amino, cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₁-C₄-cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo y dialquil C₂-C₆aminocarbonilo;

35 R₄, R₅ y R₆ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o alcoxi C₁-C₃;

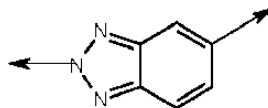
40 J es un grupo seleccionado de:



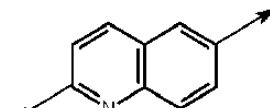
J4



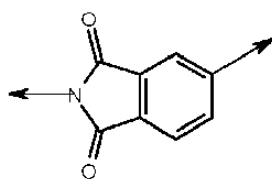
J5



J8



J11



J13

y sales y enantiómeros agroquímicamente aceptables de los mismos.

5 Preferiblemente, el compuesto de fórmula I es un compuesto, en donde:

Ar₁ es fenilo o fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, haloalquil C₁-C₃-cicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halógeno, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

10 Ar₂ es fenilo o fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, haloalquil C₁-C₃-cicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halógeno, ciano, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio.

X es un enlace directo, O, S, SO₂, CR₄R₅ o NR₆;

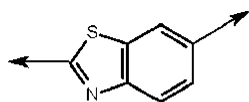
Y es oxígeno o azufre;

15 R₁ es hidrógeno o alquilo C₁-C₆;

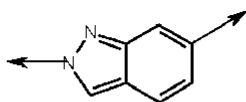
R₂ y R₃ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆;

R₄, R₅ y R₆ son, independientemente uno de otro, hidrógeno o alquilo C₁-C₆;

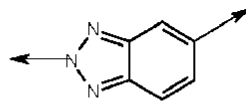
J es un grupo seleccionado de:



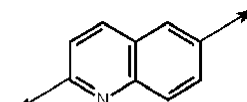
J4



J5

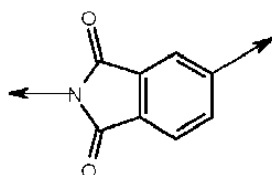


J8



J11

20



J13

y sales y enantiómeros agroquímicamente aceptables de los mismos.

25

Preferiblemente, el compuesto de fórmula I es un compuesto, en donde:

Ar₁ es fenilo sustituido con haloalcoxi C₁-C₄;

Ar₂ es fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, halógeno, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄;

30 X es un enlace directo, O, S, SO₂, CR₄R₅ o NR₆;

Y es oxígeno o azufre;

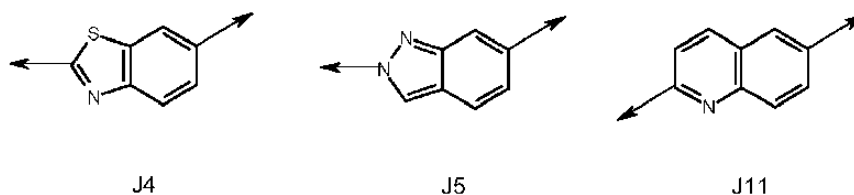
R₁ es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o alcoxi C₁-C₃;

R₂ y R₃ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalquil C₁-C₄sulfinilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆aminocarbonilo, alcoxi C₂-C₆carboniloxi, alquil C₂-C₆aminocarboniloxi, dialquil C₃-C₆aminocarboniloxi o alcoxi C₁-C₄imino-alquilo C₁-C₄; con la condición de que cuando R₂ y R₃ son diferentes de hidrógeno, R₂ y R₃ pueden estar sustituidos con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfoximino, alquil C₁-C₄amino, dialquil C₂-C₆amino, cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₁-C₄-cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo y dialquil C₂-C₆aminocarbonilo;

40 R₄, R₅ y R₆ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o alcoxi C₁-C₃;

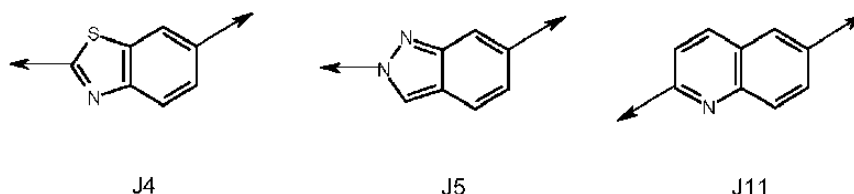
45

J es un grupo seleccionado de:



y sales y enantiómeros agroquímicamente aceptables de los mismos.

- 5 Preferiblemente, el compuesto de fórmula I es un compuesto, en donde:
 Ar₁ es fenilo sustituido con haloalcoxi C₁-C₄;
 Ar₂ es fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, halógeno, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄;
 X es un enlace directo u O;
 10 Y es oxígeno o azufre;
 R₁ es hidrógeno o alquilo C₁-C₆,
 R₂ y R₃ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆
 J es un grupo seleccionado de:

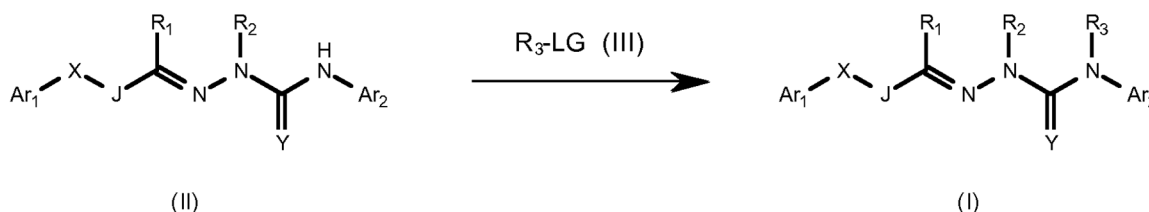


- 15 y sales y enantiómeros agroquímicamente aceptables de los mismos.
 Incluso más preferiblemente, el compuesto de fórmula (I) es el compuesto P1, P2 o P3 que figura a continuación: 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[[2-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-6-il]metilnamino]tiourea, 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[[2-[4-(trifluorometoxi)fenoxi]-6-quinolil]metilnamino]tiourea, 1-(2-isopropilfenil)-3-[[2-[4-(trifluorometoxi)fenoxi]-1,3-benzotiazol-5-il]metilnamino]tiourea.

- 20 La invención también se refiere a compuestos de fórmula (IV), (VI), (Via), (Vib), (Vlc), (Vld), (Vle), (Vlf), (XV) y (XXI) como se muestra a continuación, en donde Ar₁, Ar₂, R₁, R₂, J, A₁, A₂, B₁, B₂, B₃, B₄, B₅ y B₆ son como se definen para la fórmula I. Estos compuestos, incluyendo sales o N-óxidos de los mismos, son útiles como compuestos intermedios en la síntesis de compuestos de fórmula I. Definiciones preferidas de Ar₁, Ar₂, R₁, R₂, J, A₁, A₂, B₁, B₂, B₃, B₄, B₅ y B₆ son como se definen para la fórmula I.

- El procedimiento de acuerdo con la invención para preparar compuestos de fórmula I se lleva a cabo en principio utilizando métodos conocidos por los expertos en la técnica. Más específicamente, compuestos de fórmula (I) se pueden preparar tal como se representa en el esquema 1, haciendo reaccionar compuestos de fórmula (II) con compuestos de fórmula (III), en donde LG es un grupo lábil tal como halógeno, preferentemente cloro, bromo o yodo, o un sulfonato, tal como por ejemplo un metanosulfonato o un trifluorometanosulfonato en presencia o ausencia de una base, tal como carbonato de sodio o trietilamina, en un disolvente o una mezcla de disolventes, tal como tetrahidrofurano, DMF, dioxano o acetonitrilo. La temperatura de reacción puede variar preferentemente desde la temperatura ambiente hasta el punto de ebullición de la mezcla de reacción. En las fórmulas (I), (II) y (III), Ar₁, X, J, R₁, R₂, Y, R₃ y Ar₂ son como se describieron arriba.

Esquema 1:

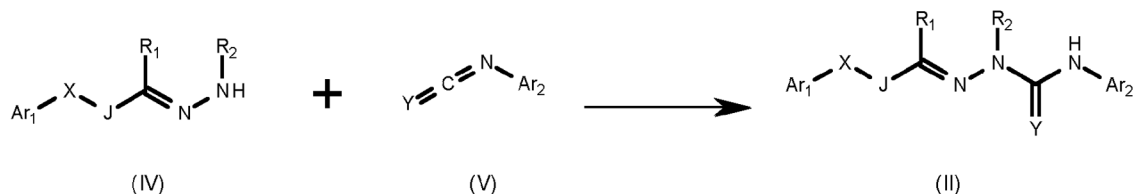


- 40 Compuestos de fórmula (II) pueden prepararse tal como se representa en el esquema 2, haciendo reaccionar compuestos de fórmula (IV) con compuestos de fórmula (V), en presencia o en ausencia de una base, tal como trietilamina o N,N-diisopropiletilamina, en un disolvente o una mezcla de disolventes, tal como tetrahidrofurano, DMF, dioxano o acetonitrilo. La temperatura de reacción puede variar preferentemente desde la temperatura ambiente hasta

el punto de ebullición de la mezcla de reacción. Compuestos de fórmula (V) son isocianatos (Y es O) o isotiocianatos (Y es S) y pueden prepararse por métodos conocidos por los expertos en la técnica (véase, p. ej., M. Smith, J. March, March's Advanced Organic Chemistry, 6ª edición, Wiley, 2007). En las fórmulas (II), (IV) y (V), Ar₁, X, J, R₁, R₂, Y y Ar₂ son como se describieron arriba.

5

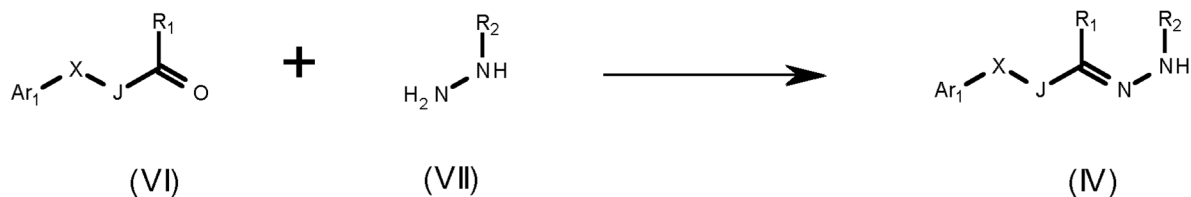
Esquema 2:



Compuestos de fórmula (IV) pueden prepararse tal como se representa en el esquema 3, haciendo reaccionar compuestos de fórmula (VI) con compuestos de fórmula (VII), por métodos conocidos por los expertos en la técnica (véase, p. ej., M. Smith, J. March, March's Advanced Organic Chemistry, 6ª edición, Wiley, 2007). Compuestos de fórmula (VII) pueden prepararse por métodos conocidos por los expertos en la técnica (véase, p. ej., M. Smith, J. March, March's Advanced Organic Chemistry, 6ª edición, Wiley, 2007). En las fórmulas (IV), (VI) y (VII), Ar₁, X, J, R₁ y R₂ son como se describieron arriba.

10

Esquema 3:



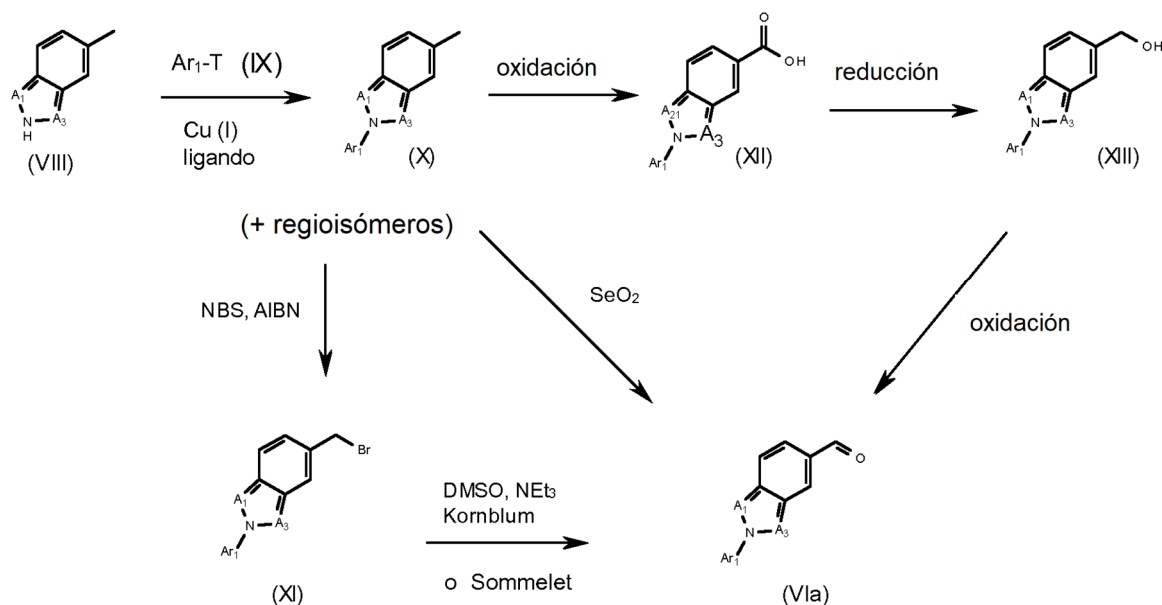
15

Los compuestos de fórmula (VI) pueden prepararse de acuerdo con varios métodos conocidos por los expertos en la materia.

Más específicamente, compuestos de fórmula (VIa) se pueden preparar de acuerdo con el esquema 4. El compuesto de fórmula (VIII) reacciona con un compuesto de fórmula (IX) (T es, p. ej., Cl, Br, I, OTf, OMe) bajo catálisis con Cu(I) en presencia de un ligando tal como prolina o N,N'-dimetiletildiamina. Existen varias formas de elaborar el grupo metilo del compuesto de fórmula (X) para formar el aldehído de fórmula (VIa) tal como se representa en el esquema 4, utilizando métodos conocidos por los expertos en la técnica (véase, p. ej., M. Smith, J. March, March's Advanced Organic Chemistry, 6ª edición, Wiley, 2007). En las fórmulas (VIa), (VIII), (IX), (X), (XI), (XII) y (XIII), A₁, A₃ y Ar₁ son como se describieron arriba.

25

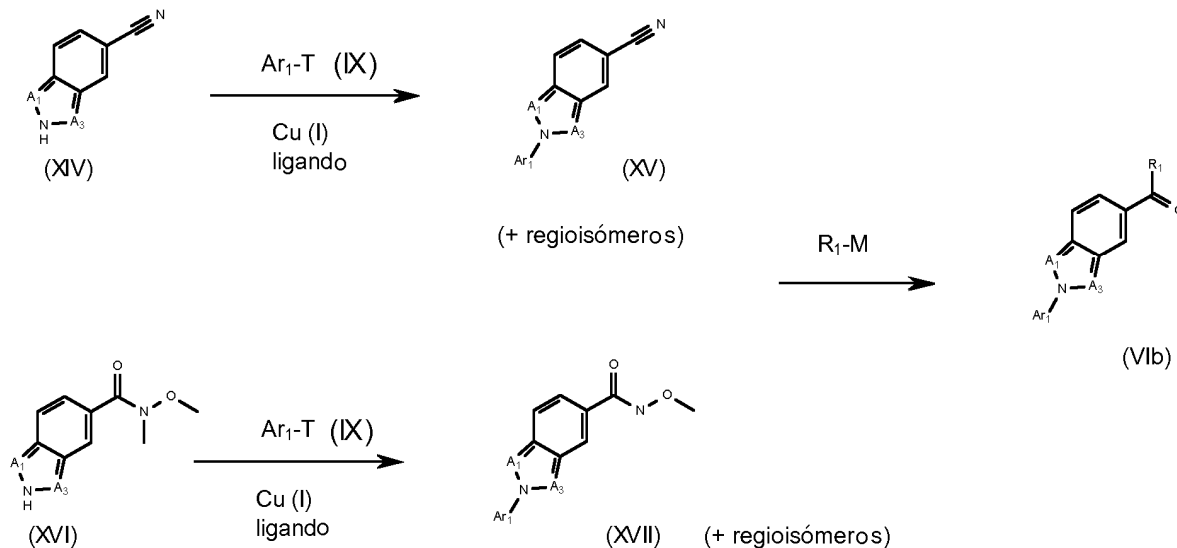
Esquema 4:



5

Compuestos de fórmula (VIb) se pueden preparar de acuerdo con el esquema 5. Compuestos de fórmula (XIV) o (XVI) se hacen reaccionar con un compuesto de fórmula (IX) (T es, p. ej., Cl, Br, I, OTf, OMes) bajo catálisis con Cu(I) en presencia de un ligando tal como prolina o N,N'-dimetiletilendiamina. La adición de un compuesto de fórmula R₁-M (M es, p. ej., MgCl, MgBr, Li, ZnCl) a compuestos de fórmula (XV) o (XVII) da compuestos de fórmula (VIb). En la fórmula (VIb), (IX), (XIV), (XV), (XVI) y (XVII), A₁, A₃ y R₁ son como se definieron arriba.

Esquema 5:

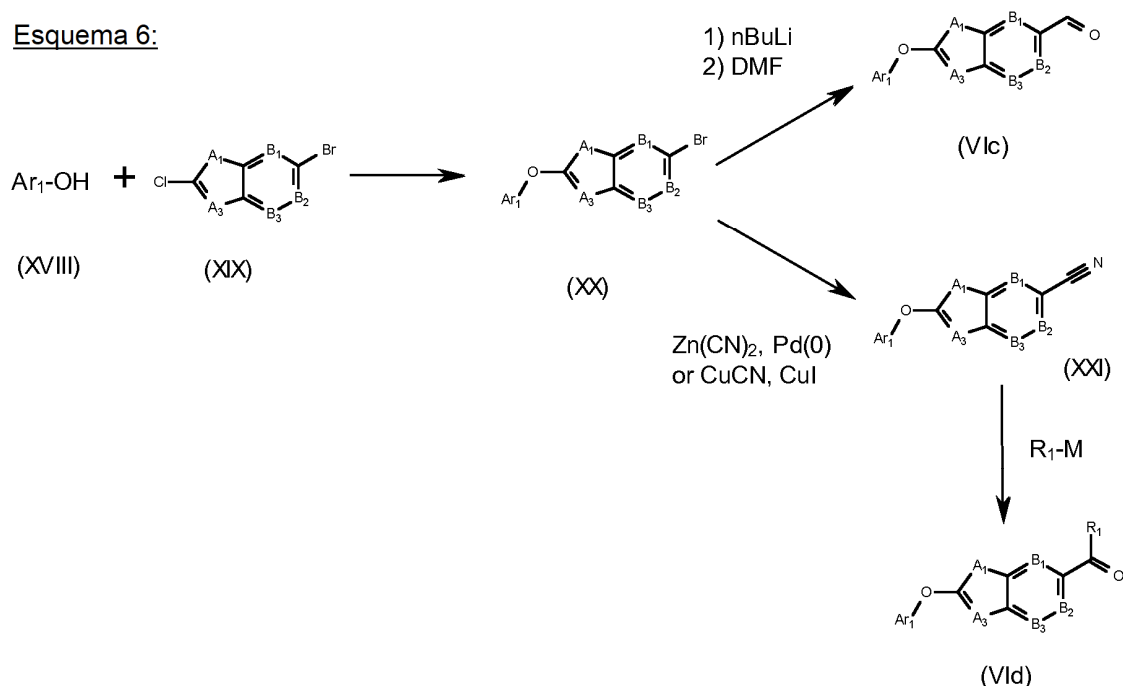


10

15

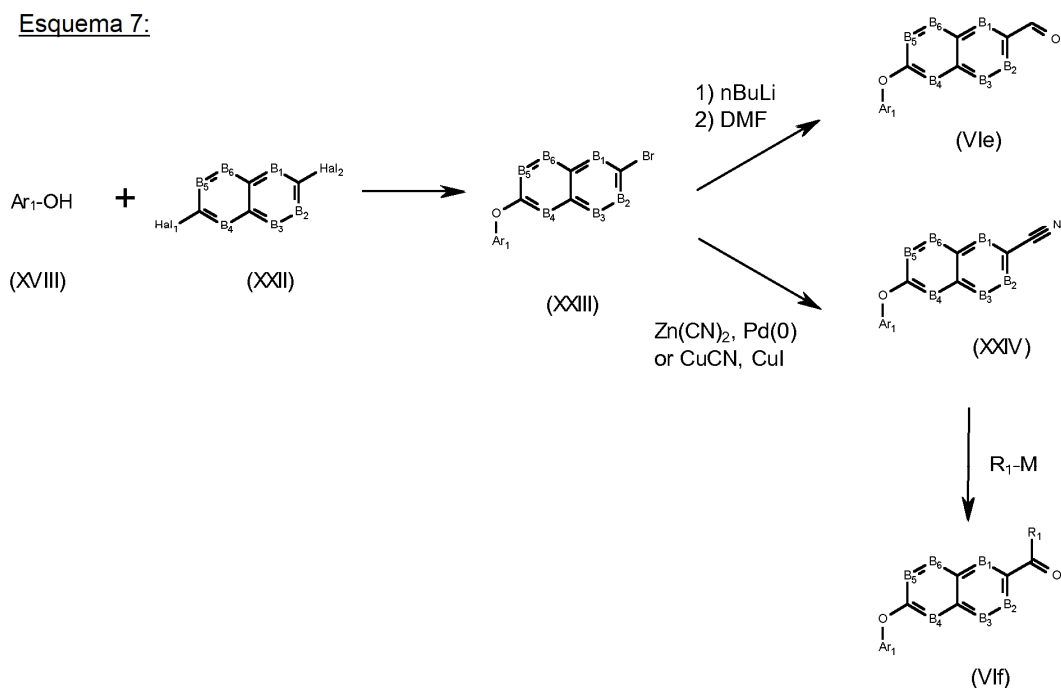
Compuestos de fórmulas (VIc) y (VI d) se pueden preparar de acuerdo con el esquema 6. Compuestos de fórmula (XVIII) pueden hacerse reaccionar con un compuesto de fórmula (XIX) en presencia de una base tal como NaH para dar compuestos de fórmula (XX). Compuestos de fórmula (XX) pueden metalarse con un agente tal como n-Buli o iPrMgCl y reaccionar con un agente de formilación tal como DMF para dar un compuesto de fórmula (VIc). Alternativamente, compuestos de fórmula (XX) pueden hacerse reaccionar con un agente de cianación, tal como CuCN o Zn(CN)₂ en presencia de un catalizador, tal como Pd(PPh₃)₄ o CuI para dar compuestos de fórmula (XXI). Compuestos de fórmula (XXI) se pueden elaborar para dar compuestos de fórmula (VI d) de la misma manera que los compuestos de fórmula (XV) se elaboran para dar compuestos de fórmula (VIb) como se representa en los esquemas 5 y 6. En las fórmulas (VIc), (VI d), (XVIII) (XIX) (XX) y (XXI), A₁, A₃, B₁, B₂, B₃ y R₁ son como se definieron arriba.

Esquema 6:



Compuestos de fórmulas (VIe) y (VI f) se pueden preparar de acuerdo con el esquema 7. Compuestos de fórmula (XVIII) pueden hacerse reaccionar con un compuesto de fórmula (XXII) en presencia de una base tal como NaH para dar compuestos de fórmula (XXIII). Compuestos de fórmula (XXIII) pueden metalarse con un agente tal como $n\text{-BuLi}$ o $i\text{PrMgCl}$ y reaccionar con un agente de formilación tal como DMF para dar compuestos de fórmula (VIe). Alternativamente, compuestos de fórmula (XXIII) pueden hacerse reaccionar con un agente de cianación tal como CuCN o Zn(CN)_2 en presencia de un catalizador, tal como $\text{Pd(PPh}_3)_4$ o CuI para dar compuestos de fórmula (XXIV). Compuestos de fórmula (XXIV) se pueden elaborar para dar compuestos de fórmula (VI f) de la misma manera que los compuestos de fórmula (XV) se elaboran para dar compuestos de fórmula (VI b) como se representa en los esquemas 5 y 7. En las fórmulas (VIe), (VI f), (XVIII), (XXII), (XXIII) y (XXIV), $\text{Ar}_1, \text{B}_1, \text{B}_2, \text{B}_3, \text{B}_4, \text{B}_5, \text{B}_6$ y R_1 son como se definieron arriba. Hal_1 y Hal_2 son independientemente Cl, Br, I .

Esquema 7:



Los compuestos de acuerdo con las Tablas 1 a 13 que figuran más adelante pueden prepararse de acuerdo con los métodos arriba descritos. Los ejemplos que siguen pretenden ser ilustrativos de la invención y muestran compuestos de fórmula I preferidos.

- 5 Dependiendo del procedimiento o de las condiciones de reacción, los compuestos de fórmula I, que tienen propiedades formadoras de sales, se pueden obtener en forma libre o en forma de sales.

10 Los compuestos de fórmula I y, cuando sea apropiado, los tautómeros de los mismos, en cada caso en forma libre o en forma de sal, pueden estar presentes en forma de uno de los isómeros que son posibles o como una mezcla de estos, por ejemplo en forma de isómeros puros, tales como antípodas y/o diastereómeros, o como mezclas de isómeros, como mezclas de enantiómeros, por ejemplo, racematos, mezclas de diastereómeros o mezclas de racematos, dependiendo del número, de la configuración absoluta y relativa de átomos de carbono asimétricos que se producen en la molécula y/o dependiendo de la configuración de los dobles enlaces no aromáticos que se producen en la molécula; la invención se refiere a los isómeros puros y también a todas las mezclas de isómeros que son posibles y deben entenderse en cada caso en este sentido más arriba y más adelante en esta memoria, incluso cuando los detalles estereoquímicos no se mencionen específicamente en cada caso.

20 Mezclas de diastereómeros o mezclas de racemato de compuestos de fórmula I, en forma libre o en forma de sal, que se pueden obtener dependiendo de qué materiales de partida y procedimientos se hayan elegido, se pueden separar de manera conocida en los diastereómeros o racematos puros en base a Las diferencias fisico-químicas de los componentes, por ejemplo por cristalización fraccionada, destilación y/o cromatografía.

25 Mezclas de enantiómeros, tales como racematos, que pueden obtenerse de manera similar pueden resolverse en las antípodas ópticos por métodos conocidos, por ejemplo, por recristalización en un disolvente ópticamente activo, por cromatografía sobre adsorbentes quirales, por ejemplo, cromatografía líquida de alto rendimiento (HPLC) en acetil celulosa, con la ayuda de microorganismos adecuados, mediante escisión con enzimas inmovilizadas específicas, mediante la formación de compuestos de inclusión, por ejemplo, utilizando éteres corona quirales, en que solo un enantiómero está complejado, o por conversión en sales diastereoméricas, por ejemplo, haciendo reaccionar un racemato de producto final básico con un ácido ópticamente activo, tal como un ácido carboxílico, por ejemplo alcanfor, ácido tartárico o málico, o ácido sulfónico, por ejemplo ácido canforsulfónico, y separando la mezcla de diastereómeros que se puede obtener de esta manera, por ejemplo, por cristalización fraccionada basada en sus diferentes solubilidades, para dar los diastereómeros, de los cuales el enantiómero deseado puede liberarse mediante la acción de agentes adecuados, por ejemplo, agentes de carácter básico.

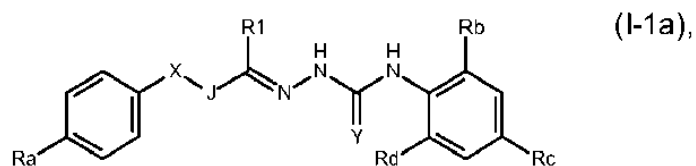
35 Diastereómeros o enantiómeros puros se pueden obtener de acuerdo con la invención no solo separando mezclas de isómeros adecuadas, sino también mediante métodos generalmente conocidos de síntesis diastereoselectiva o enantioselectiva, por ejemplo llevando a cabo el procedimiento de acuerdo con la invención con materiales de partida de una estereoquímica adecuada.

40 N-óxidos se pueden preparar haciendo reaccionar un compuesto de la fórmula I con un agente oxidante adecuado, por ejemplo el aducto de H₂O₂/urea en presencia de un anhídrido de ácido, p. ej. anhídrido trifluoroacético. Oxidaciones de este tipo son conocidas de la bibliografía, por ejemplo de J. Med. Chem. 1989, 32, 2561 o el documento WO 2000/15615.

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

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

55 Tabla X: Esta tabla describe 100 definiciones de sustituyentes X.001 a X.100 de la fórmula I-1a:



en donde R_a, X, R₁, Y, R_b, R_c y R_d son como se define a continuación:

ES 2 816 773 T3

Tabla X:

Comp. N°	R _a	X	R ₁	Y	R _b	R _c	R _d
X.001	OCF ₃	Enlace directo	H	O	CH ₃	H	CH ₃
X.002	OCF ₃	Enlace directo	H	O	iPr	H	H
X.003	OCF ₃	Enlace directo	H	O	CH ₃	OCH ₃	CH ₃
X.004	OCF ₃	Enlace directo	H	O	CH ₃	H	Cl
X.005	OCF ₃	Enlace directo	H	O	CH ₃	OCH ₃	Cl
X.006	OCF ₃	Enlace directo	H	O	Cl	H	Cl
X.007	OCF ₃	Enlace directo	H	O	Cl	H	F
X.008	OCF ₃	Enlace directo	H	O	CH ₃	H	H
X.009	OCF ₃	Enlace directo	H	O	Cl	H	H
X.010	OCF ₃	Enlace directo	H	O	CH ₃	OCH ₃	H
X.011	OCF ₂ CF ₃	Enlace directo	H	O	CH ₃	H	CH ₃
X.012	OCF ₂ CF ₃	Enlace directo	H	O	iPr	H	H
X.013	OCF ₂ CF ₃	Enlace directo	H	O	CH ₃	OCH ₃	CH ₃
X.014	OCF ₂ CF ₃	Enlace directo	H	O	CH ₃	H	Cl
X.015	OCF ₂ CF ₃	Enlace directo	H	O	CH ₃	OCH ₃	Cl
X.016	OCF ₂ CF ₃	Enlace directo	H	O	Cl	H	Cl
X.017	OCF ₂ CF ₃	Enlace directo	H	O	Cl	H	F
X.018	OCF ₂ CF ₃	Enlace directo	H	O	CH ₃	H	H
X.019	OCF ₂ CF ₃	Enlace directo	H	O	Cl	H	H
X.020	OCF ₂ CF ₃	Enlace directo	H	O	CH ₃	OCH ₃	H
X.021	OCF ₃	O	H	O	CH ₃	H	CH ₃
X.022	OCF ₃	O	H	O	iPr	H	H
X.023	OCF ₃	O	H	O	CH ₃	OCH ₃	CH ₃
X.024	OCF ₃	O	H	O	CH ₃	H	Cl
X.025	OCF ₃	O	H	O	CH ₃	OCH ₃	Cl
X.026	OCF ₃	O	H	O	Cl	H	Cl
X.027	OCF ₃	O	H	O	Cl	H	F
X.028	OCF ₃	O	H	O	CH ₃	H	H
X.029	OCF ₃	O	H	O	Cl	H	H
X.030	OCF ₃	O	H	O	CH ₃	OCH ₃	H
X.031	OCF ₃	O	CH ₃	O	CH ₃	H	CH ₃
X.032	OCF ₃	O	CH ₃	O	iPr	H	H
X.033	OCF ₃	O	CH ₃	O	CH ₃	OCH ₃	CH ₃
X.034	OCF ₃	O	CH ₃	O	CH ₃	H	Cl
X.035	OCF ₃	O	CH ₃	O	CH ₃	OCH ₃	Cl
X.036	OCF ₃	O	CH ₃	O	Cl	H	Cl
X.037	OCF ₃	O	CH ₃	O	Cl	H	F
X.038	OCF ₃	O	CH ₃	O	CH ₃	H	H
X.039	OCF ₃	O	CH ₃	O	Cl	H	H
X.040	OCF ₃	O	CH ₃	O	CH ₃	OCH ₃	H
X.041	OCF ₃	Enlace directo	CH ₃	O	CH ₃	H	CH ₃
X.042	OCF ₃	Enlace directo	CH ₃	O	iPr	H	H
X.043	OCF ₃	Enlace directo	CH ₃	O	CH ₃	OCH ₃	CH ₃

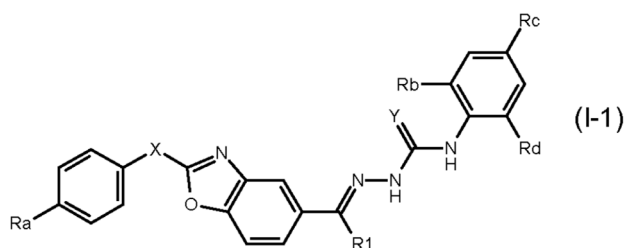
ES 2 816 773 T3

Comp. N°	R _a	X	R ₁	Y	R _b	R _c	R _d
X.044	OCF ₃	Enlace directo	CH ₃	O	CH ₃	H	Cl
X.045	OCF ₃	Enlace directo	CH ₃	O	CH ₃	OCH ₃	Cl
X.046	OCF ₃	Enlace directo	CH ₃	O	Cl	H	Cl
X.047	OCF ₃	Enlace directo	CH ₃	O	Cl	H	F
X.048	OCF ₃	Enlace directo	CH ₃	O	CH ₃	H	H
X.049	OCF ₃	Enlace directo	CH ₃	O	Cl	H	H
X.050	OCF ₃	Enlace directo	CH ₃	O	CH ₃	OCH ₃	H
X.051	OCF ₃	Enlace directo	H	S	CH ₃	H	CH ₃
X.052	OCF ₃	Enlace directo	H	S	iPr	H	H
X.053	OCF ₃	Enlace directo	H	S	CH ₃	OCH ₃	CH ₃
X.054	OCF ₃	Enlace directo	H	S	CH ₃	H	Cl
X.055	OCF ₃	Enlace directo	H	S	CH ₃	OCH ₃	Cl
X.056	OCF ₃	Enlace directo	H	S	Cl	H	Cl
X.057	OCF ₃	Enlace directo	H	S	Cl	H	F
X.058	OCF ₃	Enlace directo	H	S	CH ₃	H	H
X.059	OCF ₃	Enlace directo	H	S	Cl	H	H
X.060	OCF ₃	Enlace directo	H	S	CH ₃	OCH ₃	H
X.061	OCF ₂ CF ₃	Enlace directo	H	S	CH ₃	H	CH ₃
X.062	OCF ₂ CF ₃	Enlace directo	H	S	iPr	H	H
X.063	OCF ₂ CF ₃	Enlace directo	H	S	CH ₃	OCH ₃	CH ₃
X.064	OCF ₂ CF ₃	Enlace directo	H	S	CH ₃	H	Cl
X.065	OCF ₂ CF ₃	Enlace directo	H	S	CH ₃	OCH ₃	Cl
X.066	OCF ₂ CF ₃	Enlace directo	H	S	Cl	H	Cl
X.067	OCF ₂ CF ₃	Enlace directo	H	S	Cl	H	F
X.068	OCF ₂ CF ₃	Enlace directo	H	S	CH ₃	H	H
X.069	OCF ₂ CF ₃	Enlace directo	H	S	Cl	H	H
X.070	OCF ₂ CF ₃	Enlace directo	H	S	CH ₃	OCH ₃	H
X.071	OCF ₃	O	H	S	CH ₃	H	CH ₃
X.072	OCF ₃	O	H	S	iPr	H	H
X.073	OCF ₃	O	H	S	CH ₃	OCH ₃	CH ₃
X.074	OCF ₃	O	H	S	CH ₃	H	Cl
X.075	OCF ₃	O	H	S	CH ₃	OCH ₃	Cl
X.076	OCF ₃	O	H	S	Cl	H	Cl
X.077	OCF ₃	O	H	S	Cl	H	F
X.078	OCF ₃	O	H	S	CH ₃	H	H
X.079	OCF ₃	O	H	S	Cl	H	H
X.080	OCF ₃	O	H	S	CH ₃	OCH ₃	H
X.081	OCF ₃	O	CH ₃	S	CH ₃	H	CH ₃
X.082	OCF ₃	O	CH ₃	S	iPr	H	H
X.083	OCF ₃	O	CH ₃	S	CH ₃	OCH ₃	CH ₃
X.084	OCF ₃	O	CH ₃	S	CH ₃	H	Cl
X.085	OCF ₃	O	CH ₃	S	CH ₃	OCH ₃	Cl
X.086	OCF ₃	O	CH ₃	S	Cl	H	Cl
X.087	OCF ₃	O	CH ₃	S	Cl	H	F
X.088	OCF ₃	O	CH ₃	S	CH ₃	H	H

Comp. N°	R _a	X	R ₁	Y	R _b	R _c	R _d
X.089	OCF ₃	O	CH ₃	S	Cl	H	H
X.090	OCF ₃	O	CH ₃	S	CH ₃	OCH ₃	H
X.091	OCF ₃	Enlace directo	CH ₃	S	CH ₃	H	CH ₃
X.092	OCF ₃	Enlace directo	CH ₃	S	iPr	H	H
X.093	OCF ₃	Enlace directo	CH ₃	S	CH ₃	OCH ₃	CH ₃
X.094	OCF ₃	Enlace directo	CH ₃	S	CH ₃	H	Cl
X.095	OCF ₃	Enlace directo	CH ₃	S	CH ₃	OCH ₃	Cl
X.096	OCF ₃	Enlace directo	CH ₃	S	Cl	H	Cl
X.097	OCF ₃	Enlace directo	CH ₃	S	Cl	H	F
X.098	OCF ₃	Enlace directo	CH ₃	S	CH ₃	H	H
X.099	OCF ₃	Enlace directo	CH ₃	S	Cl	H	H
X.100	OCF ₃	Enlace directo	CH ₃	S	CH ₃	OCH ₃	H

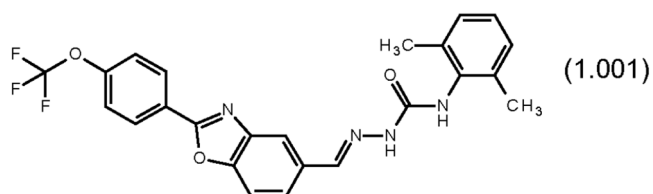
y los N-óxidos de los compuestos de la Tabla X.

