

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 817 098**

51 Int. Cl.:

C07D 275/02 (2006.01)

A01N 43/80 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **23.06.2014 PCT/EP2014/063101**

87 Fecha y número de publicación internacional: **31.12.2014 WO14206907**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **23.06.2014 E 14731658 (2)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **08.04.2020 EP 3013807**

54 Título: **Compuestos de isotiazolinas sustituidas con naftilo**

30 Prioridad:

24.06.2013 US 201361838354 P

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

06.04.2021

73 Titular/es:

**BOEHRINGER INGELHEIM ANIMAL HEALTH USA
INC. (100.0%)
3239 Satellite Boulevard, Bldg. 500
Duluth, GA 30096, US**

72 Inventor/es:

**BINDSCHÄDLER, PASCAL;
VON DEYN, WOLFGANG;
KÖRBER, KARSTEN;
CULBERTSON, DEBORAH L.;
GUNJIMA, KOSHI y
BRAUN, FRANZ JOSEF**

74 Agente/Representante:

SALVÀ FERRER, Joan

ES 2 817 098 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

Compuestos de isotiazolinas sustituidas con naftilo

5 La presente invención se refiere a compuestos de isotiazolina sustituidos con naftilo o isoquinolinilo que son útiles para combatir o controlar plagas de invertebrados, en particular plagas de artrópodos y nemátodos. La invención también se refiere a un procedimiento para controlar plagas de invertebrados usando estos compuestos y a material de propagación vegetal y a una composición agrícola y veterinaria que comprende dichos compuestos.

10 Las plagas de invertebrados y, en particular, los artrópodos y nematodos destruyen los cultivos en crecimiento y cosechados y atacan las viviendas de madera y las estructuras comerciales, provocando grandes pérdidas económicas para el suministro de alimentos y la propiedad. Si bien se conoce un gran número de agentes pesticidas, debido a la capacidad de las plagas objetivo de desarrollar resistencia a dichos agentes, existe una necesidad continua de nuevos agentes para combatir las plagas de invertebrados, en particular insectos, arácnidos y nematodos.

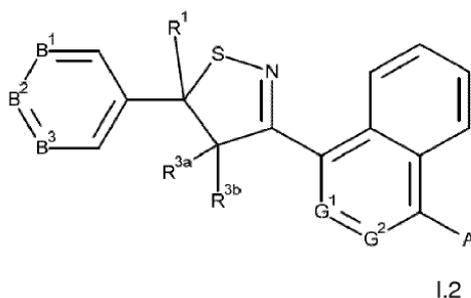
En el documento WO 2013/037626 se describen compuestos de aril isotiazolina insecticidas relacionados. Sin embargo, este documento no describe compuestos que tengan los sustituyentes característicos y la disposición de sustituyentes como se reivindica en la presente invención. Los compuestos de aril azolina insecticidas relacionados se describen adicionalmente en los documentos WO 2011/092287, WO 2011/073444, WO 2010/090344, WO 2009/112275 y WO 97/23212. Estos documentos tampoco describen compuestos que tengan los sustituyentes característicos y la disposición de sustituyentes como se reivindica en la presente invención.

25 Es un objeto de la presente invención proporcionar compuestos que tienen una buena actividad pesticida, en particular actividad insecticida, y muestran un amplio espectro de actividad contra un gran número de diferentes plagas de invertebrados, especialmente contra plagas de artrópodos y/o nematodos difíciles de controlar.

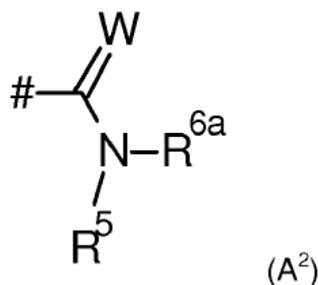
30 Se ha encontrado que estos objetivos pueden ser alcanzados por los compuestos de isotiazolina de la fórmula I a continuación, por sus estereoisómeros y sus sales, en particular sus sales agrícola o veterinariamente aceptables.

La invención se define por las reivindicaciones. La materia fuera del alcance de las reivindicaciones se proporciona solo a título informativo.

35 En un primer aspecto, la presente invención se refiere a compuestos de isotiazolina de la fórmula 1.2



50 en la que
A es un grupo A², donde A² es un grupo de la siguiente fórmula:



65

en la que # indica el enlace al resto de la molécula;

W es O;

B¹, B² y B³ son cada uno independientemente CR²;

5 G¹ y G² son cada uno independientemente CR⁴;

R¹ es CF₃;

cada R² se selecciona independientemente del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno y haloalquilo C₁-C₂;

R^{3a}, R^{3b} se seleccionan cada uno independientemente del grupo que consiste en hidrógeno y halógeno;

cada R⁴ es hidrógeno;

10 R⁵ es hidrógeno;

R^{6a} se selecciona entre H, -X-R^{6b} y -N(R^{5a})R^{6c}; en el que

X se selecciona entre -C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-C(=O)-NH-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-C(R^a)₂-C(=O)-NH-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂S(O)_n-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-C(R^a)₂-S(O)_n-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-OC(R^a)₂- y -C(R^a)₂-C(R^a)₂-OC(R^a)₂-, en la que cada R^a se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno y metilo;

15 R^{5a} tiene el significado dado para R⁵;

R^{6b} se selecciona entre alquenido C₂-C₈, haloalquenido C₂-C₈, alquinilo C₂-C₈, haloalquinilo C₂-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈ y cicloalquilo C₃-C₈ sustituido por un grupo ciano;

R^{6c} es -C(=O)N(R^{14a})R^{14b};

R^{14a} se selecciona entre hidrógeno y alquilo C₁-C₆; y

20 R^{14b} se selecciona entre hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquenido C₂-C₆, haloalquenido C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆ y cicloalquil C₃-C₆ alquilo C₁-C₄, donde los restos cicloalquilo en los tres últimos grupos mencionados pueden estar sustituidos por un grupo ciano; y alquilo C₁-C₆ sustituido con un grupo CN;

cada n es independientemente 0, 1 o 2;

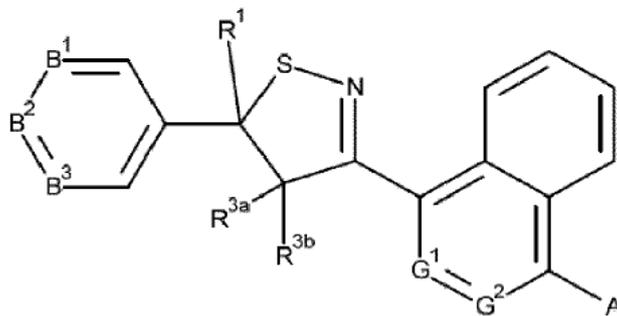
25 y los N-óxidos, estereoisómeros y sales agrícola o veterinariamente aceptables de los mismos.

La presente invención también se refiere a compuestos de isotiazolina de la fórmula I.1

30

35

40



I.1

en los que

45 A es un grupo A¹, donde A¹ es -C(=NR⁶)R⁸;

B¹, B² y B³ son cada uno independientemente CR²;

G¹ y G² son cada uno independientemente CR⁴;

R¹ es CF₃;

cada R² se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno y haloalquilo C₁-C₂;

50 R^{3a}, R^{3b} se seleccionan cada uno independientemente entre hidrógeno y halógeno;

cada R⁴ es hidrógeno;

R⁸ es hidrógeno;

R⁶ es -NR^{10a}R^{10b};

R^{10a} se selecciona entre hidrógeno y alquilo C₁-C₆;

55 R^{10b} es -C(=O)N(R^{14a})R^{14b};

R^{14a} se selecciona entre hidrógeno y metilo; y

R^{14b} se selecciona entre hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alquenido C₂-C₄, haloalquenido C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄ y haloalquinilo C₂-C₄.

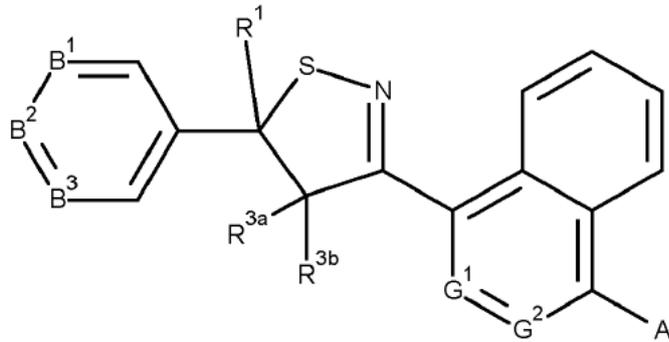
60 En el presente documento se describen compuestos de isotiazolina de fórmula I

65

5

10

15



20

en los que

A es un grupo A¹, A² o A³;

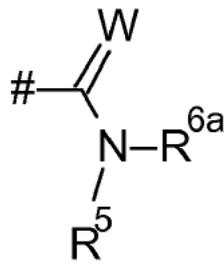
en la que

A¹ se selecciona entre el grupo que consiste en -C(=NR⁶)R⁸, -S(O)_nR⁹, -CN y -N(R⁵)R⁶;

25

A² es un grupo de fórmula siguiente:

30



35

40

en la que

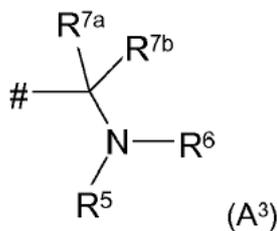
indica el enlace con el resto de la molécula;

W se selecciona entre O y S;

A³ es un grupo de fórmula siguiente:

45

50



55

60

en la que

indica el enlace con el anillo aromático de fórmula (I);

B¹, B² y B³ se seleccionan cada uno independientemente del grupo que consiste en N y CR², con la condición de que como máximo dos de B¹, B² y B³ sean N;

65

G¹ y G² se seleccionan cada uno independientemente del grupo que consiste en N y CR⁴, con la condición de que

como máximo uno de G¹ y G² sea N;

R¹ se selecciona entre el grupo que consiste en alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆ y -C(=O)OR¹⁵;

cada R² se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, azido, nitro, -SCN, -SF₅, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, donde los cuatro últimos radicales alifáticos y cicloalifáticos mencionados pueden estar parcial o totalmente halogenados y/o pueden estar sustituidos con uno o más radicales R⁸, -Si(R¹²)₃, -OR⁹, -S(O)_nR⁹ y -NR^{10a}R^{10b};

R^{3a}, R^{3b} cada uno se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, hidroxilo, -CO₂R^{3d}, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alquenilo C₂-C₃, alquinilo C₂-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃, haloalquiltio C₁-C₃, alquil C₁-C₃ sulfonilo y haloalquil C₁-C₃ sulfonilo; o R^{3a} y R^{3b} juntos forman un grupo =O, =C(R^{3c})₂, =NOH o =NOCH₃;

cada R^{3c} se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, CH₃ y CF₃;

R^{3d} se selecciona en el grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₆ y alquilo C₁-C₃ alquilo C₁-C₃;

cada R⁴ se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, azido, nitro, -SCN, -SF₅, alquilo C₁-C₆ que puede estar parcial o totalmente halogenado y/o puede estar sustituido por uno o más radicales R⁸, cicloalquilo C₃-C₈ que puede estar parcial o totalmente halogenado y/o puede estar sustituido por uno o más radicales R⁸, alquenilo C₂-C₆ que puede estar parcial o totalmente halogenado y/o puede estar sustituido por uno o más radicales R⁸, alquinilo C₂-C₆ que puede estar parcial o totalmente halogenado y/o puede estar sustituido por uno o más radicales R⁸, -Si(R¹²)₃, -OR⁹, -S(O)_nR⁹ y -NR^{10a}R^{10b};

cada R⁵ se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₁₀, cicloalquilo C₃-C₈, alquenilo C₂-C₁₀, alquinilo C₂-C₁₀, en el que los últimos cuatro radicales alifáticos y cicloalifáticos mencionados pueden estar parcial o totalmente halogenados y/o pueden estar sustituidos con uno o más sustituyentes R⁸,

R^{6a} se selecciona entre -XR^{6b} y -N(R^{5a})R^{6c}; en el que

X se selecciona entre -C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-C(=O)-NR^{10a}-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-C(R^a)₂-C(=O)-NR^{10a}-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂S(O)_n-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-C(R^a)₂-S(O)_n-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-OC(R^a)₂- y -C(R^a)₂-C(R^a)₂-O-C(R^a)₂-;

en los que cada R^a se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₃ y haloalquilo C₁-C₃;

R^{5a} tiene independientemente uno de los significados dados para R⁵;

R^{6b} se selecciona en el grupo que consiste en cicloalquilo C₃-C₈, alquenilo C₂-C₈, alquinilo C₂-C₈, en el que los tres últimos radicales mencionados pueden ser parcial o completamente halogenados y/o pueden estar sustituidos por uno o más sustituyentes R⁸; y

R^{6c} se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, donde los restos alifáticos y cicloalifáticos de los últimos ocho radicales mencionados pueden estar sustituidos con uno o más radicales R¹³;

-alquilo C₁-C₆-C(=O)OR¹⁵, -alquilo C₁-C₆-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}, -alquilo C₁-C₆-C(=S)N(R^{14a})R^{14b}, -alquilo C₁-C₆-C(=NR¹⁴)N(R^{14a})R^{14b}, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆,

-S(O)_nR¹⁵, -S(O)_nN(R^{14a})R^{14b}, -C(=O)R¹³, -C(=O)OR¹⁵,

-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}, -C(=S)R¹³, -C(=S)SR¹⁵, -C(=S)N(R^{14a})R^{14b} y -C(=NR¹⁴)R¹³; donde en el caso de que R⁵ sea hidrógeno, R^{6a} se selecciona además entre hidrógeno, 1-cianociclopropilo, 1-cianociclobutilo y 1-cianopentilo; o R⁵ y R^{6a} forman juntos un grupo =S(O)_m(R⁹)₂;

cada R⁶ se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, ciano, alquilo C₁-C₁₀, cicloalquilo C₃-C₈, alquenilo C₂-C₁₀, alquinilo C₂-C₁₀, en el que los cuatro últimos radicales alifáticos y cicloalifáticos mencionados pueden estar parcial o totalmente halogenados y/o pueden estar sustituidos con uno o más sustituyentes R⁸,

-OR⁹, -NR^{10a}R^{10b}, -S(O)_nR⁹, -C(=O)NR^{10a}N(R^{10a})R^{10b}, -Si(R¹²)₃, -C(=O)R⁸, fenilo que puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R¹¹, y un anillo heteromonocíclico o heterobíciclico saturado, parcialmente insaturado o máximamente insaturado de 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 o 10 miembros que contiene 1, 2, 3 o 4 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados independientemente de N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heteromonocíclico o heterobíciclico puede estar sustituido con uno o más sustituyentes R¹¹;

o R⁵ y R⁶ o R⁵ y R^{6a}, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o máximamente insaturado de 3, 4, 5, 6, 7 u 8 miembros, donde el anillo puede contener además 1, 2, 3 o 4 heteroátomos o grupos que contienen heteroátomos seleccionados entre O, S, N, SO, SO₂, C=O y C=S como miembros del anillo, en donde el anillo heterocíclico puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆,

haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, en el que los restos alifáticos o cicloalifáticos de los doce últimos radicales mencionados pueden estar sustituidos con uno o más radicales R⁸, y fenilo que puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R¹¹;

R^{7a}, R^{7b} se seleccionan cada uno independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, alqueno C₂-C₆ y alquino C₂-C₆, en el que los cuatro últimos radicales alifáticos y cicloalifáticos mencionados pueden estar parcial o completamente halogenados y/o pueden estar sustituidos con uno o más radicales R⁸;

cada R⁸ se selecciona independientemente del grupo que consiste en ciano, azido, nitro, -SCN, -SF₅, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalqueno C₂-C₆, halocicloalqueno C₂-C₆, donde los restos cicloalifáticos en los cuatro últimos radicales mencionados pueden estar sustituidos por uno o más radicales R¹³;

-Si(R¹²)₃, -OR⁹, -OSO₂R⁹, -S(O)_nR⁹, -N(R^{10a})R^{10b}, -C(=O)N(R^{10a})R^{10b}, -C(=S)N(R^{10a})R^{10b}, -C(=O)OR⁹,

fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R¹⁶, y un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o máximamente insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R¹⁶, o

dos R⁸ presentes en el mismo átomo de carbono de un grupo alquilo, alqueno, alquino o cicloalquilo forman juntos un grupo =O, =C(R¹³)₂; =S; =S(O)_m(R¹⁵)₂, =S(O)_mR¹⁵N(R^{14a})R^{14b}, =NR^{10a}, =NOR⁹; o =NN(R^{10a})R^{10b};

o

dos radicales R⁸, junto con los átomos de carbono de un grupo alquilo, alqueno, alquino o cicloalquilo a los que están unidos, forman un anillo carbocíclico o heterocíclico saturado o parcialmente insaturado de 3, 4, 5, 6, 7 u 8 miembros, donde el anillo heterocíclico comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados independientemente entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, y donde el anillo carbocíclico o heterocíclico está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R¹⁶; y

R⁸ como un sustituyente en un anillo de cicloalquilo se selecciona adicionalmente del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆ y haloalquino C₂-C₆, donde los restos alifáticos de estos seis radicales pueden estar sustituidos con uno o más radicales R¹³; y

R⁸ en los grupos -C(=NR⁶)R⁸, y -C(=O)R⁸ está, además, seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆ y haloalquino C₂-C₆, donde los restos alifáticos en los seis últimos radicales mencionados pueden estar sustituidos por uno o más radicales R¹³;

cada R⁹ se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈ alquilo C₁-C₄, -halocicloalquilo C₃-C₈, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, donde los restos alifáticos y cicloalifáticos en los nueve últimos radicales mencionados pueden estar sustituidos por uno o más radicales R¹³,

-alquilo C₁-C₆-C(=O)OR¹⁵, -alquilo C₁-C₆-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}, -alquilo C₁-C₆-C(=S)N(R^{14a})R^{14b}, -alquilo C₁-C₆-C(=NR¹⁴)N(R^{14a})R^{14b}, -Si(R¹²)₃, -S(O)_nR¹⁵, -S(O)_nN(R^{14a})R^{14b}, -N(R^{10a})R^{10b}, -N=C(R¹³)₂, -C(=O)R¹³, -C(=O)N(R^{14a})R^{14b}, -C(=S)N(R^{14a})R^{14b}, -C(=O)OR¹⁵, fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R¹⁶; y

un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o máximamente insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R¹⁶; y