Tabla 1: Esta tabla describe los 100 compuestos 1.001 a 1.100 de la fórmula I-1, en donde R_a, X, R₁, Y, R_b, R_c y R_d son como se define en la Tabla X.



5

Por ejemplo, el compuesto N° 1.001 tiene la siguiente estructura:



10 **Tabla 2:** Esta tabla describe los 100 compuestos 2.001 a 2.100 de la fórmula I-2, en donde R_a, X, R₁, Y, R_b, R_c y R_d son como se define en la Tabla X.

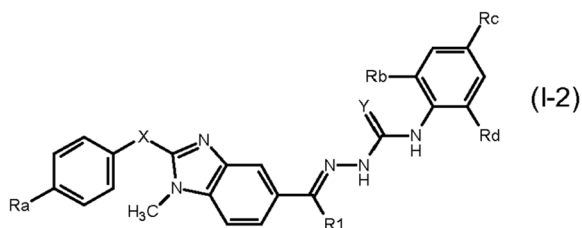
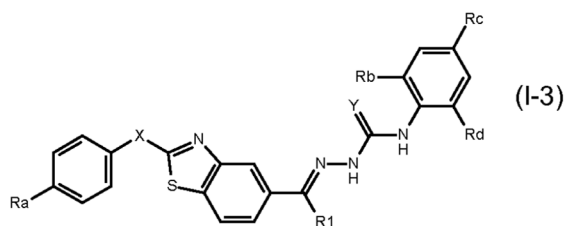
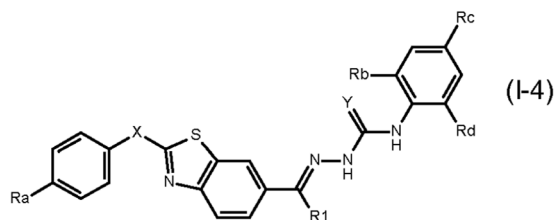


Tabla 3: Esta tabla describe los 100 compuestos 3.001 a 3.100 de la fórmula I-3, en donde R_a , X, R_1 , Y, R_b , R_c y R_d son como se define en la Tabla X.

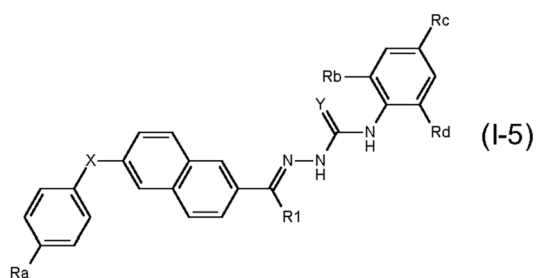


5

Tabla 4: Esta tabla describe los 100 compuestos 4.001 a 4.100 de la fórmula I-4, en donde R_a , X, R_1 , Y, R_b , R_c y R_d son como se define en la Tabla X.



10 **Tabla 5:** Esta tabla describe los 100 compuestos 5.001 a 5.100 de la fórmula I-5, en donde R_a , X, R_1 , Y, R_b , R_c y R_d son como se define en la Tabla X.



15 **Tabla 6:** Esta tabla describe los 100 compuestos 6.001 a 6.100 de la fórmula I-6, en donde R_a , X, R_1 , Y, R_b , R_c y R_d son como se define en la Tabla X.

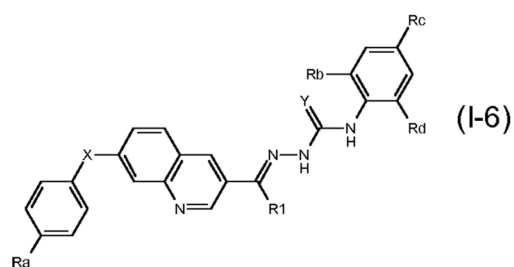
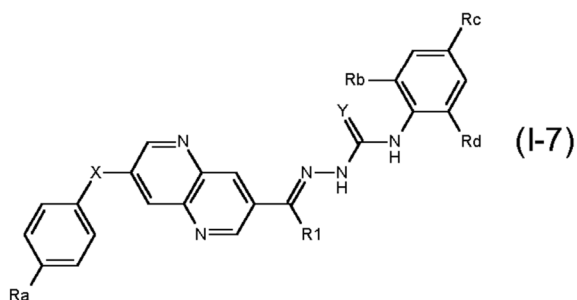
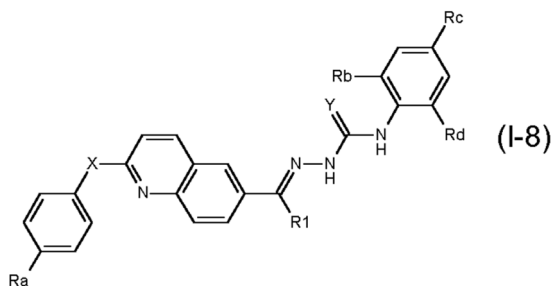


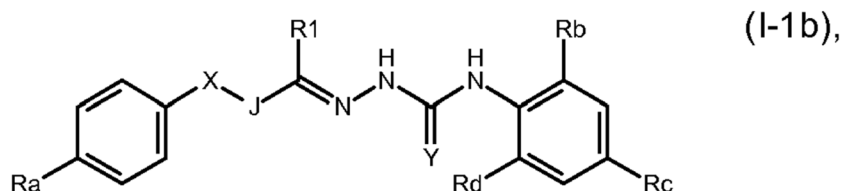
Tabla 7: Esta tabla describe los 100 compuestos 7.001 a 7.100 de la fórmula I-7, en donde Ra, X, R1, Y, Rb, Rc y Rd son como se define en la Tabla X.



5 Tabla 8: Esta tabla describe los 100 compuestos 8.001 a 8.100 de la fórmula I-8, en donde Ra, X, R1, Y, Rb, Rc y Rd son como se define en la Tabla X.



10 Tabla Y: Esta tabla describe 60 definiciones de sustituyentes Y.001 a Y.060 de la fórmula I-1b:



15 en donde Ra, X, R1, Y, Rb, Rc y Rd son como se define a continuación:

Tabla Y:

Comp. N°	Ra	R1	Y	Rb	Rc	Rd
Y.001	OCF ₃	H	O	CH ₃	H	CH ₃
Y.002	OCF ₃	H	O	iPr	H	H
Y.003	OCF ₃	H	O	CH ₃	OCH ₃	CH ₃
Y.004	OCF ₃	H	O	CH ₃	H	Cl
Y.005	OCF ₃	H	O	CH ₃	OCH ₃	Cl
Y.006	OCF ₃	H	O	Cl	H	Cl
Y.007	OCF ₃	H	O	Cl	H	F
Y.008	OCF ₃	H	O	CH ₃	H	H
Y.009	OCF ₃	H	O	Cl	H	H
Y.010	OCF ₃	H	O	CH ₃	OCH ₃	H
Y.011	OCF ₂ CF ₃	H	O	CH ₃	H	CH ₃
Y.012	OCF ₂ CF ₃	H	O	iPr	H	H
Y.013	OCF ₂ CF ₃	H	O	CH ₃	OCH ₃	CH ₃

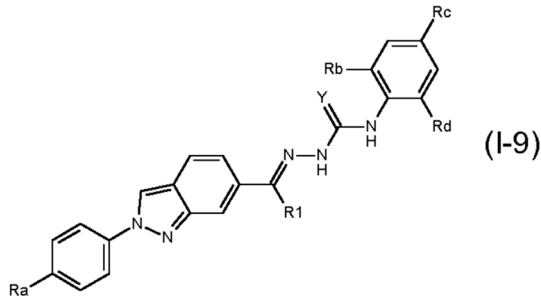
ES 2 816 773 T3

Comp. N°	R _a	R ₁	Y	R _b	R _c	R _d
Y.014	OCF ₂ CF ₃	H	O	CH ₃	H	Cl
X.015	OCF ₂ CF ₃	H	O	CH ₃	OCH ₃	Cl
Y.016	OCF ₂ CF ₃	H	O	Cl	H	Cl
Y.017	OCF ₂ CF ₃	H	O	Cl	H	F
Y.018	OCF ₂ CF ₃	H	O	CH ₃	H	H
Y.019	OCF ₂ CF ₃	H	O	Cl	H	H
Y.020	OCF ₂ CF ₃	H	O	CH ₃	OCH ₃	H
Y.021	OCF ₃	CH ₃	O	CH ₃	H	CH ₃
Y.022	OCF ₃	CH ₃	O	iPr	H	H
Y.023	OCF ₃	CH ₃	O	CH ₃	OCH ₃	CH ₃
Y.024	OCF ₃	CH ₃	O	CH ₃	H	Cl
Y.025	OCF ₃	CH ₃	O	CH ₃	OCH ₃	Cl
Y.026	OCF ₃	CH ₃	O	Cl	H	Cl
Y.027	OCF ₃	CH ₃	O	Cl	H	F
Y.028	OCF ₃	CH ₃	O	CH ₃	H	H
Y.029	OCF ₃	CH ₃	O	Cl	H	H
Y.030	OCF ₃	CH ₃	O	CH ₃	OCH ₃	H
Y.031	OCF ₃	H	S	CH ₃	H	CH ₃
Y.032	OCF ₃	H	S	iPr	H	H
Y.033	OCF ₃	H	S	CH ₃	OCH ₃	CH ₃
Y.034	OCF ₃	H	S	CH ₃	H	Cl
Y.035	OCF ₃	H	S	CH ₃	OCH ₃	Cl
Y.036	OCF ₃	H	S	Cl	H	Cl
Y.037	OCF ₃	H	S	Cl	H	F
Y.038	OCF ₃	H	S	CH ₃	H	H
Y.039	OCF ₃	H	S	Cl	H	H
Y.040	OCF ₃	H	S	CH ₃	OCH ₃	H
Y.041	OCF ₂ CF ₃	H	S	CH ₃	H	CH ₃
Y.042	OCF ₂ CF ₃	H	S	iPr	H	H
Y.043	OCF ₂ CF ₃	H	S	CH ₃	OCH ₃	CH ₃
Y.044	OCF ₂ CF ₃	H	S	CH ₃	H	Cl
Y.045	OCF ₂ CF ₃	H	S	CH ₃	OCH ₃	Cl
Y.046	OCF ₂ CF ₃	H	S	Cl	H	Cl
Y.047	OCF ₂ CF ₃	H	S	Cl	H	F
Y.048	OCF ₂ CF ₃	H	S	CH ₃	H	H
Y.049	OCF ₂ CF ₃	H	S	Cl	H	H
Y.050	OCF ₂ CF ₃	H	S	CH ₃	OCH ₃	H
Y.051	OCF ₃	CH ₃	S	CH ₃	H	CH ₃
Y.052	OCF ₃	CH ₃	S	iPr	H	H
Y.053	OCF ₃	CH ₃	S	CH ₃	OCH ₃	CH ₃
Y.054	OCF ₃	CH ₃	S	CH ₃	H	Cl
Y.055	OCF ₃	CH ₃	S	CH ₃	OCH ₃	Cl
Y.056	OCF ₃	CH ₃	S	Cl	H	Cl
Y.057	OCF ₃	CH ₃	S	Cl	H	F
Y.058	OCF ₃	CH ₃	S	CH ₃	H	H

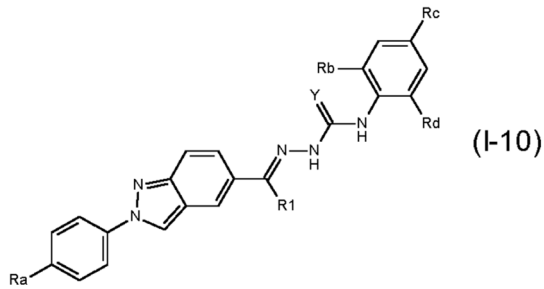
Comp. N°	R _a	R ₁	Y	R _b	R _c	R _d
Y.059	OCF ₃	CH ₃	S	Cl	H	H
Y.060	OCF ₃	CH ₃	S	CH ₃	OCH ₃	H

y los N-óxidos de los compuestos de la Tabla Y.

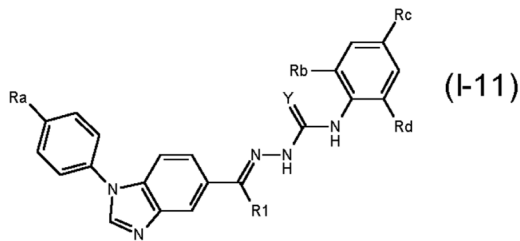
5 **Tabla 9:** Esta tabla describe los 60 compuestos 9.001 a 9.060 de la fórmula I-9, en donde R_a, R₁, Y, R_b, R_c y R_d son como se define en la Tabla Y.



10 **Tabla 10:** Esta tabla describe los 60 compuestos 10.001 a 10.060 de la fórmula I-10, en donde R_a, R₁, Y, R_b, R_c y R_d son como se define en la Tabla Y.



15 **Tabla 11:** Esta tabla describe los 60 compuestos 11.001 a 11.060 de la fórmula I-11, en donde R_a, R₁, Y, R_b, R_c y R_d son como se define en la Tabla Y.



20 **Tabla 12:** Esta tabla describe los 60 compuestos 12.001 a 12.060 de la fórmula I-12, en donde R_a, R₁, Y, R_b, R_c y R_d son como se define en la Tabla Y.

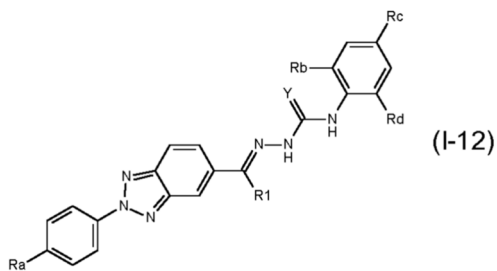
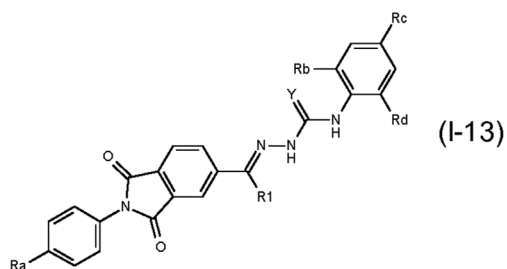


Tabla 13: Esta tabla describe los 60 compuestos 13.001 a 13.060 de la fórmula I-13, en donde Ra, R1, Y, Rb, Rc y Rd son como se define en la Tabla Y.



5 Los compuestos de fórmula I de acuerdo con la invención son ingredientes activos preventivos y/o curativamente valiosos en el campo del control de plagas, incluso a bajas dosis de aplicación, que tienen un espectro biocida favorable y son bien tolerados por especies de sangre caliente, peces y plantas. Compuestos de fórmula I pueden actuar contra todas o solo las fases de desarrollo individuales de plagas animales normalmente sensibles, pero también resistentes, tales como insectos o representantes del orden Acarina. La actividad insecticida o acaricida de los compuestos puede manifestarse directamente, es decir, en la destrucción de las plagas, que tiene lugar inmediatamente o solamente después de que haya transcurrido un tiempo, por ejemplo, durante la ecdisis, o indirectamente, por ejemplo, en una tasa de oviposición y/o incubación reducida, correspondiendo una buena actividad a una tasa de destrucción (mortalidad) de al menos un 50 a un 60 %.

15 Ejemplos de las plagas animales arriba mencionadas son:
del orden *Acarina*, por ejemplo, *Acalitus spp.*, *Aculus spp.*, *Acaricalus spp.*, *Aceria spp.*, *Acarus siro*, *Amblyomma spp.*, *Argas spp.*, *Boophilus spp.*, *Brevipalpus spp.*, *Bryobia spp.*, *Calipitimerus spp.*, *Chorioptes spp.*, *Dermanyssus gallinae*, *Dermatophagoides spp.*, *Eotetranychus spp.*, *Eriophyes spp.*, *Hemitarsonemus spp.*, *Hyalomma spp.*, *Ixodes spp.*, *Olygonychus spp.*, *Ornithodoros spp.*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Panonychus spp.*, *Phyllocoptruta oleivora*, *Phytonemus spp.*, *Polyphagotarsonemus spp.*, *Psoroptes spp.*, *Rhipicephalus spp.*, *Rhizoglyphus spp.*, *Sarcoptes spp.*, *Steneotarsonemus spp.*, *Tarsonemus spp.* y *Tetranychus spp.*;

25 del orden *Anoplura*, por ejemplo, *Haematopinus spp.*, *Linognathus spp.*, *Pediculus spp.*, *Pemphigus spp.* y *Phylloxera spp.*;

del orden *Coleoptera*, por ejemplo, *Agriotes spp.*, *Amphimallon majale*, *Anomala orientalis*, *Anthonomus spp.*, *Aphodius spp.*, *Astylus atomaculatus*, *Ataenius spp.*, *Atomaria linearis*, *Chaetocnema tibialis*, *Ceratomyza spp.*, *Conoderus spp.*, *Cosmopolites spp.*, *Cotinis nitida*, *Curculio spp.*, *Cyclocephala spp.*, *Dermestes spp.*, *Diabrotica spp.*, *Diloboderus abderus*, *Epilachna spp.*, *Eremnus spp.*, *Heteronychus arator*, *Hypothenemus hampei*, *Lagria villosa*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Lissorhynchus spp.*, *Liogenys spp.*, *Maecolaspis spp.*, *Maladera castanea*, *Megascelis spp.*, *Melighetes aeneus*, *Melolontha spp.*, *Myochrous armatus*, *Oryzaephilus spp.*, *Otiorhynchus spp.*, *Phyllophaga spp.*, *Phlyctinus spp.*, *Popillia spp.*, *Psylliodes spp.*, *Rhyssomatus aubtilis*, *Rhizopertha spp.*, *Scarabeidae*, *Sitophilus spp.*, *Sitotroga spp.*, *Somaticus spp.*, *Sphenophorus spp.*, *Sternechus subsignatus*, *Tenebrio spp.*, *Tribolium spp.* y *Trogoderma spp.*;

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

45 del orden *Hemiptera*, por ejemplo, *Acanthocoris scabrator*, *Acrostemum spp.*, *Adelphocoris lineolatus*, *Amblypelta nitida*, *Bathycorixa thalassina*, *Blissus spp.*, *Cimex spp.*, *Clavigralla tomentosicollis*, *Creontiades spp.*, *Distantiella theobroma*, *Dichelops furcatus*, *Dysdercus spp.*, *Edessa spp.*, *Euchistus spp.*, *Eurydema pulchrum*, *Eurygaster spp.*, *Halyomorpha halys*, *Horcias nobilellus*, *Leptocoris spp.*, *Lygus spp.*, *Margarodes spp.*, *Murgantia histrionic*, *Neomegalotomus spp.*, *Nesidiocoris tenuis*, *Nezara spp.*, *Nysius simulans*, *Oebalus insularis*, *Piesma spp.*, *Piezodorus spp.*, *Rhodnius spp.*, *Sahlbergella singularis*, *Scaptocoris castanea*, *Scotinophara spp.*, *Thyanta spp.*, *Triatoma spp.* y *Vatiga illudens*;

50 del orden *homoptera*, por ejemplo, *Acyrtosium pisum*, *Adalgas spp.*, *Agalliana ensigera*, *Agonoscena targionii*, *Aleurodicus spp.*, *Aleurocanthus spp.*, *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus floccosus*, *Aleyrodes brassicae*, *Amarasca biguttula*, *Amritodus atkinsoni*, *Aonidiella spp.*, *Aonidiella auranti*, *Aphididae*, *Aphis spp.*, *Aspidiotus spp.*, *Aulacorthum solani*, *Bactericera cockerelli*, *Bemisia spp.*, *Brachycaudus spp.*, *Brevicoryne brassicae*, *Cacopsylla spp.*, *Cavariella aegopodii Scop.*, *Ceroplaster spp.*, *Chrysomphalus aonidium*, *Chrysomphalus dictyospermi*, *Cicadella spp.*, *Cofana spectra*, *Cryptomyzus spp.*, *Cicadulina spp.*, *Coccus hesperidum*, *Dalbulus maidis*, *Dialeurodes spp.*, *Diaphorina citri*,

5 *Diuraphis noxia*, *Dysaphis* spp, *Empoasca* spp., *Eriosoma larigerum*, *Erythroneura* spp., *Gascardia* spp., *Glycaspis brimblecombei*, *Hyadaphis pseudobrassicae*, *Hyalopterus* spp, *Hyperomyzus pallidus*, *Idioscopus clypealis*, *Jacobiasca lybica*, *Laodelphax* spp., *Lecanium corni*, *Lepidosaphes* spp., *Lopaphis erysimi*, *Lyogenys maidis*, *Macrosiphum* spp., *Mahanarva* spp, *Metcalfa pruinosa*, *Metopolophium dirhodum*, *Myndus crudus*, *Myzus* spp.,
 10 *Neotoxoptera* sp, *Nephotettix* spp., *Nilaparvata* spp., *Nippolachnus piri* Mats, *Odonaspis ruthae*, *Oregma lanigera* Zehnter, *Parabemisia myricae*, *Paratrioza cockerelli*, *Parlatoria* spp., *Pemphigus* spp., *Peregrinus maidis*, *Perkinsiella* spp, *Phorodon humuli*, *Phylloxera* spp, *Planococcus* spp., *Pseudaulacaspis* spp., *Pseudococcus* spp., *Pseudatomoscelis seriatus*, *Psylla* spp., *Pulvinaria aethiopica*, *Quadraspidiotus* spp., *Quesada gigas*, *Recilia dorsalis*, *Rhopalosiphum* spp., *Saissetia* spp., *Scaphoideus* spp., *Schizaphis* spp., *Sitobion* spp., *Sogatella furcifera*, *Spissistilus festinus*, *Tarophagus Proserpina*, *Toxoptera* spp, *Trialeurodes* spp, *Tridiscus sporoboli*, *Trionymus* spp, *Triozia erytrae* , *Unaspis citri*, *Zygina flammigera*, y *Zyginidia scutellaris*;

15 del orden *Hymenoptera*, por ejemplo, *Acromyrmex*, *Arge* spp, *Atta* spp., *Cephus* spp., *Diprion* spp., *Diprionidae*, *Gilpinia polytoma*, *Hoplocampa* spp., *Lasius* spp., *Monomorium pharaonis*, *Neodiprion* spp., *Pogonomyrmex* spp, *Slenopsis invicta*, *Solenopsis* spp. y *Vespa* spp.; del orden *Isoptera*, por ejemplo, *Coptotermes* spp, *Cornitermes cumulans*, *Incisitermes* spp, *Macrotermes* spp, *Mastotermes* spp, *Microtermes* spp, *Reticulitermes* spp.; *Solenopsis geminate*;

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

35 del orden *Mallophaga*, por ejemplo, *Damalinea* spp. y *Trichodectes* spp.; del orden *Orthoptera*, por ejemplo, *Blatta* spp., *Blattella* spp., *Gryllotalpa* spp., *Leucophaea maderae*, *Locusta* spp., *Neocurtilla hexadactyla*, *Periplaneta* spp., *Scapteriscus* spp, y *Schistocerca* spp.;

40 del orden *Psocoptera*, por ejemplo, *Liposcelis* spp.;

45 del orden *Siphonaptera*, por ejemplo, *Ceratophyllus* spp., *Ctenocephalides* spp. y *Xenopsylla cheopis*;
 del orden *Thysanoptera*, por ejemplo, *Calliothrips phaseoli*, *Frankliniella* spp., *Heliothrips* spp, *Hercinothrips* spp., *Parthenothrips* spp, *Scirtothrips aurantii*, *Sericothrips variabilis*, *Taeniothrips* spp., *Thrips* spp; y/o
 del orden *Thysanura*, por ejemplo, *Lepisma saccharina*.

Ejemplos de plagas que habitan en el suelo, que pueden dañar a un cultivo en las fases tempranas del desarrollo de la planta, son:

50 del orden *Lepidoptera*, por ejemplo, *Acleris* spp., *Aegeria* spp., *Agrotis* spp., *Alabama argillaceae*, *Amylois* spp., *Autographa* spp., *Busseola fusca*, *Cadra cautella*, *Chilo* spp., *Crocidolomia binotalis*, *Diatraea* spp., *Diparopsis castanea*, *Elasmopalpus* spp., *Heliothis* spp., *Mamestra brassicae*, *Phthorimaea operculella*, *Plutella xylostella*, *Scirpophaga* spp., *Sesamia* spp., *Spodoptera* spp. y *Tortrix* spp.;

55 del orden *Coleoptera*, por ejemplo, *Agriotes* spp., *Anthonomus* spp., *Atomaria linearis*, *Chaetocnema tibialis*, *Conotrachelus* spp., *Cosmopolites* spp., *Curculio* spp., *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., *Dilopoderus* spp., *Epilachna* spp., *Eremnus* spp., *Heteronychus* spp., *Lissorhoptrus* spp., *Melolontha* spp., *Oryzaephilus* spp., *Otiiorhynchus* spp., *Phlyctinus* spp., *Popillia* spp., *Psylliodes* spp., *Rhizopertha* spp., *Scarabeidae*, *Sitotroga* spp., *Somaticus* spp., *Tanymecus* spp., *Tenebrio* spp., *Tribolium* spp., *Trogoderma* spp. y *Zabrus* spp.;

60 del orden *Orthoptera*, por ejemplo, *Gryllotalpa* spp.;

del orden *Isoptera*, por ejemplo, *Reticulitermes* spp.;

del orden *Psocoptera*, por ejemplo, *Liposcelis* spp.;

del orden *Anoplura*, por ejemplo, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Pemphigus* spp. y *Phylloxera* spp.;

65 del orden *Homoptera*, por ejemplo, *Eriosoma larigerum*;

del orden Hymenoptera, por ejemplo, *Acromyrmex*, *Atta* spp., *Cephus* spp., *Lasius* spp., *Monomorium pharaonis*, *Neodiprion* spp., *Solenopsis* spp. y *Vespa* spp.;
 del orden Diptera, por ejemplo, *Tipula* spp.;
 escarabajos de pulgas crucíferos (*Phyllotreta* spp.), gusanos de raíz (*Delia* spp.), gorgojos de la semilla de col
 5 (*Ceutorhynchus* spp.) y áfidos.

Los compuestos de fórmula (I) pueden ser útiles para el control de nematodos. . Por lo tanto, en un aspecto adicional, la invención también se refiere a un método para controlar el daño a una planta y a partes de la misma por nematodos
 10 parásitos de plantas (nematodos endoparasitarios, semiendoparasitarios y ectoparasitarios), especialmente nematodos parásitos de plantas, tales como nematodos de nudos de raíz, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica*, *Meloidogyne arenaria* y otras especies de *Meloidogyne*; nematodos formadores de quistes, *Globodera rostochiensis* y otras especies de *Globodera*; *Heterodera avenae*, *Heterodera glycines*, *Heterodera schachtii*, *Heterodera trifolii*, y otras especies de *Heterodera*; nematodos de la hiel de la semilla, especies de *Anguina*;
 15 nematodos del tallo y las hojas, especies de *Aphelenchoides*; nematodos de picadura, *Eelionolaimus longicaudatus* y otras especies de *Belonolaimus*; nematodos de la madera del pino, *Bursaphelenchus xylophilus* y otras especies de *Bursaphelenchus*; nematodos del anillo, especies de *Criconema*, especies de *Criconemella*, especies de *Criconemoides*, especies de *Mesocriconema*; nematodos del tallo y del bulbo, *Ditylenchus destructor*, *Ditylenchus dipsaci* y otras especies de *Ditylenchus*; nematodos del punzón, especies de *Dolichodorus*; nematodos espirales, *Helicotylenchus multicinctus* y otras especies de *Helicotylenchus*; nematodos formadores de vaina y vainoides, especies de *Hemicycliophora* y especies de *Hemicriconemoides*; especies de *Hirshmanniella*; nematodos de lanza, especies de *Hoploaimus*; nematodos falsos del nudo de la raíz, especies de *Nacobbus*; nematodos de aguja, *Longidorus elongatus* y otras especies de *Longidorus*; nematodos de la espiga, especies de *Pratylenchus*;
 20 nematodos de lesión, *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus curvatus*, *Pratylenchus goodeyi* y otras especies de *Pratylenchus*; nematodos barrenadores, *Radopholus similis* y otras especies de *Radopholus*; nematodos *Reniform*, *Rotylenchus robustus*, *Rotylenchus reniformis* y otras especies de *Rotylenchus*; *Scutellonema*; nematodos de la raíz rechoncha, *Trichodorus primitivus* y otras especies de *Trichodorus*, especies de *Paratrachodorus*; nematodos acrobáticos, *Tylenchorhynchus claytoni*, *Tylenchorhynchus dubius* y otras especies de *Tylenchorhynchus*; nematodos de los cítricos, especies de *Tylenchulus*; nematodos perforadores, especies de *Xiphinema*; y otras especies de nematodos parasitarios de las plantas, tales como *Subanguina*., spp *Hypsoperine* spp., *Macroposthonia* spp., *Melinius* spp., *Punctodera* spp., y *Quinisulcius* spp.

En particular, las especies de nematodos *Meloidogyne* spp., *Heterodera* spp., *Rotylenchus* spp. y *Pratylenchus* spp. pueden ser controladas por los presentes compuestos de la invención.

35 Los ingredientes activos de acuerdo con la invención pueden utilizarse para controlar, es decir, contener o destruir plagas del tipo mencionado anteriormente que se producen, en particular, en plantas, especialmente en plantas útiles y plantas ornamentales útiles en agricultura, horticultura y en bosques, o en órganos tales como frutos, flores, follaje, tallos, tubérculos o raíces, de tales plantas y, en algunos casos, incluso órganos de plantas que se forman en un momento posterior permanecen protegidos contra estas plagas.

40 Cultivos objetivo adecuados son, en particular, cereales, tales como trigo, cebada, centeno, avena, arroz, maíz o sorgo; remolacha, tal como remolacha azucarera o forrajera; fruta, por ejemplo, fruta de pepitas, fruta de hueso o fruta blanda, tales como manzanas, peras, ciruelas, melocotones, almendras, cerezas o bayas, por ejemplo fresas, frambuesas o moras; cultivos de leguminosas, tales como habas, lentejas, guisantes o soja; cultivos oleaginosos, tales como colza, 45 mostaza, amapolas, aceitunas, girasoles, coco, ricino, cacao o nueces molidas; cucurbitáceas, tales como calabazas, pepinos o melones; plantas de fibra, tales como algodón, lino, cáñamo o yute; frutas de cítricos, tales como naranjas, limones, pomelos o mandarinas; verduras, tales como espinacas, lechugas, espárragos, coles, zanahorias, cebollas, tomates, patatas o pimientos; Lauraceae, tales como aguacate, canela o alcanfor; y también tabaco, nueces, café, berenjenas, caña de azúcar, té, pimienta, vides, lúpulo, la familia del plátano, plantas de látex y plantas ornamentales.

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

55 Otros campos de aplicación de las composiciones de acuerdo con la invención son la protección de bienes almacenados y ambientes de almacenamiento y la protección de materias primas, tales como madera, textiles, recubrimientos para suelos o edificios y también en el sector de la higiene, especialmente la protección de seres humanos, animales domésticos y ganadería productiva, frente a plagas del tipo mencionado.

60 La presente invención también proporciona un método para controlar plagas (tales como mosquitos y otros vectores de enfermedades). En una realización, el método para controlar plagas comprende aplicar las composiciones de la invención a las plagas o su entorno, a su lugar, por ejemplo, al suelo o a una superficie o sustrato mediante cepillado, laminado, pulverización, extensión o inmersión. A modo de ejemplo, el método de la invención contempla una aplicación de IRS (rociado residual en interiores) de una superficie tal como una pared, techo o superficie del piso. En 65 otra realización, se contempla aplicar composiciones de este tipo a un sustrato tal como material no tejido o un material

de tela en forma de (o que se puede usar en la fabricación de) mallas, prendas de vestir, ropa de cama, cortinas y tiendas de campaña.

En una realización, el método para controlar este tipo de plagas comprende aplicar una cantidad eficaz como plaguicida de las composiciones de la invención a las plagas diana, a su lugar, o a una superficie o sustrato para proporcionar actividad plaguicida residual efectiva en la superficie o sustrato. Dicha aplicación se puede realizar mediante brocha, rodillo, pulverización, dispersión o inmersión de la composición plaguicida de la invención. A modo de ejemplo, el método de la invención contempla una aplicación IRS de una superficie, tal como una pared, techo o superficie del piso para proporcionar una actividad plaguicida residual efectiva en la superficie. En otra realización, se contempla aplicar composiciones de este tipo para el control residual de plagas en un sustrato tal como un material de tela en forma de (o que se puede utilizar en la fabricación de) redes, prendas de vestir, ropa de cama, cortinas y tiendas de campaña.

Sustratos que incluyen materiales no tejidos, telas o mallas a tratar pueden estar hechos de fibras naturales, tales como algodón, rafia, yute, lino, sisal, arpillera o lana, o fibras sintéticas, tales como poliamida, poliéster, polipropileno, poliacrilonitrilo o similares. Los poliésteres son particularmente adecuados. Los métodos de tratamiento textil son conocidos, p. ej., documento WO 2008/151984, WO 2003/034823, US 5631072, WO 2005/64072, WO2006/128870, EP 1724392, WO2005113886 o WO 2007/090739.

Por lo tanto, la invención también se refiere a composiciones plaguicidas tales como concentrados emulsionables, concentrados en suspensión, microemulsiones, aceites dispersables, soluciones que se pueden diluir o pulverizar directamente, pastas untables, emulsiones diluidas, polvos solubles, polvos dispersables, polvos humectables, polvos finos, gránulos o encapsulaciones en sustancias poliméricas que comprenden, al menos, uno de los principios activos de acuerdo con la invención y que se seleccionarán de modo que se ajusten a los objetivos previstos y las circunstancias predominantes.

Por lo tanto, la invención se refiere a una composición plaguicida, que comprende al menos un compuesto de fórmula (I), o en los casos en los que sea apropiado, un tautómero del mismo, en cada caso en forma libre o en forma de sal agroquímicamente utilizable, como ingrediente activo y al menos un auxiliar.

En estas composiciones, el ingrediente activo se emplea en forma pura, un ingrediente activo sólido, por ejemplo, en un tamaño de partícula específico, o, preferiblemente, junto con - al menos - uno de los auxiliares utilizados convencionalmente en la técnica de la formulación, tales como extendedores, tales como, por ejemplo, disolventes o soportes sólidos, o como compuestos tensioactivos (surfactantes).

Ejemplos de disolventes adecuados son: hidrocarburos aromáticos no hidrogenados o parcialmente hidrogenados, preferiblemente las fracciones C₈ a C₁₂ de alquilbencenos, tales como mezclas de xileno, naftalenos alquilados o tetrahidronaftaleno, hidrocarburos alifáticos o cicloalifáticos, tales como parafinas o ciclohexano, alcoholes tales como etanol, propanol o butanol, glicoles y sus éteres y ésteres, tales como propilenglicol, dipropilenglicol éter, etilenglicol o etilenglicol monometil éter o etilenglicol monoetil éter, cetonas, tales como ciclohexanona, isoforona o alcohol de diacetona, disolventes fuertemente polares, tales como N-metilpirrolid-2-ona, dimetilsulfóxido o N,N-dimetilformamida, agua, aceites vegetales no epoxidados o epoxidados, tales como semillas de colza, aceite de ricino, coco o soja no epoxidadas o epoxidadas, y aceites de silicona.

Soportes sólidos que se utilizan, por ejemplo, para polvos espolvoreables y polvos dispersables son, por regla general, minerales naturales molidos, tales como calcita, talco, caolín, montmorillonita o atapulgita. Para mejorar las propiedades físicas, también es posible añadir sílices altamente dispersas o polímeros absorbentes altamente dispersos. Soportes adsorbentes adecuados para gránulos son tipos porosos, tales como piedra pómez, grano de ladrillo, sepiolita o bentonita, y materiales portadores no sorbentes adecuados son calcita o arena. Además, se puede utilizar una gran cantidad de materiales granulados de naturaleza inorgánica u orgánica, en particular dolomita o residuos vegetales triturados.

Compuestos tensioactivos adecuados son, dependiendo del tipo de ingrediente activo a formular, tensioactivos no iónicos, catiónicos y/o aniónicos o mezclas de tensioactivos que tienen buenas propiedades emulsionantes, dispersantes y humectantes. Los tensioactivos mencionados a continuación solo deben considerarse como ejemplos; en la bibliografía pertinente se describe un gran número de tensioactivos adicionales que se utilizan convencionalmente en la técnica de formulación y son adecuados de acuerdo con la invención.

Tensioactivos no iónicos adecuados son, especialmente, derivados de poliglicol éter de alcoholes alifáticos o cicloalifáticos, de ácidos grasos saturados o insaturados o de alquilfenoles que pueden contener aproximadamente 3 a aproximadamente 30 grupos de glicol éter y aproximadamente 8 a aproximadamente 20 átomos de carbono en el radical hidrocarbonado (ciclo)alifático o aproximadamente 6 a aproximadamente 18 átomos de carbono en el resto alquilo de los alquilfenoles. También son adecuados aductos de poli(óxido de etileno) hidrosolubles con polipropilenglicol, etilendiaminopolipropilenglicol o alquil polipropilenglicol que tienen de 1 a aproximadamente 10 átomos de carbono en la cadena alquílica y de aproximadamente 20 a aproximadamente 250 grupos de etilenglicol éter y de aproximadamente 10 a aproximadamente 100 grupos de propilenglicol éter. Normalmente, los compuestos

mencionados anteriormente contienen de 1 a aproximadamente 5 unidades de etilenglicol por unidad de propilenglicol. Ejemplos que se pueden mencionar son nonilfenoxipolietoxietanol, aceite de ricino, poliglicoléter, aductos de polipropilenglicol/poli(óxido de etileno), tributilfenoxipolietoxietanol, polietilenglicol u octilfenoxipolietoxietanol. También son adecuados ésteres de ácidos grasos de polioxietilensorbitán, tales como trioleato de polioxietilensorbitán.

Los tensioactivos catiónicos son, especialmente, sales de amonio cuaternario que generalmente tienen al menos un radical alquilo de aproximadamente 8 a aproximadamente 22 átomos de C como sustituyentes y como sustituyentes adicionales (no halogenados o halogenados) radicales alquilo o hidroxialquilo inferior o bencilo. Las sales están preferiblemente en forma de haluros, metilsulfatos o etilsulfatos. Ejemplos son cloruro de esteariltrimetilamonio y bromuro de bencilbis(2-cloroetil)etilamonio.

Ejemplos de tensioactivos aniónicos adecuados son jabones hidrosolubles o compuestos tensioactivos sintéticos hidrosolubles. Ejemplos de jabones adecuados son las sales de metales alcalinos, alcalinotérreos o de amonio (no sustituido o sustituido) de ácidos grasos que tienen aproximadamente 10 a aproximadamente 22 átomos de C, tales como las sales de sodio o potasio de ácido oleico o esteárico, o de mezclas de ácidos grasos naturales que se pueden obtener, por ejemplo, de coco o tall oil; también deben mencionarse los metil tauratos de ácidos grasos. Sin embargo, los tensioactivos sintéticos se utilizan con más frecuencia, en particular sulfonatos grasos, sulfatos grasos, derivados de bencimidazol sulfonados o alquilarilsulfonatos. Como regla general, los sulfonatos grasos y los sulfatos grasos están presentes como sales de metales alcalinos, alcalinotérreos o de amonio (sustituido o no sustituido) y generalmente tienen un radical alquilo de aproximadamente 8 a aproximadamente 22 átomos de C, también se entiende que alquilo incluye el resto alquilo de radicales acilo; ejemplos que pueden mencionarse son las sales de sodio o calcio del ácido lignosulfónico, del éster dodecilsulfúrico o de una mezcla de sulfato de alcohol graso preparada a partir de ácidos grasos naturales. Este grupo también incluye las sales de los ésteres sulfúricos y ácidos sulfónicos de aductos de alcohol graso/óxido de etileno. Los derivados de bencimidazol sulfonados contienen preferiblemente 2 grupos sulfonilo y un radical de ácido graso de aproximadamente 8 a aproximadamente 22 átomos de C. Ejemplos de alquilarilsulfonatos son las sales de sodio, calcio o trietanolamonio del ácido decilbencenosulfónico, del ácido dibutilnaftalenosulfónico o de un condensado de ácido naftalenosulfónico/formaldehído. También son posibles, además, fosfatos adecuados, tales como sales del éster fosfórico de un aducto de p-nonilfenol/(4-14) óxido de etileno, o fosfolípidos.

Como regla, las composiciones comprenden 0,1 a 99%, especialmente 0,1 a 95% de ingrediente activo y 1 a 99,9%, especialmente 5 a 99,9%, de al menos un adyuvante sólido o líquido, siendo posible como regla para 0 a 25%, especialmente 0,1 a 20%, de la composición para ser tensioactivos (% en cada caso significa porcentaje en peso). Mientras que las composiciones concentradas tienden a preferirse para productos comerciales, el consumidor final, por regla general, utiliza composiciones diluidas que tienen concentraciones sustancialmente más bajas de ingrediente activo.

Típicamente, una formulación de premezcla para aplicación foliar comprende 0,1 a 99,9%, especialmente 1 a 95%, de los ingredientes deseados, y 99,9 a 0,1%, especialmente 99 a 5%, de un adyuvante sólido o líquido (que incluye, por ejemplo, un disolvente tal como agua), en que los auxiliares pueden ser un tensioactivo en una cantidad de 0 a 50%, especialmente de 0,5 a 40%, basado en la formulación de premezcla.

Normalmente, una formulación de mezcla en tanque para la aplicación para el tratamiento de semillas comprende 0,25 a 80%, especialmente 1 a 75%, de los ingredientes deseados, y 99,75 a 20%, especialmente 99 a 25%, de auxiliares sólidos o líquidos (incluyendo, por ejemplo, un disolvente tal como agua), en que los auxiliares pueden ser un tensioactivo en una cantidad de 0 a 40%, especialmente de 0,5 a 30%, en base a la formulación de mezcla en tanque.

Típicamente, una formulación de mezcla en tanque para aplicación para el tratamiento de semillas comprende 0,5 a 99,9%, especialmente 1 a 95%, de los ingredientes deseados, y 99,5 a 0,1%, especialmente 99 a 5%, de un adyuvante sólido o líquido (que incluye, por ejemplo, un disolvente tal como agua), en que los auxiliares pueden ser un tensioactivo en una cantidad de 0 a 50%, especialmente de 0,5 a 40%, basado en la formulación de mezcla en tanque.

Mientras que los productos comerciales se formularán preferiblemente como concentrados (p. ej., composición (formulación) de pre-mezcla), el usuario final normalmente empleará formulaciones diluidas (p. ej., composición de mezcla en tanque).

Formulaciones de premezcla de tratamiento de semillas preferidas son concentrados de suspensión acuosa. La formulación se puede aplicar a las semillas utilizando técnicas y máquinas de tratamiento convencionales, tales como técnicas de lecho fluidizado, el método del molino de rodillos, dispositivos de tratamiento de semillas rotostáticos y dispositivos de revestimiento de tambor. Otros métodos, como lechos con boquilla también pueden ser útiles. Las semillas pueden ser clasificadas antes del recubrimiento. Después del recubrimiento, las semillas generalmente se secan y luego se transfieren a una máquina de calibrado para su calibrado. Procedimientos de este tipo son conocidos en la técnica.

En general, las composiciones de pre-mezcla de la invención contienen 0,5 a 99,9, especialmente 1 a 95, ventajosamente 1 a 50%, en masa de los ingredientes deseados, y 99,5 a 0,1, especialmente 99 a 5%, en masa de

un adyuvante sólido o líquido (que incluye, por ejemplo, un disolvente tal como agua), en que los auxiliares (o adyuvante) pueden ser un tensioactivo en una cantidad de 0 a 50, especialmente 0,5 a 40%, en masa en base a la masa de la formulación de pre-mezcla.

5 Ejemplos de tipos de formulación foliar para composiciones de pre-mezcla son:

GR: Gránulos
 WP: polvos humectables
 WG: gránulos dispersables en agua (povos)
 10 SG: gránulos hidrosolubles
 SL: concentrados solubles
 EC: concentrado emulsionable
 EW: emulsiones, aceite en agua
 ME: micro-emulsión

15 SC: concentrado de suspensión acuosa
 CS: suspensión acuosa de cápsulas
 OD: concentrado en suspensión a base de aceite, y
 SE: suspo-emulsión acuosa.

Mientras que ejemplos de tipos de formulación para el tratamiento de semillas para composiciones de pre-mezcla son:

20 WS: polvos humectables para suspensión de tratamiento de semillas
 LS: solución para el tratamiento de semillas
 ES: emulsiones para el tratamiento de semillas
 FS: concentrado en suspensión para el tratamiento de semillas
 WG: gránulos dispersables en agua, y
 25 CS: suspensión acuosa de cápsulas.

Ejemplos de tipos de formulación adecuados para composiciones de mezcla en tanque son soluciones, emulsiones diluidas, suspensiones, o una mezcla de las mismas, y polvos.

30 Composiciones preferidas se componen, en particular, de la siguiente manera (% = porcentaje en peso):

Concentrados emulsionables:

ingrediente activo	1 a 95%, preferiblemente 5 a 20%
tensioactivo:	1 a 30%, preferiblemente 10 a 20 %
disolvente:	5 a 98%, preferiblemente 70 a 85%

35 **Polvos espolvoreables:**

ingrediente activo	0,1 a 10%, preferiblemente 0,1 a 1%
soporte sólido	99,9 a 90%, preferiblemente 99,9 a 99%

Concentrados en suspensión:

ingrediente activo	5 a 75%, preferiblemente 10 a 50%
agua:	94 a 24%, preferiblemente 88 a 30%
tensioactivo:	1 a 40%, preferiblemente 2 a 30%

40

Polvos humectables:

ingrediente activo	0,5 a 90%, preferiblemente 1 a 80%
tensioactivo:	0,5 a 20%, preferiblemente 1 a 15%
soporte sólido	5 a 99%, preferiblemente 15 a 98%

Granulados:

45

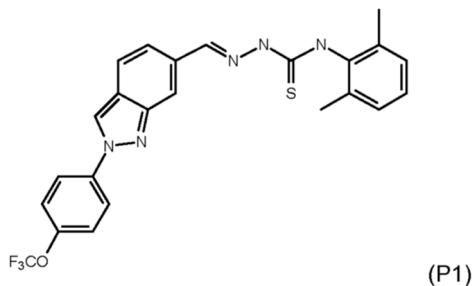
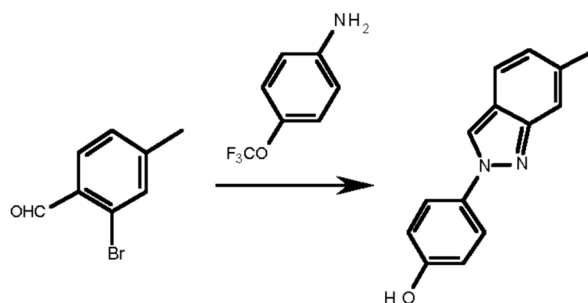
ingrediente activo	0,5 a 30%, preferiblemente 3 a 15%
soporte sólido	99,5 a 70%, preferiblemente 97 a 85%

Ejemplos de preparación:

"Pf" significa punto de fusión en °C. Las mediciones ¹H RMN se registraron en un espectrómetro Bruker a 400 MHz, los desplazamientos químicos se dan en ppm relevantes para un patrón de TMS. Espectros medidos en disolventes deuterados como se indica.

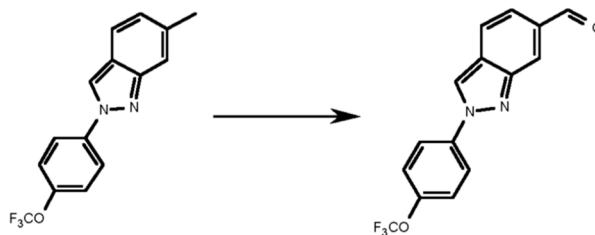
Método LC MS Patrón:

Los espectros se registraron en un espectrómetro de masas de Waters (espectrómetro de masas de cuadrupolo simple SQD o ZQ) equipado con una fuente de electropulverización (polaridad: iones positivos o negativos, Capilar: 3,00 kV, intervalo de cono: 30-60 V, extractor: 2,00 V, Temperatura Fuente: 150 °C, temperatura de desolvatación: 350 °C, flujo del gas del cono: 0 L/H, Flujo de Gas de Desolvatación: 650 L/H, intervalo de masas: 100 a 900 Da) y un UPLC Acquity de Waters: Bomba binaria, compartimento de columna caldeado y detector de matriz de diodos. Desgasificador de disolventes, bomba binaria, compartimento de columna caldeado y detector de matriz de diodos. Columna: Waters UPLC HSS T3, 1,8 μm, 30 x 2,1 mm, temp: 60 °C, intervalo de longitudes de onda DAD (nm): 210 a 500, Gradiente de Disolvente: A = agua + 5% de MeOH + 0,05% de HCOOH, B = Acetonitrilo + 0,05% HCOOH: gradiente: gradiente: 0 min 0 % de B, 100 % de A; 1,2-1,5 min 100 % de B; Caudal (ml/min) 0,85.

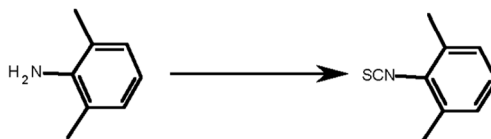
EJEMPLO P1: Preparación de N-(2,6-dimetilfenil)-2-((2-(4-(trifluorometoxi)fenil)-2H-indazol-6-il)metileno)hidrazinacarbotoamida (compuesto P1)**Etapa A-1: Preparación de 6-metil-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol**

Una solución de 2-bromo-4-metil-benzaldehído (30,0 g, 0,15 mol) y 4-(trifluorometoxi)anilina (32,0 g, 0,180 mol) en dimetilformamida (300 mL) se cargó con azida de sodio (18,9 g, 0,30 mol) seguido de tetrametiletilendiamina (1,74 g, 0,015 mol) a temperatura ambiente, seguido de agitación durante 10 minutos. Se añadió yoduro de cobre (2,85 g, 0,015 mol) a la mezcla de reacción y se calentó a 120°C durante 16 horas. La mezcla de reacción se enfrió a 0 °C, se diluyó con agua (300 mL) y se extrajo en acetato de etilo (2 x 500 mL). Las capas orgánicas combinadas se lavaron con salmuera (100 mL), se secaron sobre sulfato de sodio anhidro y se concentraron a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en columna para proporcionar 6-metil-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol (5,00 g) en forma de un sólido pardo claro. MS *m/z*: 293 [M + H]⁺.

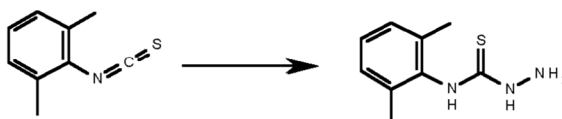
¹H RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 8,31 (s, 1H), 7,92 (dd, 2H), 7,59 (d, 1H), 7,51 (s, 1H), 7,37 (d, 2H), 6,96 (dd, 1H), 2,46(s, 3H).

EtapA A-2: Preparación de 2-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-6-carbaldehído

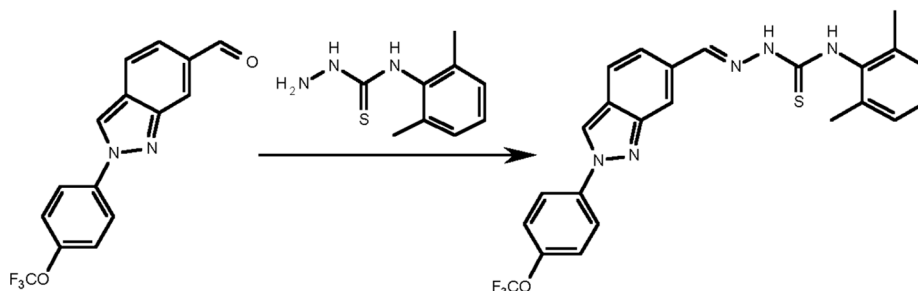
- 5 Una solución de 6-metil-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol (5,0 g, 0,017 mol) en 1,4-dioxano (100 mL) se cargó con óxido de selenio (5,65 g, 0,514 mol) a temperatura ambiente y se calentó a 110°C durante 72 horas. La mezcla de reacción se enfrió a 0 °C, se diluyó con agua (100 mL) y se extrajo con acetato de etilo (2 x 300 mL). Los componentes orgánicos combinados se lavaron con salmuera (50 mL), se secaron sobre sulfato de sodio anhidro y se concentraron a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en columna para proporcionar 2-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-6-carbaldehído (3,00 g) en forma de un sólido amarillo pálido .
- 10 MS m/z : 307 [M + H]⁺.
¹H RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 10,10 (s, 1H), 8,46 (d, 1H), 8,30 (d, 1H), 7,95-7,99 (m, 2H), 7,80 (d, 1H), 7,66 (dd, 1H), 7,42 (d, 2H).

15 Etapa A-3: Preparación de 2-isotiocianato-1,3-dimetil-benceno

- 20 Una solución de 2,6-dimetilanilina (5,00 g, 0,04 mol) en acetonitrilo (100 mL) se cargó con 1,1'-tiocarbonildiimidazol (14,7 g, 0,08 mol) gota a gota a 0 °C a lo largo de 10 min y se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas. La mezcla de reacción se enfrió a 0 °C, se enfrió bruscamente con agua (200 mL) y se extrajo con acetato de etilo (2 x 100 mL). Las capas orgánicas combinadas se lavaron con agua (100 mL) y salmuera (50 mL), se secaron sobre sulfato de sodio anhidro y se concentraron a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía de resolución instantánea en columna para proporcionar 2-isotiocianato-1,3-dimetil-benceno (4,50 g) en forma de un líquido incoloro.
- 25 ¹H RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 7,09-7,01 (m, 3H), 2,37 (s, 6H).

EtapA A-4: Preparación de 1-amino-3-(2,6-dimetilfenil)tiourea

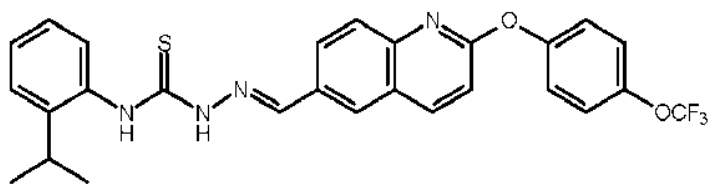
- 30 Una solución de 2-isotiocianato-1,3-dimetil-benceno (2,00 g, 0,01 mol) en etanol (40 mL) se cargó con hidrato de hidrazina (5,80 mL, 0,12 mol) gota a gota a 0 °C a lo largo de 10 min y se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y se trató con MTBE (50 mL) y se secó en vacío para proporcionar 1-amino-3-(2,6-dimetilfenil)tiourea (2,20 g) en forma de un sólido blanquecino.
- 35 MS m/z : 196 [M + H]⁺.
¹H RMN (300 MHz, CDCl₃): δ 9,09 (s a, 1H), 8,90 (s a, 1H), 7,05-7,04 (m, 3H), 4,69 (s a, 2H), 2,14 (s, 6H).

Etapa A-5: Preparación de 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[[2-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-6-il]metileno-amino]tiourea

- 5 Una solución de 2-[4-(trifluorometoxi)fenil] indazol-6-carbaldehído (1,00 g, 3,26 mmol), y 1-amino-3-(2,6-dimetilfenil)tiourea (0,64 g, 3,26 mmol) en etanol (25 mL) se cargó con ácido acético (40 mg, 0,65 mmol) a temperatura ambiente y se calentó a 90°C durante 16 horas. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente y los sólidos se filtraron, se lavaron con etanol (10 mL) y se secaron en vacío para proporcionar 1-(2,6-dimetilfenil)-3 [(E)-[2-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-6-il]metilenoamino]tiourea (0,71 g) en forma de un sólido amarillo pálido.
- 10 MS m/z : 484 $[M + H]^+$.

EJEMPLO P2: Preparación de N-(2-isopropilfenil)-2-((2-[4-(trifluorometoxi)fenoxi]quinolin-6-il)metileno)hidrazinacarbotoamida (compuesto P2)

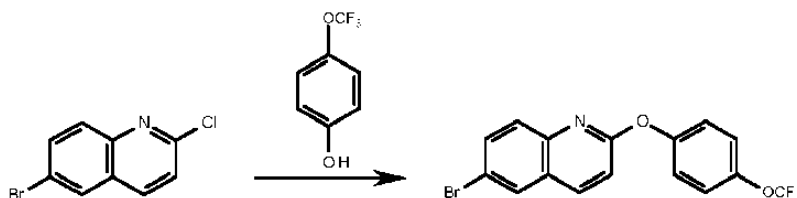
15



(P2)

Etapa B-1: Preparación de 6-bromo-2-[4-(trifluorometoxi)fenoxi]quinolina

20



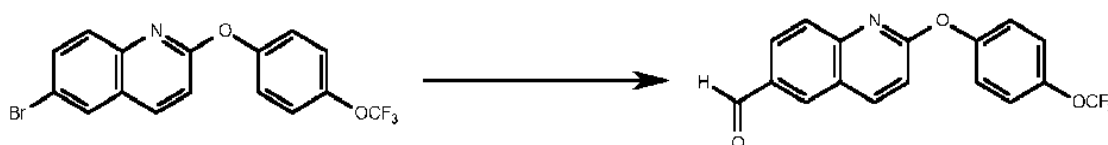
25

Una suspensión de hidruro de sodio (0,25 g, 6,16 mmol) en dimetilformamida (5 mL) se cargó con una solución de 4-(trifluorometoxi)fenol (1,00 g, 5,60 mmol) en dimetilformamida (5 mL) a 0°C y se agitó a la misma temperatura durante 30 minutos. Se añadió una solución de 6-bromo-2-cloro-quinolina (1,36 g, 5,60 mmol) en dimetilformamida (5 mL) a la mezcla de reacción gota a gota durante 15 minutos a 0 °C. La mezcla de reacción se calentó a 90°C durante 16 horas. La mezcla de reacción se enfrió a 0 °C, se diluyó con agua (20 mL) y se extrajo en acetato de etilo (2 x 50 mL). Los componentes orgánicos combinados se lavaron con salmuera (20 mL), se secaron sobre sulfato de sodio anhidro y se concentraron a presión reducida. El residuo se trituró con etanol (20 mL) y se filtró, se secó en vacío para proporcionar 6-bromo-2-[4-(trifluorometoxi)fenoxi]quinolina (1,10 g) en forma de un sólido pardo.

30

MS m/z : 384 $[M + H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CDCl_3): δ 8,05 (d, 1H), 7,92 (d, 1H), 7,62-7,70 (m, 2H), 7,27(d, 1H), 7,13 (d, 1H).**Etapa B-2: Preparación de 2-[4-(trifluorometoxi)fenoxi]quinolina-6-carbaldehído**

35

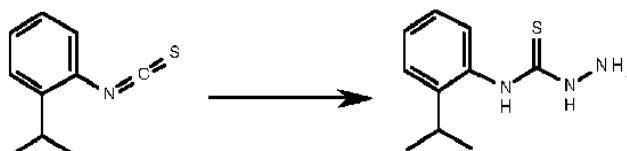


Una solución de 6-bromo-2-[4-(trifluorometoxi)fenoxi]quinolina (0,80 g, 2,08 mmol) en tetrahidrofurano (20 mL) se cargó con n-butil-litio (1,0 mL, 2,5 M en hexanos) gota a gota a lo largo de 5 minutos a -78°C y se agitó a la misma temperatura durante 1 hora. Se añadió dimetilformamida (25 mg, 4,16 mmol) en tetrahidrofurano (1,0 mL) gota a gota

a lo largo de 2 minutos a $-78\text{ }^{\circ}\text{C}$. La mezcla de reacción se agitó a la misma temperatura durante otras 2 horas. La mezcla de reacción se diluyó con HCl 2 N (10 mL) y se extrajo con acetato de etilo (2 x 50 mL). Los componentes orgánicos combinados se lavaron con salmuera (20 mL), se secaron sobre sulfato de sodio anhidro y se concentraron a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en columna para proporcionar 2-[4-(trifluorometoxi)fenoxi]quinolin-6-carbaldehído (0,20 g) en forma de un sólido blanquecino.
MS m/z : 334 $[\text{M} + \text{H}]^+$.

^1H RMN (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$): δ 10,1 (s, 1H), 8,67 (d, 1H), 8,62 (d, 1H), 8,07 (dd, 1H), 7,77(d, 1H), 7,44-7,51 (m, 5H).

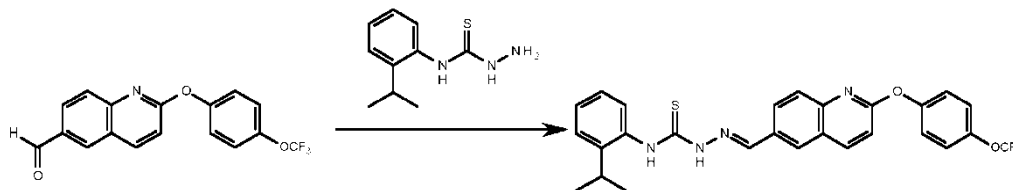
10 Etapa B-3: Preparación de 1-amino-3-(2-isopropilfenil)tiourea



15 Una solución de 1-isopropil-2-isotiocianato-benceno (1,00 g, 5,64 mmol) en etanol (10 mL) se cargó con monohidrocloreto de hidrazina (1 mL) a temperatura ambiente y se agitó durante 16 horas. Los sólidos resultantes se filtraron, se lavaron con etanol (5 mL) y se secaron en vacío para proporcionar 1-amino-3-(2-isopropilfenil)tiourea (0,60 g) en forma de un sólido blanquecino.

20 ^1H RMN (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$): δ 9,01 (s a, 1H), 7,35 (s, 1H), 7,29 (dd, 1H), 7,12-7,27 (m, H), 4,30-5,30 (s a, 2H), 3,08 (m, 1H), 1,16 (d, 6H).

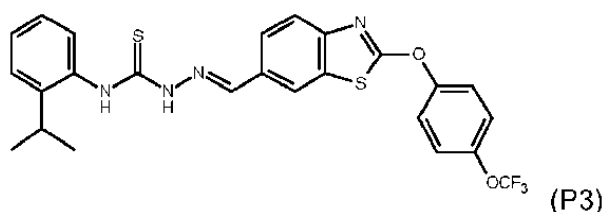
25 Etapa B-4: Preparación de 1-(2-isopropilfenil)-3-[[2-[4-(trifluorometoxi)fenoxi]-6-quinolil]-metileno-amino]tiourea

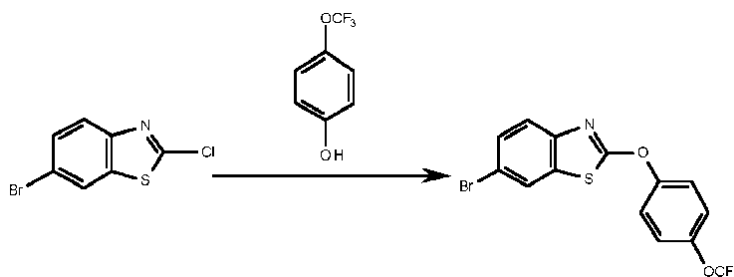


30 Una solución de 2-[4-(trifluorometoxi)fenoxi]quinolina-6-carbaldehído (0,20 g, 0,60 mmol) y 1-amino-3-(2-isopropilfenil)tiourea (0,126 g, 0,60 mmol) en etanol (10 mL) se cargó con ácido acético (7,0 mg, 0,12 mmol) a temperatura ambiente y se calentó a $90\text{ }^{\circ}\text{C}$ durante 16 horas. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente y los sólidos se filtraron, se lavaron con etanol (5 mL) y se secaron en vacío para proporcionar 1-(2-isopropilfenil)-3-[[E]-2-[4-(trifluorometoxi)fenoxi]-6-quinolil]metilenoamino]tiourea (0,20 g) en forma de un sólido amarillo pálido.
MS m/z : 525 $[\text{M} + \text{H}]^+$.

35 ^1H RMN (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$): δ 11,8 (s, 1H), 10,10 (s, 1H), 8,44-8,51 (m, 2H), 8,29 (s, 1H), 8,21 (d, 1H), 7,62 (d, 1H), 7,40-7,50 (m, 4H), 7,17-7,37 (m, 5H).