R⁹ en los grupos -S(O)_nR⁹ y -OSO₂R⁹ se selecciona adicionalmente del grupo que consiste en alcoxi C₁-C₆ y haloalcoxi C₁-C₆;

R^{10a}, R^{10b} independientemente entre sí e independientemente de cada caso, se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, donde los restos alifáticos y cicloalifáticos en los ocho últimos radicales mencionados pueden estar sustituidos con uno o más radicales R¹³; -alquilo C₁-C₆-C(=O)OR¹⁵, -alquilo C₁-C₆-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}, -alquilo C₁-C₆-C(=S)N(R^{14a})R^{14b}, -alquilo C₁-C₆-C(=NR¹⁴)N(R^{14a})R^{14b}, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, -S(O)_nR¹⁵, -S(O)_nN(R^{14a})R^{14b}, -C(=O)R¹³, -(C=O)OR¹⁵, -C(=O)N(R^{14a})R^{14b}, -C(=S)R¹³, -C(=S)SR¹⁵, -C(=S)N(R^{14a})R^{14b}, -C(=NR¹⁴)R¹³;

fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3 o 4 sustituyentes R¹⁶; y

un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o máximamente insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R¹⁶;

o

R^{10a} y R^{10b} forman junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o máximamente insaturado de 3, 4, 5, 6, 7 u 8 miembros, en el que el anillo heterocíclico puede contener además uno o dos heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico opcionalmente lleva uno o más sustituyentes seleccionados entre halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆,

- haloalquinilo C₂-C₆, fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R¹⁶, y un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o máximamente insaturado de 3, 4, 5, 6, o 7 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico lleva opcionalmente uno o más sustituyentes R¹⁶;
- 5 o R^{10a} y R^{10b} juntos forman un grupo =C(R¹³)₂, =S(O)_m(R¹⁵)₂, =S(O)_mR¹⁵N(R^{14a})R^{14b}, =NR¹⁴ o =NOR¹⁵;
- R¹¹ se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, azido, nitro, -SCN, -SF₅, alquilo C₁-C₁₀, cicloalquilo C₃-C₈, alqueno C₂-C₁₀, alquinilo C₂-C₁₀, en el que los cuatro últimos radicales alifáticos y cicloalifáticos mencionados pueden estar parcial o completamente halogenados y/o pueden estar
- 10 sustituidos con uno o más radicales R⁸, -OR⁹, -NR^{10a}R^{10b}, -S(O)_nR⁹, -Si(R¹²)₃;
- fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R¹⁶; y un anillo heterocíclico aromático saturado, parcialmente insaturado o máximamente insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico está opcionalmente sustituido con uno o más
- 15 sustituyentes seleccionados independientemente de R¹⁶;
- o dos R¹¹ presentes en el mismo átomo de carbono del anillo de un anillo heterocíclico insaturado o parcialmente insaturado pueden formar juntos un grupo =O, =C(R¹³)₂, =S; =S(O)_m(R¹⁵)₂; =S(O)_mR¹⁵N(R^{14a})R^{14b}, =NR¹⁴, =NOR¹⁵, o =NN(R^{14a})R^{14b}, o dos R¹¹ unidos a átomos adyacentes del anillo forman junto con los átomos del anillo a los que
- 20 están unidos, un anillo saturado de 3, 4, 5, 6, 7, 8 o 9 miembros, en el que el anillo puede contener 1 o 2 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre O, S, N, NR¹⁴, NO, SO y SO₂ y/o 1 o 2 grupos seleccionados entre C=O, C=S y C=NR¹⁴ como miembros del anillo, y donde el anillo puede estar sustituido por uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquinilo, haloalquinilo C₂-C₆ y un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o
- 25 máximamente insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico puede estar sustituido con uno o más radicales R¹⁶;
- cada R¹² se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo, C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, alcoxi C₁-C₆, alquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquilo C₁-C₆, y fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4, o 5 sustituyentes R¹⁶;
- cada R¹³ se selecciona independientemente del grupo que consiste en ciano, nitro, -OH, -SH, -SCN, -SF₅, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquil C₁-C₆ sulfinilo, haloalquil C₁-C₆ sulfinilo, alquil C₁-C₆ sulfonilo, haloalquil C₁-C₆ sulfonilo, -NR^{14a}R^{14b}, -C(=O)NR^{14a}R^{14b}, trimetilsililo, trietilsililo, terc-butildimetilsililo, cicloalquilo C₃-C₈ que puede estar no sustituido, parcial o completamente halogenados y/o puede llevar 1 o 2 radicales seleccionados de ciano, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ y oxo; fenilo, bencilo, fenoxi,
- 40 donde el resto fenilo en los tres últimos radicales mencionados puede estar sin sustituir o llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R¹⁶; y un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o máximamente insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico puede estar sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes R¹⁶;
- o
- 45 dos R¹³ presentes en el mismo átomo de carbono de un grupo alquilo, alqueno, alquinilo o cicloalquilo pueden ser juntos =O, =CH(alquilo C₁-C₄), =C(alquil C₁-C₄) alquilo C₁-C₄, =NR¹⁷ o =NOR¹⁷;
- y
- R¹³ como un sustituyente en un anillo de cicloalquilo es adicionalmente seleccionado del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆ y alquinilo C₂-C₆, en el que los tres últimos radicales alifáticos mencionados pueden estar no sustituidos, parcial o completamente halogenados y/o pueden llevar 1 o 2 sustituyentes seleccionados entre CN, cicloalquilo C₃-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ y oxo;
- 50 y
- R¹³ en los grupos =C(R¹³)₂, -N=C(R¹³)₂, -C(=O)R¹³, -C(=S)R¹³ y -C(=NR¹⁴)R¹³ es además, seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆ y alquinilo C₂-C₆, en el que los tres últimos radicales alifáticos mencionados pueden estar no sustituidos, parcial o totalmente halogenados y/o pueden llevar 1 o 2 radicales seleccionados de CN, cicloalquilo C₃-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ y oxo;
- 55 cada R¹⁴ se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, ciano, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquil C₁-C₆ sulfinilo, haloalquil C₁-C₆ sulfinilo, alquil C₁-C₆ sulfonilo, haloalquil C₁-C₆ sulfonilo, -C(=O)NR^{18a}R^{18b}, trimetilsililo, trietilsililo, terc-butildimetilsililo, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, en el que los tres últimos radicales alifáticos mencionados pueden estar no sustituidos, parcial o completamente halogenados y/o pueden llevar 1 o 2 radicales seleccionados de CN, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquil C₁-C₄ sulfinilo, alquil C₁-C₄ sulfonilo, cicloalquilo C₃-C₄ que puede estar sustituido con 1 o 2 sustituyentes seleccionados entre halógeno y ciano; y oxo; cicloalquilo C₃-C₈ que puede estar no sustituido, parcial o
- 65 completamente halogenado y/o puede llevar 1 o 2 radicales seleccionados de ciano, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄,

haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquil C₁-C₄ sulfínico, alquil C₁-C₄ sulfónico, cicloalquilo C₃-C₄, cicloalquil C₃-C₄ - alquilo C₁-C₄, donde el resto cicloalquilo en los dos últimos radicales mencionados puede estar sustituido con 1 o 2 sustituyentes seleccionados entre halógeno y ciano; y oxo;

fenilo, bencilo, piridilo, fenoxi, en donde los restos cíclicos en los cuatro últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos y/o llevar 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆ y (alcoxi C₁-C₆) carbonilo; y un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o máximamente insaturado de 3, 4, 5 o 6 miembros que comprende 1 o 2 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R¹⁶;

R^{14a} y R^{14b}, independientemente entre sí, tienen uno de los significados indicados para R¹⁴; o

R^{14a} y R^{14b}, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o máximamente insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros, en el que el anillo heterocíclico puede contener además 1 o 2 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico opcionalmente lleva uno o más sustituyentes seleccionados entre halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

o

R^{14a} y R¹⁴ o R^{14b} y R¹⁴, junto con los átomos de nitrógeno a los que están unidos en el grupo -C(=NR¹⁴)N(R^{14a})R^{14b} forman un anillo heterocíclico parcialmente insaturado o máximamente insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros, en el que el anillo heterocíclico puede contener adicionalmente 1 o 2 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico opcionalmente lleva uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

cada R¹⁵ se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, ciano, trimetilsililo, trietilsililo, terc-butildimetilsililo,

alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, en el que los tres últimos radicales alifáticos mencionados pueden estar no sustituidos, parcialmente o completamente halogenados y/o pueden llevar 1 o 2 radicales seleccionados de cicloalquilo C₃-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquil C₁-C₄ sulfínico, alquil C₁-C₄ sulfónico y oxo; cicloalquilo C₃-C₈ que puede estar no sustituido, parcial o completamente halogenado y/o puede llevar 1 o 2 radicales seleccionados de alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquil C₁-C₄ sulfínico, alquil C₁-C₄ sulfónico y oxo;

fenilo, bencilo, piridilo y fenoxi, en donde los cuatro últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos, parcialmente o completamente halogenados y/o llevar 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados de alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆ y (alcoxi C₁-C₆) carbonilo;

cada R¹⁶ se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, -OH, -SH, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquil C₁-C₆ sulfínico, haloalquil C₁-C₆ sulfínico, alquill C₁-C₆ sulfónico, haloalquil C₁-C₆ sulfónico, trimetilsililo, trietilsililo, terc-butildimetilsililo;

alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, en el que los tres últimos radicales alifáticos mencionados pueden estar no sustituidos, parcial o completamente halogenados y/o pueden llevar 1 o 2 radicales seleccionados de cicloalquilo C₃-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ y oxo;

cicloalquilo C₃-C₈ que puede estar no sustituido, parcial o completamente halogenado y/o puede llevar 1 o 2 radicales seleccionados de alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ y oxo;

fenilo, bencilo, piridilo y fenoxi, en donde los cuatro últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos, parcial o completamente halogenados y/o llevar 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados de alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆ y (alcoxi C₁-C₆) carbonilo;

o

dos R¹⁶ presentes juntos en el mismo átomo de un anillo insaturado o parcialmente insaturado pueden ser =O, =S, =N(alquilo C₁-C₆), =NO(alquilo C₁-C₆), =CH(alquilo C₁-C₄) o =C(alquil C₁-C₄) alquilo C₁-C₄;

o

dos R¹⁶ en dos átomos de carbono adyacentes forman junto con los átomos de carbono a los que están unidos, un anillo saturado, parcialmente insaturado o máximamente insaturado de 4, 5, 6, 7 u 8 miembros, en el que el anillo puede contener 1 o 2 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, y en el que el anillo lleva opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados entre halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄; y en particular de entre halógeno, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

R¹⁷, R^{18a} y R^{18b}, independientemente entre sí e independientemente de cada caso, se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, en los que los tres últimos radicales alifáticos mencionados pueden estar no sustituidos, parcialmente o completamente halogenados y/o pueden llevar 1 o 2 radicales seleccionados de CN, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquil C₁-C₄ sulfínico, alquil C₁-C₄ sulfónico, cicloalquilo C₃-C₄ que puede estar sustituido con 1 o 2 sustituyentes seleccionados entre halógeno y ciano; y oxo;

cicloalquilo C₃-C₈ que puede estar no sustituido, parcial o completamente halogenado y/o puede llevar 1 o 2 radicales seleccionados de ciano, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄; fenilo y bencilo;

cada n es independientemente 0, 1 o 2; y
cada m es independientemente 0 o 1;
y los N-óxidos, estereoisómeros y sales agrícolas o veterinariamente aceptables de los mismos.

5 La presente invención también proporciona una composición agrícola que comprende al menos un compuesto de la fórmula I.1 o fórmula I.2, tal como se define en el presente documento y/o una sal agrícolamente aceptable del mismo y al menos un portador líquido o sólido.

10 La presente invención también proporciona una composición veterinaria que comprende al menos un compuesto de la fórmula I.1 o fórmula I.2, tal como se define en el presente documento y/o una sal veterinariamente aceptable del mismo y al menos un portador líquido o sólido.

15 La presente invención también proporciona un procedimiento no terapéutico para el control de plagas de invertebrados, cuyo procedimiento comprende tratar las plagas, su suministro de alimentos, su hábitat o su caldo de cultivo o una planta, material de propagación vegetal, suelo, área, material o entorno en que las plagas están creciendo o pueden crecer, o los materiales, plantas, material de propagación vegetal, suelos, superficies o espacios que deben protegerse del ataque o infestación de plagas de invertebrados con una cantidad plaguicidamente eficaz de al menos un compuesto de imina de fórmula I.1 o fórmula I.2, tal como se define en el presente documento, un estereoisómero del mismo y/o al menos una sal agrícolamente aceptable del mismo.

20 La presente invención se refiere también a material de propagación vegetal, en particular semillas, que comprende al menos un compuesto de fórmula I.1 o fórmula I.2 y/o una sal agrícolamente aceptable del mismo, tal como se define en el presente documento.

25 En el presente documento se describe un procedimiento para tratar o proteger a un animal de infestación o infección por parásitos que comprende poner al animal en contacto con una cantidad parasiticidamente eficaz de un compuesto de fórmula I o una sal veterinariamente aceptable del mismo, tal como se define en el presente documento. Poner al animal en contacto con el compuesto I, su sal o la composición veterinaria de la invención significa aplicarlo o administrarlo al animal.

30 El término "estereoisómeros" abarca ambos isómeros ópticos, tales como enantiómeros o diastereómeros, este último existente debido a más de un centro de quiralidad en la molécula, así como isómeros geométricos (isómeros cis/trans).

35 Dependiendo del patrón de sustitución, los compuestos de la fórmula I pueden tener uno o más centros de quiralidad, en cuyo caso están presentes como mezclas de enantiómeros o diastereómeros. Un centro de quiralidad es el átomo del anillo de carbono del anillo de isotiazolina que lleva el radical R¹. La invención proporciona los enantiómeros o diastereoisómeros puros y sus mezclas y el uso según la invención de los enantiómeros o diastereómeros puros del compuesto I o sus mezclas. Los compuestos adecuados de fórmula I también incluyen todos los posibles estereoisómeros geométricos (isómeros cis/trans) y mezclas de los mismos.

40 El término N-óxidos se refiere a una forma de los compuestos I en los que al menos un átomo de nitrógeno está presente en forma oxidada (como NO). Para ser más precisos, se refiere a cualquier compuesto de la presente invención que tiene al menos un átomo de nitrógeno terciario que está oxidado a un resto N-óxido. Los N-óxidos de los compuestos I pueden, en particular, ser preparados por oxidación por ejemplo, del átomo de nitrógeno de anillo del resto isotiazolina y/o, si G¹ o G² es N, este átomo de nitrógeno, y/o de cualquier grupo heterocíclico que contenga nitrógeno presente en el grupo A con un agente oxidante adecuado, tal como ácidos peroxocarboxílicos u otros peróxidos. El experto en la técnica sabe si los compuestos de la presente invención pueden formar N-óxidos y en qué posiciones.

45 Los compuestos de la presente invención pueden ser amorfos o pueden existir en uno o más diferentes estados cristalinos (polimorfos) que pueden tener diferentes propiedades macroscópicas, tales como la estabilidad, o mostrar diferentes propiedades biológicas, tales como actividades. La presente invención incluye tanto compuestos amorfos como cristalinos de fórmula I.1 o fórmula I.2, mezclas de diferentes estados cristalinos del respectivo compuesto I, así como sales amorfas o cristalinas del mismo.

50 Las sales de los compuestos de fórmula I son preferiblemente sales aceptables desde el punto de vista agrícola y veterinario. Pueden formarse según un procedimiento habitual, por ejemplo, haciendo reaccionar el compuesto con un ácido del anión en cuestión si el compuesto de fórmula I tiene una funcionalidad básica o haciendo reaccionar un compuesto ácido de fórmula I con una base adecuada.