40 EJEMPLO P3: Preparación de 1-(2-isopropilfenil)-3-[[2-[4-(trifluorometoxi)fenoxi]-1,3-benzotiazol-6-il]metilenoamino]tiourea (compuesto P3)

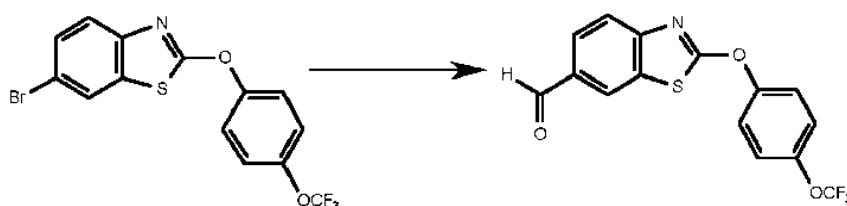


Etapa C-1: Preparación de 6-bromo-2-[4-(trifluorometoxi)fenoxi]-1,3-benzotiazol

- 5 Una suspensión de hidruro de sodio (0,25 g, 6,16 mmol) en dimetilformamida (5 mL) se cargó con una solución de 4-(trifluorometoxi)fenol (1,0 g, 5,60 mmol) en dimetilformamida (5 mL) a 0°C y se agitó durante 30 minutos. Se añadió 6-bromo-2-cloro-1,3-benzotiazol (1,40 g, 5,60 mmol) en dimetilformamida (5 mL) a la mezcla de reacción gota a gota a lo largo de 15 minutos a 0 °C. La mezcla de reacción se calentó a 90°C durante 16 horas. La mezcla de reacción se enfrió a 0 °C, se diluyó con agua (20 mL) y se extrajo con acetato de etilo (2 x 50 mL). Los componentes orgánicos combinados se lavaron con salmuera (20 mL), se secaron sobre sulfato de sodio anhidro y se concentraron a presión reducida. El residuo se trituró con etanol (20 mL) y se filtró, se secó en vacío para proporcionar 6-bromo-2-[4-(trifluorometoxi)fenoxi]-1,3-benzotiazol (1,00 g) en forma de un sólido blanquecino.

MS m/z : 392,0 [M + H]⁺.

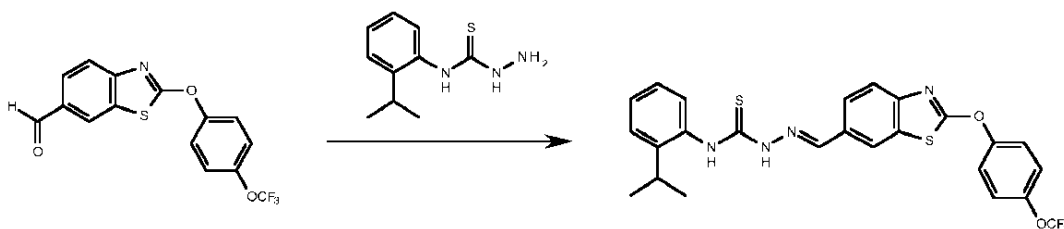
- 15 ¹H RMN (300 MHz, DMSO-*d*₆): δ 8,26 (d, 1H), 7,53-7,67 (m, 6H).

Etapa C-2: Preparación de 2-[4-(trifluorometoxi)fenoxi]-1,3-benzotiazol-6-carbaldehído

- 20 Una solución de 6-bromo-2-[4-(trifluorometoxi)fenoxi]-1,3-benzotiazol (1,00 g, 2,56 mmol) en tetrahidrofurano (20 mL) se cargó con *n*-butil-litio (1,1 mL, 2,50 M en hexanos) gota a gota a lo largo de 5 minutos a -78°C y se agitó a la misma temperatura durante 1 hora. Se añadió dimetilformamida (370 mg, 5,12 mmol) en tetrahidrofurano (1,0 mL) gota a gota a lo largo de 2 minutos a -78 °C. La mezcla de reacción se agitó a la misma temperatura durante otras 2 horas. La mezcla de reacción se diluyó con HCl (2 N 10 mL) y se extrajo con acetato de etilo (2 x 50 mL). Los componentes orgánicos combinados se lavaron con salmuera (20 mL), se secaron sobre sulfato de sodio anhidro y se concentraron a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en columna para proporcionar 2-[4-(trifluorometoxi)fenoxi]-1,3-benzotiazol-6-carbaldehído (0,10 g) en forma de un sólido blanquecino.

30 MS m/z : 340 [M + H]⁺.

¹H RMN (300 MHz, DMSO-*d*₆): δ 10,03 (s, 1H), 8,59 (d, 1H), 7,96 (dd, 1H), 7,88 (d, 1H), 7,59-7,69 (m, 2H), 7,57 (d, 2H).

Etapa C-3: Preparación de 1-(2-isopropilfenil)-3-[[2-[4-(trifluorometoxi)fenoxi]-1,3-benzotiazol-6-il]metileno]tiourea

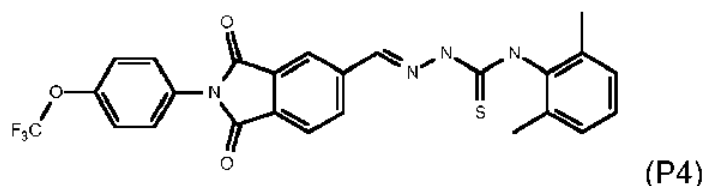
- 40 Una solución de 2-[4-(trifluorometoxi)fenoxi]-1,3-benzotiazol-6-carbaldehído (0,10 g, 0,295 mmol) y 1-amino-3-(2-isopropilfenil)tiourea (62 mg, 0,295 mmol, descrita en la etapa B-3) en etanol (5 mL) se cargó con ácido acético (3,50 mg, 0,06 mmol) a temperatura ambiente y se calentó a 90°C durante 16 horas. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente y los sólidos se filtraron, se lavaron con etanol (2 mL) y se secaron en vacío para proporcionar

1-(2-isopropilfenil)-3-[(E)-[2-[4-(trifluorometoxi)fenoxi]-1,3-benzoxazol-6-il]metilnamino]tiourea (40 mg) en forma de un sólido amarillo pálido.

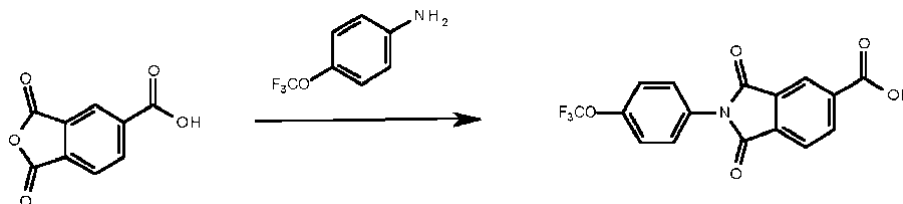
MS m/z : 531 [M + H]⁺.

¹H RMN (300 MHz, DMSO-*d*₆): δ 11,81 (s, 1H), 10,00 (s, 1H), 8,48 (s, 1H), 8,19 (s, 1H), 8,04 (dd, 1H), 7,72 (d, 1H), 7,66-7,62 (m, 2H), 7,54 (d, 2H), 7,17-7,37 (m, 4H).

EJEMPLO P4: Preparación de 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[1,3-dioxo-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]isoindolin-5-il]metilnamino]tiourea (compuesto P4)



Etapas D-1: Preparación de ácido 1,3-dioxo-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]isoindolina-5-carboxílico

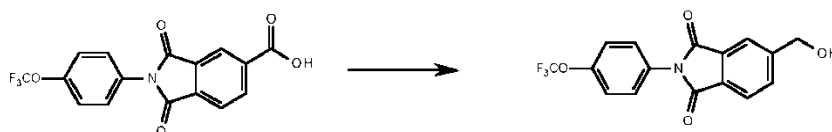


Bajo argón, una mezcla de ácido 1,3-dioxoisobenzofuran-5-carboxílico (200 mg, 1,04 mmol) y 4-(trifluorometoxi)anilina (0,184 mg, 1,04 mmol) en ácido acético (5 ml) se calentó a reflujo durante 2 horas. La reacción se interrumpió con agua helada y el precipitado se filtró y se lavó con agua y *tert*-butilmetiléter para dar ácido 1,3-dioxo-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]isoindolina-5-carboxílico (206 mg) en forma de cristales beige.

LC-MS: t_R = 1,51 min, m/z = 350 [M-1].

¹H RMN (400 MHz, DMSO) δ ppm 7,55 - 7,65 (m, 4 H) 8,11 (d, J=7,70 Hz, 1 H) 8,32 - 8,33 (m, 1 H) 8,43 (dd, J=7,70, 1,47 Hz, 1 H) 13,76 (s a., 1 H).

Etapas D-2: Preparación de 5-(hidroximetil)-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]isoindolina-1,3-diona

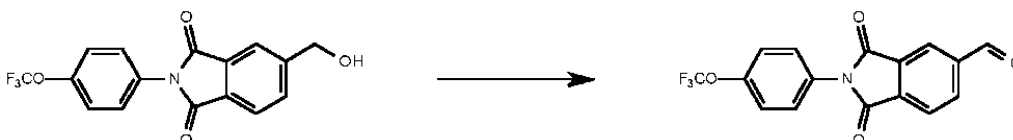


Bajo argón, una mezcla de ácido 1,3-dioxo-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]isoindolina-5-carboxílico (190 mg, 0,541 mmol) en tetrahidrofurano (3 ml) se enfrió a 0°C y luego se añadió una solución de borano en tetrahidrofurano (0,65 ml, 1 M). La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante la noche. Tras la compleción, la mezcla de reacción se diluyó con una solución de ácido clorhídrico, se extrajo con acetato de etilo y se lavó con salmuera. Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio y se evaporaron en vacío para dar 5-(hidroximetil)-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]isoindolina-1,3-diona (163 mg) en forma de un sólido beige.

LC-MS: t_R = 1,43 min, m/z = 338 [M+1].

¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 4,79 - 4,97 (m, 2 H) 7,34 - 7,38 (m, 2 H) 7,50 - 7,53 (m, 2 H) 7,78 - 7,82 (m, 1 H) 7,92 - 7,99 (m, 2 H).

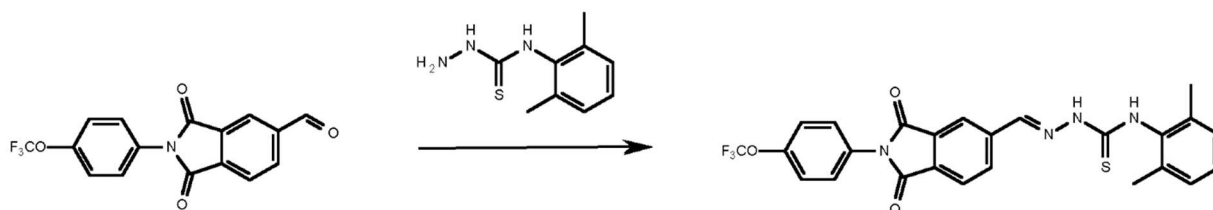
Etapas D-3: Preparación de 1,3-dioxo-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]isoindolina-5-carbaldehído



A una solución de 5-(hidroximetil)-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]isoindolina-1,3-diona (0,3 g, 0,89 mmol) en diclorometano (10 ml) se añadió dióxido de manganeso (0,85 g, 9,80 mmol) y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante la noche. Luego se filtró a través de una almohadilla de celite y se lavó con diclorometano y el filtrado combinado y el lavado se concentraron a presión reducida. El producto bruto se purificó por cromatografía de resolución instantánea para dar 1,3-dioxo-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]iso-indolina-5-carbaldehído (246 mg) en forma de cristales beige.

^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 7,38 (dd, $J=9,17$, 0,73 Hz, 2 H) 7,51 - 7,56 (m, 2 H) 8,15 (d, $J=7,70$ Hz, 1 H) 8,33 - 8,37 (m, 1 H) 8,46 (d, $J=0,73$ Hz, 1 H) 10,21 (s, 1 H).

Etapas D-4: Preparación de 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[1,3-dioxo-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]isoindolin-5-il]metilnamino]tiourea

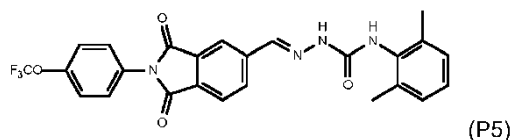


A una suspensión de 1,3-dioxo-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]isoindolina-5-carbaldehído (85 mg, 0,253 mmol) en metanol (10 ml) se añadió a temperatura ambiente 1-amino-3-(2,6-dimetilfenil)tiourea (849 mg, 0,253 mmol). Esta mezcla se calentó a reflujo durante 3 h. Después de la conversión completa, la solución se concentró en vacío, y el producto bruto se purificó por cromatografía de resolución instantánea para dar 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[1,3-dioxo-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]isoindolin-5-il]metilnamino]tiourea (77 mg) en forma de un sólido amarillo.

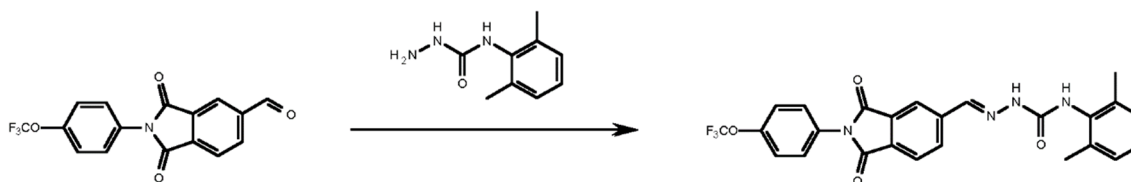
LC-MS: $t_R = 2,02$ min, $m/z = 511$ [M-1], 513 [M+1].

^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 2,34 (s, 6 H) 7,18 (s, 1 H) 7,18 - 7,18 (m, 1 H) 7,37 (d, $J=8,07$ Hz, 2 H) 7,51 - 7,54 (m, 2 H) 8,01 - 8,04 (m, 3H) 8,31 (s, 1 H) 8,69 (s, 1 H) 10,01 (s, 1 H).

EJEMPLO P5: Preparación de 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[1,3-dioxo-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]isoindolin-5-il]metilnamino]urea (compuesto P5)



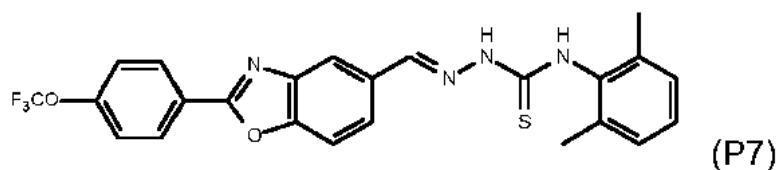
Etapas E-1: Preparación de 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[1,3-dioxo-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]isoindolin-5-il]metilnamino]urea



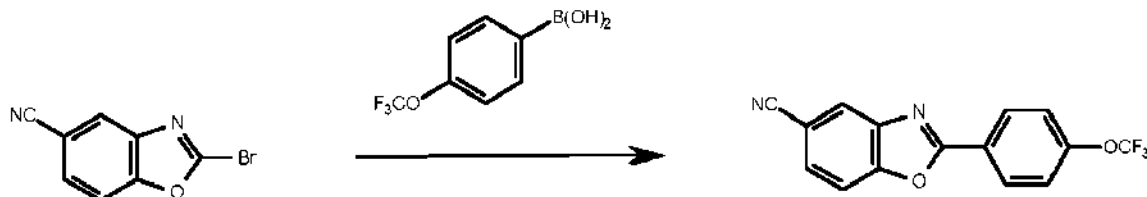
A una suspensión de 1,3-dioxo-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]isoindolina-5-carbaldehído (200 mg, 0,596 mmol, ejemplo P4, etapa D-3) en metanol (10 ml) se añadió a temperatura ambiente 1-amino-3-(2,6-dimetilfenil)urea (106 mg, 0,596 mmol). Esta mezcla se calentó a reflujo durante 3 h. Después de la conversión completa, la solución se concentró en vacío, y el producto bruto se purificó por cromatografía de resolución instantánea para dar 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[1,3-dioxo-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]isoindolin-5-il]metilnamino]urea (244 mg) en forma de un sólido blanco.

LC-MS: $t_R = 1,92$ min, $m/z = 495$ [M-1], 497 [M+1].

^1H RMN (400 MHz, DMSO-d_6) δ ppm 2,22 (s, 6 H) 7,54 - 7,66 (m, 4 H) 7,97 (d, $J=7,70$ Hz, 1 H) 8,09 (s, 1 H) 8,21 (dd, $J=8,07$, 1,10 Hz, 1 H) 8,65 (s, 1 H) 8,89 (s, 1 H) 10,91 (s, 1 H).

EJEMPLO P7: Preparación de 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[2-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1,3-benzoxazol-5-il]metileno]tiourea (compuesto P7)

5

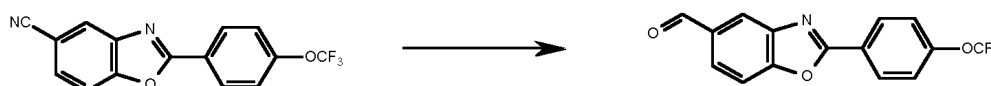
Etapas F-1: Preparación de 2-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1,3-benzotiazol-5-carbonitrilo

10 Un matraz de fondo redondo de tres bocas se cargó con ácido 2-bromo-1,3-benzotiazol-5-carbonitrilo (0,700 g, 2,82 mmol), fosfato tripotásico (1,85 g, 8,47 mmol) y ácido [4-(trifluorometoxi)fenil]borónico (0,712 g, 3,39 mmol), 1,4-dioxano (28,2 mL) y agua (11,3 mL). La mezcla de reacción se purgó con argón durante 30 min. Posteriormente, se añadió PdCl₂(dppf) (0,109 g, 0,141 mmol) y la mezcla de reacción se purgó nuevamente con argón. La mezcla de reacción naranja se agitó a 90°C durante 1 hora, luego se enfrió a 0-10°C y se diluyó con agua (20 mL), se filtró sobre celite y se lavó con acetato de etilo. Las aguas madres se diluyeron en acetato de etilo (300 mL). La capa orgánica se extrajo con agua (2x150 mL), salmuera (150 mL), se secó con sulfato de magnesio anhidro, se filtró y se evaporó. El producto bruto se purificó por cromatografía de resolución instantánea para dar 2-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1,3-benzotiazol-5-carbonitrilo (453 mg) en forma de un sólido blanco.

20 LC-MS: t_R = 1,12 min, m/z = 305 [M+1].
¹H RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 7,67 (d, J=8,44 Hz, 2 H) 7,95 (dd, J=8,44, 1,47 Hz, 1 H) 8,07 (d, J=8,44 Hz, 1 H) 8,37 (d, J=8,80 Hz, 2 H) 8,47 (s, 1H).

Etapas F-2: Preparación de 2-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1,3-benzotiazol-5-carbaldehído

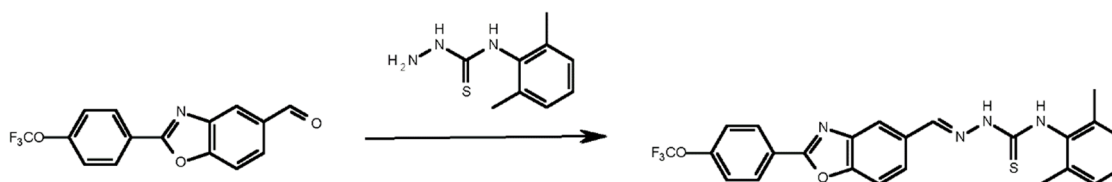
25



30 Una solución de 2-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1,3-benzotiazol-5-carbonitrilo (0,100 g, 0,322 mmol) en diclorometano (3,22 mL) se enfrió a 0°C bajo argón. Se añadió una solución de DIBAL-H en diclorometano (1 N, 0,436 g, 0,354 mmol, 0,354 mL) y la mezcla de reacción se agitó a 0°C durante 30 min. La mezcla de reacción se enfrió bruscamente mediante la adición gota a gota de agua a 0°C. Luego se diluyó en diclorometano y la capa orgánica se lavó con salmuera, se secó con sulfato de magnesio anhidro, se filtró y se evaporó para dar 90 mg de 2-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1,3-benzotiazol-5-carbaldehído. LC-MS: t_R = 1,16 min, m/z = 308 [M+1].

Etapas F-3: Preparación de 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[2-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1,3-benzotiazol-5-il]metileno]tiourea

35



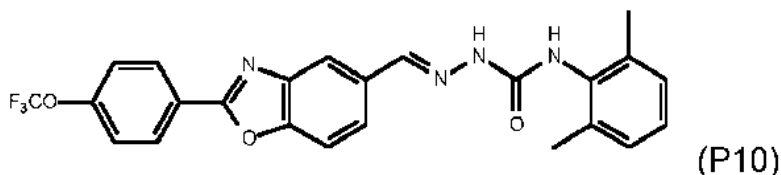
40 Un vial de 5 ml se cargó con 2-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1,3-benzotiazol-5-carbaldehído (0,090 g, 0,26 mmol) y metanol (1,3 mL). Se añadió 1-amino-3-(2,6-dimetilfenil)tiourea (0,051 g, 0,26 mmol) y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante la noche. La mezcla de reacción se filtró, se lavó con metanol y dos veces con pentano.

El producto bruto se purificó por cromatografía instantánea para dar 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[2-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1,3-benzoxazol-5-il]metilnamino]tiourea (30 mg) en forma de un sólido blanco.

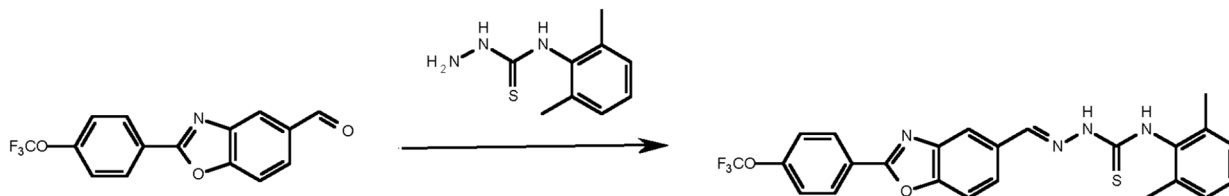
LC-MS: $t_R = 1,25$ min, $m/z = 483$ [M-1], 485 [M+1].

¹H RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 2,22 (s, 6 H) 7,12 - 7,17 (m, 3 H) 7,65 (d, J=8,80 Hz, 2 H) 7,85 (d, J=8,44 Hz, 1 H) 8,02 (d, J=8,80 Hz, 1 H) 7,99 - 8,04 (m, 1 H) 7,99 - 8,04 (m, 1 H) 8,27 (s, 1 H) 8,23 - 8,29 (m, 1 H) 8,33 (d, J=8,80 Hz, 2 H) 8,52 (s, 1 H) 10,01 (s, 1 H) 11,82 (s, 1 H).

EJEMPLO P10: Preparación de 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[2-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1,3-benzoxazol-5-il]metilnamino]urea (compuesto P10)



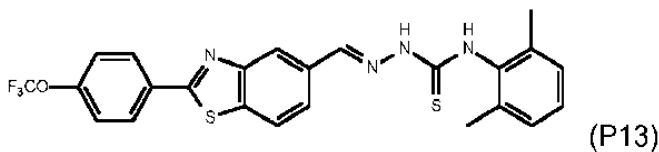
Etapa G-1: Preparación de 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[2-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1,3-benzoxazol-5-il]metilnamino]urea



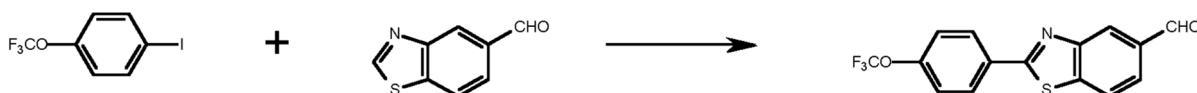
Un vial de se cargó con 2-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1,3-benzoxazol-5-carbaldehído (0,070 g, 0,21 mmol, ejemplo P7, etapa F-2) y metanol (2,1 mL). Se añadió 1-amino-3-(2,6-dimetilfenil)urea (0,035 g, 0,19 mmol) y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante la noche. La mezcla de reacción se filtró, se lavó con metanol y dos veces con pentano para dar 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[2-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1,3-benzoxazol-5-il]metilnamino]tiourea (830 mg) en forma de un sólido blanco. LC-MS: $t_R = 1,23$ min, $m/z = 467$ [M-1], 469 [M+1].

¹H RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 2,24 (s, 6 H) 7,11 (s, 3 H) 7,65 (d, J=8,07 Hz, 2 H) 7,83 (d, J=8,80 Hz, 1 H) 7,98 (d, J=8,80 Hz, 1 H) 8,06 (s, 1 H) 8,34 (d, J=8,44 Hz, 2 H) 8,40 (s, 1 H) 8,67 (s, 1 H) 10,65 (s, 1 H).

EJEMPLO P13: Preparación de 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[2-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1,3-benzoxazol-5-il]metilnamino]tiourea (compuesto P13)



Etapa H-1: Preparación de 2-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1,3-benzotiazol-5-carbaldehído



a) Un vial seco se cargó con yoduro de cobre(I) (0,120 g, 0,630 mmol) y diclorometano (7,93 g, 92,5 mmol, 5,99 mL). Se añadió XANTPHOS (0,401 g, 0,693 mmol) y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 15 min. El disolvente se separó burbujeando a través de argón. El sólido restante se utilizó directamente para la siguiente etapa.

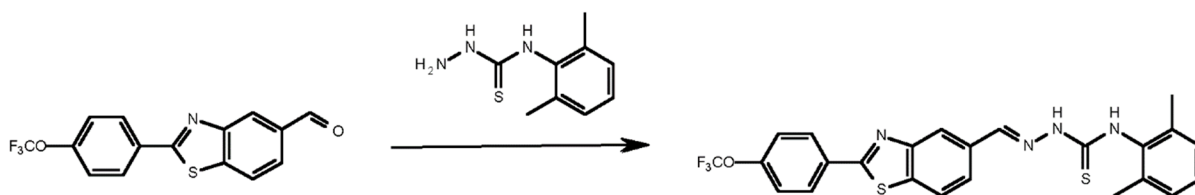
b) Se colocó un vial bajo argón y se cargó con Cu(Xantphos)I (0,0471 g, 0,0613 mmol) (etapa a) del procedimiento, dicloro-bis(triciclohexilfosfina)paladio(II) (0,119 g, 0,153 mmol), carbonato de cesio (2,50 g, 7,66 mmol) y tolueno (6,13 mL). A la mezcla resultante se añadió 1,3-benzotiazol-5-carbaldehído (0,500 g, 3,06 mmol) y 1-bromo-4-

(trifluorometoxi)benceno (1,11 g, 4,60 mmol, 0,683 mL). La mezcla de reacción se agitó a 100°C durante la noche. Después de enfriar a temperatura ambiente, se diluyó con acetato de etilo y se enfrió bruscamente con una solución saturada de cloruro de amonio/agua (1/1). La suspensión resultante se filtró sobre celite y se lavó varias veces con acetato de etilo. La capa orgánica se separó y se lavó con agua, salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtró y se evaporó. El producto bruto se purificó por cromatografía de resolución instantánea para dar 2-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1,3-benzotiazol-5-carbaldehído (352 mg) en forma de un sólido blanco.

LC-MS: $t_R = 1,82$ min, $m/z = 323$ [M+1].

1H RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 7,62 (d, J=8,07 Hz, 2 H) 8,00 (dd, J=8,25, 1,28 Hz, 1 H) 8,30 (d, J=8,80 Hz, 2 H) 8,42 (d, J=8,44 Hz, 1 H) 8,63 (d, J=1,10 Hz, 1 H) 10,18 (s, 1 H).

Etapla H-2: Preparación de 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[2-[4-(trifluorometoxifenil)-1,3-benzotiazol-5-il]metilnamino]tiourea

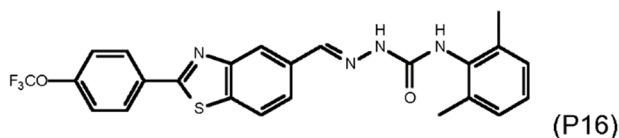


Un vial de se cargó con 2-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1,3-benzotiazol-5-carbaldehído (0,060 g, 0,18 mmol) y metanol (1,8 mL). Se añadió 1-amino-3-(2,6-dimetilfenil)tiourea (0,034 g, 0,17 mmol) y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante la noche. Para mejorar la solubilidad de la mezcla de reacción, se añadió acetonitrilo/agua (1:1, 1 ml) y la reacción se calentó adicionalmente a 65°C. Después de enfriar, la mezcla de reacción se filtró, la torta se lavó con metanol y dietiléter para dar 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[2-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1,3-benzotiazol-5-il]metilnamino]tiourea (59 mg) en forma de un sólido amarillo.

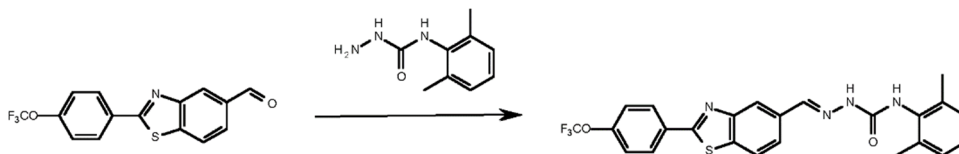
LC-MS: $t_R = 1,26$ min, $m/z = 499$ [M-1], 501 [M+1].

1H RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 2,22 (s, 6 H) 7,13 (s a., 3 H) 7,59 (d, J=8,07 Hz, 2 H) 8,04 (d, J=8,07 Hz, 1 H) 8,14 - 8,33 (m, 4 H) 8,70 (s, 1 H) 10,06 (s a., 1 H) 11,85 (s a., 1 H).

EJEMPLO P16: Preparación de 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[2-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1,3-benzotiazol-5-il]metilnamino]tiourea (compuesto P16)

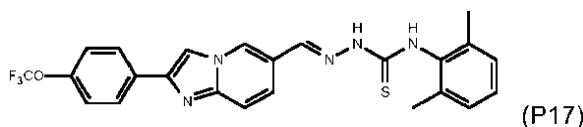


Etapla I-1: Preparación de 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[2-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1,3-benzotiazol-5-il]metilnamino]tiourea

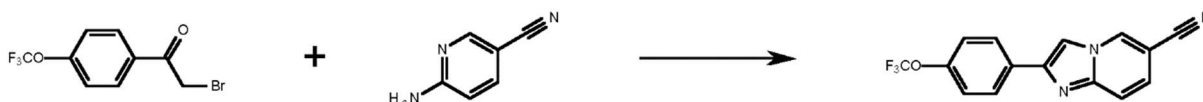


Un vial de se cargó con 2-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1,3-benzotiazol-5-carbaldehído (0,060 g, 0,18 mmol, ejemplo P13, etapa H-1) y metanol (1,8 mL). Se añadió 1-amino-3-(2,6-dimetilfenil)tiourea (0,031 g, 0,17 mmol) y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante la noche. Con el fin de completar la conversión, la mezcla de reacción se calentó adicionalmente a 65°C durante 3 horas. La mezcla de reacción se filtró, la torta se lavó con metanol para dar 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[2-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1,3-benzotiazol-5-il]metilnamino]tiourea (69 mg) en forma de un sólido amarillo. LC-MS: $t_R = 1,21$ min, $m/z = 483$ [M-1], 485 [M+1].

1H RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 2,23 (s, 6 H) 7,10 (s, 3 H) 7,59 (d, J=8,07 Hz, 2 H) 8,00 - 8,08 (m, 2 H) 8,17 - 8,25 (m, 3 H) 8,57 (s, 1 H) 8,71 (s, 1 H) 10,68 (s, 1 H).

EJEMPLO P17: Preparación de 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]imidazo[1,2-a]piridin-6-il]metilamino]tiourea (compuesto P17)

5

Etapa J-1: Preparación de 2-[4-(trifluorometoxi)fenil]imidazo[1,2-a]piridina-6-carbonitrilo

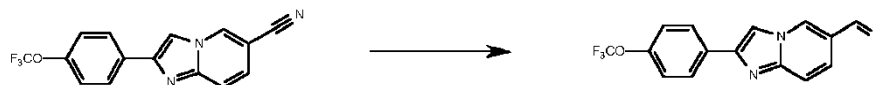
10 A una solución de 6-aminopiridina-3-carbonitrilo (5,1 g, 42,0 mmol) en 190 ml de etanol se añadió 2-bromo-1-[4-(trifluorometoxi)fenil]etanona (12,1 g, 42,0 mmol) y la mezcla se calentó a reflujo durante 24 horas. Después de la concentración a aproximadamente 100 ml, se filtró la sal precipitada, se suspendió en agua y se neutralizó con una solución acuosa de NaHCO₃. La base libre precipitada se filtró y se secó en vacío. El sólido bruto se purificó por cromatografía de resolución instantánea para dar 2-[4-(trifluorometoxi)fenil]-imidazo[1,2-a]piridina-6-carbonitrilo (7,43 g) en forma de un sólido blanco.

15

LC-MS: t_R = 1,05 min, m/z = 304 [M+1].

¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 7,29 - 7,34 (m, 3 H) 7,71 (d, J=9,17 Hz, 1 H) 7,95 (s, 1 H) 7,97 - 8,01 (m, 2 H) 8,59 (dd, J=1,65, 0,92 Hz, 1H).

20

Etapa J-2: Preparación de 2-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1,3-benzotiazol-5-carbaldehído

25

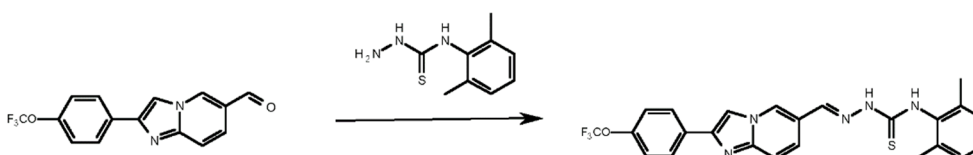
Bajo argón, se disolvió 2-[4-(trifluorometoxi)fenil]imidazo[1,2-a]piridina-6-carbonitrilo (1,0 g, 3,1 mmol) en 10 ml de tetrahidrofurano y 10 ml de diclorometano, y se enfrió a -20°C utilizando hielo seco/EtOH. A esta solución, se añadió gota a gota una solución de DIBAL-H en tolueno (1 M, 4,7 ml, 4,7 mmol) a -20°C y se agitó adicionalmente durante 30 min. La mezcla se dejó calentar a temperatura ambiente y se enfrió bruscamente cuidadosamente con 10 ml de metanol/acetato de etilo 2:1 a 0°C. La mezcla de reacción se agitó durante 30 min a 0°C y se añadieron 10 ml de agua gota a gota a 0°C. La fase orgánica se separó y el agua se extrajo con 2x100 ml de diclorometano. La capa orgánica se lavó con agua, salmuera, se secó sobre sulfato de sodio, se filtró y se evaporó. El producto bruto se purificó por cromatografía para dar (2-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1,3-benzotiazol-5-carbaldehído (354 mg) en forma de cristales naranjas.

30

LC-MS: t_R = 1,00 min, m/z = 307 [M+1].

¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 7,31 (dd, J=8,80, 1,10 Hz, 2 H) 7,68 - 7,74 (m, 2 H) 7,97 - 8,03 (m, 3 H) 8,69 (t, J=1,28 Hz, 1 H) 9,97 (s, 1H).

35

Etapa J-3: Preparación de 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]imidazo[1,2-a]piridin-6-il]metilamino]tiourea

40

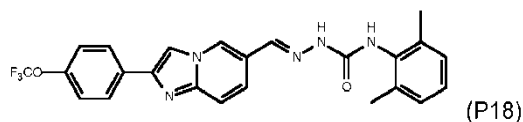
A una suspensión de 2-[4-(trifluorometoxi)fenil]imidazo[1,2-a]piridina-6-carbaldehído (200 mg, 0,653 mmol) en 5 ml de metanol se añadió a temperatura ambiente 1-amino-3-(2,6-dimetilfenil)tiourea. La mezcla se calentó a reflujo y se agitó durante 3 h. La reacción fue casi completa y se concentró en vacío.

45

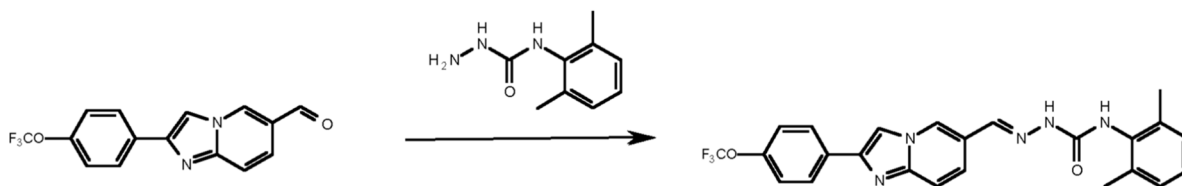
El producto bruto se purificó por cromatografía de resolución instantánea para dar 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]imidazo[1,2-a]piridin-6-il]metilamino]tiourea (84 mg) en forma de un sólido amarillo. LC-MS: t_R = 1,82 min, m/z = 483 [M-1], 484 [M+1].

¹H RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 2,21 (s, 6 H) 7,11 - 7,15 (m, 3 H) 7,46 (d, J=8,07 Hz, 2 H) 7,60 (d, J=9,54 Hz, 1 H) 8,07 - 8,11 (m, 2 H) 8,16 (s, 1 H) 8,21 (dd, J=9,54, 1,83 Hz, 1 H) 8,42 (s, 1 H) 8,90 (s, 1 H) 9,95 (s, 1 H) 11,85 (s, 1 H).

5 **EJEMPLO P18: Preparación de 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[2-[4-(trifluorometoxi)fenil]imidazo[1,2-a]piridin-6-il]metilamino]urea (compuesto P18)**



10 **Etapa K-1: Preparación de 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[2-[4-(trifluorometoxi)fenil]imidazo[1,2-a]piridin-6-il]metilamino]urea**

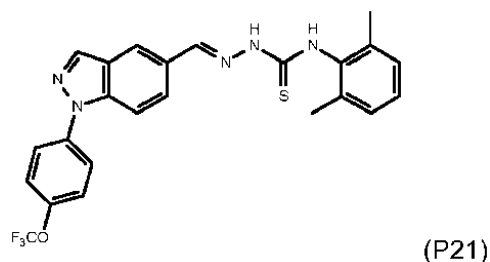


15 A una suspensión de 2-[4-(trifluorometoxi)fenil]imidazo[1,2-a]piridina-6-carbaldehído (200 mg, 0,653 mmol, ejemplo P17, etapa J-2) en 5 ml de metanol se añadió a temperatura ambiente 1-amino-3-(2,6-dimetilfenil)urea (0,117 mg, 0,653 mmol). La mezcla se calentó a reflujo durante 3 horas. La mezcla se concentró en vacío y se purificó por cromatografía de resolución instantánea para dar 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[2-[4-(trifluorometoxi)fenil]imidazo[1,2-a]piridina-6-il]metilamino]urea (84 mg) en forma de un sólido amarillo.

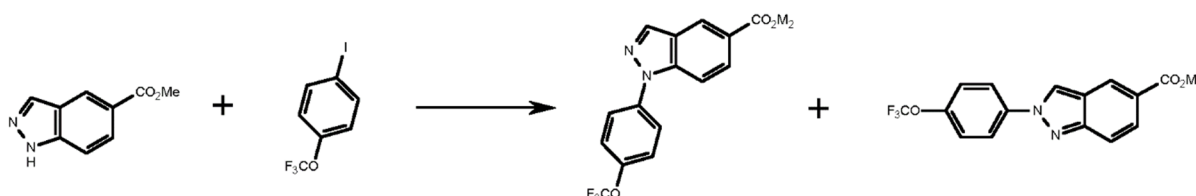
20 LC-MS: t_R = 1,82 min, m/z = 483 [M-1], 484 [M+1].

¹H RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 2,23 (s, 6 H) 7,11 (s, 3 H) 7,45 (d, J=8,07 Hz, 2 H) 7,60 (d, J=9,17 Hz, 1 H) 7,96 (s, 1 H) 8,08 - 8,16 (m, 3 H) 8,42 (s, 1 H) 8,62 (s, 1 H) 8,82 (s, 1 H) 10,69 (s, 1 H).

25 **EJEMPLO P21: Preparación de 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[1-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-5-il]metilamino]tiourea (compuesto P21)**



30 **Etapa L-1: Preparación de 1-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-5-carboxilato de metilo y 2-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-5-carboxilato de metilo**



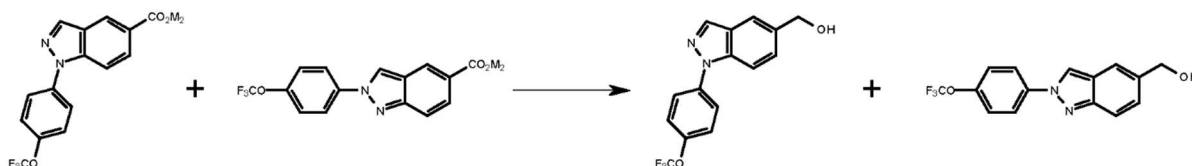
35 Un vial seco se cargó con 1H-indazol-5-carboxilato de metilo (1,00 g, 5,68 mmol), yoduro de cobre(I) (0,108 g, 0,568 mmol), carbonato de cesio (1,85 g, 5,68 mmol) y 5,7 mL de DMSO. En la mezcla de reacción se hizo el vacío y se lavó con argón nuevamente. Después de la adición de 1-yodo-4-(trifluorometoxi)benzeno (0,843 g, 2,84 mmol), la mezcla de reacción se calentó a 100°C. Después de enfriar, la mezcla de reacción se diluyó con acetato de etilo. Se filtró sobre celite y se lavó varias veces con acetato de etilo. La capa orgánica se extrajo con agua, salmuera, se secó con MgSO₄ anhidro, se filtró y se evaporó. El producto bruto se purificó por cromatografía de resolución instantánea para

dar una mezcla de 1-[4-(trifluorometoxi)-fenil]indazol-5-carboxilato de metilo y 2-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-5-carboxilato de metilo (610 mg) en forma de un sólido amarillo.

LC-MS: $t_R = 1,15$ min, $m/z = 337$ [M+1].

1H RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 3,91 (s, 3 H) 7,63 (d, J=8,44 Hz, 2 H) 7,92 - 7,99 (m, 3 H) 8,07 (dd, J=8,80, 1,47 Hz, 1 H) 8,61 (d, J=2,20 Hz, 2 H).

Etapas L-2: Preparación de [1-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-5-il]metanol y [2-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-5-il]metanol

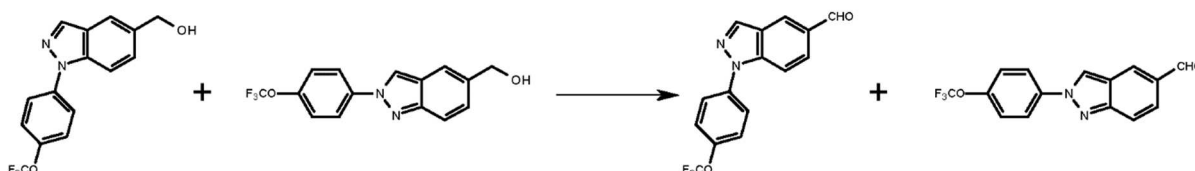


Un vial bajo argón se cargó con una mezcla de 1-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-5-carboxilato de metilo y 2-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-5-carboxilato de metilo (0,610 g, 1,72 mmol) y con dietiléter (8,62 mL). La mezcla de reacción se enfrió a -70°C y se añadió gota a gota una solución de DIBAL-H en diclorometano (1N, 1,7 mL, 1,7 mmol). Después de 1 h a esta temperatura, la mezcla de reacción se calentó a 0°C y se añadió otro 1 equivalente (1,7 mL) de DIBAL-H en diclorometano. La mezcla de reacción se agitó a 0°C durante otros 30 min. Después de enfriar bruscamente a 0°C con sal de Rochelle (10 mL), la mezcla se extrajo dos veces con diclorometano, se secó sobre MgSO₄ anhidro, se filtró y se evaporó para dar una mezcla de 1-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-5-il]metanol y [2-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-5-il]metanol (0,849 mg) en forma de un aceite amarillo.

LC-MS: $t_R = 0,97$ min, $m/z = 308$ [M+1].

1H RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 4,64 (d, J=5,50 Hz, 2 H) 7,49 (d, J=8,44 Hz, 1 H) 7,59 (d, J=8,80 Hz, 2 H) 7,81 - 7,88 (m, 2 H) 7,93 (d, J=8,80 Hz, 2H) 8,39 (s, 1 H).

Etapas L-3: Preparación de 1-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-5-carbaldehído y 2-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-5-carbaldehído



Un matraz de fondo redondo de 25 mL se colocó bajo argón y se cargó con peryodinano de Dess-Martin (0,707 g, 1,67 mmol) suspendido en diclorometano (9,00 mL). Una mezcla de [1-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-5-il]metanol y [2-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-5-il]metanol (0,476 g, 1,39 mmol) en diclorometano (4 mL) se añadió gota a gota a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se agitó a esta temperatura durante la noche. Después de la dilución con 15 mL de acetato de etilo, la mezcla se vertió en una mezcla de NaHCO₃ saturado y Na₂S₂O₃ saturado (~ 40 mL, 1:1) y se agitó durante 10 min a 0°C (pH ~ 9). Después, la solución se extrajo con acetato de etilo (100 mL), se lavó con solución saturada de NaHCO₃ (80 mL), agua (80 mL), salmuera (80 mL), se secó sobre MgSO₄ anhidro, se filtró y se evaporó. La mezcla bruta se separó por cromatografía de resolución instantánea para dar 1-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-5-carbaldehído (0,265 mg) y 2-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-5-carbaldehído (0,046 mg).

1-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-5-carbaldehído

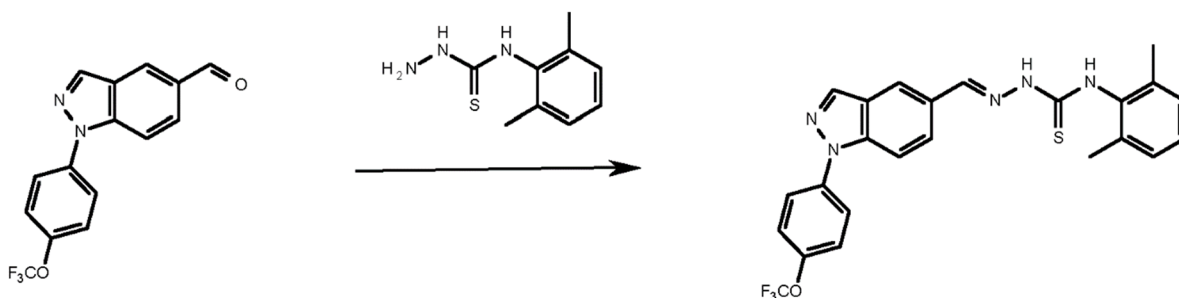
LC-MS: $t_R = 1,07$ min, $m/z = 307$ [M+1].

1H RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 7,65 (d, J=8,44 Hz, 2 H) 7,94 - 8,07 (m, 4 H) 8,54 - 8,74 (m, 2 H) 10,07 - 10,16 (m, 1 H).

2-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-5-carbaldehído

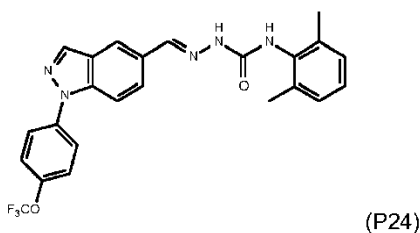
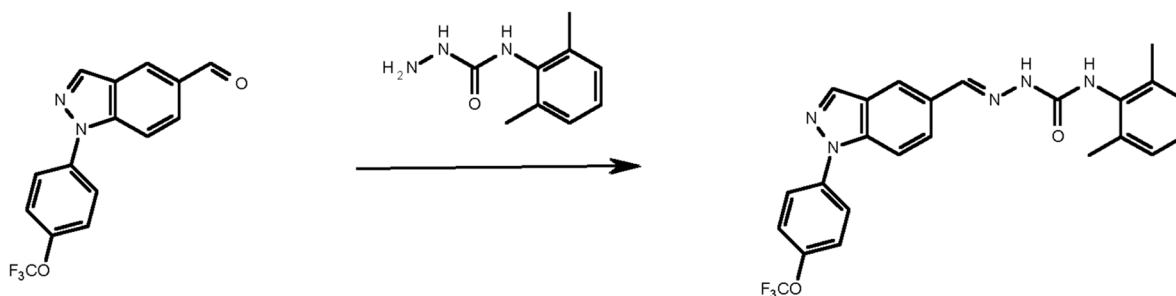
LC-MS: $t_R = 1,05$ min, $m/z = 307$ [M+1].

1H RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 7,67 (d, J=8,80 Hz, 2 H) 7,74 - 7,79 (m, 1 H) 7,84 - 7,89 (m, 1 H) 8,29 (d, J=9,17 Hz, 2 H) 8,57 (s, 1 H) 9,52 (s, 1 H) 10,05 (s, 1 H).

Etapas L-4: Preparación de 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[1-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-5-il]metilnamino]tiourea

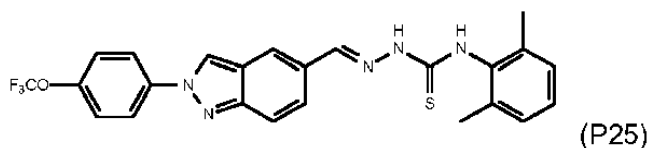
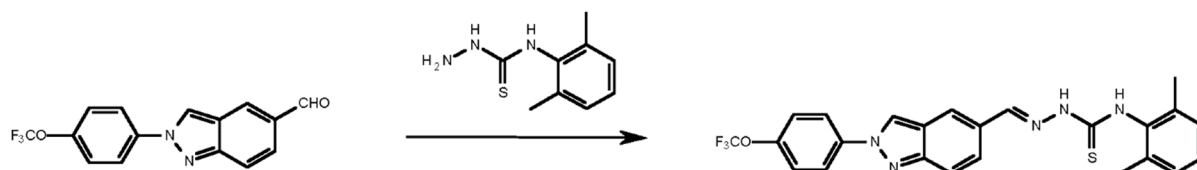
5 A una solución de 1-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-5-carbaldehído (0,050 g, 0,16 mmol) en metanol (1,6 mL) se le añadió 1-amino-3-(2,6-dimetilfenil)tiourea (0,029 g, 0,15 mmol) y la mezcla de reacción se calentó a 65°C durante la noche. La mezcla de reacción se filtró, el sólido se lavó con metanol y dietiléter para dar 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[1-[4-(trifluorometoxi)fenil] indazol-5-il]metilnamino] tiourea (49 mg) en forma de un sólido amarillo.

10 LC-MS: $t_R = 1,24$ min, $m/z = 482$ [M-1], 484 [M+1].
 1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 2,22 (s, 6 H) 7,12 - 7,16 (m, 3 H) 7,63 (d, J=8,44 Hz, 2 H) 7,87 (d, J=8,80 Hz, 1 H) 7,96 (d, J=9,17 Hz, 2 H) 8,26 - 8,32 (m, 3 H) 8,47 (s, 1 H) 9,94 (s, 1 H) 11,75 (s, 1 H).

EJEMPLO P24: Preparación de 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[1-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-5-il]metilnamino]urea (compuesto P24)**Etapas M-1: Preparación de 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[1-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-5-il]metilnamino]urea**

25 A una solución de 1-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-5-carbaldehído (0,050 g, 0,16 mmol, ejemplo P21, etapa L-3) en metanol (1,6 mL) se añadió 1-amino-3-(2,6-dimetilfenil)urea (0,026 g, 0,15 mmol) y la mezcla de reacción se agitó durante 3 h a 65°C. La mezcla se filtró, se lavó con metanol y dietiléter para dar 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[1-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-5-il]metilnamino]urea (27 mg) en forma de un sólido blanco.

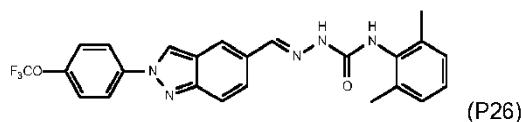
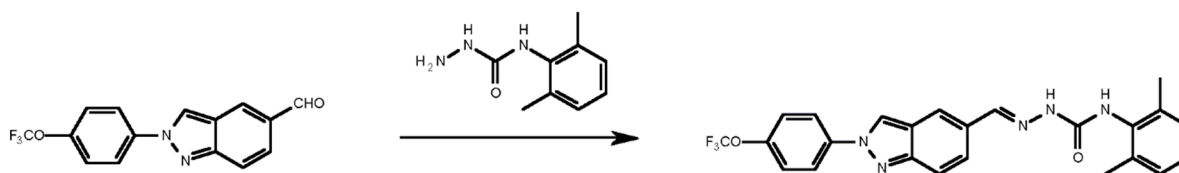
30 LC-MS: $t_R = 1,19$ min, $m/z = 467$ [M-1], 468 [M+1].
 1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 2,23 (s, 6 H) 7,10 (s, 3 H) 7,61 (d, J=8,44 Hz, 2 H) 7,87 (d, J=9,17 Hz, 1 H) 7,92 - 7,97 (m, 2 H) 8,08 (s, 1 H) 8,18 - 8,22 (m, 2 H) 8,45 (d, J=0,73 Hz, 1 H) 8,57 (s, 1 H) 10,57 (s, 1 H).

EJEMPLO P25: Preparación de 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[2-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-5-il]metilnamino]tiourea (compuesto P25)5 **Etapa N-1: Preparación de 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[2-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-5-il]metilnamino]tiourea**

10 A una solución de 2-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-5-carbaldehído (0,023 g, 0,075 mmol, ejemplo P21, etapa L-3) en metanol (0,75 mL) se añadió 1-amino-3-(2,6-dimetilfenil)tiourea (0,014 g, 0,071 mmol) y la mezcla de reacción se calentó durante 3 h a 65°C. Después de enfriar, se filtró, se lavó con metanol y dietiléter para dar 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[2-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-5-il]metilnamino]tiourea (14 mg) en forma de un sólido amarillo.

15 LC-MS: $t_R = 1,23$ min, $m/z = 482$ [M-1], 484 [M+1].

1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 2,22 (s, 6 H) 7,10 - 7,15 (m, 3 H) 7,63 (d, J=8,44 Hz, 2 H) 7,71 (d, J=9,17 Hz, 1 H) 8,00 (s, 1 H) 8,22 - 8,30 (m, 4 H) 9,19 (s, 1 H) 9,91 (s, 1 H) 11,72 (s, 1 H).

20 **EJEMPLO P26: Preparación de 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[2-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-5-il]metilnamino]urea (compuesto P26)**25 **Etapa O-1: Preparación de 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[2-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-5-il]metilnamino]urea**

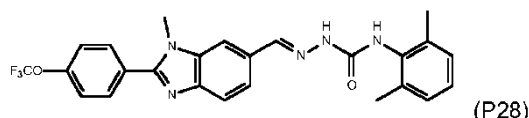
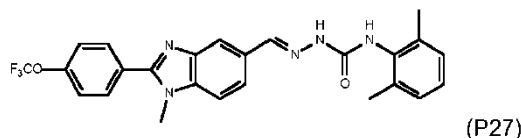
30 A una solución de 2-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-5-carbaldehído (0,023 g, 0,075 mmol, ejemplo P21, etapa L-3) en metanol (0,75 mL) se añadió 1-amino-3-(2,6-dimetilfenil)urea (0,013 g, 0,071 mmol) y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante la noche. La mezcla de reacción se filtró y la torta se lavó dos veces con metanol. El producto bruto se suspendió en dietiléter y se filtró para dar 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[2-[4-(trifluorometoxi)fenil]indazol-5-il]metilnamino]urea (8,5 mg) en forma de un sólido blanco.

LC-MS: $t_R = 1,23$ min, $m/z = 482$ [M-1], 484 [M+1].

35 1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 2,24 (s, 6 H) 7,11 (s, 3 H) 7,63 (d, J=8,44 Hz, 2 H) 7,72 (d, J=9,17 Hz, 1 H) 7,94 (s, 1 H) 8,04 (s, 1 H) 8,17 - 8,30 (m, 4 H) 8,57 (s, 1 H) 9,18 (s, 1 H) 10,56 (s, 1 H).

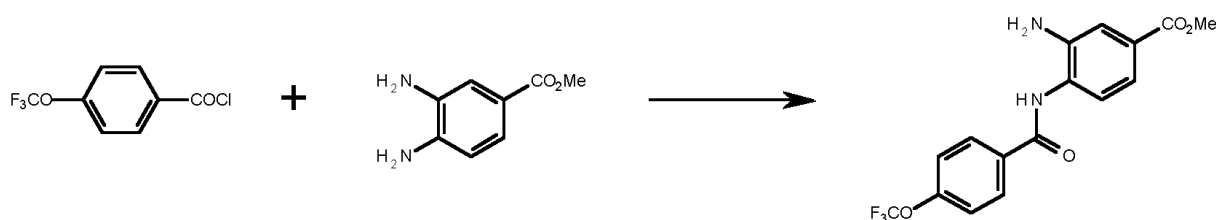
EJEMPLOS P27 Y P28 Preparación de 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[2-[4-(trifluorometoxi)fenil]-indazol-5-il]metilnamino]urea (compuesto P27) y 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[3-metil-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]bencimidazol-5-il]metilnamino]urea (compuesto P28)

5



10

Etapas P-1: Preparación de 3-amino-4-[[4-(trifluorometoxi)benzoil]amino]benzoato de metilo

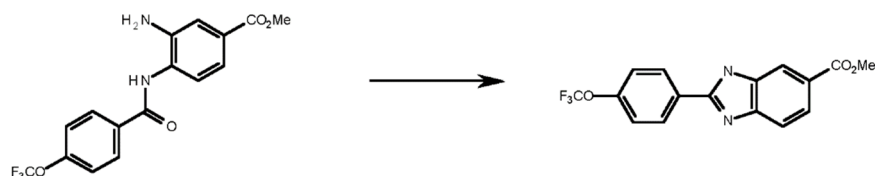


15 Bajo argón, una solución de 3,4-diaminobenzoato de metilo (5,0 g, 29,2 mmol), trietilamina (10,3 ml, 73,0 mmol) en 90 ml de tetrahidrofurano se enfrió a 0°-5°C. Se añadió gota a gota una solución de cloruro de 4-(trifluorometoxi)benzoilo (4,98 ml, 30,6 mmol) en 60 ml de tetrahidrofurano a 0°-5°C. La mezcla se agitó durante 2 h a 0°-5°C y 1 h a TA. Una vez completada la reacción, la mezcla se diluyó con *tert*-butil metil éter, se enfrió bruscamente con una solución saturada de NH₄Cl y se extrajo con 2x300 ml de *tert*-butil metil éter. Las capas orgánicas combinadas se lavaron con salmuera y se secaron sobre Na₂SO₄, se filtró y se evaporó para dar 3-amino-4-[[4-(trifluorometoxi)benzoil]amino]benzoato de metilo (11,2 g) en forma de cristales beige.

20 LC-MS: t_R = 0,95 min, m/z = 353 [M-1], 355 [M+1].
¹H RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 3,76 (s, 3 H) 5,89 (s, 2 H) 6,76 - 6,80 (m, 1 H) 7,50 - 7,54 (m, 2 H) 7,60 (dd, J=8,44, 1,83 Hz, 1 H) 7,78 (d, J=1,83 Hz, 1 H) 8,13 (d, J=8,80 Hz, 2 H) 9,75 (s, 1 H).

25

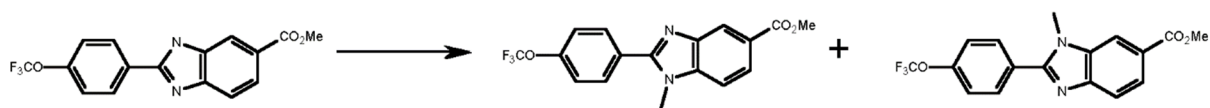
Etapas P-2: Preparación de 3-amino-4-[[4-(trifluorometoxi)benzoil]amino]benzoato de metilo



30 Una solución de 3-amino-4-[[4-(trifluorometoxi)benzoil]amino]benzoato de metilo (2,5 g, 6,7 mmol) en 15 ml de ácido acético se irradió en el microondas durante 30 min a 140°C. La mezcla de reacción se vertió luego en agua (30 mL) y el precipitado formado se filtró para dar 3-amino-4-[[4-(trifluorometoxi)benzoil]amino]benzoato de metilo (2,7 g) en forma de cristales beige.

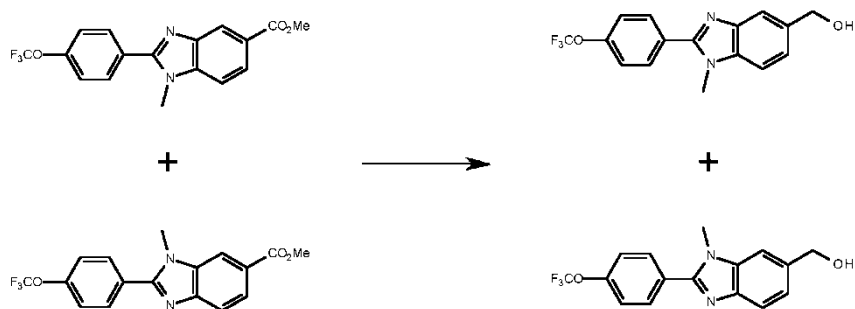
35 LC-MS: t_R = 1,01 min, m/z = 335 [M-1], 337 [M+1].
¹H RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ ppm 3,89 (s, 3 H) 7,60 (d, J=8,07 Hz, 2 H) 7,71 (d, J=8,44 Hz, 1 H) 7,86 - 7,90 (m, 1 H) 8,22 (s, 1 H) 8,31 - 8,35 (m, 2 H).

Etapa P-3: Preparación de 1-metil-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]bencimidazol-5-carboxilato de metilo y 3-metil-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]bencimidazol-5-carboxilato de metilo



5 Bajo argón, se suspendió hidruro de sodio (60 mg, 1,48 mmol) en 5 ml de DMF y se enfrió a 5°-10° C. A esta suspensión, se añadió 3-amino-4-[[4-(trifluorometoxi)benzoyl]amino]benzoato de metilo (500 mg, 1,41 mmol) en 7 ml de DMF gota a gota a 5°-10°C y se agitó durante 30 min más a temperatura ambiente. Luego se añadió gota a gota yodometano (98 µl, 1,55 mmol) a 25°-32°C y la solución incolora se calentó a 70°C durante la noche. Después de enfriar, la mezcla se vertió en 40 ml de agua y se extrajo con 3 x 20 ml de *tert*-butil metil éter. La capa orgánica se lavó con salmuera, se secó sobre Na₂SO₄, se filtró y se evaporó para dar una mezcla de 1-metil-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]bencimidazol-5-carboxilato de metilo y 3-metil-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]bencimidazol-5-carboxilato de metilo (400 mg) en forma de un sólido blanco.

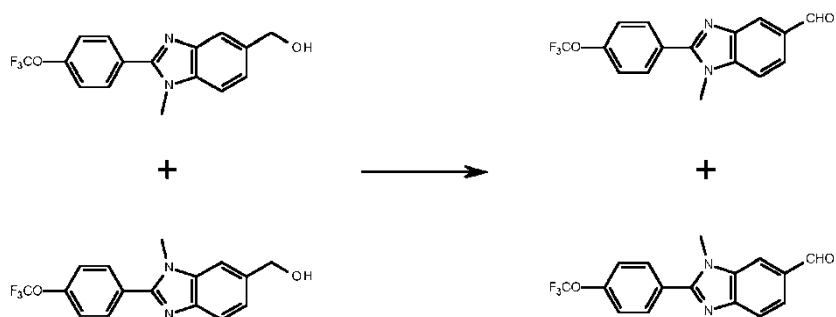
15 **Etapa P-4: Preparación de [1-metil-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]bencimidazol-5-il]metanol y [3-metil-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1H-bencimidazol-5-il]metanol**



20 Bajo argón, una mezcla de 1-metil-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]bencimidazol-5-carboxilato de metilo y 3-metil-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]bencimidazol-5-carboxilato de metilo (400 mg, 1,08 mmol) se disolvió en 8 ml de tetrahidrofurano y 8 ml de diclorometano y se enfrió a -70°C. A esta solución amarilla, se añadió DIBAL-H en tolueno (25%, 1,46 ml, 2,17 mmol) gota a gota a -70°-65°C. La mezcla se agitó a -70°C durante 3 horas y se dejó calentar a temperatura ambiente durante la noche. Para completar la reacción, la mezcla se enfrió a -70°C y se añadió DIBAL-H adicional en tolueno (25%, 1,46 ml, 2,17 mmol) gota a gota a -70°-65°C. Después de enfriar bruscamente cuidadosamente con 3 ml de metanol a -70°C y agitar durante 30 min a -70°C, se añadieron gota a gota 3 ml de agua. La mezcla se agitó durante 30 min a -70°C y luego se dejó calentar a temperatura ambiente. La fase orgánica se separó y la fase acuosa se extrajo con 2 x 10 ml de diclorometano. La capa orgánica se lavó con agua y salmuera, se secó sobre Na₂SO₄, se filtró y se evaporó. El producto bruto se purificó por cromatografía de resolución instantánea para dar una mezcla de [1-metil-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]bencimidazol-5-il]metanol y [3-metil-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1H-bencimidazol-5-il]metanol en forma de una cera naranja.

30 LC-MS: t_R = 0,75 min, m/z = 321 [M-1], 323 [M+1].

35 **Etapa P-5: Preparación de 1-metil-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]bencimidazol-5-carbaldehído y 3-metil-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1H-bencimidazol-5-carbaldehído**



40 A una solución de [1-metil-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]bencimidazol-5-il]metanol y [3-metil-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1H-bencimidazol-5-il]metanol (1,97 g, 5,81 mmol) en 100 ml de diclorometano se añadió dióxido de manganeso (5,61 g, 58,1 mmol) y la mezcla se agitó a ta durante la noche. La mezcla se filtró sobre una almohadilla de celite y el filtrado

se evaporó para dar una mezcla de 1-metil-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]bencimidazol-5-carbaldehído y 3-metil-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1H-bencimidazol-5-carbaldehído (1,58 g).

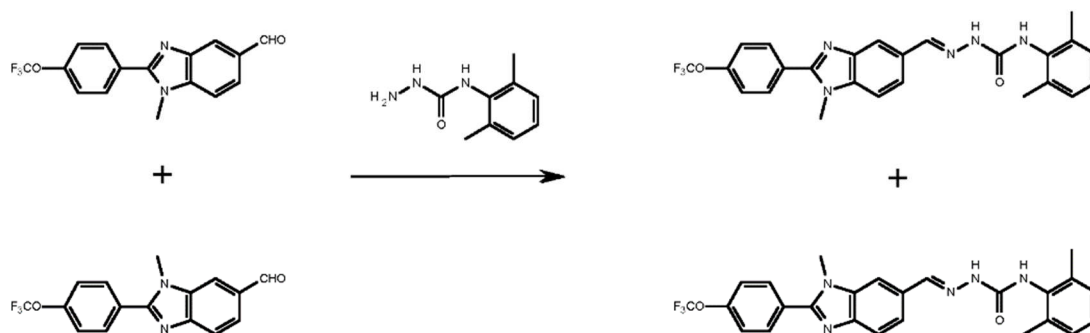
LC-MS: $t_R = 0,98$ min, $m/z = 321$ [M-1].

1H RMN (400 MHz, $CDCl_3$) δ ppm 3,96 (d, $J=14,67$ Hz, 6 H) 7,26 (s, 2 H) 7,40 - 7,45 (m, 4 H) 7,50 - 7,54 (m, 1 H) 7,82 - 7,98 (m, 7 H) 8,01 (d, $J=0,73$ Hz, 1 H) 8,31 (d, $J=0,73$ Hz, 1 H) 10,12 (d, $J=5,14$ Hz, 2 H).

5

Etapa P-6: Preparación de 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[1-metil-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]bencimidazol-5-il]metilnamino]urea y 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[3-metil-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]bencimidazol-5-il]metilnamino]urea

10



15

A una solución de una mezcla de 1-metil-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]bencimidazol-5-carbaldehído y 3-metil-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1H-bencimidazol-5-carbaldehído (120 mg, 0,356 mmol) en 10 ml de etanol se añadió 1-amino-3-(2,6-dimetilfenil)urea (71 mg, 0,374 mmol) y la mezcla de reacción se calentó a 65°C durante 3 h. Después de la evaporación, el producto bruto se purificó por cromatografía de resolución instantánea para dar 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[1-metil-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]bencimidazol-5-il]metilnamino]urea (P27) (64 mg) y 1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[3-metil-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]bencimidazol-5-il]metilnamino]urea (P28) (64 mg) en forma de cristales blancos.

20

1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[1-metil-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]bencimidazol-5-il]metilnamino]urea (P27):

25

LC-MS: $t_R = 1,05$ min, $m/z = 480$ [M-1], 482 [M+1].

1H RMN (400 MHz, $CDCl_3$) δ ppm 2,36 (s, 6 H) 3,90 (s, 3 H) 7,13 (s, 3 H) 7,26 (s, 1 H) 7,41 (t, $J=8,07$ Hz, 3 H) 7,62 (s, 1 H) 7,74 (dd, $J=8,44, 1,47$ Hz, 1 H) 7,81 - 7,86 (m, 2 H) 7,94 (s, 1 H) 8,01 (d, $J=0,73$ Hz, 1 H) 9,02 (s, 1 H).

30

1-(2,6-dimetilfenil)-3-[(E)-[3-metil-2-[4-(trifluorometoxi)fenil]bencimidazol-5-il]metilnamino]urea (P28):

35

LC-MS: $t_R = 1,05$ min, $m/z = 480$ [M-1], 482 [M+1].