55 Las sales aceptables agrícolas adecuadas son especialmente las sales de esos cationes o las sales de adición de ácidos de aquellos ácidos cuyos cationes y aniones, respectivamente, no tienen ningún efecto adverso sobre la acción de los compuestos según la presente invención. Los cationes adecuados son en particular los iones de los

- metales alcalinos, preferiblemente litio, sodio y potasio, de los metales alcalinotérreos, preferiblemente calcio, magnesio y bario, y de los metales de transición, preferiblemente manganeso, cobre, zinc y hierro, y también amonio (NH_4^+) y amonio sustituido en el que uno a cuatro de los átomos de hidrógeno están reemplazados por alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, hidroxialquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$ alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, hidroxio- $\text{C}_1\text{-C}_4$ alcoxi- $\text{C}_1\text{-C}_4$, fenilo o bencilo. Ejemplos de 5 iones de amonio sustituidos comprenden metilamonio, isopropilamonio, dimetilamonio, diisopropilamonio, trimetilamonio, tetrametilamonio, tetraetilamonio, tetrabutilamonio, 2-hidroxi-etilamonio, 2-(2-hidroxi-etoxi)etilamonio, bis(2-hidroxi-etoxi)etilamonio, benciltrimetilamonio y benciltri-etilamonio, además, iones fosfonio, iones sulfonio, preferiblemente tri(alquil $\text{C}_1\text{-C}_4$) sulfonio, e iones sulfoxonio, preferiblemente tri(alquil $\text{C}_1\text{-C}_4$) sulfoxonio.
- 10 Los aniones de sales de adición de ácido útiles son principalmente cloruro, bromuro, fluoruro, hidrógeno sulfato, sulfato, dihidrógeno fosfato, hidrógeno fosfato, fosfato, nitrato, hidrógeno carbonato, carbonato, hexafluorosilicato, hexafluorofosfato, benzoato, y los aniones de ácidos $\text{C}_1\text{-C}_4$ alcanóicos, preferiblemente formiato, acetato, propionato y butirato. Pueden formarse haciendo reaccionar un compuesto de fórmula I con un ácido del anión correspondiente, 15 preferiblemente ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico o ácido nítrico.
- La expresión "sales veterinariamente aceptables" se refiere a las sales de los cationes o aniones que son conocidos y aceptados en la técnica para la formación de sales para uso veterinario. Las sales de adición de ácido adecuadas, por ejemplo, formadas por compuestos de fórmula I que contienen un átomo de nitrógeno básico, por ejemplo, un 20 grupo amino, incluyen sales con ácidos inorgánicos, por ejemplo, clorhidratos, sulfatos, fosfatos y nitratos y sales de ácidos orgánicos, por ejemplo, ácido acético, ácido maleico, ácido dimaleico, ácido fumárico, ácido difumárico, ácido metanosulfónico, ácido metanosulfónico y ácido succínico.
- El término "plaga de invertebrados", tal como se usa en este documento, abarca las poblaciones de animales, tales como insectos, arácnidos y nematodos, que pueden atacar las plantas, lo que provoca daños sustanciales a las 25 plantas atacadas, así como ectoparásitos que pueden infestar animales, en particular animales de sangre caliente, tales como, por ejemplo, mamíferos o aves, u otros animales superiores, tales como reptiles, anfibios o peces, causando así un daño sustancial a los animales infestados.
- El término "material de propagación vegetal" debe entenderse que indica todas las partes generativas de la planta, tales como semillas y material vegetativo de la planta, tal como esquejes y tubérculos (por ejemplo patatas), que 30 pueden utilizarse para la multiplicación de la planta. Esto incluye semillas, raíces, frutos, tubérculos, bulbos, rizomas, brotes, retoños y otras partes de las plantas, incluidas las plántulas y las plantas jóvenes, que se trasplantarán después de la germinación o después de emerger del suelo. Los materiales de propagación vegetal pueden tratarse de forma profiláctica con un compuesto de protección de plantas en el momento de plantar o trasplantar o 35 antes. Dichas plantas jóvenes también pueden protegerse antes del trasplante mediante un tratamiento total o parcial por inmersión o vertido.
- El término "plantas" comprende cualquier tipo de plantas, incluyendo "plantas no cultivadas" y, en particular, "plantas cultivadas". 40
- El término "plantas no cultivadas" se refiere a cualquier especie de tipo salvaje o especies relacionadas o géneros relacionados de una planta cultivada.
- El término "plantas cultivadas" debe entenderse que incluye las plantas que han sido modificadas por el cultivo, mutagénesis o ingeniería genética incluyendo, pero no limitando a los productos biotecnológicos agrícolas en el 45 mercado o en desarrollo (cf. http://www.bio.org/speeches/pubs/er/agri_products.asp). Las plantas modificadas genéticamente son plantas cuyo material genético ha sido modificado de tal modo mediante el uso de técnicas de ADN recombinante que, en circunstancias naturales, no se pueden obtener fácilmente mediante cruzamiento, mutaciones o recombinación natural. Normalmente, se han integrado uno o más genes en el material genético de 50 una planta modificada genéticamente para mejorar determinadas propiedades de la planta. Dichas modificaciones genéticas también incluyen, pero no se limitan a, modificación postraduccional dirigida de proteína o proteínas, oligo- o polipéptidos, por ejemplo, mediante glicosilación o adiciones de polímeros, tales como restos prenilados, acetilados o farnesilados o restos PEG.
- Las plantas que han sido modificadas mediante cultivo, mutagénesis o ingeniería genética, por ejemplo, se han 55 vuelto tolerantes a las aplicaciones de las clases específicas de herbicidas, tales como herbicidas de auxina, tales como dicamba o 2,4-D; herbicidas blanqueadores, tales como inhibidores de hidroxifenilpiruvato dioxigenasa (HPPD) o inhibidores de fitoeno desaturasa (PDS); inhibidores de acetolactato sintasa (ALS), tales como sulfonil ureas o imidazolinonas; inhibidores de la enolpiruvilshikimato-3-fosfato sintasa (EPSPS), tales como el 60 glifosato; inhibidores de la glutamina sintetasa (GS), tales como el glufosinato; inhibidores de protoporfirinógeno-IX oxidasa; inhibidores de la biosíntesis de lípidos, tales como inhibidores de acetil CoA carboxilasa (ACCase); o herbicidas de oxinilo (es decir, bromoxinilo o ioxinilo) como resultado de procedimientos convencionales de cultivo o ingeniería genética. Además, las plantas se han hecho resistentes a múltiples clases de herbicidas a través de 65 múltiples modificaciones genéticas, tales como la resistencia tanto al glifosato como al glufosinato o tanto al glifosato como a un herbicida de otra clase, tales como inhibidores de ALS, inhibidores de HPPD, herbicidas de auxina o

inhibidores de ACCasa. Estas tecnologías de resistencia a herbicidas se describen, por ejemplo, en Pest Managem. Sci. 61, 2005, 246; 61, 2005, 258; 61, 2005, 277; 61, 2005, 269; 61, 2005, 286; 64, 2008, 326; 64, 2008, 332; Weed Sci. 57, 2009, 108; Austral. J. Agricult. Res. 58, 2007, 708; Science 316, 2007, 1185; y referencias citadas en el mismo. Varias plantas cultivadas se han vuelto tolerantes a los herbicidas mediante procedimientos convencionales de cultivo (mutagénesis), por ejemplo, la colza de verano Clearfield® (Canola, BASF SE, Alemania) es tolerante a las imidazolinonas, por ejemplo, imazamox, o los girasoles ExpressSun® (DuPont, EE.UU.) son tolerantes a sulfonilureas, por ejemplo tribenurón. Se han utilizado procedimientos de ingeniería genética para hacer que plantas cultivadas, tales como la soja, el algodón, el maíz, la remolacha y la colza sean tolerantes a herbicidas, tales como el glifosato y el glufosinato, algunos de los cuales están disponibles comercialmente con los nombres comerciales RoundupReady® (tolerantes al glifosato, Monsanto, EE. UU.), Cultivance® (tolerante a imidazolinona, BASF SE, Alemania) y LibertyLink® (tolerante al glufosinato, Bayer CropScience, Alemania).

Además, también se cubren las plantas que son por el uso de técnicas de ADN recombinantes capaces de sintetizar una o más proteínas insecticidas, especialmente aquellas conocidas del género bacteriano *Bacillus*, especialmente de *Bacillus thuringiensis*, tales como delta - endotoxinas, por ejemplo CryIA (b), CryIA (c), CryIF, CryIF(a2), CryIIA (b), CryIIIA, CryIIIB(b1) o Cry9c; proteínas insecticidas vegetativas (VIP), por ejemplo, VIP1, VIP2, VIP3 o VIP3A; proteínas insecticidas de bacterias que colonizan nematodos, por ejemplo *Photorhabdus spp.* o *Xenorhabdus spp.*; toxinas producidas por animales, tales como toxinas de escorpión, toxinas de arácnidos, toxinas de avispas u otras neurotoxinas específicas de insectos; toxinas producidas por hongos, tales como toxinas de Streptomycetes, lectinas de plantas, tales como lectinas de guisante o cebada; aglutininas; inhibidores de proteinasas, tales como inhibidores de tripsina, inhibidores de serina proteasa, inhibidores de patatina, cistatina o papaína; proteínas inactivadoras de ribosomas (RIP), tales como ricina, RIP de maíz, abrina, lufina, saporina o briodina; enzimas del metabolismo de esteroides, tales como 3-hidroxiesteroide oxidasa, ecdiesteroide-IDP-glicosil-transferasa, colesterol oxidasas, inhibidores de ecdisona o HMG-CoA-reductasa; bloqueadores de los canales iónicos, tales como bloqueadores de los canales de sodio o calcio; esterasa de hormona juvenil; receptores de hormonas diuréticas (receptores de helicoquinina); estilben sintasa, bibencil sintasa, quitinasas o glucanasas. En el contexto de la presente invención, estas proteínas insecticidas o toxinas deben entenderse expresamente también como pre-toxinas, proteínas híbridas, proteínas truncadas o de cualquier modo modificadas. Las proteínas híbridas se caracterizan por una nueva combinación de dominios proteicos (véase, por ejemplo, el documento WO 02/015701). Otros ejemplos de dichas toxinas o plantas modificadas genéticamente capaces de sintetizar dichas toxinas se describen, por ejemplo, en EP-A 374 753, WO 93/007278, WO 95/34656, EP-A 427 529, EP-A 451 878, WO 03/18810 y WO 03/52073. Los procedimientos para producir tales plantas modificadas genéticamente son generalmente conocidos por el experto en la técnica y se describen, por ejemplo, en las publicaciones mencionadas anteriormente. Estas proteínas insecticidas contenidas en las plantas modificadas genéticamente imparten a las plantas productoras de estas proteínas tolerancia a plagas nocivas de todos los grupos taxonómicos de artrópodos, especialmente a los escarabajos (Coeloptera), insectos de dos alas (Diptera) y polillas (Lepidoptera) y a los nematodos. (Nematoda). Las plantas genéticamente modificadas capaces de sintetizar una o más proteínas insecticidas se describen, por ejemplo, en las publicaciones mencionadas anteriormente, y algunas de las cuales están disponibles comercialmente, tales como YieldGard® (cultivares de maíz que producen la toxina Cry1Ab), YieldGard® Plus (cultivares de maíz que producen toxinas Cry1Ab y Cry3Bb1), Starlink® (cultivares de maíz que producen la toxina Cry9c), Herculex® RW (cultivares de maíz que producen Cry34Ab1, Cry35Ab1 y la enzima fosfinotricina-N-acetiltransferasa[PAT]); NuCOTN® 33B(cultivares de algodón que producen la toxina Cry1Ac), Bollgard® I (cultivares de algodón que producen la toxina Cry1Ac), Bollgard® II (cultivares de algodón que producen las toxinas Cry1Ac y Cry2Ab2); VIPCOT® (cultivares de algodón que producen una toxina VIP); NewLeaf® (cultivares de patata que producen la toxina Cry3A); Bt-Xtra®, NatureGard®, KnockOut®, BiteGard®, Protecta®, Bt11 (por ejemplo, Agrisure® CB) y Bt176 de Syngenta Seeds SAS, Francia, (cultivares de maíz que producen la toxina Cry1Ab y enzima PAT), MIR604 de Syngenta Seeds SAS, Francia (cultivares de maíz que producen una versión modificada de la toxina Cry3A, véase WO 03/018810), MON 863 de Monsanto Europe SA, Bélgica (cultivares de maíz que producen la toxina Cry3Bb1), IPC531 de Monsanto Europe SA, Bélgica (cultivares de algodón que producen una versión modificada de la toxina Cry1Ac) y 1507 de Pioneer Overseas Corporation, Bélgica (cultivares de maíz que producen la toxina Cry1Fy la enzima PAT).

Por otra parte, también se cubren las plantas que son por el uso de técnicas de ADN recombinante capaces de sintetizar una o más proteínas para aumentar la resistencia o tolerancia de las plantas a los patógenos bacterianos, virales o fúngicas. Ejemplos de tales proteínas son las llamadas "proteínas relacionadas con la patogénesis" (proteínas PR, ver, por ejemplo, EP-A 392 225), genes de resistencia a enfermedades de las plantas (por ejemplo, cultivares de patata, que expresan genes de resistencia que actúan contra *Phytophthora infestans* derivados de la patata silvestre mexicana *Solanum bulbocastanum*) o T4-lisozima (por ejemplo, cultivares de patata capaces de sintetizar estas proteínas con mayor resistencia frente a bacterias, tales como *Erwinia amylovora*). Los procedimientos para producir tales plantas modificadas genéticamente son generalmente conocidos por el experto en la técnica y se describen, por ejemplo, en las publicaciones mencionadas anteriormente.

Además, también se cubren las plantas que son por el uso de técnicas de ADN recombinante capaces de sintetizar una o más proteínas para aumentar la productividad (por ejemplo, la producción de biomasa, rendimiento de grano, contenido de almidón, contenido de aceite o contenido de proteínas), la tolerancia a sequía, salinidad u otros

factores ambientales limitantes del crecimiento o tolerancia a plagas y patógenos fúngicos, bacterianos o virales de esas plantas.

5 Por otra parte, también se cubren las plantas que contienen por el uso de técnicas de ADN recombinante una cantidad modificada de sustancias de contenido o nuevas sustancias de contenido, específicamente para mejorar la nutrición humana o animal, por ejemplo, cultivos de aceite que producen ácidos grasos omega-3 de cadena larga o ácidos grasos omega-9 insaturados que son buenos para la salud (por ejemplo, colza Nexera®, DOW Agro Sciences, Canadá).

10 Además, también se cubren plantas que contienen por el uso de técnicas de ADN recombinante una cantidad modificada de sustancias de contenido o nuevas sustancias de contenido, específicamente para mejorar la producción de materias primas, por ejemplo patatas que producen mayores cantidades de amilopectina (por ejemplo, patata Amflora®, BASFSE, Alemania).

15 Los restos orgánicos mencionados en las definiciones anteriores de las variables son - como el término halógeno - términos colectivos para listados individuales de los miembros individuales del grupo. El prefijo C_n-C_m indica en cada caso el número posible de átomos de carbono en el grupo.

20 El término halógeno significa en cada caso flúor, bromo, cloro o yodo, en particular flúor, cloro o bromo.

25 El término "alquilo", tal como se usa en el presente documento y en los restos alquilo de alcoxi, alquiltio, alquilsulfonilo, alquilsulfonilo, alquilcarbonilo, alcoxicarbonilo y similares se refiere a radicales hidrocarburos saturados de cadena lineal o ramificados que tienen de 1 a 2 ("alquilo C₁-C₂"), de 1 a 3 ("alquilo C₁-C₃"), de 1 a 4 ("alquilo C₁-C₄"), de 1 a 6 ("alquilo C₁-C₆"), de 1 a 8 ("alquilo C₁-C₈") o de 1 a 10 ("alquilo C₁-C₁₀") átomos de carbono. Alquilo C₁-C₂ es metilo o etilo. Alquilo C₁-C es además propilo e isopropilo. Alquilo C₁-C₄ es adicionalmente butilo, 1-metilpropilo (sec-butilo), 2-metilpropilo (isobutilo) o 1,1-dimetiletilo (terc-butilo). Alquilo C₁-C₆ es adicionalmente también, por ejemplo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, hexilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentil, 3-metilpentil, 4-metilpentil, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3, 3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo o 1-etil-2-metilpropilo. Alquilo C₁-C₈ es adicionalmente también, por ejemplo, heptilo, octilo, 2-etilhexilo e isómeros posicionales de los mismos. Alquilo C₁-C₁₀ es adicionalmente también, por ejemplo, nonilo, decilo e isómeros posicionales de los mismos.

35 El término "haloalquilo", tal como se usa en el presente documento, que también se expresa como "alquilo que está halogenado parcial o completamente", se refiere a grupos alquilo de cadena lineal o ramificados que tienen de 1 a 2 ("haloalquilo C₁-C₂"), de 1 a 3 ("haloalquilo C₁-C₃"), de 1 a 4 ("haloalquilo C₁-C₄"), de 1 a 6 ("haloalquilo C₁-C₆"), de 1 a 8 ("haloalquilo C₁-C₈") o de 1 a 10 ("haloalquilo C₁-C₁₀") átomos de carbono (como se mencionó anteriormente), donde algunos o todos los átomos de hidrógeno en estos grupos están reemplazados por átomos de halógeno como se mencionó anteriormente: en particular haloalquilo C₁-C₂, tal como clorometilo, bromometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorodifluorometilo, 1-cloroetilo, 1-bromoetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-cloro-2-fluoroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo o pentafluoroetilo. Haloalquilo C₁-C₃ es además, por ejemplo, 1-fluoropropilo, 2-fluoropropilo, 3-fluoropropilo, 1,1-difluoropropilo, 2,2-difluoropropilo, 1,2-difluoropropilo, 3,3-difluoropropilo, 3,3,3-trifluoropropilo, heptafluoropropilo, 1,1,1-trifluoroprop-2-ilo, 3-cloropropilo y similares. Son ejemplos de haloalquilo C₁-C₄, además de los mencionados para haloalquilo C₁-C₃, 4-clorobutilo y similares.

45 "Halometilo" es metilo en el que 1, 2 o 3 de los átomos de hidrógeno están reemplazados por átomos de halógeno. Los ejemplos son bromometilo, clorometilo, fluorometilo, diclorometilo, triclorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorodifluorometilo y similares.

50 El término "alqueno", tal como se usa en este documento se refiere a radicales de hidrocarburo monoinsaturado de cadena lineal o ramificados que tienen de 2 a 3 ("alqueno C₂-C₃"), de 2 a 4 ("alqueno C₂-C₄"), de 2 a 6 ("alqueno C₂-C₆"), de 2 a 8 ("alqueno C₂-C₈") o de 2 a 10 ("alqueno C₂-C₁₀") átomos de carbono y un doble enlace en cualquier posición, por ejemplo alqueno C₂-C₃, tal como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo o 1-metiletenilo; alqueno C₂-C₄, tal como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metiletenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo o 2-metil-2-propenilo; alqueno C₂-C₆, tal como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metiletenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-1-butenilo, 2-metil-1-butenilo, 3-metil-1-butenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1,2-dimetil-1-propenilo, 1,2-dimetil-2-propenilo, 1-etil-1-propenilo, 1-etil-2-propenilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1-metil-1-pentenilo, 2-metil-1-pentenilo, 3-metil-1-pentenilo, 4-metil-1-pentenilo, 1-metil-2-pentenilo, 2-metil-2-pentenilo, 3-metil-2-pentenilo, 4-metil-2-pentenilo, 1-metil-3-pentenilo, 2-metil-3-pentenilo, 3-metil-3-pentenilo, 4-metil-3-pentenilo, 1-metil-4-pentenilo, 2-metil-4-pentenilo, 3-metil-4-pentenilo, 4-metil-4-pentenilo, 1,1-dimetil-2-butenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, 1,2-dimetil-1-butenilo, 1,2-dimetil-2-butenilo, 1,2-dimetil-3-butenilo, 1,3-dimetil-1-butenilo, 1,3-dimetil-2-butenilo, 1,3-

5 dimetil-3-butenilo, 2,2-dimetil-3-butenilo, 2,3-dimetil-1-butenilo, 2,3-dimetil-2-butenilo, 2,3-dimetil-3-butenilo, 3,3-dimetil-1-butenilo, 3,3-dimetil-2-butenilo, 1-etil-1-butenilo, 1-etil-2-butenilo, 1-etil-3-butenilo, 2-etil-1-butenilo, 2-etil-2-butenilo, 2-etil-3-butenilo, 1,1,2-trimetil-2-propenilo, 1-etil-1-metil-2-propenilo, 1-etil-2-metil-1-propenilo, 1-etil-2-metil-2-propenilo y similares, o alqueno C_2-C_{10} , tales como los radicales mencionados para alqueno C_2-C_6 y adicionalmente 1-heptenilo, 2-heptenilo, 3-heptenilo, 1-octenilo, 2-octenilo, 3-octenilo, 4-octenilo, 1-nonenilo, 2-nonenilo, 3-nonenilo, 4-nonenilo, 1-decenilo, 2-decenilo, 3-decenilo, 4-decenilo, 5-decenilo y los isómeros posicionales del mismo.