1H RMN (400 MHz, $CDCl_3$) δ ppm 2,37 (s, 6 H) 3,93 (s, 3 H) 7,14 (s, 3 H) 7,26 (s, 2 H) 7,41 (d, $J=8,07$ Hz, 2 H) 7,58 - 7,69 (m, 3 H) 7,82 - 7,89 (m, 3 H) 7,94 (s, 1 H) 8,96 (s a., 1 H).

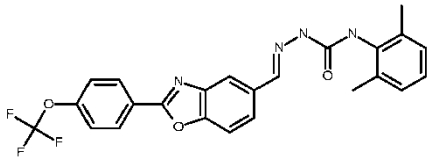
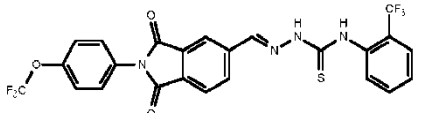
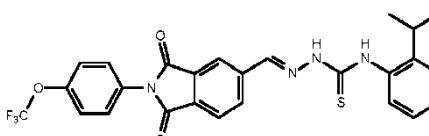
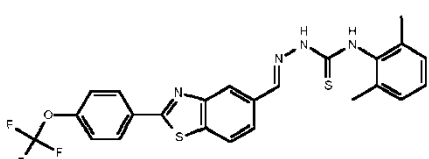
40

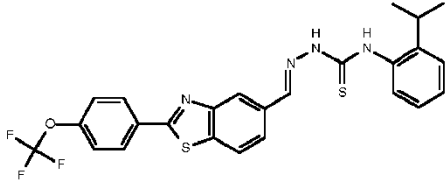
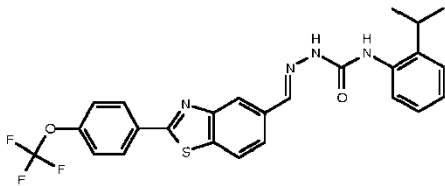
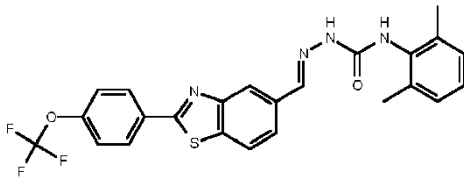
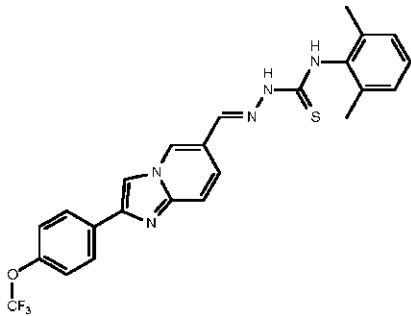
Los compuestos enumerados en la Tabla 14 se preparan tal como se describe en esta memoria o se pueden preparar de una manera similar a la descrita para los compuestos anteriores. Generalmente, los compuestos pueden prepararse de acuerdo con los esquemas 1 a 7 anteriores o de acuerdo con métodos conocidos.

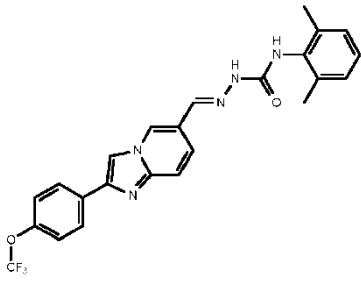
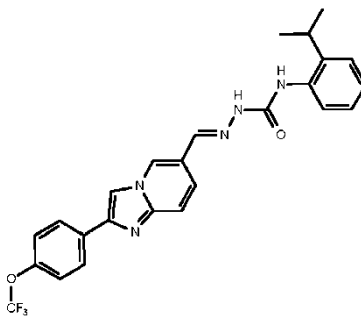
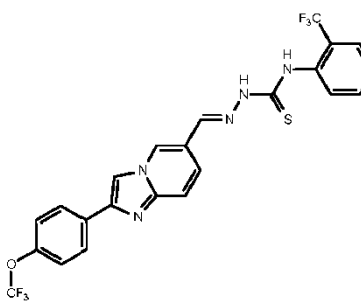
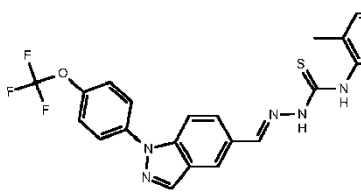
Tabla 14: Ejemplos de compuestos de fórmula (I)

Compuesto n.º	Estructuras	Punto de fusión	MS/RMN
P1		255-260	MS: 484 (M+H) ⁺ ¹ H RMN (300 MHz, CDCl ₃): δ 10,0 (s, 1H), 8,70 (s, 1H), 8,40 (s, 1H), 8,05 (s, 1H), 7,91-7,97 (m, 3H), 7,73 (d, 1H), 7,63 (dd, J 1H), 7,41 (d, 2H), 7,15-7,26 (m, 3H), 2,35 (s, 6H).
P2		205-210	MS: 525 (M+H) ⁺ ¹ H RMN (400 MHz, DMSO-d ₆): δ 11,8 (s, 1H), 10,10 (s, 1H), 8,44-8,51 (m, 2H), 8,29 (s, 1H), 8,21 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 7,62 (d, J = 12,0 Hz, 1H), 7,40-7,50 (m, 4H), 7,17-7,37 (m, 5H).
P3		180-185	MS: 531 (M+H) ⁺ ¹ H RMN (300 MHz, DMSO-d ₆): δ 11,81 (s, 1H), 10,00 (s, 1H), 8,48 (s, 1H), 8,19 (s, 1H), 8,04 (dd, J = 8,4 Hz, J = 1,2 Hz, 1H), 7,72 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 7,66-7,62 (m, 2H), 7,54 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,17-7,37 (m, 4H).
P4		>240	LC-MS: t _R = 2,02 min, m/z = 511 [M-1], 513 [M+1]. ¹ H RMN (400 MHz, CDCl ₃) δ ppm 2,34 (s, 6 H) 7,18 (s, 1 H) 7,18 - 7,18 (m, 1 H) 7,37 (d, J=8,07 Hz, 2 H) 7,51 - 7,54 (m, 2 H) 8,01 - 8,04 (m, 3H) 8,31 (s, 1 H) 8,69 (s, 1 H) 10,01 (s, 1 H).
P5			¹ H RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ ppm 2,22 (s, 6 H) 7,54 - 7,66 (m, 4 H) 7,97 (d, J=7,70 Hz, 1 H) 8,09 (s, 1 H) 8,21 (dd, J=8,07, 1,10 Hz, 1 H) 8,65 (s, 1 H) 8,89 (s, 1 H) 10,91 (s, 1 H).

Compuesto n.º	Estructuras	Punto de fusión	MS/RMN
P6		239-240°C	LC-MS: $t_R = 2,06$ min, $m/z = 509$ [M-1], 511 [M+1]. 1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 1,22 (d, $J=6,97$ Hz, 6 H) 3,15-3,25 (m, 1 H) 7,18 - 7,22 (m, 2 H) 7,31 - 7,35 (m, 1 H) 7,39 - 7,44 (m, 1 H) 7,54 - 7,58 (m, 2 H) 7,60 - 7,64 (m, 2 H) 8,00 (d, $J=7,70$ Hz, 1 H) 8,12 (s, 1 H) 8,20 (dd, $J=7,89$, 1,28 Hz, 1 H) 8,56 (s, 1 H) 8,94 (s, 1 H) 11,03 (s, 1 H)
P7			LC-MS: $t_R = 1,92$ min, $m/z = 495$ [M-1], 497 [M+1]. 1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 2,22 (s, 6 H) 7,54 - 7,66 (m, 4 H) 7,97 (d, $J=7,70$ Hz, 1 H) 8,09 (s, 1 H) 8,21 (dd, $J=8,07$, 1,10 Hz, 1 H) 8,65 (s, 1 H) 8,89 (s, 1 H) 10,91 (s, 1 H).
P8			LC-MS: $t_R = 1,27$ min, $m/z = 4999$ [M-1], 500 [M+1]. 1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 1,21 (d, $J=6,60$ Hz, 7 H) 3,14 - 3,21 (m, 1 H) 7,20 - 7,40 (m, 4 H) 7,65 (d, $J=8,07$ Hz, 2 H) 7,86 (d, $J=8,80$ Hz, 1 H) 8,00 (d, $J=8,07$ Hz, 1 H) 8,23 - 8,36 (m, 3 H) 8,53 (s, 1 H) 10,13 (s, 1 H) 11,84 (s, 1 H)
P9			LC-MS: $t_R = 1,30$ min, $m/z = 481$ [M-1], 483 [M+1]. 1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 1,25 (d, $J=6,97$ Hz, 6 H) 3,20 - 3,27 (m, 1 H) 7,17 - 7,24 (m, 2 H) 7,31 - 7,37 (m, 1 H) 7,47 - 7,52 (m, 1 H) 7,65 (d, $J=8,07$ Hz, 2 H) 7,84 - 7,96 (m, 2 H) 8,10 (s, 1 H) 8,32 - 8,37 (m, 3 H) 8,74 (s, 1 H) 10,79 (s, 1 H)

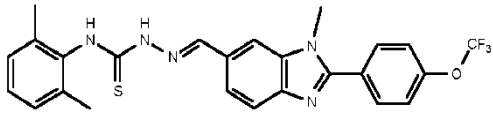
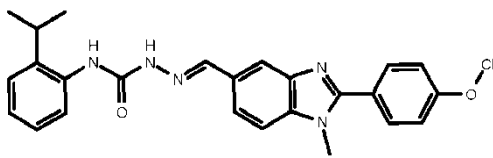
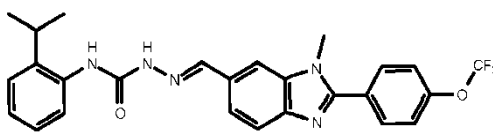
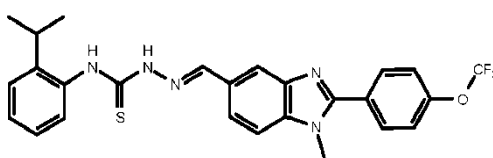
Compuesto n.º	Estructuras	Punto de fusión	MS/RMN
P10			LC-MS: $t_R = 1,23$ min, $m/z = 467$ [M-1], 469 [M+1]. 1H RMN (400 MHz, DMSO-d6) δ ppm 2,24 (s, 6 H) 7,11 (s, 3 H) 7,65 (d, $J=8,07$ Hz, 2 H) 7,83 (d, $J=8,80$ Hz, 1 H) 7,98 (d, $J=8,80$ Hz, 1 H) 8,06 (s, 1 H) 8,34 (d, $J=8,44$ Hz, 2 H) 8,40 (s, 1 H) 8,67 (s, 1 H) 10,65 (s, 1 H).
P11		235-236°C	LC-MS: $t_R = 2,04$ min, $m/z = 551$ [M-1], 553 [M+1]. 1H RMN (400 MHz, $CDCl_3$) δ ppm 7,32 - 7,42 (m, 3 H) 7,51 - 7,56 (m, 2 H) 7,66 (t, $J=7,89$ Hz, 1 H) 7,73 (d, $J=7,70$ Hz, 1 H) 7,99 - 8,04 (m, 2 H) 8,06 - 8,10 (m, 1 H) 8,23 - 8,31 (m, 2 H) 9,56 (s, 1 H) 9,73 - 9,77 (m, 1 H) 9,73 - 9,77 (m, 1 H) 9,73 - 9,77 (m, 1 H) 9,74 (s, 1 H).
P12			LC-MS: $t_R = 2,11$ min, $m/z = 525$ [M-1], 527 [M+1]. 1H RMN (400 MHz, $CDCl_3$) δ ppm 1,32 (d, $J=6,97$ Hz, 6 H) 3,18 (quin, $J=6,88$ Hz, 1 H) 7,31 (dd, $J=7,70$, 1,83 Hz, 1 H) 7,35 - 7,43 (m, 4 H) 7,50 - 7,54 (m, 2 H) 7,61 (d, $J=6,60$ Hz, 1 H) 8,00 - 8,06 (m, 3 H) 8,31 (s, 1 H) 9,02 (s, 1 H) 10,03 (s, 1 H).
P13			LC-MS: $t_R = 1,26$ min, $m/z = 499$ [M-1], 501 [M+1]. 1H RMN (400 MHz, DMSO-d6) δ ppm 2,22 (s, 6 H) 7,13 (s a., 3 H) 7,59 (d, $J=8,07$ Hz, 2 H) 8,04 (d, $J=8,07$ Hz, 1 H) 8,14 - 8,33 (m, 4 H) 8,70 (s, 1 H) 10,06 (s a., 1 H) 11,85 (s a., 1 H).

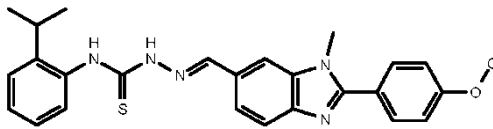
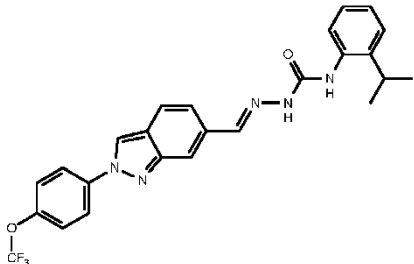
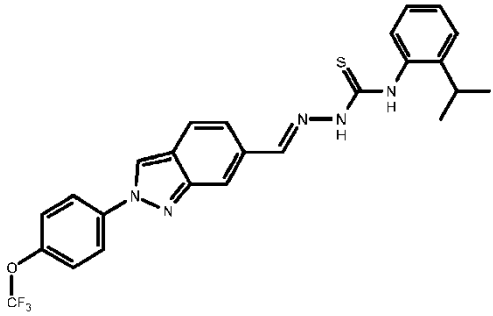
Compuesto n.º	Estructuras	Punto de fusión	MS/RMN
P14			LC-MS: $t_R = 1,35$ min, $m/z = 513$ [M-1], 515 [M+1]. 1H RMN (400 MHz, DMSO-d6) δ ppm 1,20 (d, $J=6,60$ Hz, 6 H) 3,13 - 3,20 (m, 1 H) 7,17 - 7,26 (m, 2 H) 7,29 - 7,39 (m, 2 H) 7,59 (d, $J=8,44$ Hz, 2 H) 8,03 (d, $J=8,44$ Hz, 1 H) 8,21 (t, $J=4,22$ Hz, 2 H) 8,29 (s, 1 H) 8,70 (s, 1 H) 10,18 (s, 1 H) 11,86 (s, 1 H)
P15			LC-MS: $t_R = 1,29$ min, $m/z = 497$ [M-1], 499 [M+1]. 1H RMN (400 MHz, DMSO-d6) δ ppm 1,23 (d, $J=6,97$ Hz, 6 H) 3,20 - 3,26 (m, 1 H) 7,16 - 7,23 (m, 2 H) 7,31 - 7,36 (m, 1 H) 7,44 - 7,51 (m, 1 H) 7,59 (d, $J=8,07$ Hz, 2 H) 7,95 - 8,01 (m, 1 H) 8,11 (s, 1 H) 8,19 - 8,27 (m, 3 H) 8,51 (s, 1 H) 8,78 (s, 1 H) 10,82 (s, 1 H)
P16			LC-MS: $t_R = 1,21$ min, $m/z = 483$ [M-1], 485 [M+1]. 1H RMN (400 MHz, DMSO-d6) δ ppm 2,23 (s, 6 H) 7,10 (s, 3 H) 7,59 (d, $J=8,07$ Hz, 2 H) 8,00 - 8,08 (m, 2 H) 8,17 - 8,25 (m, 3 H) 8,57 (s, 1 H) 8,71 (s, 1 H) 10,68 (s, 1 H).
P17			LC-MS: $t_R = 1,82$ min, $m/z = 483$ [M-1], 484 [M+1]. 1H RMN (400 MHz, DMSO-d6) δ ppm 2,21 (s, 6 H) 7,11 - 7,15 (m, 3 H) 7,46 (d, $J=8,07$ Hz, 2 H) 7,60 (d, $J=9,54$ Hz, 1 H) 8,07 - 8,11 (m, 2 H) 8,16 (s, 1 H) 8,21 (dd, $J=9,54, 1,83$ Hz, 1 H) 8,42 (s, 1 H) 8,90 (s, 1 H) 9,95 (s, 1 H) 11,85 (s, 1 H).

Compuesto n.º	Estructuras	Punto de fusión	MS/RMN
P18			LC-MS: $t_R = 1,82$ min, $m/z = 483$ [M-1], 484 [M+1]. 1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 2,23 (s, 6 H) 7,11 (s, 3 H) 7,45 (d, $J=8,07$ Hz, 2 H) 7,60 (d, $J=9,17$ Hz, 1 H) 7,96 (s, 1 H) 8,08 - 8,16 (m, 3 H) 8,42 (s, 1 H) 8,62 (s, 1 H) 8,82 (s, 1 H) 10,69 (s, 1 H).
P19			LC-MS: $t_R = 1,83$ min, $m/z = 480$ [M-1], 482 [M+1]. 1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 1,23 (d, $J=6,97$ Hz, 6 H) 3,21 (quin, $J=6,88$ Hz, 1 H) 7,17 - 7,22 (m, 2 H) 7,31 - 7,36 (m, 1 H) 7,43 - 7,48 (m, 3 H) 7,64 (d, $J=9,54$ Hz, 1 H) 7,98 - 8,02 (m, 2 H) 8,09 - 8,14 (m, 2 H) 8,44 (s, 1 H) 8,68 (s, 1 H) 8,83 (s, 1 H) 10,81 (s, 1 H)
P20			LC-MS: $t_R = 1,87$ min, $m/z = 522$ [M-1], 524 [M+1]. 1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 7,46 (d, $J=8,07$ Hz, 2 H) 7,50 - 7,58 (m, 1 H) 7,62 - 7,68 (m, 2 H) 7,72 - 7,82 (m, 2 H) 8,07 - 8,14 (m, 3 H) 8,20 (s, 1 H) 8,45 (s, 1 H) 8,91 (s, 1 H) 10,09 (s, 1 H) 12,11 (s, 1 H)
P21		233-239°C	LC-MS: $t_R = 1,24$ min, $m/z = 482$ [M-1], 484 [M+1]. 1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 2,22 (s, 6 H) 7,12 - 7,16 (m, 3 H) 7,63 (d, $J=8,44$ Hz, 2 H) 7,87 (d, $J=8,80$ Hz, 1 H) 7,96 (d, $J=9,17$ Hz, 2 H) 8,26 - 8,32 (m, 3 H) 8,47 (s, 1 H) 9,94 (s, 1 H) 11,75 (s, 1 H).

Compuesto n.º	Estructuras	Punto de fusión	MS/RMN
P22		214-222°C	LC-MS: $t_R = 1,24$ min, $m/z = 496$ [M-1], 498 [M+1]. 1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 1,11 - 1,27 (m, 6 H) 3,16 (dt, $J=13,57, 6,79$ Hz, 1 H) 7,20 - 7,41 (m, 4 H) 7,62 (d, $J=8,80$ Hz, 2 H) 7,89 (d, $J=9,17$ Hz, 1 H) 7,96 (d, $J=8,80$ Hz, 2 H) 8,23 - 8,34 (m, 3 H) 8,48 (s, 1 H) 10,04 (s, 1 H) 11,79 (s, 1 H)
P23		207-213°C	LC-MS: $t_R = 1,23$ min, $m/z = 480$ [M-1], 482 [M+1]. 1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 1,27 (d, $J=6,60$ Hz, 6 H) 3,21 (quin, $J=6,79$ Hz, 1 H) 7,15 - 7,24 (m, 2 H) 7,34 (dd, $J=7,52, 2,02$ Hz, 1 H) 7,58 - 7,66 (m, 3 H) 7,93 - 8,00 (m, 3 H) 8,10 - 8,21 (m, 3 H) 8,49 (s, 1 H) 8,67 (s, 1 H) 10,78 (s, 1 H).
P24		227-233°C	LC-MS: $t_R = 1,19$ min, $m/z = 467$ [M-1], 468 [M+1]. 1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 2,23 (s, 6 H) 7,10 (s, 3 H) 7,61 (d, $J=8,44$ Hz, 2 H) 7,87 (d, $J=9,17$ Hz, 1 H) 7,92 - 7,97 (m, 2 H) 8,08 (s, 1 H) 8,18 - 8,22 (m, 2 H) 8,45 (d, $J=0,73$ Hz, 1 H) 8,57 (s, 1 H) 10,57 (s, 1 H).
P25		225-234°C	LC-MS: $t_R = 1,23$ min, $m/z = 482$ [M-1], 484 [M+1]. 1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ ppm 2,22 (s, 6 H) 7,10 - 7,15 (m, 3 H) 7,63 (d, $J=8,44$ Hz, 2 H) 7,71 (d, $J=9,17$ Hz, 1 H) 8,00 (s, 1 H) 8,22 - 8,30 (m, 4 H) 9,19 (s, 1 H) 9,91 (s, 1 H) 11,72 (s, 1 H).

Compuesto n.º	Estructuras	Punto de fusión	MS/RMN
P26		244-250°C	LC-MS: $t_R = 1,23$ min, $m/z = 482$ [M-1], 484 [M+1]. 1H RMN (400 MHz, DMSO-d6) δ ppm 2,24 (s, 6 H) 7,11 (s, 3 H) 7,63 (d, $J=8,44$ Hz, 2 H) 7,72 (d, $J=9,17$ Hz, 1 H) 7,94 (s, 1 H) 8,04 (s, 1 H) 8,17 - 8,30 (m, 4 H) 8,57 (s, 1 H) 9,18 (s, 1 H) 10,56 (s, 1 H).
P27		>245°C	LC-MS: $t_R = 1,05$ min, $m/z = 480$ [M-1], 482 [M+1]. 1H RMN (400 MHz, $CDCl_3$) δ ppm 2,36 (s, 6 H) 3,90 (s, 3 H) 7,13 (s, 3 H) 7,26 (s, 1 H) 7,41 (t, $J=8,07$ Hz, 3 H) 7,62 (s, 1 H) 7,74 (dd, $J=8,44, 1,47$ Hz, 1 H) 7,81 - 7,86 (m, 2 H) 7,94 (s, 1 H) 8,01 (d, $J=0,73$ Hz, 1 H) 9,02 (s, 1 H).
P28		218-219°C	LC-MS: $t_R = 1,05$ min, $m/z = 480$ [M-1], 482 [M+1]. 1H RMN (400 MHz, $CDCl_3$) δ ppm 2,37 (s, 6 H) 3,93 (s, 3 H) 7,14 (s, 3 H) 7,26 (s, 2 H) 7,41 (d, $J=8,07$ Hz, 2 H) 7,58 - 7,69 (m, 3 H) 7,82 - 7,89 (m, 3 H) 7,94 (s, 1 H) 8,96 (s a., 1 H)
P29		219-221°C	LC-MS: $t_R = 1,11$ min, $m/z = 496$ [M-1], 498 [M+1]. 1H RMN (400 MHz, $CDCl_3$) δ ppm 2,33 - 2,37 (m, 6 H) 3,92 - 3,96 (m, 3 H) 7,12 - 7,22 (m, 3 H) 7,37 - 7,48 (m, 3 H) 7,78 (d, $J=8,80$ Hz, 1 H) 7,88 (d, $J=8,80$ Hz, 2 H) 8,02 (s, 1 H) 8,10 (s, 1 H) 8,70 (s, 1 H) 9,44 (s a., 1 H)

Compuesto n.º	Estructuras	Punto de fusión	MS/RMN
P30		230-259°C	LC-MS: $t_R = 1,10$ min, $m/z = 496$ [M-1], 498 [M+1]. 1H RMN (400 MHz, MeOH- d_4) δ ppm 2,32 - 2,35 (m, 6 H) 3,97 (s, 3 H) 7,12 - 7,18 (m, 3 H) 7,55 (d, $J=8,07$ Hz, 2 H) 7,72 - 7,76 (m, 1 H) 7,80 - 7,83 (m, 1 H) 7,94 - 7,98 (m, 2 H) 8,20 (s, 1 H) 8,24 (s, 1 H)
P31		216-217°C	LC-MS: $t_R = 1,13$ min, $m/z = 494$ [M-1], 496 [M+1]. 1H RMN (400 MHz, $CDCl_3$) δ ppm 1,35 - 1,40 (m, 6 H) 3,19 (quin, $J=6,88$ Hz, 1 H) 3,93 (s, 3 H) 7,12 - 7,18 (m, 1 H) 7,22 - 7,26 (m, 2 H) 7,31 (dd, $J=7,70, 1,47$ Hz, 1 H) 7,44 (dd, $J=14,86, 8,25$ Hz, 3 H) 7,76 (dd, $J=8,44, 1,47$ Hz, 1 H) 7,85 - 7,96 (m, 4 H) 8,03 (s, 1 H) 8,22 (s, 1 H)
P32		237-239°C	LC-MS: $t_R = 1,12$ min, $m/z = 494$ [M-1], 496 [M+1]. 1H RMN (400 MHz, $CDCl_3$) δ ppm 1,36 - 1,40 (m, 7 H) 3,23 (quin, $J=6,88$ Hz, 1 H) 3,94 (s, 3 H) 7,14 - 7,19 (m, 1 H) 7,33 (dd, $J=7,70, 1,47$ Hz, 1 H) 7,42 (d, $J=8,07$ Hz, 2 H) 7,65 - 7,70 (m, 2 H) 7,87 (d, $J=8,80$ Hz, 3 H) 7,92 - 7,97 (m, 2 H) 8,28 (s, 1 H) 8,77 (s a., 1 H)
P33			LC-MS: $t_R = 1,16$ min, $m/z = 510$ [M-1], 512 [M+1]. 1H RMN (400 MHz, $CDCl_3$) δ ppm 1,27 - 1,34 (m, 6 H) 3,16 - 3,25 (m, 1 H) 7,27 - 7,36 (m, 2 H) 7,36 - 7,47 (m, 4 H) 7,65 (dd, $J=7,70, 1,47$ Hz, 1 H) 7,74 (dd, $J=8,44, 1,47$ Hz, 1 H) 7,81 - 7,86 (m, 2 H) 8,03 - 8,08 (m, 2 H) 9,04 (s, 1 H) 9,63 (s a., 1 H).

Compuesto n.º	Estructuras	Punto de fusión	MS/RMN
P34		205-207°C	LC-MS: $t_R = 1,16$ min, $m/z = 510$ [M-1], 512 [M+1]. 1H RMN (400 MHz, $CDCl_3$) δ ppm 1,33 (d, $J=6,97$ Hz, 6 H) 3,18 - 3,26 (m, 1 H) 7,27 - 7,37 (m, 2 H) 7,37 - 7,43 (m, 3 H) 7,64 - 7,72 (m, 3 H) 7,82 - 7,87 (m, 3 H) 8,06 (s, 1 H) 9,06 (s, 1 H) 9,67 (s, 1 H)
P35			LC-MS: $t_R = 2,11$ min, $m/z = 480$ [M-1], 482 [M+1]. 1H RMN (400 MHz, $CDCl_3$) δ ppm 1,38 (d, $J=6,97$ Hz, 6 H) 3,16 - 3,26 (m, 1 H) 7,14 - 7,20 (m, 1 H) 7,32 (dd, $J=7,70, 1,47$ Hz, 1 H) 7,41 (d, $J=8,44$ Hz, 2 H) 7,64 (dd, $J=8,80, 1,10$ Hz, 1 H) 7,75 (d, $J=9,17$ Hz, 1 H) 7,84 (s, 1 H) 7,89 - 7,99 (m, 4 H) 8,24 (s, 1 H) 8,39 - 8,45 (m, 2 H)
P36			LC-MS: $t_R = 2,15$ min, $m/z = 496$ [M-1], 498 [M+1]. 1H RMN (400 MHz, $CDCl_3$) δ ppm 1,32 (d, $J=6,97$ Hz, 6 H) 3,20 (dt, $J=13,66, 6,92$ Hz, 1 H) 7,28 - 7,36 (m, 2 H) 7,37 - 7,43 (m, 3 H) 7,64 (ddd, $J=10,09, 8,44, 1,28$ Hz, 2 H) 7,74 (d, $J=8,80$ Hz, 1 H) 7,92 (s, 1 H) 7,93 - 7,99 (m, 3 H) 8,41 (d, $J=0,73$ Hz, 1 H) 9,03 (s, 1 H) 9,33 (s, 1 H)

Ejemplos de formulación (% = porcentaje en peso)

Ejemplo F1: Concentrados en emulsión	a)	b)	c)
Principio activo	25 %	40 %	50%
Dodecilsulfonato de calcio	5 %	8 %	6%
Aceite de ricino polietilenglicol éter (36 mol de OE)	5 %	-	
Tributilfenoxipolietilenglicol éter (30 mol de OE)	-	12 %	- 4%
Ciclohexanona	-	15 %	20%
Mezcla de xilenos	65 %	25 %	20%

Se pueden preparar emulsiones de cualquier concentración deseada a partir de estos concentrados diluyendo con agua.

<u>Ejemplo F2: Soluciones</u>	a)	b)	c)	d)
Principio activo	80 %	10 %	5 %	95 %
Éter monometílico de etilenglicol	20 %	-	-	-
Polietilenglicol PM 400	-	70 %	-	-
N-metilpirrolid-2-ona	-	20 %	-	-
Aceite de coco epoxidado	-	-	1 %	5 %
Éter de petróleo (intervalo de ebullición: 160-190°)	-	-	94 %	-

5 Las soluciones son adecuadas para su uso en forma de microgotas.

<u>Ejemplo F3: Gránulos</u>	a)	b)	c)	d)
Principio activo	5 %	10 %	8 %	21 %
Caolin	94 %	-	79 %	54 %
Sílice altamente dispersa	1 %	-	13 %	7 %
Atapulgita	-	90 %	-	18 %

Se disuelve el principio activo en diclorometano, se pulveriza la solución sobre el/los soportes y posteriormente se evapora el disolvente en vacío.

10

<u>Ejemplo F4: Polvos espolvoreables</u>	a)	b)
Principio activo	2 %	5 %
Sílice altamente dispersa	1 %	5 %
Talco	97 %	-
Caolin	-	90 %

Se obtienen polvos finos listos para usar mezclando íntimamente los soportes y el principio activo.

<u>Ejemplo F5: Polvos humectables</u>	a)	b)	c)
Principio activo	25 %	50 %	75 %
Lignosulfonato de sodio	5 %	5 %	-
Laurilsulfato de sodio	3 %	-	5 %
Diisobutil-naftalenosulfonato de sodio	-	6 %	10 %
Octilfenoxipolietilenglicol éter (7-8 mol de OE)	-	2 %	-
Sílice altamente dispersa	5 %	10 %	10 %
Caolin	62 %	27 %	-

15 Se mezcla el principio activo con los aditivos y se muele exhaustivamente la mezcla en un molino adecuado. Esto da polvos humectables, que pueden diluirse con agua para dar suspensiones de cualquier concentración deseada.

Ejemplo F6: Gránulos de extrusora

Principio activo	10 %
Lignosulfonato de sodio	2 %
Carboximetilcelulosa	1 %
Caolin	87 %

20

El principio activo se mezcla con los aditivos y la mezcla se muele, se humedece con agua, se extrude, se granula y se seca en una corriente de aire.

Ejemplo F7: Gránulos recubiertos

Principio activo	3 %
Polietilenglicol (PM 200)	3 %
Caolín	94 %

- 5 En una mezcladora, se aplica uniformemente el principio activo finamente molido al caolín, que se ha humedecido con el polietilenglicol. Esto da gránulos recubiertos sin polvo.

Ejemplo F8: Concentrado en suspensión

Principio activo	40 %
Etilenglicol	10 %
Éter nonilfenoxipolietilenglicólico (15 mol de OE)	6 %
Lignosulfonato de sodio	10 %
Carboximetilcelulosa	1 %
Solución acuosa de formaldehído al 37%	0,2 %
Aceite de silicona (emulsión acuosa al 75%)	0,8 %
Agua	32 %

- 10 El principio activo finamente molido se mezcla íntimamente con los aditivos. Se pueden preparar suspensiones de cualquier concentración deseada a partir del concentrado de suspensión así resultante por dilución con agua.

<u>Ejemplo F9: Polvos para el tratamiento de semillas secas</u>	a)	b)	c)
principio activo	25 %	50 %	75 %
aceite mineral ligero	5 %	5 %	5 %
ácido silícico altamente disperso	5 %	5 %	-
Caolín	65 %	40 %	-
Talco	-	-	20 %

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

Ejemplo F10: Concentrado emulsionable

principio activo	10 %
octilfenol polietilenglicol éter (4-5 mol de óxido de etileno)	3 %
dodecilbencenosulfonato de calcio	3 %
aceite de ricino poliglicol éter (35 mol de óxido de etileno)	4 %
Ciclohexanona	30 %
mezcla de xilenos	50 %

- 20 Las emulsiones de cualquier dilución requerida, que se pueden utilizar en la protección de las plantas se pueden obtener de este concentrado mediante dilución con agua.

Ejemplo F11: Concentrado fluido para el tratamiento de semillas

Principios activos	40 %
propilenglicol	5 %
copolímero de butanol OP/OE	2 %
Tristirenofenol con 10-20 moles de OE	2 %
1,2-benzisotiazolin-3-ona (en forma de una solución al 20% en agua)	0,5 %
Pigmento monoazo sal de calcio	5 %
Aceite de silicona (en forma de una emulsión al 75 % en agua)	0,2 %
Agua	45,3 %

La combinación finamente molida se mezcla íntimamente con los adyuvantes, dando un concentrado en suspensión a partir del cual se pueden obtener suspensiones de cualquier dilución deseada por dilución con agua. Utilizando estas diluciones, las plantas vivas, así como el material de propagación vegetal pueden tratarse y protegerse contra la infestación por microorganismos, mediante pulverización, vertido o inmersión.

La actividad de composiciones que comprenden compuestos de acuerdo con la invención puede ampliarse considerablemente y adaptarse a las circunstancias predominantes, incluyendo otras sustancias activas. Las sustancias activas pueden ser de tipo químico o biológico, y en el caso del biológico, podrían modificarse además a partir de la especie biológica de la que deriva de forma natural. Las sustancias activas incluyen sustancias que controlan, repelen o atraen plagas que dañan o lesionan plantas útiles en general, pero también sustancias que mejoran el crecimiento de una planta útil, tales como reguladores del crecimiento de las plantas, y sustancias que mejoran el rendimiento de la sustancia activa, tales como compuestos sinérgicos. Ejemplos son insecticidas, acaricidas, nematocidas, molusquicidas, alguicidas, virucidas, raticidas, bactericidas, fungicidas, quimioesterilizantes, antihelmínticos. Ejemplos de una sustancia activa biológica incluyen baculovirus, extracto vegetal y bacterias.

Las mezclas de los compuestos de fórmula I con otras sustancias activas también pueden tener ventajas sorprendentes adicionales que también pueden describirse, en un sentido más amplio, como actividad sinérgica. Por ejemplo, mejor tolerancia por las plantas, fitotoxicidad reducida, los insectos pueden controlarse en sus diferentes fases del desarrollo, o mejor comportamiento respecto a producción, por ejemplo, molienda o mezcla, almacenamiento o uso.

Pueden existir sustancias activas individuales en más de un grupo o clase, y en más de una ubicación dentro de un grupo o clase: puede encontrarse información acerca de las sustancias activas, su espectro, fuentes y clasificaciones en el Compendio de Denominaciones Comunes de Plaguicidas (véase <http://www.alanwood.net/pesticides/index.html>) o en el Manual de Plaguicidas creado por el British Crop Production Council (véase <http://bcpcdata.com/pesticide-manual.html>).

Se indican a continuación mezclas preferidas, en que un compuesto de fórmula I de acuerdo con la invención se indica como "I".

Las composiciones que comprenden un adyuvantes incluyen I + compuestos seleccionados del grupo de sustancias que consiste en aceites del petróleo;

Composiciones que comprenden un acaricida incluyen I + 1,1-bis(4-clorofenil)-2-etoxietanol, I + bencenosulfonato de 2,4-diclorofenilo, I + 2-fluoro-N-metil-N-1-naftilacetamida, I + 4-clorofenil fenil sulfona, I + abamectina, I + acequinocilo, I + acetoprol, I + acrinatrina, I + aldicarb, I + aldoxycarb, I + alfa-cipermetrina, I + amiditiona, I + amidoflumet, I + amidotioato, I + amiton, I + hidrogenooxalato de amiton, I + amitraz, I + aramite, I + óxido arsenioso, I + AVI 382, I + AZ 60541, I + azinfós-etilo, I + azinfós-metilo, I + azobenceno, I + azociclotina, I + azotoato, I + benomilo, I + benoxafós, I + benzoximato, I + benzoato de bencilo, I + bifenazato, I + bifentrina, I + binapacril, I + brofenvalerato, I + bromocicleno, I + bromofós, I + bromofós-etilo, I + bromopropilato, I + buprofezina, I + butocarboxim, I + butoxicarboxim, I + butilpiridabeno, I + polisulfuro de calcio, I + camfeclor, I + carbanolato, I + carbarilo, I + carbofurano, I + carbofenotona, I + CGA 50'439, I + quinometionat, I + clorbensido, I + clordimeform, I + clorhidrato de clordimeform, I + clorfenapir, I + clorfenetol, I + clorfensona, I + clorfensulfuro, I + clorfenvinfós, I + clorobencilato, I + cloromebuform, I + clorometiurona, I + cloropropilato, I + clorpirifós, I + clorpirifós-metilo, I + clortiofós, I + cinerina I, I + cinerina II, I + cinerinas, I + clofentezina, I + closantel, I + coumafós, I + crotamitona, I + crotoxifós, I + cufraneb, I + ciantoato, I + ciflumetofeno, I + cihalotrina, I + cihexatina, I + cipermetrina, I + DCPM, I + DDT, I + demefiona, I + demefiona-O, I + demefiona-S, I + demetona, I + demetona-metilo, I + demetona-O, I + demetona-O-metilo, I + demetona-S, I + demetona-S-metilo, I + demetona-S-metilsulfona, I + diafentiurona, I + dialifós, I + diazinona, I + diclofluanid, I + diclorvos, I + diclifós, I + dicofol, I + dicrotofós, I + dienoclor, I + dimefox, I + dimetoato, I + dinactina, I + dinex, I + dinex-diclexina, I + dinobutona, I + dinocap, I + dinocap-4, I + dinocap-6, I + dinocetona, I + dinopentona, I + dinosulfona, I + dinoterbona, I + dioxationa, I + difenilsulfona, I + disulfiram, I + disulfotona, I + DNOC, I + dofenapina, I + doramectina, I + endosulfano, I + endotiona, I + EPN, I + eprinomectina, I + etiona, I + etoato-metilo, I + etoxazol, I + etrimfós, I + fenazaflor, I + fenazaquina, I + óxido de fenbutatina, I + fenotiocarb, I + fenpropatrina, I + fenpirad, I + fenpiroximato, I + fenfona, I + fentrifanilo, I + fenvalerato, I + fipronilo, I + fluacripirim, I + fluazurona, I + flubenzimina, I + flucicloxurona, I + flucitrinato, I + fluenetilo, I + flufenoxurona, I + flumetrina, I + fluorbensido, I + fluvalinato, I + FMC 1137, I + formetanato, I + clorhidrato de formetanato, I + formotiona, I + formparanato, I + gamma-HCH, I + gliodina, I + halfenprox, I + heptenofós, I + ciclopropanocarboxilato de hexadecilo, I + hexitiazox, I + yodometano, I + isocarbafós, I + O-(metoxiaminotiofosforil)salicilato de isopropilo, I + ivermectina, I + jasmolina I, I + jasmolina II, I + jodfenfós, I + lindano, I + lufenurona, I + malationa, I + malonobeno, I + mecarbam, I + mefosfolano, I + mesulfeno, I + metacrifós, I + metamidofós, I + metidationa, I + metiocarb, I + metomilo, I + bromuro de metilo, I + metolcarb, I + mevinfós, I + mexacarbato, I + milbemectina, I + oxima de milbemicina, I + mipafox, I + monocrotofós, I + morfotiona, I + moxidectina, I + naled, I + NC-184, I + NC-512, I + nifluridido, I + nikomicinas, I + nitrilacarb, I + complejo 1:1 de cloruro de cinc de nitrilacarb, I + NNI-0101, I + NNI-0250, I + ometoato, I + oxamilo, I + oxideprofós, I + oxidisulfotona, I + pp'-DDT, I + parationa, I + permetrina, I + aceites de petróleo, I + fenkaptona, I + fentoato, I + forato, I + fosalona, I + fosfolano, I + fosfolano, I + fosmet, I + fosfamidona, I + foxim, I + pirimifós-metilo, I + policloroterpenos, I + polinactinas, I + proclonol, I + profenofós, I + promacilo, I + propargita, I + propetamfós, I + propoxur, I + protidationa, I + protoato, I + piretrina I, I + piretrina II, I

- + piretrinas, I + piridabeno, I + piridafentona, I + pirimidifeno, I + pirimitato, I + quinalfós, I + quintiofós, I + R-1492, I + RA-17, I + rotenona, I + schradan I + sebufós, I + selamectina, I + SI-0009, I + sofamida, I + espiroclorfenol, I + espiromesifeno, I + SSI-121, I + sulfiram, I + sulfluramid, I + sulfotep, I + azufre, I + SZI-121, I + tau-fluvalinato, I + tebufenpirad, I + TEPP, I + terbam, I + tetraclorvinfós, I + tetradifona, I + tetranactina, I + tetrasul, I + tifenox, I + tiocarboxima, I + tiofanox, I + tiometona, I + tioquinox, I + turingiensina, I + triamifós, I + triaratenol, I + triazofós, I + triazurona, I + triclorfona, I + trifenofós, I + trinactina, I + vamidotona, I + vaniliprol y I + YI-5302;
- 5 Composiciones que comprenden un antihelmíntico incluyen I + abamectina, I + crufomato, I + doramectina, I + emamectina, I + benzoato de emamectina, I + eprinomectina, I + ivermectina, I + oxima de milbemicina, I + moxidectina, I + piperazina, I + selamectina, I + spinosad y I + tiofanato;
- 10 Composiciones que comprenden un avicida incluyen I + cloralosa, I + endrina, I + fentiona, I + piridin-4-amina y I + estriquina;
- Composiciones que comprenden un agente de control biológico incluyen I + *Adoxophyes orana* GV, I + *Agrobacterium radiobacter*, I + *Amblyseius* spp., I + *Anagrapha falcifera* NPV, I + *Anagrus atomus*, I + *Aphelinus abdominalis*, I + *Aphidius colemani*, I + *Aphidoletes aphidimyza*, I + *Autographa californica* NPV, I + *Bacillus firmus*, I + *Bacillus sphaericus* Neide, I + *Bacillus thuringiensis* Berliner, I + *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*, I + *Bacillus thuringiensis* subsp. *israelensis*, I + *Bacillus thuringiensis* subsp. *japonensis*, I + *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, I + *Bacillus thuringiensis* subsp. *tenebrionis*, I + *Beauveria bassiana*, I + *Beauveria brongniartii*, I + *Chrysoperla carnea*, I + *Cryptolaemus montrouzieri*, I + *Cydia pomonella* GV, I + *Dacnusa sibirica*, I + *Diglyphus isaea*, I + *Encarsia formosa*, I + *Eretmocerus eremicus*, I + *Helicoverpa zea* NPV, I + *Heterorhabditis bacteriophora* y *H. megidis*, I + *Hippodamia convergens*, I + *Leptomastix dactylopii*, I + *Macrolophus caliginosus*, I + *Mamestra brassicae* NPV, I + *Metaphycus helvolus*, I + *Metarhizium anisopliae* var. *acidum*, I + *Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae*, I + *Neodiprion sertifer* NPV y *N. lecontei* NPV, I + *Orius* spp., I + *Paecilomyces fumosoroseus*, I + *Phytoseiulus persimilis*, I + *Spodoptera exigua* virus de la poliedrosis nuclear multicápsida, I + *Steinernema bibionis*, I + *Steinernema carpocapsae*, I + *Steinernema feltiae*, I + *Steinernema glaseri*, I + *Steinernema riobrave*, I + *Steinernema riobrave*, I + *Steinernema scapterisci*, I + *Steinernema* spp., I + *Trichogramma* spp., I + *Typhlodromus occidentalis* e I + *Verticillium lecanii*;
- 15 Composiciones que comprenden un esterilizante del suelo incluyen I + yodometano y bromuro de metilo;
- Composiciones que comprenden un quimioesterilizante incluyen I + afolato, I + bisazir, I + busulfano, I + diflubenzurona, I + dimatif, I + hemel, I + hempa, I + metepa, I + metiotepa, I + afolato de metilo, I + morzid, I + penflurona, I + tepa, I + tiohempa, I + tiotepa, I + tretamina y I + uredepa;
- 20 Composiciones que comprenden una feromona de insectos incluyen I + acetato de (E)-dec-5-en-1-ilo con (E)-dec-5-en-1-ol, I + acetato de (E)-tridec-4-en-1-ilo, I + (E)-6-metilhept-2-en-4-ol, I + acetato de (E,Z)-tetradeca-4,10-dien-1-ilo, I + acetato de (Z)-dodec-7-en-1-ilo, I + (Z)-hexadec-11-enal, I + acetato de (Z)-hexadec-11-en-1-ilo, I + acetato de (Z)-hexadec-13-en-11-in-1-ilo, I + (Z)-icos-13-en-10-ona, I + acetato de (Z)-tetradec-7-en-1-ol, I + (Z)-tetradec-9-en-1-ol, I + acetato de (Z)-tetradec-9-en-1-ilo, I + acetato de (7E,9Z)-dodeca-7,9-dien-1-ilo, I + acetato de (9Z,11E)-tetradeca-9,11-dien-1-ilo, I + acetato de (9Z,12E)-tetradeca-9,12-dien-1-ilo, I + 14-metiloctadec-1-eno, I + 4-metilnonan-5-ol con 4-metilnonan-5-ona, I + alfa-multistriatina, I + brevicomina, I + codlure, I + codlemona, I + cuelure, I + disparture, I + acetato de dodec-8-en-1-ilo, I + acetato de dodec-9-en-1-ilo, I + dodeca-8, I + acetato de 10-dien-1-ilo, I + dominicalure, I + 4-metiloctanoato de etilo, I + eugenol, I + frontalina, I + gossypure, I + grandlure, I + grandlure I, I + grandlure II, I + grandlure III, I + grandlure IV, I + hexalure, I + ipsdienol, I + ipsenol, I + japonilure, I + lineatina, I + litlure, I + looplure, I + medlure, I + ácido megatomoico, I + metil eugenol, I + muscalure, I + acetato de octadeca-2,13-dien-1-ilo, I + acetato de octadeca-3,13-dien-1-ilo, I + orflure, I + orictalure, I + ostromona, I + siglure, I + sordidina, I + sulcatol, I + acetato de tetradec-11-en-1-ilo, I + trimedlure, I + trimedlure A, I + trimedlure B₁, I + trimedlure B₂, I + trimedlure C y I + truncall;
- 25 Composiciones que comprenden un repelente de insectos incluyen I + 2-(octiltio)etanol, I + butopironoxilo, I + butoxi(polipropilenglicol), I + adipato de dibutilo, I + ftalato de dibutilo, I + succinato de dibutilo, I + dietiltoluamida, I + carbato de dimetilo, I + ftalato de dimetilo, I + etil hexanodiol, I + hexamida, I + metoquina-butilo, I + metilneodecanamida, I + oxamato y I + picaridina;
- 30 Composiciones que comprenden un insecticida incluyen I + 1-dicloro-1-nitroetano, I + 1,1-dicloro-2,2-bis(4-etilfenil)etano, I + 1,2-dicloropropano, I + 1,2-dicloropropano con 1,3-dicloropropeno, I + 1-bromo-2-cloroetano, I + acetato de 2,2,2-tricloro-1-(3,4-diclorofenil)etilo, I + fosfato de 2,2-diclorovinil 2-etilsulfinitil metilo, I + dimetilcarbamato de 2-(1,3-ditiolan-2-il)fenilo, I + tiocianato de 2-(2-butoxi)etilo, I + metilcarbamato de 2-(4,5-dimetil-1,3-dioxolan-2-il)fenilo, I + 2-(4-cloro-3,5-xililoxi)etanol, I + fosfato de 2-clorovinil dietilo, I + 2-imidazolidona, I + 2-isovalerilindan-1,3-diona, I + metilcarbamato de 2-metil(prop-2-inil)aminofenilo, I + laurato de 2-tiocianatoetilo, I + 3-bromo-1-cloroprop-1-eno, I + dimetilcarbamato de 3-metil-1-fenilpirazol-5-ilo, I + metilcarbamato de 4-metil(prop-2-inil)amino-3,5-xililo, I + dimetilcarbamato de 5,5-dimetil-3-oxociclohex-1-enilo, I + abamectina, I + acefato, I + acetamiprid, I + acetona, I + acetoprol, I + acrinatrina, I + acrilonitrilo, I + alanicarb, I + aldicarb, I + aldixcarb, I + aldrina, I + aletrina, I + alosamidina, I + alixicarb, I + alfa-cipermetrina, I + alfa-ecdisona, I + fosforo de aluminio, I + amiditiona, I + amidotioato, I + aminocarb, I + amiton, I + hidrogenooxalato de amiton, I + amitraz, I + anabasina, I + atidationa, I + AVI 382, I + AZ 60541, I + azadiractina, I + azametifós, I + azinfós-etilo, I + azinfós-metilo, I + azotoato, I + endotoxinas delta de *Bacillus thuringiensis*, I + hexafluorosilicato de bario, I + polisulfuro de bario, I + barrina, I + Bayer 22/190, I + Bayer 22408, I + bendiocarb, I + benfuracarb, I + bensultap, I + beta-ciflutrina, I + beta-cipermetrina, I + bifentrina, I + bioaletrina, I + S-ciclohexenil isómero de bioaletrina, I + bioetanometrina, I + biopermetrina, I + bioresmetrina, I + éter bis(2-cloroetil)ico, I + bistriflurona, I + bórax, I + brofenvalerato, I + brofenvinfós, I + bromocicleno, I + bromo-DDT, I + bromofós, I + bromofós-etilo, I + bufencarb, I + buprofezina, I + butacarb, I + butatiófós, I + butocarboxim, I + butonato, I + butoxicarboxim, I + butilpiridabeno, I + cadusafós, I + arseniato de calcio, I + cianuro
- 35
40
45
50
55
60
65

de calcio, I + polisulfuro de calcio, I + camfeclor, I + carbanolato, I + carbarilo, I + carbofurano, I + disulfuro de carbono, I + tetracloruro de carbono, I + carbofenotiona, I + carbosulfano, I + cartap, I + clorhidrato de cartap, I + cevadina, I + clorbiciclono, I + clordano, I + clordecona, I + clordimeform, I + clorhidrato de clordimeform, I + cloretoxifós, I + clorfenapir, I + clorfenvinfós, I + clorfluzaurona, I + clormefós, I + cloroformo, I + cloropicrina, I + clorfoxima, I + clorprazofós, I + clorpirifós, I + clorpirifós-metilo, I + clortiofós, I + cromafenozida, I + cinerina I, I + cinerina II, I + cinerinas, I + cis-resmetrina, I + cismetrina, I + clocitrina, I + cloetocarb, I + closantel, I + clotianidina, I + acetoarsenito de cobre, I + arseniato de cobre, I + oleato de cobre, I + coumafós, I + coumitoato, I + crotamitona, I + crotoxifós, I + crufomato, I + criolita, I + CS 708, I + cianofenfós, I + cianofós, I + ciantoato, I + cicetrina, I + cicloprotrina, I + ciflutrina, I + cihalotrina, I + cipermetrina, I + cifenotrina, I + ciromazina, I + citioato, I + *d*-limoneno, I + *d*-tetrametrina, I + DAEP, I + dazomet, I + DDT, I + decarbofurano, I + deltametrina, I + demefiona, I + demefiona-O, I + demefiona-S, I + demetona, I + demetona-metilo, I + demetona-O, I + demetona-O-metilo, I + demetona-S, I + demetona-S-metilo, I + demetona-S-metilsulfona, I + diafentiurona, I + dialifós, I + diamidafós, I + diazinona, I + dicaptona, I + diclofentona, I + diclorvos, I + diclifós, I + dicresilo, I + dicrotofós, I + dicitlanilo, I + dieldrina, I + fosfato de dietil 5-metilpirazol-3-ilo, I + diflubenzurona, I + dilor, I + dimeflutrina, I + dimefox, I + dimetano, I + dimetona, I + dimetrina, I + dimetilvinfós, I + dimetilano, I + dinex, I + dinex-diclexina, I + dinoprop, I + dinosam, I + dinoseb, I + dinotefurano, I + diofenolano, I + dioxabenzofós, I + dioxacarb, I + dioxationa, I + disulfotona, I + diticrofós, I + DNOC, I + doramectina, I + DSP, I + ecdisterona, I + EI 1642, I + emamectina, I + benzoato de emamectina, I + EMPC, I + empentrina, I + endosulfano, I + endotiona, I + endrina, I + EPBP, I + EPN, I + epofenonano, I + eprinomectina, I + esfenvalerato, I + etafós, I + etiofencarb, I + etiona, I + etiprol, I + etoato-metilo, I + etopofós, I + formiato de etilo, I + etil-DDD, I + dibromuro de etileno, I + dicloruro de etileno, I + óxido de etileno, I + etofenprox, I + etrimfós, I + EXD, I + famfur, I + fenamifós, I + fenazaflor, I + fenclorfós, I + fenetacarb, I + fenflutrina, I + fenitrotiona, I + fenobucarb, I + fenoxacrim, I + fenoxicarb, I + fenpiritrina, I + fenpropatrina, I + fenpirad, I + fensulfotona, I + fentiona, I + fentiona-etilo, I + fenvalerato, I + fipronilo, I + flonicamid, I + flubendiamida, I + flucofurona, I + flucicloxurona, I + flucitrinato, I + fluenetilo, I + flufenerim, I + flufenoxurona, I + flufenprox, I + flumetrina, I + fluvalinato, I + FMC 1137, I + fonofós, I + formetanato, I + clorhidrato de formetanato, I + formotiona, I + formparanato, I + fosmetilano, I + fospirato, I + fostiazato, I + fostietano, I + furatiocarb, I + furetrina, I + gamma-cihalotrina, I + gamma-HCH, I + guazatina, I + acetatos de guazatina, I + GY-81, I + halfenprox, I + halofenozida, I + HCH, I + HEOD, I + heptaclor, I + heptenofós, I + heterofós, I + hexaflumurona, I + HHND, I + hidrametilnona, I + cianuro de hidrógeno, I + hidropreno, I + hiquincarb, I + imidacloprid, I + imiprotrina, I + indoxacarb, I + yodometano, I + IPSP, I + isazofós, I + isobenzano, I + isocarbófós, I + isodrina, I + isofenfós, I + isolano, I + isoprocarb, I + *O*-(metoxi-aminotiofosforil)salicilato de isopropilo, I + isoprotiolano, I + isotioato, I + isoxationa, I + ivermectina, I + jasmolina I, I + jasmolina II, I + jodfenfós, I + hormona juvenil I, I + hormona juvenil II, I + hormona juvenil III, I + kelevano, I + kinopreno, I + lambda-cihalotrina, I + arseniato de plomo, I + lepimectina, I + leptofós, I + lindano, I + lirimfós, I + lufenurona, I + litidationa, I + metilcarbamato de *m*-cumenilo, I + fosfuro de magnesio, I + malationa, I + malonobeno, I + mazidox, I + mecarbom, I + mecarfona, I + menazona, I + mefosfolano, I + cloruro mercurioso, I + mesulfenfós, I + metaflumizona, I + metam, I + metam-potasio, I + metam-sodio, I + metacrifós, I + metamidofós, I + fluoruro de metanosulfonilo, I + metidationa, I + metiocarb, I + metocrotofós, I + metomilo, I + metopreno, I + metoquina-butilo, I + metotrina, I + metoxiclor, I + metoxifeno, I + bromuro de metilo, I + isotiocianato de metilo, I + metilcloroformo, I + cloruro de metileno, I + metoflutrina, I + metolcarb, I + metoxadiazona, I + mevinfós, I + mexacarbato, I + milbemectina, I + oxima de milbemicina, I + mipafox, I + mirex, I + monocrotofós, I + morfotiona, I + moxidectina, I + naftalofós, I + naled, I + naftaleno, I + NC-170, I + NC-184, I + nicotina, I + sulfato de nicotina, I + nifluridido, I + nitenpiram, I + nitiazina, I + nitrilacarb, I + complejo 1:1 de cloruro de cinc de nitrilacarb, I + NNI-0101, I + NNI-0250, I + nornicotina, I + novalurona, I + noviflumurona, I + etilfosforotioato de *O*-5-dicloro-4-yodofenil *O*-etilo, I + fosforotioato de *O,O*-dietil *O*-4-metil-2-oxo-2*H*-cromen-7-ilo, I + fosforotioato de *O,O*-dietil *O*-6-metil-2-propilpirimidin-4-ilo, I + ditiopirofosfato de *O,O,O',O'*-tetrapropilo, I + ácido oleico, I + ometoato, I + oxamilo, I + oxidemetona-metilo, I + oxideprofós, I + oxidisulfotona, I + pp'-DDT, I + para-diclorobenceno, I + parationa, I + parationa-metilo, I + penflurona, I + pentaclorofenol, I + laurato de pentaclorofenilo, I + permetrina, I + aceites de petróleo, I + PH 60-38, I + fenkaptona, I + fenotrina, I + fentoato, I + forato+ TX, I + fosalona, I + fosfolano, I + fosmet, I + fosniclor, I + fosamidona, I + fosfina, I + foxim, I + foxim-metilo, I + pirimetafós, I + pirimicarb, I + pirimifós-etilo, I + pirimifós-metilo, I + isómeros de policlorodociclopentadieno, I + policloroterpenos, I + arsenito de potasio, I + tiocianato de potasio, I + praletrina, I + precoceno I, I + precoceno II, I + precoceno III, I + primidofós, I + profenofós, I + proflutrina, I + promacilo, I + promecarb, I + propafós, I + propetamfós, I + propoxur, I + protidationa, I + protiofós, I + protoato, I + protrifenbuta, I + pimetozina, I + piraclófós, I + pirazofós, I + piresmetrina, I + piretrina I, I + piretrina II, I + piretrinas, I + piridabeno, I + piridalilo, I + piridafentona, I + pirimidifeno, I + pirimitato, I + piriproxifeno, I + quassia, I + quinalfós, I + quinalfós-metilo, I + quinotiona, I + quintiofós, I + R-1492, I + rafoxanida, I + resmetrina, I + rotenona, I + RU 15525, I + RU 25.475, I + riania, I + rianodina, I + sabadilla, I + schradano, I + sebufós, I + selamectina, I + SI-0009, I + SI-0205, I + SI-0404, I + SI-0405, I + silafluofeno, I + SN 72129, I + arsenito de sodio, I + cianuro de sodio, I + fluoruro de sodio, I + hexafluorosilicato de sodio, I + pentaclorofenóxido de sodio, I + selenato de sodio, I + tiocianato de sodio, I + sofamida, I + spinosad, I + espiromesifeno, I + espirotetmat, I + sulcofurona, I + sulcofurona-sodio, I + sulfuramid, I + sulfotep, I + fluoruro de sulfurilo, I + sulprofós, I + aceites de alquitrán, I + tau-fluvalinato, I + tazimcarb, I + TDE, I + tebufenozida, I + tebufenpirad, I + tebupirimfós, I + teflubenzurona, I + teflutrina, I + temefós, I + TEPP, I + teraletrina, I + terbam, I + terbufós, I + tetracloroetano, I + tetraclorvinfós, I + tetrametrina, I + teta-cipermetrina, I + tiacloprid, I + tiafenox, I + tiametoxam, I + ticrofós, I + tiocarboxima, I + tiociclám, I + hidrogenooxalato de tiociclám, I + tiodicarb, I + tiofanox, I + tiometona, I + tionazina, I + tiosultap, I + tiosultap-sodio, I + turingiensina, I + tolfenpirad, I + tralometrina, I + transflutrina, I + transpermetrina, I + triamifós, I + triazamato, I + triazofós, I + triazurona, I + triclorfona, I + triclormetafós-3, I + tricloronat, I + trifenofós, I + triflumurona, I + trimetacarb, I + tripreno, I + vamidotona, I + vaniliprol, I + veratrídina, I + veratrina, I + XMC, I + xililcarb, I + YI-5302, I + zeta-cipermetrina, I + zetametrina, I + fosfuro de cinc,

I + zolaprotóf y ZXI 8901, I + ciantraniliprol, I + clorantraniliprol, I + cienopirafeno, I + ciflumetofeno, I + pirifluquinazona, I + espinetoram, I + espirotetramat, I + sulfoxaflor, I + flufiprol, I + meperflutrina, I + tetrametilflutrina, I + triflumezopirim; Composiciones que comprenden un molusquicida incluyen I + óxido de bis(tributilestaño), I + bromoacetamida, I + arseniato de calcio, I + cloetocarb, I + acetoarsenito de cobre, I + sulfato de cobre, I + fentina, I + fosfato férrico, I + metaldehído, I + metiocarb, I + niclosamida, I + niclosamida-olamina, I + pentaclorofenol, I + pentaclorofenóxido de sodio, I + tazimcarb, I + tiodicarb, I + óxido de tributilestaño, I + trifenmorf, I + trimetacarb, I + acetato de trifenilestaño e hidróxido de trifenilestaño, I + piriprol;

Composiciones que comprenden un nematocida incluyen I + AKD-3088, I + 1,2-dibromo-3-cloropropano, I + 1,2-dicloropropano, I + 1,2-dicloropropano con 1,3-dicloropropeno, I + 1,3-dicloropropeno, I + 1,1-dióxido de 3,4-diclorotetrahidrotiofeno, I + 3-(4-clorofenil)-5-metilrodanina, I + ácido 5-metil-6-tioxo-1,3,5-tiadiazinan-3-ilacético, I + 6-isopentenilaminopurina, I + abamectina, I + acetoprol, I + alanicarb, I + aldicarb, I + aldoxicarb, I + AZ 60541, I + benclotiaz, I + benomilo, I + butilpiridabeno, I + cadusafós, I + carbofurano, I + disulfuro de carbono, I + carbosulfano, I + cloropicrina, I + clorpirifós, I + cloetocarb, I + citocininas, I + dazomet, I + DBCP, I + DCIP, I + diamidafós, I + diclofentona, I + diclifós, I + dimetoato, I + doramectina, I + emamectina, I + benzoato de emamectina, I + eprinomectina, I + etoprofós, I + dibromuro de etileno, I + fenamifós, I + fenpirad, I + fensulfotona, I + fostiazato, I + fostietano, I + furfural, I + GY-81, I + heterofós, I + yodometano, I + isamidofós, I + isazofós, I + ivermectina, I + cinetina, I + mecarfona, I + metam, I + metam-potasio, I + metam-sodio, I + bromuro de metilo, I + isotiocianato de metilo, I + oxima de milbemicina, I + moxidectina, I + composición de *Myrothecium verrucaria*, I + NC-184, I + oxamilo, I + forato, I + fosfamidona, I + fosfocarb, I + sebufós, I + selamectina, I + spinosad, I + terbam, I + terbufós, I + tetraclorotiofeno, I + tiafenox, I + tionazina, I + triazofós, I + triazurona, I + xilenoles, I + YI-5302 y zeatina, I + fluensulfona;

Composiciones que comprenden un compuesto sinérgico incluyen I + piperonilato de 2-(2-butoxi)etilo, I + 5-(1,3-benzodioxol-5-il)-3-hexilciclohex-2-enona, I + farnesol con nerolidol, I + MB-599, I + MGK 264, I + butóxido de piperonilo, I + piprotal, I + isómero de propilo, I + S421, I + sesamex, I + sesasmolina y I + sulfóxido;

Composiciones que comprenden un repelente de animales incluyen I + antraquinona, I + cloralosa, I + naftenato de cobre, I + oxiclورو de cobre, I + diazinona, I + dicitlopentadieno, I + guazatina, I + acetatos de guazatina, I + metiocarb, I + piridin-4-amina, I + tiram, I + trimetacarb, I + naftenato de cinc y I + ziram;

Composiciones adicionales incluyen I + broflutrinato, I + cicloxaprid, I + diflovidazina, I + flometoquina, I + fluhexafona, I + guadipir, I + virus de la granulosis por *Plutella xylostella* I + virus de la granulosis por *Cydia pomonella* I + harpina, I + imiciáfós, I + nucleopoliedrovirus de *Heliothis virescens* I + nucleopoliedrovirus de *Heliothis punctigera* I + nucleopoliedrovirus de *Helicoverpa armigera* I + nucleopoliedrovirus de *Helicoverpa zea* I + nucleopoliedrovirus de *Spodoptera frugiperda* I + nucleopoliedrovirus de *Plutella xylostella* I + *Pasteuria nishizawae* I + p-cimeno, I + piflubumida, I + pirafiluprol, I + pretrum, I + QRD 420, I + QRD 452, I + QRD 460, I + mezclas de terpenoides, I + terpenoides, I + traniliprol, y I + α -terpeno;

La composición también incluye mezclas de compuesto de fórmula I y una sustancia activa denominada por un código, tal como I + código AE 1887196 (BSC-BX60309), I + código NNI-0745 GR, I + código IKI-3106, I + código JT-L001, I + código ZNQ-08056, I + código IPPA152201, I + código HNPC-A9908 (CAS: [660411-21-2]), I + código HNPC-A2005 (CAS: [860028-12-2]), I + código JS118, I + código ZJ0967, I + código ZJ2242, I + código JS7119 (CAS: [929.545-74-4]), I + código SN-1172, I + código HNPC-A9835, I + código HNPC-A9955, I + código HNPC-A3061, I + código Chuanhua 89-1, I + código IPP-10, I + código ZJ3265, I + código JS9117, I + código SYP-9080, I + código ZJ3757, I + código ZJ4042, I + código ZJ4014, I + código ITM-121, I + código DPX-RAB55 (DKI-2301), I + código Me5382, I + código NC-515, I + código NA-89, I + código MIE-1209, I + código MCI-8007, I + código BCS-CL73507, I + código S-1871, I + código DPX-RDS63, y I + código AKD-1193.

La mezcla de principios activos de los compuestos de fórmula I seleccionados de las Tablas 1 a 13 con los principios activos arriba descritos comprende un compuesto seleccionado de las Tablas 1 a 13 y un ingrediente activo tal como se describe arriba, preferiblemente en una relación de mezcla de 100:1 a 1:6000, especialmente de 50:1 a 1:50, más especialmente en una relación de 20:1 a 1:20, aún más especialmente de 10:1 a 1:10, muy especialmente de 5:1 y 1:5, dándose preferencia especial a una relación de 2:1 a 1:2, siendo igualmente preferida una relación de 4:1 a 2:1, sobre todo en una relación de 1:1 o 5:1 o 5:2 o 5:3 o 5:4 o 4:1 o 4:2 o 4:3 o 3:1 o 3:2 o 2:1 o 1:5 o 2:5 o 3:5 o 4:5 o 1:4 o 2:4 o 3:4 o 1:3 o 2:3 o 1:2 o 1:600 o 1:300 o 1:150 o 1:35 o 2:35 o 4:35 o 1:75 o 2:75 o 4:75 o 1:6000 o 1:3000 o 1:1500 o 1:350 o 2:350 o 4:350 o 1:750 o 2:750 o 4:750. Estas relaciones de mezcla están en peso.

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

Las mezclas que comprenden un compuesto de fórmula I seleccionado de las Tablas 1 a 13 y uno o más ingredientes activos como se describió arriba se pueden aplicar, por ejemplo, en una forma de "mezcla lista» única, en una mezcla combinada en aerosol compuesta de formulaciones separadas de los componentes del ingrediente activo único, tal como una "mezcla de tanque", y en un uso combinado de los ingredientes activos individuales cuando se aplican de manera secuencial, es decir, uno después del otro con un período razonablemente corto, tales como unas pocas horas o días. El orden de aplicación de los compuestos de fórmula I seleccionados de las Tablas 1 a 13 y los ingredientes activos tal como se describió arriba no es esencial para poner en práctica la presente invención.

65

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

Las composiciones de acuerdo con la invención se preparan de una manera conocida per se, en ausencia de auxiliares, por ejemplo, moliendo, tamizando y/o comprimiendo un ingrediente activo sólido y en presencia de al menos un auxiliar, por ejemplo, mezclando íntimamente y/o moliendo el ingrediente activo con el auxiliar (auxiliares). Estos procedimientos para la preparación de las composiciones y el uso de los compuestos I para la preparación de estas composiciones también son un objeto de la invención.