10 El término "haloalqueno", tal como se usa en el presente documento, que también se expresa como "alqueno que está halogenado parcial o completamente", se refiere a restos hidrocarburo insaturados de cadena lineal o ramificada que tienen de 2 a 3 ("haloalqueno C_2-C_3 "), de 2 a 4 ("haloalqueno C_2-C_4 "), de 2 a 6 ("haloalqueno C_2-C_6 "), de 2 a 8 ("haloalqueno C_2-C_8 ") o de 2 a 10 ("haloalqueno C_2-C_{10} ") átomos de carbono y un doble enlace en cualquier posición (como se mencionó anteriormente), donde algunos o todos los átomos de hidrógeno en estos grupos están reemplazados por átomos de halógeno como se mencionó anteriormente, en particular flúor, cloro y bromo, por ejemplo clorovinilo, cloroalilo y similares.

20 El término "alquino", tal como se usa en este documento se refiere a grupos hidrocarburos de cadena lineal o ramificada que tienen de 2 a 3 ("alquino C_2-C_3 "), de 2 a 4 ("alquino C_2-C_4 "), de 2 a 6 ("alquino C_2-C_6 "), de 2 a 8 ("alquino C_2-C_8 "), o de 2 a 10 ("alquino C_2-C_{10} ") átomos de carbono y uno o dos triples enlaces en cualquier posición, por ejemplo alquino C_2-C_3 , tal como etinilo, 1-propinilo o 2-propinilo; alquino C_2-C_4 , tal como etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo, 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 1-metil-2-propinilo y similares, alquino C_2-C_6 , tales como etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo, 1-butinilo, 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 1-metil-2-propinilo, 1-pentinilo, 2-pentinilo, 3-pentinilo, 4-pentinilo, 1-metil-2-butinilo, 1-metil-3-butinilo, 2-metil-3-butinilo, 3-metil-1-butinilo, 1,1-dimetil-2-propinilo, 1-etil-2-propinilo, 1-hexinilo, 2-hexinilo, 3-hexinilo, 4-hexinilo, 5-hexinilo, 1-metil-2-pentinilo, 1-metil-3-pentinilo, 1-metil-4-pentinilo, 2-metil-3-pentinilo, 2-metil-4-pentinilo, 3-metil-1-pentinilo, 3-metil-4-pentinilo, 4-metil-1-pentinilo, 4-metil-2-pentinilo, 1,1-dimetil-2-butinilo, 1,1-dimetil-3-butinilo, 1,2-dimetil-3-butinilo, 2,2-dimetil-3-butinilo, 3,3-dimetil-1-butinilo, 1-etil-2-butinilo, 1-etil-3-butinilo, 2-etil-3-butinilo, 1-etil-1-metil-2-propinilo y similares;

30 El término "haloalquino", tal como se usa en el presente documento, que también se expresa como "alquino que está parcialmente o completamente halogenado", se refiere a radicales hidrocarburo insaturados de cadena lineal o ramificada que tiene de 2 a 3 ("haloalquino C_2-C_3 "), de 2 a 4 ("haloalquino C_2-C_4 "), de 3 a 4 ("haloalquino C_3-C_4 "), de 2 a 6 ("haloalquino C_2-C_6 "), de 2 a 8 ("haloalquino C_2-C_8 ") o de 2 a 10 ("haloalquino C_2-C_{10} ") átomos de carbono y uno o dos triples enlaces en cualquier posición (como se mencionó anteriormente), donde algunos o todos de la los átomos de hidrógeno en estos grupos se reemplazan por átomos de halógeno como se mencionó anteriormente, en particular flúor, cloro y bromo;

40 El término "cicloalquilo", tal como se utiliza en este documento, se refiere a radicales hidrocarburos saturados mono- o bi- o policíclicos que tienen de 3 a 8 ("cicloalquilo C_3-C_8 "), en particular de 3 a 6 ("cicloalquilo C_3-C_6 ") o de 3 a 5 ("cicloalquilo C_3-C_5 "), de 3 a 4 ("cicloalquilo C_3-C_4 ") de átomos de carbono. Ejemplos de radicales monocíclicos que tienen de 3 a 4 átomos de carbono comprenden ciclopropilo y ciclobutilo. Ejemplos de radicales monocíclicos que tienen de 3 a 5 átomos de carbono comprenden ciclopropilo, ciclobutilo y ciclopentilo. Ejemplos de radicales monocíclicos que tienen de 3 a 6 átomos de carbono comprenden ciclopropilo, ciclobutilo, ciclohexilo y ciclohexilo. Ejemplos de radicales monocíclicos que tienen de 3 a 8 átomos de carbono comprenden ciclopropilo, ciclobutilo, ciclohexilo, cicloheptilo y ciclooctilo. Ejemplos de radicales bicíclicos que tienen 7 u 8 átomos de carbono comprenden biciclo[2.2.1] heptilo, biciclo[3.1.1] heptilo, biciclo[2.2.2] octilo y biciclo[3.2.1] octilo. Preferiblemente, el término cicloalquilo indica un radical hidrocarburo saturado monocíclico.

50 El término "halocicloalquilo", tal como se utiliza en el presente documento, que también se expresa como "cicloalquilo que está parcialmente o completamente halogenado", se refiere a grupos hidrocarburos saturados mono- o bi- o policíclicos que tienen de 3 a 8 ("halocicloalquilo C_3-C_8 ") o preferentemente de 3 a 6 ("halocicloalquilo C_3-C_6 ") o de 3 a 5 ("halocicloalquilo C_3-C_5 ") o de 3 a 4 ("halocicloalquilo C_3-C_4 ") miembros del anillo de carbono (como se mencionó anteriormente) en los que algunos o todos los átomos de hidrógeno están reemplazados por átomos de halógeno como se mencionó anteriormente, en particular flúor, cloro y bromo.

55 El término "cicloalquil-alquilo C_1-C_4 " se refiere a un grupo cicloalquilo C_3-C_8 ("cicloalquil C_3-C_8 alquilo C_1-C_4 "), preferiblemente un grupo cicloalquilo C_3-C_6 ("cicloalquil C_3-C_6 alquilo C_1-C_4 "), más preferiblemente un grupo cicloalquilo C_3-C_4 ("cicloalquil C_3-C_4 alquilo C_1-C_4 ") como se definió anteriormente (preferiblemente un grupo cicloalquilo monocíclico) que está unido al resto de la molécula a través de un grupo alquilo C_1-C_4 , como se definió anteriormente. Ejemplos de cicloalquil C_3-C_4 alquilo C_1-C_4 son ciclopropilmetilo, ciclopropiletilo, ciclopropilpropilo, ciclobutilmetilo, ciclobutiletilo y ciclobutilpropilo. Ejemplos de cicloalquil C_3-C_6 alquilo C_1-C_4 , aparte de los mencionados para cicloalquil C_3-C_4 alquilo C_1-C_4 , son ciclopentilmetilo, ciclopentiletilo, ciclopentilpropilo, ciclohexilmetilo, ciclohexiletilo y ciclohexilpropilo. Ejemplos de cicloalquil C_3-C_8 alquilo C_1-C_4 , aparte de los mencionados para cicloalquil C_3-C_6 alquilo C_1-C_4 , son cicloheptilmetilo, cicloheptiletilo, ciclooctilmetilo y similares.

65 El término " halocicloalquil C_3-C_8 alquilo C_1-C_4 " se refiere a un grupo halocicloalquilo C_3-C_8 , como se definió

anteriormente, que está unido al resto de la molécula a través de un grupo alquilo C₁-C₄, como se definió anteriormente.

El término "cicloalqueno", tal como se usa en este documento, se refiere a radicales hidrocarburos monocíclicos con al menos un doble enlace C-C en el anillo, cuyo anillo, sin embargo, no es aromático, los radicales hidrocarburos que tienen de 3 a 8 ("cicloalquilo C₃-C₈") átomos de carbono. Ejemplos son ciclopropenilo, tales como cicloprop-1-enilo y cicloprop-2-enilo, ciclobutenilo, como ciclobut-1-enilo y ciclobut-2-enilo, ciclopentenilo, como ciclopent-1-enilo, ciclopent-2-enilo y ciclopent-3-enilo, ciclopentadienilo, como ciclopenta-1,3-dienilo, ciclopenta-1,4-dienilo y ciclopenta-2,4-dienilo, ciclohexenilo, como ciclohex-1-enilo, ciclohex-2-enilo y ciclohex-3-enilo, ciclohexadienilo, como ciclohexa-1,3-dienilo, ciclohexa-1,4-dienilo, ciclohexa-1,5-dienilo y ciclohexa-2,5-dienilo, cicloheptenilo, cicloheptadienilo, cicloheptatrienilo, ciclooctenilo, ciclooctadienilo, ciclooctatrienilo y ciclooctatetraenilo.

El término "halocicloalqueno", tal como se utiliza en este documento, se refiere a radicales hidrocarburos monocíclicos con al menos un doble enlace C-C en el anillo, cuyo anillo, sin embargo, no es aromático, los radicales hidrocarburos que tienen de 3 a 8 ("halocicloalquilo C₃-C₈") átomos de carbono, y en el que algunos o todos los átomos de hidrógeno están reemplazados por átomos de halógeno, como se mencionó anteriormente, en particular flúor, cloro y bromo.

El término "alcoxi C₁-C₂" es un grupo alquilo C₁-C₂, como se definió anteriormente, unido a través de un átomo de oxígeno. El término "alcoxi C₁-C₃" es un grupo alquilo C₁-C₃, como se definió anteriormente, unido a través de un átomo de oxígeno. El término "alcoxi C₁-C₄" es un grupo alquilo C₁-C₄, como se definió anteriormente, unido a través de un átomo de oxígeno. El término "alcoxi C₁-C₆" es un grupo alquilo C₁-C₆, como se definió anteriormente, unido a través de un átomo de oxígeno. El término "alcoxi C₁-C₁₀" es un grupo alquilo C₁-C₁₀, como se definió anteriormente, unido a través de un átomo de oxígeno. Alcoxi C₁-C₂ es metoxi o etoxi. Alcoxi C₁-C₃ es adicionalmente, por ejemplo, n-propoxi y 1-metiletoxi (isopropoxi). Alcoxi C₁-C₄ es adicionalmente, por ejemplo, butoxi, 1-metilpropoxi (secbutoxi), 2-metilpropoxi (isobutoxi) o 1,1-dimetiletoxi (terc-butoxi). Alcoxi C₁-C₆ es, además, por ejemplo, pentoxi, 1-metilbutoxi, 2-metilbutoxi, 3-metilbutoxi, 1,1-dimetilpropoxi, 1,2-dimetilpropoxi, 2,2-dimetilpropoxi, 1-etilpropoxi, hexoxi, 1-metilpentoxi, 2-metilpentoxi, 3-metilpentoxi, 4-metilpentoxi, 1,1-dimetilbutoxi, 1,2-dimetilbutoxi, 1,3-dimetilbutoxi, 2,2-dimetilbutoxi, 2,3-dimetilbutoxi, 3,3-dimetilbutoxi, 1-etilbutoxi, 2-etilbutoxi, 1,1,2-trimetilpropoxi, 1,2,2-trimetilpropoxi, 1-etil-1-metilpropoxi o 1-etil-2-metilpropoxi. Alcoxi C₁-C₈ es adicionalmente, por ejemplo, heptiloxi, octiloxi, 2-etilhexiloxi e isómeros posicionales de los mismos. Alcoxi C₁-C₁₀ es adicionalmente, por ejemplo, noniloxi, deciloxi e isómeros posicionales de los mismos.

El término "haloalcoxi C₁-C₂" es un grupo haloalquilo C₁-C₂, como se definió anteriormente, unido a través de un átomo de oxígeno. El término "haloalcoxi C₁-C₃" es un grupo haloalquilo C₁-C₃, como se definió anteriormente, unido a través de un átomo de oxígeno. El término "haloalcoxi C₁-C₄" es un grupo haloalquilo C₁-C₄, como se definió anteriormente, unido a través de un átomo de oxígeno. El término "haloalcoxi C₁-C₆" es un grupo haloalquilo C₁-C₆, como se definió anteriormente, unido mediante un átomo de oxígeno. El término "haloalcoxi C₁-C₁₀" es un grupo haloalquilo C₁-C₁₀, como se definió anteriormente, unido mediante un átomo de oxígeno. Haloalcoxi C₁-C₂ es, por ejemplo, OCH₂F, OCHF₂, OCF₃, OCH₂Cl, OCHCl₂, OCCl₃, clorofluorometoxi, diclorofluorometoxi, clorodifluorometoxi, 2-fluoroetoxi, 2-cloroetoxi, 2-bromoetoxi, 2-yodoetoxi, 2,2-difluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2-fluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, 2,2-dicloro-2-fluoroetoxi, 2,2, 2-tricloroetoxi u OC₂F₅. Haloalcoxi C₁-C₃ es, además, por ejemplo, 2-fluoropropoxi, 3-fluoropropoxi, 2,2-difluoropropoxi, 2,3-difluoropropoxi, 2-cloropropoxi, 3-cloropropoxi, 2,3-dicloropropoxi, 2-bromopropoxi, 3-bromopropoxi, 3,3,3-trifluoropropoxi, 3,3,3-tricloropropoxi, OCH₂-C₂F₅, OCF₂-C₂F₅, 1-(CH₂F)-2-fluoroetoxi, 1-(CH₂Cl)-2-cloroetoxi o 1-(CH₂Br)-2-bromoetoxi. Haloalcoxi C₁-C₄ es adicionalmente, por ejemplo, 4-fluorobutoxi, 4-clorobutoxi, 4-bromobutoxi o nonafluorobutoxi. Haloalcoxi C₁-C₆ haloalcoxi es, además, por ejemplo, 5-fluoropentoxi, 5-cloropentoxi, 5-bromopentoxi, 5-yodopentoxi, undecafluoropentoxi, 6-fluorohexoxi, 6-clorohexoxi, 6-bromohexoxi, 6-yodohexoxi o dodecafluorohexoxi.

El término "alcoxi C₁-C₃ alquilo C₁-C₃" como se usa en este documento, se refiere a un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 3 átomos de carbono, como se definió anteriormente, donde un átomo de hidrógeno se reemplaza por un grupo alcoxi C₁-C₃, como se definió anteriormente. El término "alcoxi C₁-C₄ alquilo C₁-C₄ alquilo" como se usa en este documento, se refiere a un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene 1 a 4 átomos de carbono, como se definió anteriormente, en donde un átomo de hidrógeno se reemplaza por un grupo alcoxi C₁-C₄, como se definió anteriormente. El término "alcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆" como se usa en este documento, se refiere a un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, como se definió anteriormente, donde un átomo de hidrógeno se reemplaza por un grupo alcoxi C₁-C₆, como se definió anteriormente. Ejemplos son metoximetilo, etoximetilo, propoximetilo, isopropoximetilo, n-butoximetilo, secbutoximetilo, isobutoximetilo, terc-butoximetilo, 1-metoxietilo, 1-etoxietilo, 1-propoxietilo, 1-isopropoxietilo, 1-n-butylbutoxietilo, 1-isobutoxietilo, 1-terc-butoxietilo, 2-metoxietilo, 2-etoxietilo, 2-propoxietilo, 2-isopropoxietilo, 2-n-butoxietilo, 2-sec-butoxietilo, 2-isobutoxietilo, 2-terc-butoxietilo, 1-metoxipropilo, 1-etoxipropilo, 1-propoxipropilo, 1-isopropoxipropilo, 1-n-butoxipropilo, 1-sec-butoxipropilo, 1-isobutoxipropilo, 1-terc-butoxipropilo, 2-metoxipropilo, 2-etoxipropilo, 2-metoxipropilo, 2-etoxipropilo, 2-isopropoxipropilo, 2-n-butoxipropilo, 2-sec-butoxipropilo, 2-isobutoxipropilo, 2-terc-butoxipropilo, 3-metoxipropilo, 3-etoxipropilo, 3-propoxipropilo, 3-isopropoxipropilo, 3-n-butoxipropilo, 3-isobutoxipropilo, 3-terc-butoxipropilo y similares.

El término "alcoxi C₁-C₄-metilo" como se usa en el presente documento, se refiere a metilo en el que un átomo de hidrógeno es reemplazado por un grupo alcoxi C₁-C₄, como se definió anteriormente. El término "alcoxi C₁-C₆-metilo" como se usa en este documento, se refiere a metilo en el que un átomo de hidrógeno está reemplazado por un grupo alcoxi C₁-C₆, como se definió anteriormente. Los ejemplos son metoximetilo, etoximetilo, propoximetilo, isopropoximetilo, n-butoximetilo, sec-butoximetilo, isobutoximetilo, terc-butoximetilo, pentiloximetilo, hexiloximetilo y similares.

Haloalcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆ es un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 6, especialmente 1 a 4 átomos de carbono (=haloalcoxi C₁-C₆ alquilo-C₁-C₄), en el que uno de los átomos de hidrógeno está reemplazado por un grupo alcoxi C₁-C₆ y en el que al menos uno, por ejemplo 1, 2, 3, 4 o todos los átomos de hidrógeno restantes (ya sea en el resto alcoxi o en el resto alquilo o en ambos) se reemplazan por átomos de halógeno. Haloalcoxi C₁-C₄ alquilo C₁-C₄ es un grupo alquilo de cadena lineal ramificada que tiene de 1 a 4 átomos de carbono, en donde uno de los átomos de hidrógeno está reemplazado por un grupo alcoxi C₁-C₄ y en el que al menos uno, por ejemplo 1, 2, 3, 4 o todos los átomos de hidrógeno restantes (ya sea en el resto alcoxi o en el resto alquilo o en ambos) están reemplazados por átomos de halógeno. Ejemplos son difluorometoximetilo (CHF₂OCH₂), trifluorometoximetilo, 1-difluorometoxietilo, 1-trifluorometoxietilo, 2-difluorometoxietilo, 2-trifluorometoxietilo, difluorometoximetilo (CH₃OCF₂), 2-difluorometoximetilo (CH₃OCF₂), 2-difluorometoxietilo 2-difluoro-2-metoxietilo y similares.

El término "alquiltio C₁-C₂" es un grupo alquilo C₁-C₂, como se definió anteriormente, unido a través de un átomo de azufre. El término "alquiltio C₁-C₃" es un grupo alquilo C₁-C₃, como se definió anteriormente, unido mediante un átomo de azufre. El término "alquiltio C₁-C₄" es un grupo alquilo C₁-C₄, como se definió anteriormente, unido mediante un átomo de azufre. El término "alquiltio C₁-C₆" es un grupo alquilo C₁-C₆, como se definió anteriormente, unido a través de un átomo de azufre. El término "alquiltio C₁-C₁₀" es un grupo alquilo C₁-C₁₀, como se definió anteriormente, unido mediante un átomo de azufre. Alquiltio C₁-C₂ es metiltio o etiltio. Alquiltio C₁-C₃ es adicionalmente, por ejemplo, n-propiltio o 1-metiletiltio (isopropiltio). Alquiltio C₁-C₄ es además, por ejemplo, butiltio, 1-metilpropiltio (sec-butiltio), 2-metilpropiltio (isobutiltio) o 1,1-dimeteiltio (terc-butiltio). Alquiltio C₁-C₆ es, además, por ejemplo, pentiltio, 1-metilbutiltio, 2-metilbutiltio, 3-metilbutiltio, 1,1-dimetilpropiltio, 1,2-dimetilpropiltio, 2,2-dimetilpropiltio, 1-etilpropiltio, hexiltio, 1-metilpentiltio, 2-metilpentiltio, 3-metilpentiltio, 4-metilpentiltio, 1,1-dimetilbutiltio, 1,2-dimetilbutiltio, 1,3-dimetilbutiltio, 2,2-dimetilbutiltio, 2,3-dimetilbutiltio, 3,3-dimetilbutiltio, 1-etilbutiltio, 2-etilbutiltio, 1,1,2-trimetilpropiltio, 1,2,2-trimetilpropiltio, 1-etil-1-metilpropiltio o 1-etil-2-metilpropiltio. Alquiltio C₁-C₈ es, además, por ejemplo, heptiltio, octiltio, 2-etilhexiltio y los isómeros posicionales de los mismos. Alquiltio C₁-C₁₀ es adicionalmente, por ejemplo, noniltio, deciltio e isómeros posicionales de los mismos.

El término "haloalquiltio C₁-C₂" es un grupo haloalquilo C₁-C₂, como se definió anteriormente, unido a través de un átomo de azufre. El término "haloalquiltio C₁-C₃" es un grupo haloalquilo C₁-C₃, como se definió anteriormente, unido mediante un átomo de azufre. El término "haloalquiltio C₁-C₄" es un grupo haloalquilo C₁-C₄, como se definió anteriormente, unido mediante un átomo de azufre. El término "haloalquiltio C₁-C₆" es un grupo haloalquilo C₁-C₆, como se definió anteriormente, unido mediante un átomo de azufre. El término "haloalquiltio C₁-C₁₀" es un grupo haloalquilo C₁-C₁₀, como se definió anteriormente, unido mediante un átomo de azufre. Haloalquiltio C₁-C₂ es, por ejemplo, SCH₂F, SCH₂F₂, SCF₃, SCH₂Cl, SCHCl₂, SCCl₃, clorofluorometiltio, diclorofluorometiltio, clorodifluorometiltio, 2-fluoroetiltio, 2-cloroetiltio, 2-bromoetiltio, 2-yodoetiltio, 2,2-difluoroetiltio, 2,2,2-trifluoroetiltio, 2-cloro-2-fluoroetiltio, 2-cloro-2,2-difluoroetiltio, 2,2-dicloro-2-fluoroetiltio, 2,2, 2-tricloroetiltio o SC₂F₅. Haloalquiltio C₁-C₃ es adicionalmente, por ejemplo, 2-fluoropropiltio, 3-fluoropropiltio, 2,2-difluoropropiltio, 2,3-difluoropropiltio, 2-cloropropiltio, 3-cloropropiltio, 2,3-dicloropropiltio, 2-bromopropiltio, 3-bromopropiltio, 3,3,3-trifluoropropiltio, 3,3,3-tricloropropiltio, SCH₂-C₂F₅, SCF₂-C₂F₅, 1-(CH₂F)-2-fluoroetiltio, 1-(CH₂Cl)-2-cloroetiltio o 1-(CH₂Br)-2-bromoetiltio. Haloalquiltio C₁-C₄ es adicionalmente, por ejemplo, 4-fluorobutiltio, 4-clorobutiltio, 4-bromobutiltio o nonafluorobutiltio. C₁-C₆ haloalquiltio es, además, por ejemplo, 5-fluoropentiltio, 5-cloropentiltio, 5-bromopentiltio, 5-iodopentiltio, undecafluoropentiltio, 6-fluorohexiltio, 6-clorohexiltio, 6-bromohexiltio, 6-iodohexiltio o dodecafluorohexiltio.

El término "alquil C₁-C₂ sulfinilo" es un grupo alquilo C₁-C₂, como se definió anteriormente, unido a través de un grupo sulfinilo [S(O)]. El término "alquil C₁-C₄ sulfinilo" es un grupo alquilo C₁-C₄, como se definió anteriormente, unido mediante un grupo sulfinilo [S(O)]. El término "alquil C₁-C₆ sulfinilo" es un grupo alquilo C₁-C₆, como se definió anteriormente, unido a través de un grupo sulfinilo [S(O)]. El término "alquil C₁-C₁₀ sulfinilo" es un grupo alquilo C₁-C₁₀, como se definió anteriormente, unido mediante un grupo sulfinilo [S(O)]. Alquil C₁-C₂ sulfinilo es metilsulfinilo o etilsulfinilo. Alquil C₁-C₃ sulfinilo es adicionalmente, por ejemplo, n-propilsulfinilo y 1-metiletilsulfinilo (isopropilsulfinilo). Alquil C₁-C₄ sulfinilo es adicionalmente, por ejemplo, butilsulfinilo, 1-metilpropilsulfinilo (sec-butilsulfinilo), 2-metilpropilsulfinilo (isobutilsulfinilo) o 1,1-dimeteilsulfinilo (terc-butilsulfinilo). Alquil C₁-C₆ sulfinilo es, además, por ejemplo, pentilsulfinilo, 1-metilbutilsulfinilo, 2-metilbutilsulfinilo, 3-metilbutilsulfinilo, 1,1-dimetilpropilsulfinilo, 1,2-dimetilpropilsulfinilo, 2,2-dimetilpropilsulfinilo, 1-etilpropilsulfinilo, hexilsulfinilo, 1-metilpentilsulfinilo, 2-metilpentilsulfinilo, 3-metilpentilsulfinilo, 4-metilpentilsulfinilo, 1,1-dimetilbutilsulfinilo, 1,2-dimetilbutilsulfinilo, 1,3-dimetilbutilsulfinilo, 2,2-dimetilbutilsulfinilo, 2,3-dimetilbutilos -dimetilbutilsulfinilo, 1-etilbutilsulfinilo, 2-etilbutilsulfinilo, 1,1,2-trimetilpropilsulfinilo, 1,2,2-trimetilpropilsulfinilo, 1-etil-1-metilpropilsulfinilo o 1-

etil-2-metilpropilsulfonilo. Alquil C₁-C₈ sulfonilo es, además, por ejemplo, heptilsulfonilo, octilsulfonilo, 2-etilhexilsulfonilo y los isómeros posicionales de los mismos. Alquil C₁-C₁₀ sulfonilo es adicionalmente, por ejemplo, nonilsulfonilo, decilsulfonilo e isómeros posicionales de los mismos.

5 El término "haloalquil C₁-C₂ sulfonilo" es un grupo haloalquilo C₁-C₂, como se definió anteriormente, unido a través de un grupo sulfonilo [S(O)₂]. El término "haloalquil C₁-C₄ sulfonilo" es un grupo haloalquilo C₁-C₄, como se definió anteriormente, unido mediante un grupo sulfonilo [S(O)₂]. El término "haloalquil C₁-C₆ sulfonilo" es un grupo haloalquilo C₁-C₆, como se definió anteriormente, unido mediante un grupo sulfonilo [S(O)₂]. El término "haloalquil C₁-C₁₀ sulfonilo" es un grupo haloalquilo C₁-C₁₀, como se definió anteriormente, unido mediante un grupo sulfonilo [S(O)₂]. Haloalquilsulfonilo C₁-C₂ es, por ejemplo, S(O)CH₂F, S(O)CHF₂, S(O)CF₃, S(O)CH₂Cl, S(O)CHCl₂, S(O)CCl₃, clorofluorometilsulfonilo, diclorofluorometilsulfonilo, clorodifluorometilsulfonilo, 2-fluoroetilsulfonilo, 2-cloroetilsulfonilo, 2-bromoetilsulfonilo, 2-yodoetilsulfonilo, 2,2-trifluoroetil-2,2-trifluoroetilsulfonilo, 2-yodoetilsulfonilo, 2,2-trifluoroetil-2,2-trifluoroetilsulfonilo 2-cloro-2,2-difluoroetilsulfonilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilsulfonilo, 2,2,2-tricloroetilsulfonilo o S(O)C₂F₅. Haloalquilsulfonilo C₁-C₃ es, además, por ejemplo, 2-fluoropropilsulfonilo, 3-fluoropropilsulfonilo, 2,2-difluoropropilsulfonilo, 2,3-difluoropropilsulfonilo, 2-cloropropilsulfonilo, 3-cloropropilsulfonilo, 2,3-dicloropropilsulfonilo, 2-bromopropilsulfonilo, 3-bromopropilsulfonilo, 3,3,3-trifluoropropilsulfonilo, 3,3,3-tricloropropilsulfonilo, S(O)CH₂-C₂F₅, S(O)CF₂-C₂F₅, 1-(CH₂F)-2-fluoroetilsulfonilo, 1-(CH₂Cl)-2-cloroetilsulfonilo y 1-(CH₂Br)-2-bromoetilsulfonilo. Haloalquilsulfonilo C₁-C₄ es, además, por ejemplo, 4-fluorobutilsulfonilo, 4-clorobutilsulfonilo, 4-bromobutilsulfonilo o nonafluorobutilsulfonilo. Haloalquilsulfonilo C₁-C₆ es adicionalmente, por ejemplo, 5-fluoropentilsulfonilo, 5-cloropentilsulfonilo, 5-bromopentilsulfonilo, 5-yodopentilsulfonilo, undecafluoropentilsulfonilo, 6-fluorohexilsulfonilo, 6-clorohexilohexilsulfonilo, 6-clorohexilohexilsulfonilo, 6-clorohexilsulfonilo, 6-clorohexilsulfonilo, 6-clorohexilsulfonilo, 6-clorohexilsulfonilo, 6-clorohexilsulfonilo, 6-clorohexilsulfonilo, 6-clorohexilsulfonilo.

25 El término "alquil C₁-C₂ sulfonilo" es un grupo alquilo C₁-C₂, como se definió anteriormente, unido a través de un grupo sulfonilo [S(O)₂]. El término "alquil C₁-C₃ sulfonilo" es un grupo alquilo C₁-C₃, como se definió anteriormente, unido a través de un grupo sulfonilo [S(O)₂]. El término "alquil C₁-C₄ sulfonilo" es un grupo alquilo C₁-C₄, como se definió anteriormente, unido a través de un grupo sulfonilo [S(O)₂]. El término "alquil C₁-C₆ sulfonilo" es un grupo alquilo C₁-C₆, como se definió anteriormente, unido a través de un grupo sulfonilo [S(O)₂]. El término "alquil C₁-C₁₀ sulfonilo" es un grupo alquilo C₁-C₁₀, como se definió anteriormente, unido a través de un grupo sulfonilo [S(O)₂]. Alquilsulfonilo C₁-C₂ es metilsulfonilo o etilsulfonilo. Alquilsulfonilo C₁-C₃ es adicionalmente, por ejemplo, n-propilsulfonilo o 1-metiletilsulfonilo (isopropilsulfonilo). Alquilsulfonilo C₁-C₄ es además, por ejemplo, butilsulfonilo, 1-metilpropilsulfonilo (sec-butilsulfonilo), 2-metilpropilsulfonilo (isobutilsulfonilo) o 1,1-dimetiletilsulfonilo (terc-butilsulfonilo). Alquilsulfonilo C₁-C₆ es, además, por ejemplo, pentilsulfonilo, 1-metilbutilsulfonilo, 2-metilbutilsulfonilo, 3-metilbutilsulfonilo, 1,1-dimetilpropilsulfonilo, 1,2-dimetilpropilsulfonilo, 2,2-dimetilpropilsulfonilo, 1-etilpropilsulfonilo, hexilsulfonilo, 1-metilpentilsulfonilo, 2-metilpentilsulfonilo, 3-metilpentilsulfonilo, 4-metilpentilsulfonilo, 1,1-dimetilbutilsulfonilo, 1,2-dimetilbutilsulfonilo, 1,3-dimetilbutilsulfonilo, 2,2-dimetilbutilsulfonilo, 2,3-dimetilbutilsulfonilo - dimetilbutilsulfonilo, 1-etilbutilsulfonilo, 2-etilbutilsulfonilo, 1,1,2-trimetilpropilsulfonilo, 1,2,2-trimetilpropilsulfonilo, 1-etil-1-metilpropilsulfonilo o 1-etil-2-metilpropilsulfonilo. Alquilsulfonilo C₁-C₈ es adicionalmente, por ejemplo, heptilsulfonilo, octilsulfonilo, 2-etilhexilsulfonilo e isómeros posicionales de los mismos. Alquilsulfonilo C₁-C₁₀ es adicionalmente, por ejemplo, nonilsulfonilo, decilsulfonilo e isómeros posicionales de los mismos.

45 El término "haloalquil C₁-C₂ sulfonilo" es un grupo haloalquilo C₁-C₂, como se definió anteriormente, unido a través de un grupo sulfonilo [S(O)₂]. El término "haloalquil C₁-C₃ sulfonilo" es un grupo haloalquilo C₁-C₃, como se definió anteriormente, unido a través de un grupo sulfonilo [S(O)₂]. El término "haloalquil C₁-C₄ sulfonilo" es un grupo haloalquilo C₁-C₄, como se definió anteriormente, unido a través de un grupo sulfonilo [S(O)₂]. El término "haloalquil C₁-C₆ sulfonilo" es un grupo haloalquilo C₁-C₆, como se definió anteriormente, unido a través de un grupo sulfonilo [S(O)₂]. El término "haloalquil C₁-C₁₀ sulfonilo" es un grupo haloalquilo C₁-C₁₀, como se definió anteriormente, unido a través de un grupo sulfonilo [S(O)₂]. C₁-C₂-Haloalquilsulfonilo es, por ejemplo, S(O)₂CH₂F, S(O)₂CHF₂, S(O)₂CF₃, S(O)₂CH₂Cl, S(O)₂CHCl₂, S(O)₂CCl₃, clorofluorometilsulfonilo, dicloro-fluorometilsulfonilo, clorodifluorometilsulfonilo, 2-fluoroetilsulfonilo, 2-cloroetilsulfonilo, 2-bromoetilsulfonilo, 2-yodoetilsulfonilo, 2,2-difluoroetilsulfonilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfonilo, 2-cloro-2-fluoroetilsulfonilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilsulfonilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilsulfonilo, 2,2,2-tricloroetilsulfonilo o S(O)₂C₂F₅. Haloalquilsulfonilo C₁-C₃ es adicionalmente, por ejemplo, 2-fluoropropilsulfonilo, 3-fluoropropilsulfonilo, 2,2-difluoropropilsulfonilo, 2,3-difluoropropilsulfonilo, 2-cloropropilsulfonilo, 3-cloropropilsulfonilo, 2,3-dicloropropilsulfonilo, 2-cloropropilsulfonilo, 2,3-dicloropropilsulfonilo, 3-bromopropilsulfonilo, 3,3,3-trifluoropropilsulfonilo, 3,3,3-tricloropropilsulfonilo, S(O)₂CH₂-C₂F₅, S(O)₂CF₂-C₂F₅, 1-(CH₂F)-2-fluoroetilsulfonilo, 1-(CH₂Cl)-2-cloroetilsulfonilo, 1-(CH₂Br)-2-bromoetilsulfonil. Haloalquilsulfonilo C₁-C₄ es adicionalmente, por ejemplo, 4-fluorobutilsulfonilo, 4-clorobutilsulfonilo, 4-bromobutilsulfonilo o nonafluorobutilsulfonilo. Haloalquilsulfonilo C₁-C₆ es adicionalmente, por ejemplo, 5-fluoropentilsulfonilo, 5-cloropentilsulfonilo, 5-bromopentilsulfonilo, 5-yodopentilsulfonilo, undecafluoropentilsulfonilo, 6-fluorohexilsulfonilo, 6-clorohexilohexilsulfonilo, 6-clorohexilsulfonilo, 6-clorohexilsulfonilo, 6-clorohexilsulfonilo, 6-clorohexilsulfonilo.

El sustituyente "oxo" sustituye a un grupo CH₂ por un grupo C(=O).

65 El término "alquilcarbonilo" es un grupo alquilo C₁-C₆ ("alquilcarbonilo C₁-C₆"), preferiblemente un grupo alquilo C₁-C₄ ("alquilcarbonilo C₁-C₄"), como se definió anteriormente, unido mediante un grupo carbonilo [C(=O)]. Los ejemplos

son acetilo (metilcarbonilo), propionilo (etilcarbonilo), propilcarbonilo, isopropilcarbonilo, n-butilcarbonilo y similares.

El término "haloalquilcarbonilo" es un grupo haloalquilo C₁-C₆ ("haloalquilcarbonilo C₁-C₆"), preferiblemente un grupo haloalquilo C₁-C₄ ("haloalquilcarbonilo C₁-C₄"), como se definió anteriormente, unido mediante un grupo carbonilo [C(=O)]. Los ejemplos son trifluorometilcarbonilo, 2,2,2-trifluoroetilcarbonilo y similares.

El término "alcoxicarbonilo" es un alcoxilo C₁-C₆ ("C₁-C₆ alcoxicarbonilo"), preferiblemente un grupo alcoxilo C₁-C₄ ("C₁-C₄ alcoxicarbonilo"), como se definió anteriormente, unido mediante un grupo carbonilo [C(=O)]. Los ejemplos son metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, propoxicarbonilo, isopropoxicarbonilo, n-butoxicarbonilo y similares.

El término "haloalcoxicarbonilo" es un haloalcoxilo C₁-C₆ ("C₁-C₆-haloalcoxicarbonilo"), preferiblemente un grupo haloalcoxilo C₁-C₄ ("C₁-C₄-haloalcoxicarbonilo"), tal como se definió anteriormente, unido mediante un grupo carbonilo [C(=O)]. Los ejemplos son trifluorometoxicarbonilo, 2,2,2-trifluoroetoxicarbonilo y similares.

El término "C₁-C₆ alquilamino" es un grupo -N(H)-alquilo C₁-C₆. Los ejemplos son metilamino, etilamino, propilamino, isopropilamino, butilamino y similares.

El término "di-(alquilo C₁-C₆)amino" es un grupo -N(alquilo C₁-C₆)₂. Los ejemplos son dimetilamino, dietilamino, etilmetilamino, dipropilamino, diisopropilamino, metilpropilamino, metilisopropilamino, etilpropilamino, etilisopropilamino, dibutilamino y similares.

El término "anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o máximamente insaturado de 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 o 10 miembros, que contiene 1, 2 o 3 (o 4) heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados de N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo" indica un anillo heteromonocíclico saturado, parcialmente insaturado o máximamente insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros o un anillo heterobicíclico saturado, parcialmente insaturado o máximamente insaturado de 8, 9 o 10 miembros que contiene 1, 2 o 3 (o 4) heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo.

Los anillos insaturados contienen al menos un doble enlace C-C y/o C-N y/o N-N. Los anillos máximamente insaturados contienen tantos enlaces dobles C-C y/o C-N y/o N-N conjugados como lo permita el tamaño del anillo. Los anillos heterocíclicos de 5 o 6 miembros máximamente insaturados son aromáticos. El anillo heterocíclico puede estar unido al resto de la molécula mediante un miembro de anillo de carbono o mediante un miembro de anillo de nitrógeno. Por supuesto, el anillo heterocíclico contiene al menos un átomo de carbono en el anillo. Si el anillo contiene más de un átomo de anillo de O, estos no son adyacentes.

El término "anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o insaturado máximo de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que contiene 1, 2 o 3 (o 4) heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados de N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo" [en la que 'máximo insaturado' incluye también 'aromático'], tal como se utiliza en este documento, indica radicales monocíclicos, siendo los radicales monocíclicos saturados, parcialmente insaturados o máximo insaturados (incluyendo aromático). El término "anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o máximo insaturado de 3, 4, 5, 6, 7 u 8 miembros que contiene 1, 2 o 3 (o 4) heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo" [en el que "máximo insaturado" incluye también "aromático"], tal como se usa en el presente documento también abarca radicales heteromonocíclicos de 8 miembros que contienen 1, 2 o 3 (o 4) heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados de N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, siendo los radicales monocíclicos saturados, parcialmente insaturados o máximamente insaturados (incluidos los aromáticos). Los anillos insaturados contienen al menos un doble enlace C-C y/o C-N y/o N-N. Los anillos insaturados máximos contienen tantos enlaces dobles C-C y/o C-N y/o N-N conjugados como lo permita el tamaño del anillo. Los anillos heterocíclicos insaturados de 5 o 6 miembros máximos son aromáticos. Los anillos de 7 y 8 miembros no pueden ser aromáticos. Son homoaromáticos (anillo de 7 miembros, 3 dobles enlaces) o tienen 4 dobles enlaces (anillo de 8 miembros). El anillo heterocíclico puede estar unido al resto de la molécula mediante un miembro de anillo de carbono o mediante un miembro de anillo de nitrógeno. Por supuesto, el anillo heterocíclico contiene al menos un átomo de carbono en el anillo. Si el anillo contiene más de un átomo de anillo de O, estos no son adyacentes.

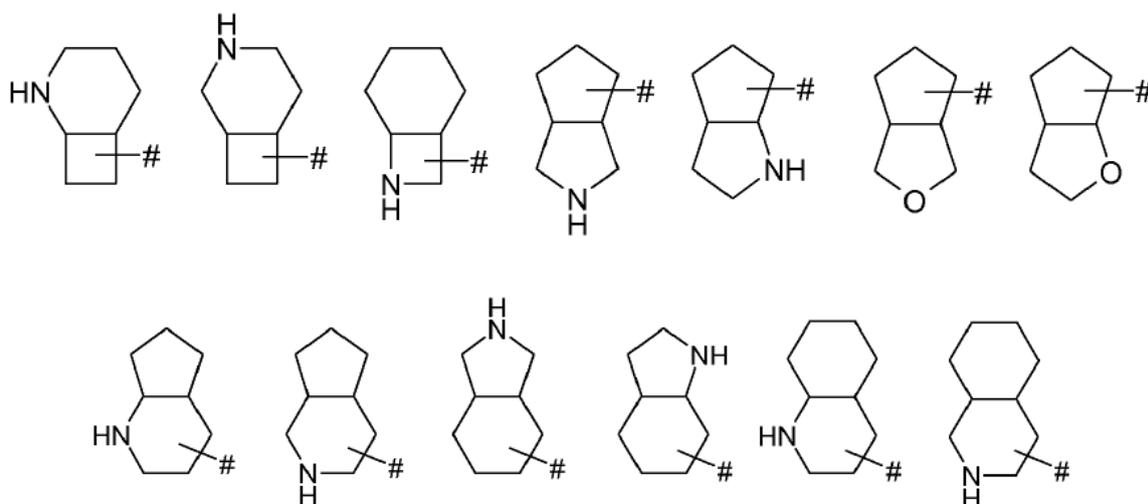
Los ejemplos de un anillo heterocíclico saturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros incluyen: oxiranilo, tiranilo, aziridinilo, oxetanilo, tietanilo, azetidino, tetrahydrofuran-2-ilo, tetrahydrofuran-3-ilo, tetrahydrotien-2-ilo, tetrahydrotien-3-ilo, pirrolidin-1-ilo, pirrolidin-2-ilo, pirrolidin-3-ilo, pirazolidin-1-ilo, pirazolidin-3-ilo, pirazolidin-4-ilo, pirazolidin-5-ilo, imidazolidin-1-ilo, imidazolidin-2-ilo, imidazolidin-4-ilo, oxazolidin-2-ilo, oxazolidin-3-ilo, oxazolidin-4-ilo, oxazolidin-5-ilo, isoxazolidin-2-ilo, isoxazolidin-3-ilo, isoxazolidin-4-ilo, isoxazolidin-5-ilo, tiazolidin-2-ilo, tiazolidin-3-ilo, tiazolidin-4-ilo, tiazolidin-5-ilo, isotiazolidin-2-ilo, isotiazolidin-3-ilo, isotiazolidin-4-ilo, isotiazolidin-5-ilo, 1,2,4-oxadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-oxadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-triazolidin-3-ilo, 1,3,4-oxadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-tiadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-triazolidin-1-ilo, 1,3,4-triazolidin-2-ilo, 2-tetrahidropiranilo, 4-tetrahidropiranilo, 1,3-di oxan-5-ilo, 1,4-dioxan-2-ilo, piperidin-1-ilo, piperidin-2-ilo, piperidin-3-ilo, piperidin-4-ilo, hexahidropiridazin-3-ilo, hexahidropiridazin-4-ilo, hexahidropirimidin-2-ilo, hexahidropirimidin-4-ilo, hexahidropirimidin-5-ilo, piperazin-1-ilo, piperazin-2-ilo, 1,3,5-hexahidrotiazin-1-ilo, 1,3,5-hexahidrotiazin-2-ilo y 1,2,4-hexahidrotiazin-3-ilo, morfolin-2-ilo,

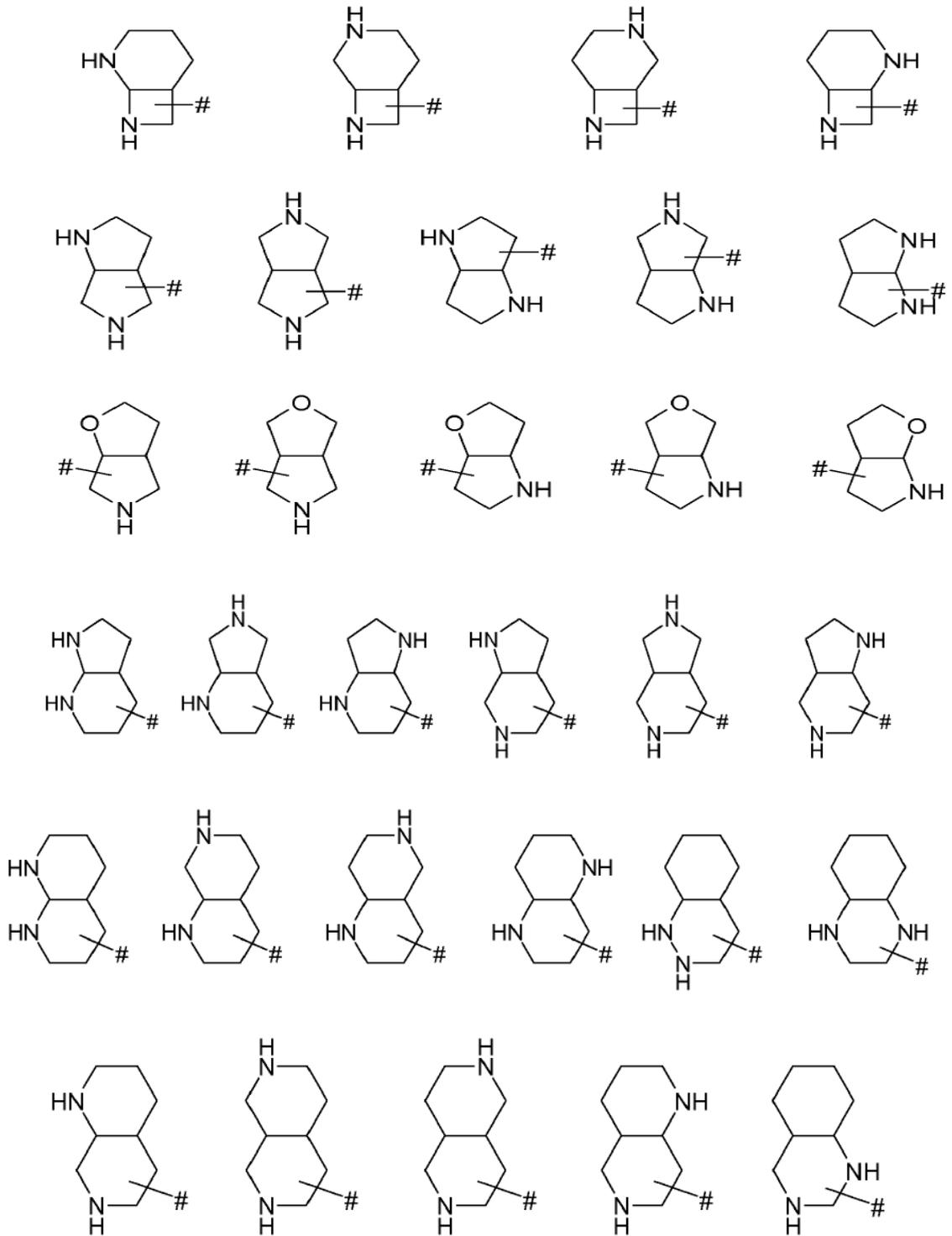
5 morfolin-3-ilo, morfolin-4-ilo, tiomorfolin-2-ilo, tiomorfolin-3-ilo, tiomorfolin-4-ilo, 1-oxotiomorfolin-2-ilo, 1-oxotiomorfolin-3-ilo, 1-oxotiomorfolin-4-ilo, 1,1-dioxotiomorfolin-2-ilo, 1,1-dioxotiomorfolin-3-ilo, 1,1-dioxotiomorfolin-4-ilo, azepan-1-, -2-, -3- o -4-ilo, oxepan-2-, -3-, -4- o -5-ilo, hexahidro-1,3-diazepinilo, hexahidro-1,4-diazepinilo, hexahidro-1,3-oxazepinilo, hexahidro-1,4-oxazepinilo, hexahidro-1,3-dioxepinilo, hexahidro-1,4-dioxepinilo y similares.

10 Los ejemplos de un anillo heterocíclico parcialmente insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros incluyen: 2,3-dihidrofur-2-ilo, 2,3-dihidrofur-3-ilo, 2,4 -dihidrofur-2-ilo, 2,4-dihidrofur-3-ilo, 2,3-dihidrotien-2-ilo, 2,3-dihidrotien-3-ilo, 2,4-dihidrotien-2-ilo, 2,4 -dihidrotien-3-ilo, 2-pirrolin-2-ilo, 2-pirrolin-3-ilo, 3-pirrolin-2-ilo, 3-pirrolin-3-ilo, 2-isoxazolin-3-ilo, 3-isoxazolina-3-ilo, 4-isoxazolin-3-ilo, 2-isoxazolin-4-ilo, 3-isoxazolin-4-ilo, 4-isoxazolin-4-ilo, 2-isoxazolin-5-ilo, 3-isoxazolin-5-ilo, 4-isoxazolin-5-ilo, 2-isotiazolin-3-ilo, 3-isotiazolin-3-ilo, 4-isotiazolin-3-ilo, 2-isotiazolin-4-ilo, 3-isotiazolin-4-ilo, 4-isotiazolin-4-ilo, 2-isotiazolin-5-ilo, 3-isotiazolin-5-ilo, 4-isotiazolin-5-ilo, 2,3-dihidropirazol-1-ilo, 2,3-dihidropirazol-2-ilo, 2,3-dihidropirazol-3-ilo, 2,3-dihidropirazol-4-ilo, 2,3-dihidropirazol-5-ilo, 3,4-dihidropirazol-1-ilo, 3,4-dihidropirazol-3-ilo, 3,4-dihidropirazol-4-ilo, 3,4-dihidropirazol-5-ilo, 4,5-dihidropirazol-1-ilo, 4,5-dihidropirazol-3-ilo, 4,5-dihidropirazol-4 -y l, 4,5-dihidropirazol-5-ilo, 2,3-dihidrooxazol-2-ilo, 2,3-dihidrooxazol-3-ilo, 2,3-dihidrooxazol-4-ilo, 2,3-dihidrooxazol-5- il, 3,4-dihidrooxazol-2-ilo, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-4-ilo, 3,4-dihidrooxazol-5-ilo, 3,4-dihidrooxazol-2- il, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-4-ilo, 2-, 3-, 4-, 5- o 6-di- o tetrahidropiridinilo, 3-di- o tetrahidropiridazinilo, 4-di- o tetrahidropiridazinilo, 2-di- o tetrahidropirimidinilo, 4-di- o tetrahidropirimidinilo, 5-di- o tetrahidropirimidinilo, di- o tetrahidropirazinilo, 1,3,5-di- o tetrahidrotiazin-2-ilo, 1,2,4-di- o tetrahidrotiazin-3-ilo, 2,3,4,5-tetrahidro[1H] azepin-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7- il, 3,4,5,6-tetrahidro[2H] azepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, 2,3,4,7-tetrahidro[1H] azepin-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, 2,3,6,7-tetrahidro[1H] azepin-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, tetrahidrooxepinilo, tal como 2,3,4,5-tetrahidro[1H]oxepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, 2,3,4,7-tetrahidro[1H] oxepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, 2,3,6,7-tetrahidro[1H]oxepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, tetrahidro-1,3-diazepinilo, tetrahidro-1,4-diazepinilo, tetrahidro-1,3-oxazepinilo, tetrahidro-1,4-oxazepinilo, tetrahidro-1,3-dioxepinilo y tetrahidro-1,4-dioxepinilo.

15 Los ejemplos de un anillo heterocíclico máximamente insaturado (incluido aromático) de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros son anillos heteroaromáticos de 5 o 6 miembros, tales como 2-furilo, 3-furilo, 2-tienilo, 3-tienilo, 1-pirrolilo, 2-pirrolilo, 3-pirrolilo, 1-pirazolilo, 3-pirazolilo, 4-pirazolilo, 5-pirazolilo, 2-oxazolilo, 4-oxazolilo, 5-oxazolilo, 2-tiazolilo, 4-tiazolilo, 5-tiazolilo, 1-imidazolilo, 2-imidazolilo, 4-imidazolilo, 1,3,4-triazol-1-ilo, 1,3,4-triazol-2-ilo, 2-piridinilo, 3 -piridinilo, 4-piridinilo, 1-oxopiridin-2-ilo, 1-oxopiridin-3-ilo, 1-oxopiridin-4-ilo, 3-piridazinilo, 4-piridazinilo, 2-pirimidinilo, 4-pirimidinilo, 5-pirimidinilo y 2-pirazinilo, y también radicales homoaromáticos, tales como 1H-azepina, 1H-[1,3]-diazepina y 1H-[1,4]-diazepina.