Los métodos de aplicación para las composiciones, es decir, los métodos para controlar las plagas del tipo arriba mencionado, tales como pulverización, atomización, desempolvado, cepillado, desinfección, dispersión o vertido, que deben seleccionarse para adaptarse a los objetivos previstos de las circunstancias imperantes - y el uso de las composiciones para controlar las plagas del tipo mencionado anteriormente son otros objetos de la invención. Tasas típicas de concentración están entre 0,1 y 1000 ppm, preferiblemente entre 0,1 y 500 ppm, de ingrediente activo. La tasa de aplicación por hectárea es generalmente de 1 a 2000 g de ingrediente activo por hectárea, en particular de 10 a 1000 g/ha, preferiblemente de 10 a 600 g/ha.

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

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

Por lo tanto, la invención se refiere a un método para la protección del material de propagación vegetal frente al ataque de plagas, que comprende tratar el material de propagación o el sitio en donde se planta el material de propagación, con un compuesto de fórmula (I) o con una composición como se define arriba, que comprende al menos un compuesto de fórmula I o, cuando sea apropiado, un tautómero del mismo, en cada caso en forma libre o en forma de sal agroquímicamente utilizable, como ingrediente activo y al menos una composición auxiliar.

El término semilla abarca semillas y propágulos de plantas de todo tipo, incluidas, pero no limitadas a semillas verdaderas, trozos de semillas, retoños, callos, bulbos, frutos, tubérculos, granos, rizomas, esquejes, brotes cortados y similares, y medios en una realización preferida de semillas verdaderas.

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

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

Ejemplos Biológicos (% = porcentaje en peso, a menos que se especifique lo contrario)

Ejemplo B1 *Soodootera littoralis* (Gusano de la hoja de algodón egipcio)

5 Se colocaron discos de hojas de algodón en agar en placas de microtitulación de 24 pocillos y se rociaron con
soluciones de ensayo acuosas preparadas a partir de soluciones madre de DMSO de 10.000 ppm. Después de
secarlos, los discos de hojas se infestaron con cinco larvas L1. Se evaluó la mortalidad de las muestras, el efecto anti-
alimentador y la inhibición del crecimiento en comparación con las muestras no tratadas 3 días después de la
infestación. El control de *Spodoptera littoralis* por una muestra de ensayo es cuando al menos uno de mortalidad,
10 efecto anti-alimentador e inhibición del crecimiento es mayor que la muestra no tratada.

Los siguientes compuestos dieron como resultado al menos un 80% de control a una velocidad de aplicación de 200
ppm: P1, P2, P3, P17, P18, P19, P21, P27, P29, P31, P32, P33, P34, P35 y P36.

15 **Ejemplo B2: *Plutella xylostella* (Palomilla dorso de diamante)**

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

Los siguientes compuestos dieron un efecto de al menos un 80 % en al menos una de las dos categorías (mortalidad
o inhibición del crecimiento) a una tasa de aplicación de 200 ppm: P1, P2, P3, P4, P12, P13, P14, P15, P17, P18, P19,
P22, P29, P30, P31, P32, P33, P34, P35 y P36.

25

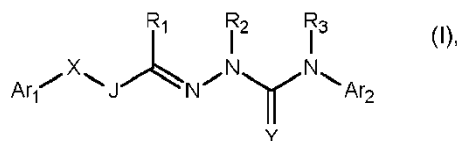
Ejemplo B3: *Diabrotica balteata* (Gusano de la raíz del maíz)

Brotos de maíz, colocados sobre una capa de agar en placas de microtitulación de 24 pocillos se trataron con
soluciones de ensayo acuosas preparadas a partir de soluciones madre de DMSO de 10 000 ppm mediante
30 pulverización. Después del secado, las placas fueron infestadas con larvas L2 (6 a 10 por pocillo). Se evaluó la
mortalidad y la inhibición del crecimiento de las muestras en comparación con las muestras no tratadas 4 días después
de la infestación.

Los siguientes compuestos dieron un efecto de al menos un 80 % en al menos una de las dos categorías (mortalidad
o inhibición del crecimiento) a una tasa de aplicación de 200 ppm: P1, P2, P3, P13, P14, P15, P17, P21, P29, P35 y
35 P36.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula I,



5 en el que,

Ar₁ y Ar₂ son, independientemente uno del otro, fenilo, tienilo, piridilo, pirimidinilo, pirazinilo, piridazinilo, furanilo, en donde dicho fenilo, tienilo, piridilo, pirimidinilo, pirazinilo, piridazinilo, furanilo pueden estar sustituidos con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, haloalquil C₁-C₃-cicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halógeno, ciano, ciano-alquilo C₁-C₄ ciano-cicloalquilo C₃-C₆, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfínilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfoximino, alquil C₁-C₄amino, dialquil C₂-C₆amino, cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₁-C₄-cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₂-C₄carbonilo, CHO, alcoxi C₂-C₆carbonilo, haloalcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, haloalquil C₂-C₆aminocarbonilo o dialquil C₂-C₈aminocarbonilo;

X es un enlace directo, O, S, SO₂, CR₄R₅ o NR₆;

Y es oxígeno o azufre;

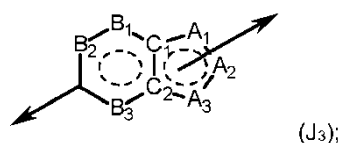
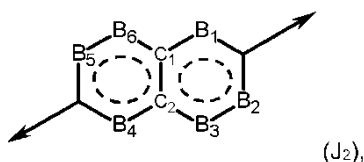
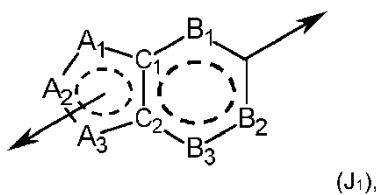
R₁ es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o alcoxi C₁-C₃;

R₂ y R₃ son, independientemente uno de otro, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalquil C₁-C₄sulfínilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfínilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆aminocarbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆aminocarbonilo o alcoxi C₁-C₄amino-alquilo C₁-C₄; con la condición de que cuando

R₂ y R₃ son diferentes de hidrógeno, R₂ y R₃ pueden estar sustituidos con uno a tres sustituyentes independientemente seleccionados del grupo que consiste en alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfínilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfoximino, alquil C₁-C₄amino, dialquil C₂-C₆amino, cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₁-C₄-cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo y dialquil C₂-C₈aminocarbonilo;

R₄, R₅ y R₆ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o alcoxi C₁-C₃;

J es un sistema de anillo bicíclico aromático o no aromático seleccionado de J₁, J₂ y J₃,



40 en donde



45 indica que el anillo es aromático o no aromático;

en el que las flechas muestran la conectividad según se representa en la fórmula (I), en donde

A₁ es nitrógeno, N-R_{7a}, azufre, oxígeno o C-R_{7b};

A₂ es nitrógeno, N-R_{8a}, azufre, oxígeno o C-R_{8b};

A₃ es nitrógeno, N-R_{9a}, azufre, oxígeno o C-R_{9b};

5 B₁ es nitrógeno o C-R₁₀;

B₂ es nitrógeno o C-R₁₁ ;

B₃ es nitrógeno o C-R₁₂ ;

B₄ es nitrógeno o C-R₁₃ ;

B₅ es nitrógeno o C-R₁₄;

10 B₆ es nitrógeno o C-R₁₅;

C₁ es nitrógeno C o C-R₁₆;

C₂ es nitrógeno, C o C-R₁₇ ;

con las condiciones de que

15 a) no más de dos sustituyentes A pueden ser oxígeno o azufre,

b) cuando dos sustituyentes A son oxígeno y/o azufre, estos sustituyentes son A₁ y A₃, y A₂ es C-R_{8b}, y

c) cuando C₁ es N, entonces C₂ es C o C-R₁₆ y cuando C₂ es N, entonces C₁ es C o C-R₁₇;

20 cada uno de R_{7a}, R_{7b}, R_{8a}, R_{8b}, R_{9a}, R_{9b}, R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₁₃, R₁₄, R₁₅, R₁₆ y R₁₇ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, hidroxilo, =O, CHO, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, haloalquil C₁-C₄tio, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfonil-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄sulfoximino-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄amino, dialquil C₂-C₄amino, cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₁-C₆-cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxilo C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆aminocarbonilo, alcoxilo C₂-C₆carboniloxi, alquil C₂-C₆aminocarboniloxi, dialquil C₃-C₆aminocarboniloxi, alcoxilo C₁-C₄imino-alquilo C₁-C₄, -CONHSO₂-alquilo C₁-C₆, -CONHSO₂N(alquilo C₁-C₆)₂ o trialquil C₃-C₆sililo;

o una sal, estereoisómero, tautómero y N-óxido agroquímicamente aceptable de los compuestos de fórmula I; con la condición de que los compuestos seleccionados de

30 (2E)-1-metil-2-[[6-(3-piridinil)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]metileno]-N-[4-(trifluorometil)fenil]-hidrazinacarbotoamida,

(2E)-N-(4-metoxifenil)-1-metil-2-[[6-(3-piridinil)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]metileno]-hidrazinacarbotoamida,

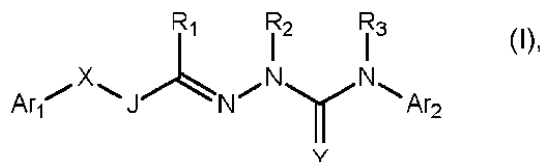
(2E)-N-(4-cianofenil)-1-metil-2-[[6-(3-piridinil)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]metileno]-hidrazinacarbotoamida,

(2E)-N-(5-fluoro-2-metilfenil)-1-metil-2-[[6-(3-piridinil)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]metileno]-hidrazinacarboxamida,

35 (2E)-N-(2-fluoro-5-metilfenil)-1-metil-2-[[6-(3-piridinil)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]metileno]-hidrazinacarboxamida,

(2E)-1-metil-N-(4-metilfenil)-2-[[6-(3-piridinil)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]metileno]-hidrazinacarboxamida y (2E)-1-metil-N-(fenilmetil)-2-[[6-(3-piridinil)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]metileno]-hidrazinacarboxamida estén excluidos del alcance.

2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1,



40

en donde

45 Ar₁ y Ar₂ son, independientemente uno del otro, fenilo, tienilo, piridilo, pirimidinilo, pirazinilo, piridazinilo, furanilo, en donde dicho fenilo, tienilo, piridilo, pirimidinilo, pirazinilo, piridazinilo, furanilo pueden estar sustituidos con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, haloalquil C₁-C₃-cicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halógeno, ciano, ciano-alquilo C₁-C₄, ciano-cicloalquilo C₃-C₆, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfoximino, alquil C₁-C₄amino, dialquil C₂-C₆amino, cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₁-C₄-cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₂-C₄carbonilo, CHO, alcoxi C₂-C₆carbonilo, haloalcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, haloalquil C₂-C₆aminocarbonilo o dialquil C₂-C₆aminocarbonilo;

X es un enlace directo, O, S, SO₂, CR₄R₅ o NR₆;

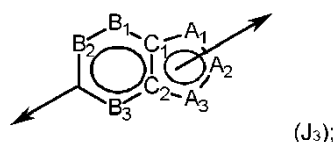
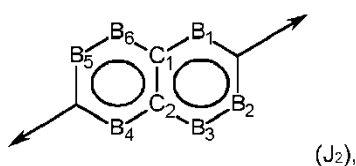
Y es oxígeno o azufre;

55 R₁ es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o alcoxi C₁-C₃;

R₂ y R₃ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆aminocarbonilo, alcoxi C₂-C₆aminocarboniloxi, alquil C₂-C₆aminocarboniloxi, dialquil C₃-C₆aminocarboniloxi o alcoxi C₁-C₄imino-alquilo C₁-C₄; con la condición de que

60 cuando R₂ y R₃ son diferentes de hidrógeno, R₂ y R₃ pueden estar sustituidos con uno a tres sustituyentes

independientemente seleccionados del grupo que consiste en alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfino, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfoximino, alquil C₁-C₄amino, dialquil C₂-C₆amino, cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₁-C₄-cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo y dialquil C₂-C₈aminocarbonilo; R₄, R₅ y R₆ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o alcoxi C₁-C₃;
J es un sistema de anillo bicíclico aromático seleccionado de J₁, J₂ y J₃,



15 en donde



20 indica que el anillo es aromático;
en el que las flechas muestran la conectividad según se representa en la fórmula (I), en donde

A₁ es nitrógeno, N-R_{7a}, azufre, oxígeno o C-R_{7b};
A₂ es nitrógeno, N-R_{8a}, azufre, oxígeno o C-R_{8b};
A₃ es nitrógeno, N-R_{9a}, azufre, oxígeno o C-R_{9b};

25 B₁ es nitrógeno o C-R₁₀;

B₂ es nitrógeno o C-R₁₁ ;

B₃ es nitrógeno o C-R₁₂ ;

B₄ es nitrógeno o C-R₁₃ ;

B₅ es nitrógeno o C-R₁₄;

30 B₆ es nitrógeno o C-R₁₅;

C₁ es nitrógeno o C;

C₂ es nitrógeno o C;

con las condiciones de que

35 a) no más de dos sustituyentes A pueden ser oxígeno o azufre,

b) cuando dos sustituyentes A son oxígeno y/o azufre, estos sustituyentes son A₁ y A₃, y A₂ es C-R_{8b}, y

c) cuando C₁ es N, entonces C₂ es C, y cuando C₂ es N, entonces C₁ es C;

40 cada uno de R_{7a}, R_{7b}, R_{8a}, R_{8b}, R_{9a}, R_{9b}, R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₁₃, R₁₄ y R₁₅ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, hidroxilo, =O, CHO, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, haloalquil C₁-C₄tio, haloalquil C₁-C₄sulfino, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfino, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfoximino-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄amino, dialquil C₂-C₄amino, cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₁-C₆-cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆aminocarbonilo, alcoxi C₂-C₆carboniloxi, alquil C₂-C₆aminocarboniloxi, dialquil C₃-C₆aminocarboniloxi, alcoxi C₁-C₄imino-alquilo C₁-C₄, -CONHSO₂-C₁-C₆-alquilo, -CONHSO₂N(alquilo C₁-C₆)₂ o trialquil C₃-C₆sililo;

45 o una sal, estereoisómero, tautómero y N-óxido agroquímicamente aceptable de los compuestos de fórmula I.

3. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, en donde

Ar₁ es fenilo o fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, haloalquil C₁-C₃-cicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfoximino, alquil C₂-C₄carbonilo, CHO, alcoxi C₂-C₆carbonilo o haloalcoxi C₂-C₆carbonilo;

Ar₂ es fenilo o fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, haloalquil C₁-C₃-cicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfoximino, alquil C₂-C₄carbonilo, CHO, alcoxi C₂-C₆carbonilo o haloalcoxi C₂-C₆carbonilo;

X es un enlace directo, O, S, SO₂, CR₄R₅ o NR₆;

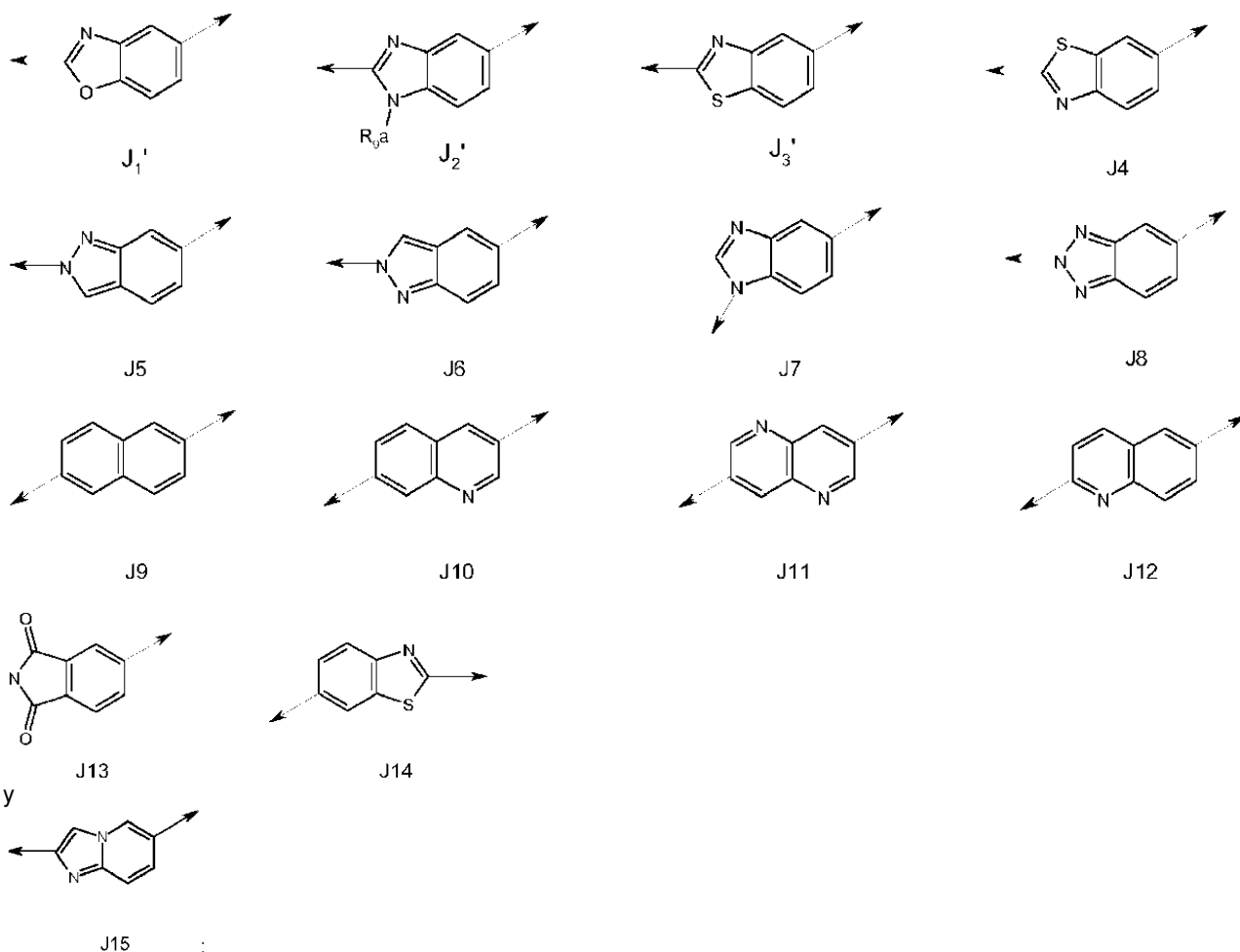
Y es oxígeno o azufre;

R₁ es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o alcoxi C₁-C₃;

R₂ y R₃ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalquil C₁-C₄sulfinilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆aminocarbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆aminocarbonilo, alcoxi C₁-C₄amino-alquilo C₁-C₄; con la condición de que cuando R₂ y R₃ son diferentes de hidrógeno, R₂ y R₃ pueden estar sustituidos con uno a tres sustituyentes independientemente seleccionados del grupo que consiste en alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfoximino, alquil C₁-C₄amino, dialquil C₂-C₆amino, cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₁-C₄-cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo y dialquil C₂-C₆aminocarbonilo;

R₄, R₅ y R₆ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o alcoxi C₁-C₃;

J es un grupo seleccionado de J₁' a J₁₅:



R_{9a} es hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, hidroxilo, =O, CHO, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalqueno C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, haloalquil C₁-C₄tio, haloalquil C₁-C₄sulfino, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfino, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfonil-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄sulfoximino-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄amino, dialquil C₂-C₄amino, cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₁-C₆-cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆aminocarbonilo, alcoxi C₂-C₆carboniloxi, alquil C₂-C₆aminocarboniloxi, dialquil C₃-C₆aminocarboniloxi, alcoxi C₁-C₄amino-alquilo C₁-C₄, -CONHSO₂-alquilo C₁-C₆, -CONHSO₂N(alquilo C₁-C₆)₂ o trialquil C₃-C₆sililo.

4. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, en donde

Ar₁ es fenilo o fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, haloalquil C₁-C₃-cicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfino, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfoximino, alquil C₂-C₄carbonilo, CHO, alcoxi C₂-C₆carbonilo o haloalcoxi C₂-C₆carbonilo;

Ar₂ es fenilo o fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, haloalquil C₁-C₃-cicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfino, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfoximino, alquil C₂-C₄carbonilo, CHO, alcoxi C₂-C₆carbonilo o haloalcoxi C₂-C₆carbonilo;

X es un enlace directo, O, S, SO₂, CR₄R₅ o NR₆;

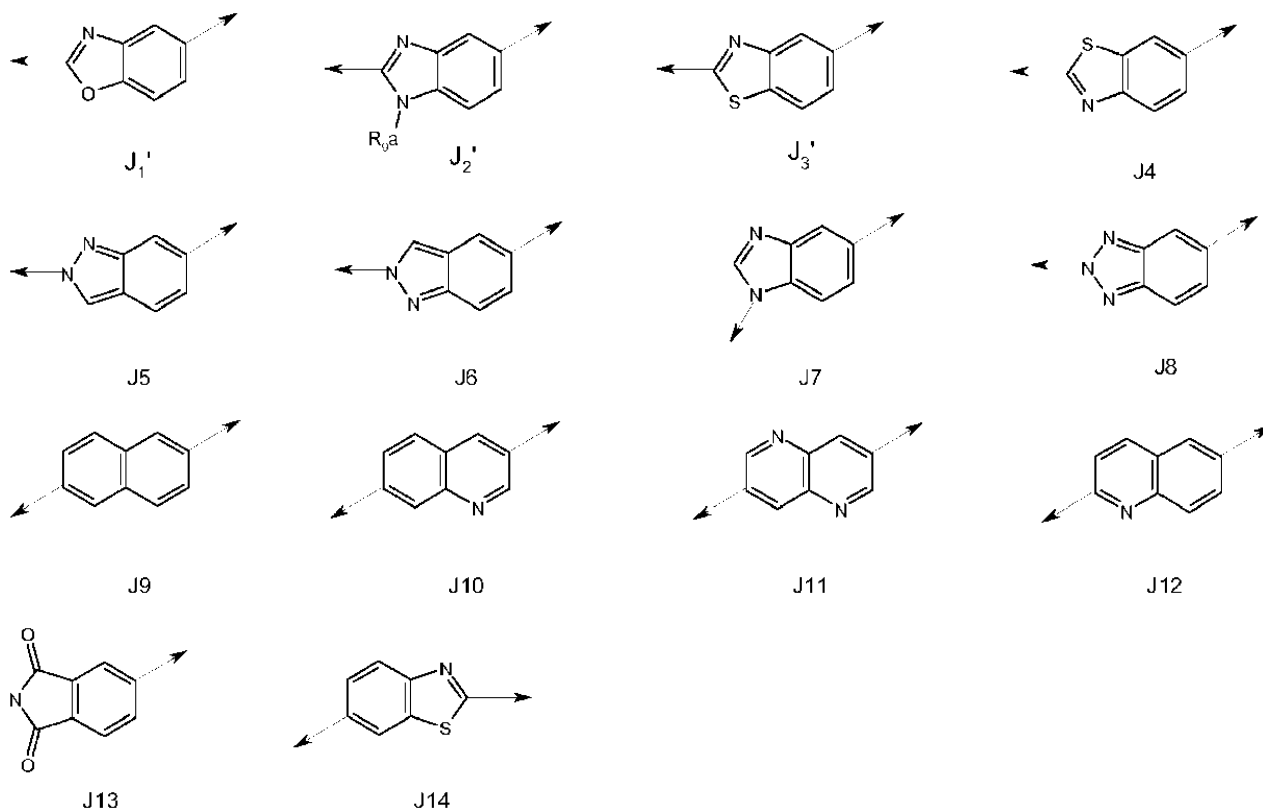
Y es oxígeno o azufre;

R₁ es hidrógeno o alquilo C₁-C₆,

R₂ y R₃ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆aminocarbonilo, alcoxi C₂-C₆carboniloxi, alquil C₂-C₆aminocarboniloxi, dialquil C₃-C₆aminocarboniloxi, con la condición de que cuando los grupos R₂ y R₃ son diferentes de hidrógeno, dichos grupos R₂ y R₃ pueden estar sustituidos con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ y alquil C₁-C₄tio;

R₄, R₅ y R₆ son, independientemente uno de otro, hidrógeno o alquilo C₁-C₆;

J es un grupo seleccionado de J₁' a J₁₄:



en donde R_{9a} es alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆.

5. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, en donde

Ar₁ es fenilo o fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, haloalquil C₁-C₃-cicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfoximino, alquil C₂-C₄carbonilo, CHO, alcoxi C₂-C₆carbonilo, haloalcoxi C₂-C₆carbonilo;

Ar₂ es fenilo o fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, haloalquil C₁-C₃-cicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfoximino, alquil C₂-C₄carbonilo, CHO, alcoxi C₂-C₆carbonilo y haloalcoxi C₂-C₆carbonilo;

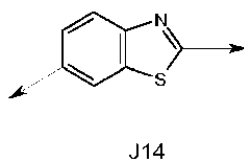
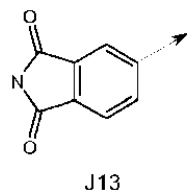
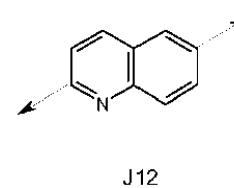
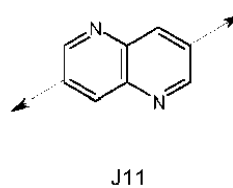
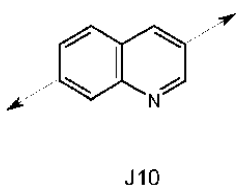
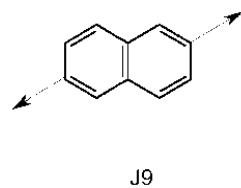
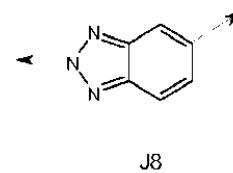
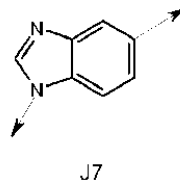
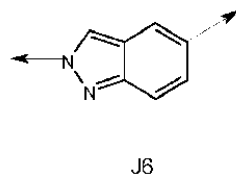
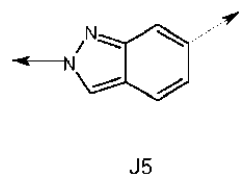
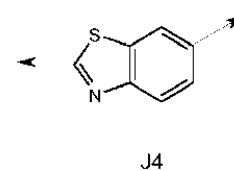
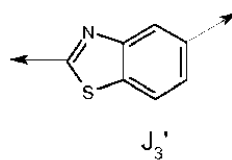
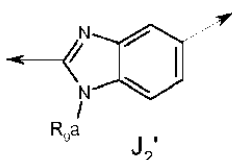
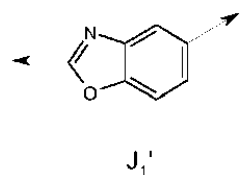
X es un enlace directo u O;

Y es oxígeno o azufre;

R₁ es hidrógeno o alquilo C₁-C₆,

R₂ y R₃ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆aminocarbonilo, alcoxi C₂-C₆carboniloxi, alquil C₂-C₆aminocarboniloxi, dialquil C₃-C₆aminocarboniloxi, con la condición de que cuando los grupos R₂ y R₃ son diferentes de hidrógeno, dichos grupos R₂ y R₃ pueden estar sustituidos con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ y alquil C₁-C₄tio;

J es un grupo seleccionado de J₁' a J₁₄:



cada uno de R_{7a}, R_{7b}, R_{8a}, R_{8b}, R_{9a}, R_{9b}, R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₁₃, R₁₄ y R₁₅ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, hidroxi, =O, CHO, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, haloalquil C₁-C₄tio, haloalquil C₁-C₄sulfinilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfonil-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄sulfoximino-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄amino, dialquil C₂-C₄amino, cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₁-C₆-cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆aminocarbonilo, alcoxi C₂-C₆carboniloxi, alquil C₂-C₆aminocarboniloxi, dialquil C₃-C₆aminocarboniloxi, alcoxi C₁-C₄imino-alquilo C₁-C₄, -CONHSO₂-alquilo C₁-C₆, -CONHSO₂N(alquilo C₁-C₆)₂ o trialquil C₃-C₆sililo.

6. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, en donde

Ar₁ es fenilo o fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, haloalquil C₁-C₃-cicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halógeno, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

Ar₂ es fenilo o fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, haloalquil C₁-C₃-cicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halógeno, ciano, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio.

X es un enlace directo, O, S, SO₂, CR₄R₅ o NR₆;

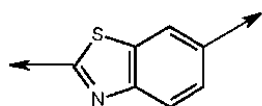
Y es oxígeno o azufre;

R₁ es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o alcoxi C₁-C₃;

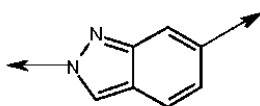
R₂ y R₃ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalquil C₁-C₄sulfinilo, haloalquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆aminocarbonilo, alcoxi C₂-C₆carboniloxi, alquil C₂-C₆aminocarboniloxi, dialquil C₃-C₆aminocarboniloxi o alcoxi C₁-C₄imino-alquilo C₁-C₄; con la condición de que cuando R₂ y R₃ son diferentes de hidrógeno, R₂ y R₃ pueden estar sustituidos con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio, alquil C₁-C₄sulfinilo, alquil C₁-C₄sulfonilo, alquil C₁-C₄sulfoximino, alquil C₁-C₄amino, dialquil C₂-C₆amino, cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₁-C₄-cicloalquil C₃-C₆amino, alquil C₂-C₄carbonilo, alcoxi C₂-C₆carbonilo, alquil C₂-C₆aminocarbonilo y dialquil C₂-C₈aminocarbonilo;

R₄, R₅ y R₆ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o alcoxi C₁-C₃;

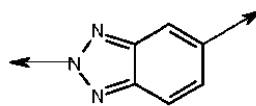
J es un grupo seleccionado de:



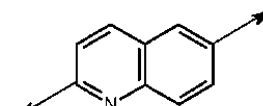
J4



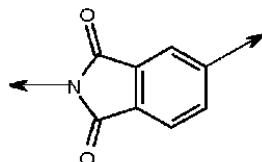
J5



J8



J11



J13

30

7. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, en donde

Ar₁ es fenilo o fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, haloalquil C₁-C₃-cicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halógeno, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

Ar₂ es fenilo o fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, haloalquil C₁-C₃-cicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halógeno, ciano, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄tio.

X es un enlace directo, O, S, SO₂, CR₄R₅ o NR₆;

Y es oxígeno o azufre;

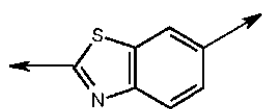
R₁ es hidrógeno o alquilo C₁-C₆;

R₂ y R₃ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆;

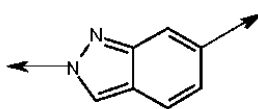
R₄, R₅ y R₆ son, independientemente uno de otro, hidrógeno o alquilo C₁-C₆;

J es un grupo seleccionado de:

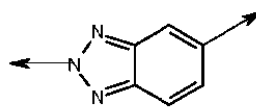
45



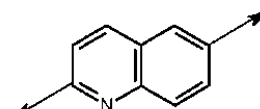
J4



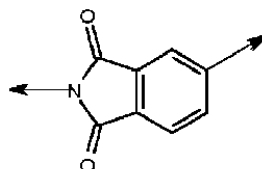
J5



J8



J11



J13

5 8. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, en donde

Ar₁ es fenilo sustituido con haloalcoxi C₁-C₄;

Ar₂ es fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, halógeno, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄;

10 X es un enlace directo, O, S, SO₂, CR₄R₅ o NR₆;

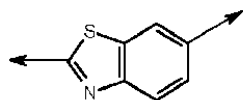
Y es oxígeno o azufre;

R₁ es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o alcoxi C₁-C₃;

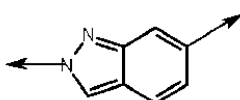
15 R₂ y R₃ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalquil C₁-C₄ sulfinilo, haloalquil C₁-C₄ sulfonilo, alquil C₁-C₄ sulfinilo, alquil C₁-C₄ sulfonilo, alquil C₂-C₄ carbonilo, alcoxi C₂-C₆ carbonilo, alquil C₂-C₆ aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆ aminocarbonilo, alcoxi C₂-C₆ carbonilo, alquil C₂-C₆ aminocarbonilo, dialquil C₃-C₆ aminocarbonilo o alcoxi C₁-C₄ imino-alquilo C₁-C₄; con la condición de que cuando R₂ y R₃ son diferentes de hidrógeno, R₂ y R₃ pueden estar sustituidos con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, haloalqueno C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, halógeno, ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄ tio, alquil C₁-C₄ sulfinilo, alquil C₁-C₄ sulfonilo, alquil C₁-C₄ sulfoximino, alquil C₁-C₄ amino, dialquil C₂-C₆ amino, cicloalquil C₃-C₆ amino, alquil C₁-C₄-cicloalquil C₃-C₆ amino, alquil C₂-C₄ carbonilo, alcoxi C₂-C₆ carbonilo, alquil C₂-C₆ aminocarbonilo y dialquil C₂-C₆ aminocarbonilo;

20 R₄, R₅ y R₆ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o alcoxi C₁-C₃;

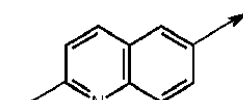
25 J es un grupo seleccionado de:



J4



J5



J11

30 9. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, donde:

Ar₁ es fenilo sustituido con haloalcoxi C₁-C₄;

Ar₂ es fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, halógeno, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄;

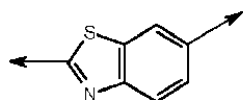
35 X es un enlace directo u O;

Y es oxígeno o azufre;

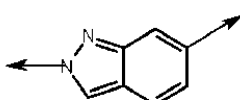
R₁ es hidrógeno o alquilo C₁-C₆,

R₂ y R₃ son, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆

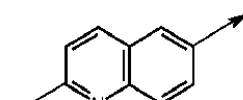
40 J es un grupo seleccionado de:



J4



J5



J11

10. Una composición plaguicida, que comprende al menos un compuesto de fórmula I de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 o, cuando sea apropiado, un tautómero del mismo, en cada caso en forma libre o en forma de sal agroquímicamente utilizable, como ingrediente activo y al menos un auxiliar.
- 5 11. Un método para controlar plagas, que comprende aplicar un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 o una composición de acuerdo con la reivindicación 10 a las plagas o su entorno con la excepción de un método para el tratamiento del cuerpo humano o animal por cirugía o terapia y métodos de diagnóstico practicados en el cuerpo humano o animal.
- 10 12. Un método para la protección de material de propagación vegetal frente al ataque de plagas, que comprende tratar el material de propagación o el sitio, donde el material de propagación está plantado, con una composición de acuerdo con la reivindicación 10.
- 15 13. Un material de propagación vegetal recubierto, en el que el recubrimiento comprende un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9.