20 Ejemplos para un anillo heterobiccíclico saturado de 8, 9 o 10 miembros que contiene 1, 2 o 3 (o 4) heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados de N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo son:

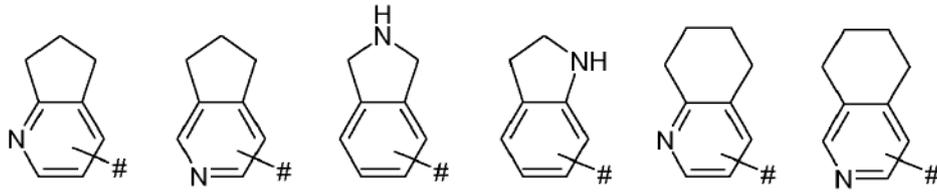




Ejemplos para un anillo heterobíciclico parcialmente insaturado de 8, 9 ó 10 miembros que contiene 1, 2 o 3 (o 4) heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados de N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo son:

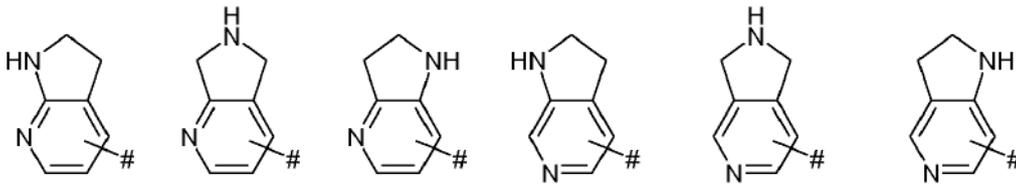
5

10



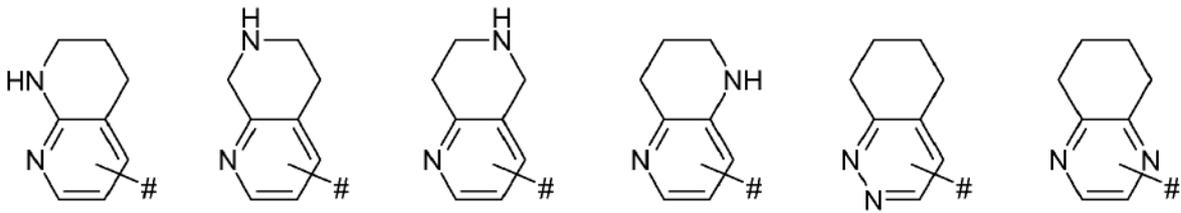
15

20



25

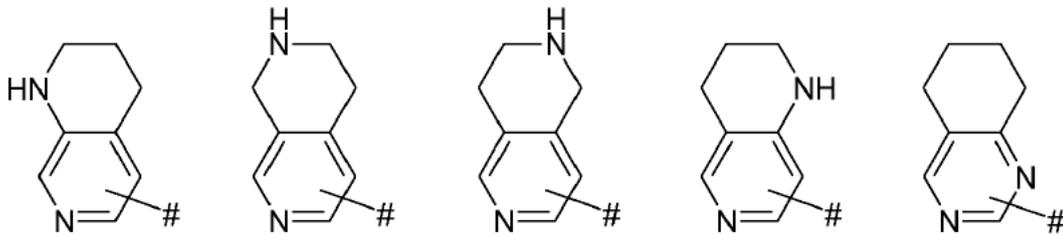
30



35

40

45



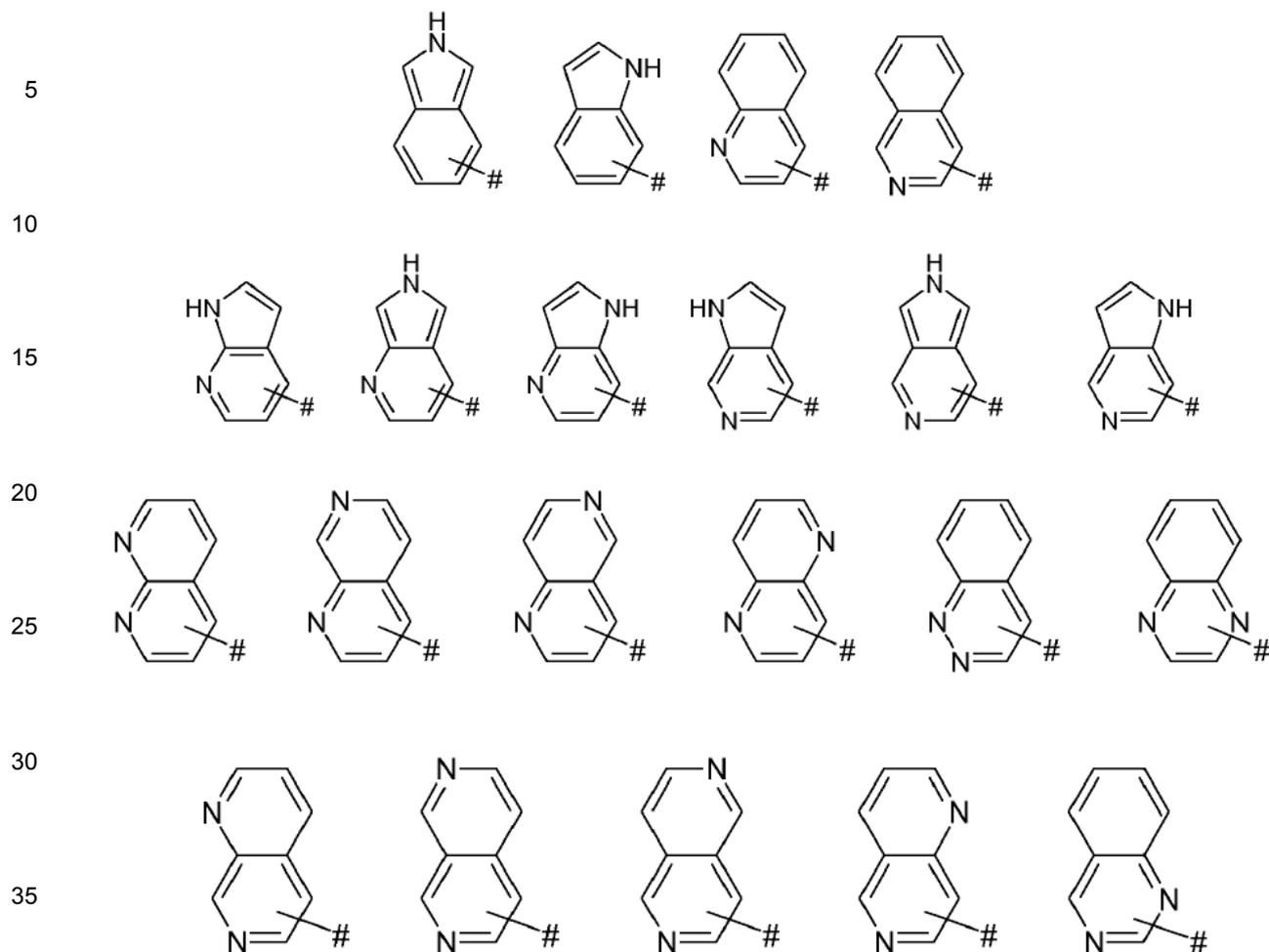
Ejemplos para un anillo heterobíciclico máximamente insaturado de 8, 9 ó 10 miembros que contiene 1, 2 o 3 (o 4) heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados de N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo son:

50

55

60

65



40 En las estructuras anteriores # indica el punto de unión al resto de la molécula. El punto de unión no está restringido al anillo en el que se muestra, sino que puede estar en cualquiera de los anillos fusionados y puede estar en un átomo de carbono o átomo en anillo de nitrógeno. Si los anillos llevan uno o más sustituyentes, estos pueden estar unidos a átomos en anillo de carbono y/o nitrógeno (si estos últimos no forman parte de un doble enlace).

45 Un anillo saturado de 3, 4, 5, 6, 7, 8 o 9 miembros, donde el anillo puede contener 1 ó 2 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados de O, S, N, NR¹⁴, NO, SO y SO₂ y/o 1 o 2 grupos seleccionados de C=O, C=S y C=NR¹⁴ como miembros del anillo, es carbocíclico o heterocíclico. Son ejemplos, además de los anillos heteromonocíclicos saturados mencionados anteriormente, anillos carbocíclicos, tales como ciclopropilo, ciclopropanonilo, ciclobutilo, ciclobutanonilo, ciclopentilo, ciclopentanonilo, ciclohexilo, ciclohexanonilo, ciclohexadienonil, ciclohexanonil, ciclohexadienonctilo, cicloheptonil-2-ciclo, cicloheptil-2-octano pirrolidina-2-onilo, pirrolidina-2,5-dionilo, piperidina-2-onilo, piperidina-2,6-dionilo y similares.

Las observaciones indicadas a continuación en relación con las realizaciones preferidas de las variables de los Compuestos de la fórmula I, especialmente con respecto a sus sustituyentes A, A¹, A², A³, B¹, B², B³, G¹, G², R¹, R², R^{3a}, R^{3b}, R^{3c}, R⁴, R⁵, R^{5a}, R⁶, R^{6a}, R^{6b}, R^{6c}, R^{7a}, R^{7b}, R⁸, R⁹, R^{10a}, R^{10b}, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴, R^{14a}, R^{14b}, R¹⁵, R¹⁶, R¹⁷, R^{18a}, R^{18b}, R^a, m y n, las características del uso y el procedimiento de acuerdo con la invención y de la composición de la invención son válidas tanto por sí mismos como, en particular, en todas las combinaciones posibles entre sí.

En una realización de la invención, A es A¹.

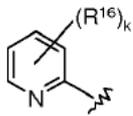
En el presente documento se describe que A¹ es CN.

En el presente documento se describe que A¹ se selecciona entre -C(=NR⁶)R⁸ y -N(R⁵)R⁶ y es más preferiblemente -C(=NR⁶)R⁸; en el que R⁵, R⁶ y R⁸ tienen uno de los significados generales anteriores o, en particular, uno de los siguientes significados preferidos.

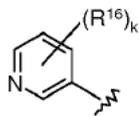
- 5 En el presente documento se describe que R^6 como un radical en el grupo $-C(=NR^6)R^8$ se selecciona preferiblemente de hidrógeno, ciano, alquilo C_1-C_{10} , cicloalquilo C_3-C_8 , alqueno C_2-C_{10} , alquino C_2-C_{10} , en el que los cuatro últimos radicales alifáticos y cicloalifáticos mencionados cada uno independientemente pueden estar parcial o completamente halogenados y/o pueden estar sustituidos con 1, 2, 3, 4, 5 o 6, preferiblemente 1, 2 o 3, en particular 1, los sustituyentes R^8 , $-OR^9$ y $-NR^{10a}R^{10b}$; en los que R^8 , R^9 , R^{10a} y R^{10b} tienen uno de los significados generales anteriores, o, en particular, uno de los siguientes significados preferidos.
- 10 En el presente documento se describe que, más preferiblemente, R^6 en $-C(=NR^6)R^8$ se selecciona entre hidrógeno, alquilo C_1-C_{10} , cicloalquilo C_3-C_8 , en el que los dos últimos radicales alifáticos y cicloalifáticos mencionados, cada uno independientemente, pueden estar parcial o completamente halogenados y/o pueden estar sustituidos con 1, 2 o 3, preferiblemente 1 o 2, en particular 1, los sustituyentes R^8 , OR^9 y $NR^{10a}R^{10b}$; en los que R^8 , R^9 , R^{10a} y R^{10b} tienen uno de los significados generales anteriores, o, en particular, uno de los siguientes significados preferidos.
- 15 En el presente documento se describe que, incluso más preferiblemente, R^6 en $-C(=NR^6)R^8$ se selecciona entre OR^9 y $NR^{10a}R^{10b}$; en los que R^8 , R^9 , R^{10a} y R^{10b} tienen uno de los significados generales anteriores, o, en particular, uno de los siguientes significados preferidos.
- 20 En el presente documento se describe que, en OR^9 como un significado preferido de R^6 en $-C(=NR^6)R^8$, R^9 se selecciona preferiblemente de hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , halocicloalquilo C_3-C_8 , cicloalquil C_3-C_8 alquilo C_1-C_4 , alqueno C_2-C_6 , haloalqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , haloalquino C_2-C_6 , y más preferiblemente de hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , halocicloalquilo C_3-C_8 y cicloalquil C_3-C_8 alquilo C_1-C_4 .
- 25 En el presente documento se describe que, en $NR^{10a}R^{10b}$ como un significado preferido de R^6 en $-C(=NR^6)R^8$, R^{10a} y R^{10b} , independientemente entre sí, se seleccionan del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , haloalqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , haloalquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , halocicloalquilo C_3-C_8 , alquilcarbonilo C_1-C_6 , haloalquilcarbonilo C_1-C_6 , $-C(=O)OR^{15}$, $-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}$, $-C(=S)N(R^{14a})R^{14b}$, fenilo que está opcionalmente sustituido con 1, 2, 3 o 4 sustituyentes R^{16} y un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o máximamente insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO_2 , como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R^{16} ;
- 30 o R^{10a} y R^{10b} forman junto con el átomo de nitrógeno al que están unido, un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o máximamente insaturado de 3, 4, 5, 6, 7 u 8 miembros, en el que el anillo heterocíclico puede contener además uno o dos heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO_2 , como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico opcionalmente lleva uno o más sustituyentes seleccionados entre halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , C_1-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , halocicloalquilo C_3-C_8 , alqueno C_2-C_6 , haloalqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 y haloalquino C_2-C_6 ;
- 35 donde R^{14a} , R^{14b} y R^{16} tienen uno de los significados generales anteriores o, en particular, uno de los siguientes significados preferidos.
- 40 En el presente documento se describe que, más preferiblemente, R^{10a} se selecciona entre hidrógeno, alquilo C_1-C_6 y haloalquilo C_1-C_6 ; y R^{10b} se selecciona entre alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alquilcarbonilo C_1-C_6 , haloalquilcarbonilo C_1-C_6 , $-C(=O)OR^{16}$, $-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}$, $-C(=S)N(R^{14a})R^{14b}$, fenilo que está opcionalmente sustituido con 1, 2, 3 o 4 sustituyentes R^{16} , y un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados entre N, O y S, como miembros del anillo, donde el anillo heteroaromático está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R^{16} ;
- 45 donde R^{14a} , R^{14b} y R^{16} tienen uno de los significados generales anteriores o, en particular, uno de los siguientes significados preferidos.
- 50 En el presente documento se describe que, incluso más preferiblemente, R^{10a} se selecciona entre hidrógeno y alquilo C_1-C_6 ; y R^{10b} se selecciona entre $-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}$ y $-C(=S)N(R^{14a})R^{14b}$; y es en particular $-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}$; en los que R^{14a} y R^{14b} tienen uno de los significados generales anteriores o, en particular, uno de los siguientes significados preferidos.
- 55 En el presente documento se describe que, en los radicales anteriores, R^{10a} y R^{10b} , R^{14a} se selecciona entre hidrógeno, alquilo C_1-C_6 y haloalquilo C_1-C_6 ;
- 60 R^{14b} se selecciona entre hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , haloalqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , haloalquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquil C_3-C_6 alquilo C_1-C_4 , donde los restos cicloalquilo en los tres últimos grupos mencionados pueden estar sustituidos por un grupo ciano; alquilo C_1-C_6 sustituido con un grupo CN, alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , fenilo que está opcionalmente sustituido con 1, 2, 3 ó

4 sustituyentes seleccionados cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄ y haloalquinilo C₂-C₄; y un anillo heterocíclico seleccionado de los anillos de fórmulas E-1 a E-54, específicamente E-1 a E-51

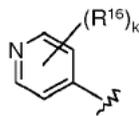
5



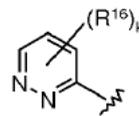
E-1



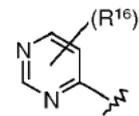
E-2



E-3



E-4

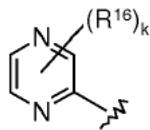


E-5

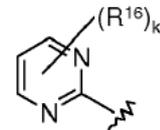
10

15

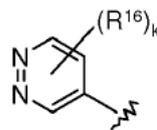
20



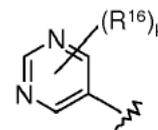
E-6



E-7

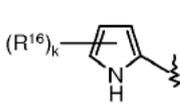


E-8

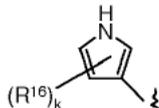


E-9

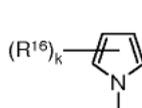
25



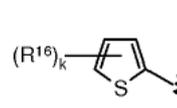
E-10



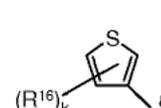
E-11



E-12



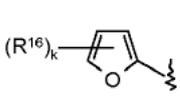
E-13



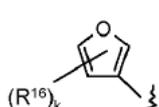
E-14

30

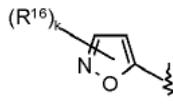
35



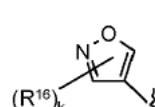
E-15



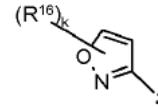
E-16



E-17



E-18



E-19

40

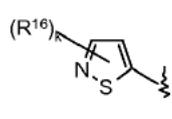
45

50

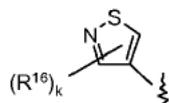
55

60

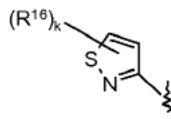
65



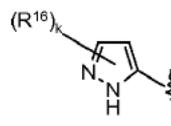
E-20



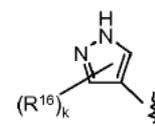
E-21



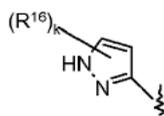
E-22



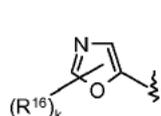
E-23



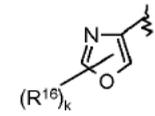
E-24



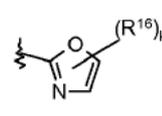
E-25



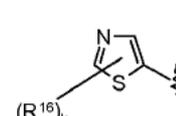
E-26



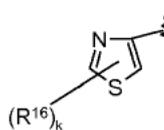
E-27



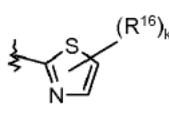
E-28



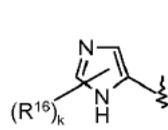
E-29



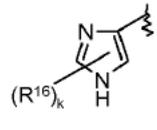
E-30



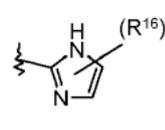
E-31



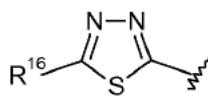
E-32



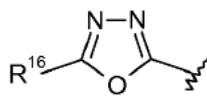
E-33



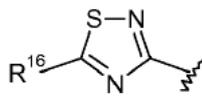
E-34



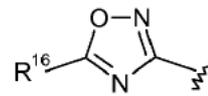
E-35



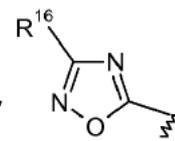
E-36



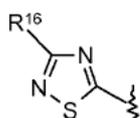
E-37



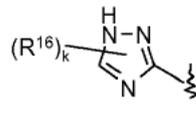
E-38



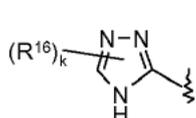
E-39



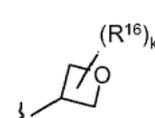
E-40



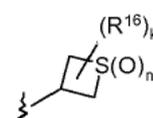
E-41



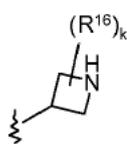
E-42



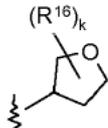
E-43



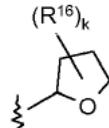
E-44



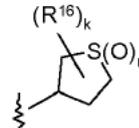
E-45



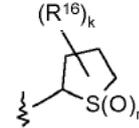
E-46



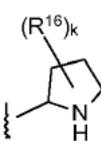
E-47



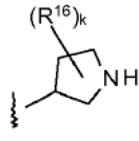
E-48



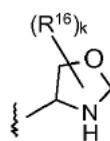
E-49



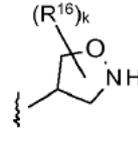
E-50



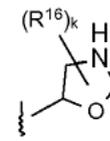
E-51



E-52



E-53



E-54

donde

k es 0, 1, 2 o 3,

n es 0, 1 o 2; y

5 cada R¹⁶ se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄ y haloalquinilo C₂-C₄; o dos R¹⁶ presentes en el mismo átomo de carbono de un anillo saturado pueden formar juntos =O o = S.

10 En el presente documento se describe que, más preferiblemente, en los radicales anteriores, R^{10a} y R^{10b}, R^{14a} se selecciona entre hidrógeno y metilo; y

15 R^{14b} se selecciona entre hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆ metilo, cicloalquilo C₃-C₆ sustituido con un grupo CN, alquilo C₁-C₆ sustituido con un grupo CN, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, fenilo que está opcionalmente sustituido con 1, 2, 3 o 4, preferiblemente 1, 2 o 3, en particular 1, sustituyentes R¹⁶ seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄ y haloalquinilo C₂-C₄; y un anillo heterocíclico saturado de 4 miembros que comprende un heteroátomo o grupo de heteroátomos seleccionado entre S, SO y SO₂ como miembro del anillo (anillo E-44), donde el anillo heterocíclico está opcionalmente sustituido con uno o más, preferiblemente 1 o 2, en particular 1, sustituyentes R¹⁶;

20 en el que cada R¹⁶ se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄ y haloalquinilo C₂-C₄; o dos R¹⁶ presentes en el mismo átomo de carbono pueden formar juntos un grupo =O o = S.

25 En el presente documento se describe que, incluso más preferiblemente, en los radicales anteriores, R^{10a} y R^{10b}, R^{14a} se selecciona entre hidrógeno y metilo; y

30 R^{14b} se selecciona entre hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆ metilo, cicloalquilo C₃-C₆ sustituido con un grupo CN, alquilo C₁-C₆ sustituido con un grupo CN, alcoxi C₁-C₆ y haloalcoxi C₁-C₆; y en particular de hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄.

35 En el presente documento se describe que, preferiblemente, en los radicales anteriores, cada R¹⁶ se selecciona independientemente de halógeno, CN, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄.

En el presente documento se describe que, R⁸ como un radical en el grupo -C(=NR⁶)R⁸ se selecciona preferiblemente de hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y NR^{10a}R^{10b}, y más preferiblemente de hidrógeno y NR^{10a}R^{10b}, y es específicamente hidrógeno.

40 En el presente documento se describe que, en este caso (es decir, en NR^{10a}R^{10b} como un significado de R⁸), R^{10a} y R^{10b} se seleccionan preferiblemente, independientemente entre sí, entre hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄, alquilaminocarbonilo C₁-C₄, haloalquilaminocarbonilo C₁-C₄, cicloalquilaminocarbonilo C₃-C₆ y halocicloalquilaminocarbonilo C₃-C₆,

45 o, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un anillo heterocíclico aromático, parcialmente insaturado o saturado de 5 o 6 miembros, que además puede contener 1 o 2 heteroátomos o grupos de heteroátomos adicionales seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico puede llevar 1 o 2, en particular 1, sustituyentes seleccionados de halógeno, CN, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄ y haloalquiltio C₁-C₄.

50 Se describe en el presente documento que, más preferiblemente, R^{10a} y R^{10b} son en este caso seleccionados, independientemente entre sí, entre hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquilaminocarbonilo C₁-C₄ y haloalquilaminocarbonilo C₁-C₄.

55 En una realización alternativa de la invención, A es A².

En A², W es O.

60 En una realización preferida de un A², R^{6a} es -X-R^{6b}, donde X y R^{6b} tienen uno de los significados anteriores generales, o, en particular, uno de los siguientes significados preferidos.

65 X se selecciona entre -C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-C(=O)-NH-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-C(R^a)₂-C(=O)-NH-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂S(O)_n-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-C(R^a)₂-S(O)_n-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-OC(R^a)₂- y -C(R^a)₂-C(R^a)₂-OC(R^a)₂-, y preferiblemente de -C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-C(=O)-NH-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-C(R^a)₂-S(O)₂-C(R^a)₂- y -C(R^a)₂-C(R^a)₂-OC(R^a)₂-, donde cada R^a y n

tienen uno de los significados anteriores generales, o, en particular, uno de los siguientes significados preferidos.

Cada R^a se selecciona independientemente de hidrógeno y metilo y es en particular hidrógeno.

5 Preferiblemente, en los grupos X anteriores, n es 2.

En el presente documento se describe que, en el grupo A^2 anterior en el que R^{6a} es $-X-R^{6b}$, R^5 se selecciona preferiblemente de hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , haloalqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , haloalquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 y halocicloalquilo C_3-C_8 , donde los radicales alifáticos y cicloalifáticos antes mencionados pueden estar sustituidos por 1, 2 o 3 radicales R^8 ; más preferiblemente de hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , haloalqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , haloalquino C_2-C_6 y alquilo C_1-C_4 sustituido con un grupo ciano, un grupo cicloalquilo C_3-C_8 o un grupo alcoxi C_1-C_4 ; en particular, de hidrógeno y alquilo C_1-C_6 ; y es específicamente hidrógeno;

10 donde R^8 tiene uno de los significados anteriores generales, o, en particular, uno de los siguientes significados preferidos.

En el presente documento se describe que, en este contexto, R^8 se selecciona preferiblemente de ciano, cicloalquilo C_3-C_8 opcionalmente sustituido con un grupo ciano; halocicloalquilo C_3-C_8 , alcoxi C_1-C_4 y haloalcoxi C_1-C_4 , y más preferiblemente entre ciano, cicloalquilo C_3-C_8 y alcoxi C_1-C_4 .

20 En el grupo anterior A^2 en el que R^{6a} es $-X-R^{6b}$, R^{6b} se selecciona entre alqueno C_2-C_8 , haloalqueno C_2-C_8 , alquino C_2-C_8 , haloalquino C_2-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 , halocicloalquilo C_3-C_8 y cicloalquilo C_3-C_8 sustituido por un grupo ciano.

25 En otra realización preferida de A^2 , R^{6a} es $-N(R^{5a})R^{6c}$, donde R^{5a} y R^{6c} tienen uno de los significados anteriores generales, o, en particular, uno de los siguientes significados preferidos.

En el presente documento se describe que, en el grupo anterior A^2 en el que R^{6a} es $N(R^{5a})R^{6c}$, R^{5a} se selecciona preferiblemente de hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , haloalqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , haloalquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 y halocicloalquilo C_3-C_8 , donde los radicales alifáticos y cicloalifáticos antes mencionados pueden estar sustituidos por 1, 2 o 3 radicales R^8 ; preferiblemente de hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , haloalqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , haloalquino C_2-C_6 y alquilo C_1-C_4 sustituido con un grupo ciano, un grupo cicloalquilo C_3-C_8 o un grupo alcoxi C_1-C_4 , en particular de hidrógeno y alquilo C_1-C_6 ; y es específicamente hidrógeno;

30 donde R^8 tiene uno de los significados anteriores generales, o, en particular, uno de los siguientes significados preferidos.

En el presente documento se describe, en el grupo anterior A^2 en el que R^{6a} es $N(R^{5a})R^{6c}$, R^5 se selecciona preferiblemente de hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , haloalqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , haloalquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 y halocicloalquilo C_3-C_8 , donde los radicales alifático y radicales cicloalifáticos antes mencionados pueden estar sustituidos por 1, 2 o 3 radicales R^8 ; preferiblemente de hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , haloalqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , haloalquino C_2-C_6 y alquilo C_1-C_4 sustituido con un grupo ciano, un grupo cicloalquilo C_3-C_8 o un grupo alcoxi C_1-C_4 , en particular de hidrógeno y alquilo C_1-C_6 ; y es específicamente hidrógeno;

40 donde R^8 tiene uno de los significados anteriores generales, o, en particular, uno de los siguientes significados preferidos.

En el presente documento se describe que, en este contexto, R^8 se selecciona preferiblemente entre ciano, cicloalquilo C_3-C_8 opcionalmente sustituido por un grupo ciano; halocicloalquilo C_3-C_8 , alcoxi C_1-C_4 y haloalcoxi C_1-C_4 , y más preferiblemente entre ciano, cicloalquilo C_3-C_8 y alcoxi C_1-C_4 .

En el presente documento se describe que, en el grupo anterior A^2 en el que R^{6a} es $N(R^{5a})R^{6c}$, R^{6c} se selecciona preferiblemente de $-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}$ y $-C(=S)N(R^{14a})R^{14b}$, y en particular de $-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}$, donde R^{14a} y R^{14b} tienen uno de los significados generales anteriores o, en particular, uno de los siguientes significados preferidos.

En el presente documento se describe que, preferiblemente, en los radicales anteriores $-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}$ y $-C(=S)N(R^{14a})R^{14b}$,

60 R^{14a} se selecciona entre hidrógeno, alquilo C_1-C_6 y haloalquilo C_1-C_6 ; y R^{14b} se selecciona entre hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , haloalqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , haloalquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquil C_3-C_6 alquilo C_1-C_4 , donde los restos cicloalquilo en los tres últimos grupos mencionados pueden estar sustituidos por un grupo ciano; alquilo C_1-C_6 sustituido con un grupo CN, alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , fenilo que está opcionalmente sustituido con 1, 2, 3 o 4, sustituyentes seleccionados cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , alquilitio C_1-C_4 , haloalquilitio C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 ,

halocicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄ y haloalquinilo C₂-C₄; y un anillo heterocíclico seleccionado de anillos de fórmulas E-1 a E-54, específicamente E-1 a E-51 como se definió anteriormente.

- 5 En el presente documento se describe que, más preferiblemente, en los radicales anteriores $-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}$ y $-C(=S)N(R^{14a})R^{14b}$,
 R^{14a} se selecciona entre hidrógeno y metilo; y
 R^{14b} se selecciona entre hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆ metilo, cicloalquilo C₃-C₆
 10 sustituido con un grupo CN, alquilo C₁-C₆ sustituido con un grupo CN, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, fenilo que está opcionalmente sustituido con 1, 2, 3 o 4, preferiblemente 1, 2 o 3, en particular 1, sustituyentes R^{16} seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄ y haloalquinilo C₂-C₄; y un anillo heterocíclico saturado de 4 miembros que comprende un heteroátomo o
 15 grupo de heteroátomos seleccionado entre S, SO y SO₂ como miembro del anillo (anillo E-44), donde el anillo heterocíclico está opcionalmente sustituido con uno o más, preferiblemente 1 o 2, en particular 1, sustituyentes R^{16} ;
 en el que cada R^{16} se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆,
 20 halocicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄ y haloalquinilo C₂-C₄; o dos R^{16} presentes en el mismo átomo de carbono pueden formar juntos un grupo =O o =S.

- En el anterior radical $-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}$,
 R^{14a} se selecciona entre hidrógeno y alquilo C₁-C₆, en particular entre hidrógeno y metilo; y
 25 R^{14b} se selecciona entre hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆ alquilo C₁-C₄, donde los restos cicloalquilo en los tres últimos grupos mencionados pueden estar sustituidos por un grupo ciano; y alquilo C₁-C₆ sustituido con un grupo CN.

- 30 Específicamente, en el anterior radical $-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}$,
 R^{14a} es hidrógeno; y
 R^{14b} se selecciona entre hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆ alquilo C₁-C₄, donde los restos cicloalquilo en los tres últimos grupos mencionados pueden estar sustituidos por un grupo ciano; y alquilo C₁-C₆
 35 sustituido con un grupo CN; y es en particular seleccionado de hidrógeno, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄.

En el presente documento se describe que, preferiblemente, en los radicales anteriores, cada R^{16} se selecciona independientemente de halógeno, CN, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄.

- 40 En el presente documento se describe que, R^5 en A^2 es hidrógeno y R^{6a} se selecciona entre hidrógeno, 1-cianociclopropilo, 1-cianociclobutilo y 1-cianociclopentilo; o,
 R^5 y R^{6a} forman juntos un grupo $=S(O)_m(R^9)_2$, donde R^9 y m tienen uno de los significados generales anteriores o, en particular, uno de los siguientes significados preferidos.

- 45 En el presente documento se describe que, en este contexto, R^9 se selecciona entre alquilo C₁-C₆, haloalquilo, C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆ alquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, fenilo y bencilo, donde el resto fenilo en los dos últimos grupos mencionados pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5, preferiblemente 1, 2 o 3, en particular 1, radicales R^{16} , más preferiblemente de alquilo C₁-C₆ y haloalquilo C₁-C₆, y es en particular alquilo C₁-C₆;
 50 donde R^{16} tiene uno de los significados anteriores generales, o, en particular, uno de los siguientes significados preferidos.

En el presente documento se describe que, preferiblemente, en los radicales anteriores, cada R^{16} se selecciona independientemente de halógeno, CN, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄.

- 55 En una realización particular de A^2 , R^5 en A^2 es hidrógeno y R^{6a} se selecciona entre hidrógeno y 1-cianociclopropilo.

En el presente documento se describe que A es A^3 .

- 60 Preferiblemente, R^{7a} y R^{7b} en el grupo A^3 son independientemente entre sí seleccionados de hidrógeno, ciano, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄, y más preferiblemente de hidrógeno, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄. Incluso más preferiblemente, uno de R^{7a} y R^{7b} es hidrógeno y el otro es hidrógeno o metilo. Específicamente, ambos son hidrógeno.

- 65 En el grupo A^3 ,

R⁵ se selecciona preferiblemente de hidrógeno, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, en el que los cuatro últimos radicales alifáticos y cicloalifáticos mencionados pueden estar parcial o totalmente halogenados y/o pueden estar sustituidos con uno o más, preferiblemente 1, 2 o 3, en particular 1, sustituyentes R⁸; y

5 R⁶ se selecciona preferiblemente de hidrógeno, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, en los que los cuatro últimos radicales alifáticos y cicloalifáticos mencionados pueden estar parcial o totalmente halogenados y/o pueden estar sustituidos con uno o más, preferiblemente 1, 2 o 3, en particular 1, sustituyentes R⁸, -OR⁹, -NR^{10a}R^{10b}, -S(O)_nR⁹, -C(=O)NR^{10a}N(R^{10a}R^{10b}), -C(=O)R⁸,
 10 y un anillo heteromonocíclico o heterobícíclico saturado, parcialmente insaturado o máximamente insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que contiene 1, 2, 3 o 4 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados independientemente entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heteromonocíclico o heterobícíclico puede estar sustituido con uno o más, preferiblemente 1, 2 o 3, en particular 1, sustituyentes R¹¹;

15 R⁵ y R⁶, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o máximamente insaturado de 3, 4, 5 o 6 miembros, donde el anillo puede contener además 1, 2, 3 o 4 heteroátomos o grupos que contienen heteroátomos seleccionados de O, S, N, SO, SO₂, C=O y C=S como miembros del anillo, en donde el anillo heterocíclico puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5, preferiblemente 1, 2 o 3, en particular 1, sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆,
 20 halocicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, en el que los restos alifáticos o cicloalifáticos de los doce últimos radicales mencionados pueden estar sustituidos con uno o más, preferiblemente 1, 2 o 3, en particular 1, radicales R⁸, y fenilo que puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5, preferiblemente 1, 2 o 3, en particular 1, sustituyentes R¹¹;
 25 en los que R⁸, R⁹, R^{10a}, R^{10b} y R¹¹ tienen uno de los significados generales anteriores o, en particular, uno de los siguientes significados preferidos.

Más preferiblemente, en el grupo A³,

30 R⁵ se selecciona entre hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₃, alquino C₂-C₃, -CH₂-CN y alcoxi C₁-C₆ -metilo y preferiblemente de hidrógeno y alquilo C₁-C₄; y
 R⁶ es -C(=O)R⁸;
 en la que R⁸ tiene uno de los significados generales anteriores, o, en particular, uno de los siguientes significados preferidos.

35 R⁸ en -C(=O)R⁸ como un significado de los radicales R⁵ y R⁶ del grupo A³ se selecciona preferiblemente del grupo que consiste en hidrógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₃, haloalqueno C₂-C₃, alquino C₂-C₃, haloalquino C₂-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalqueno C₃-C₆, halocicloalqueno C₃-C₆, donde los restos alifáticos y cicloalifáticos en los diez últimos radicales mencionados pueden estar sustituidos con uno o más, preferiblemente 1, 2 o 3, en particular 1, radicales R¹³;

40 -OR⁹, -S(O)_nR⁹, -N(R^{10a})R^{10b}, -C(=O)N(R^{10a})R^{10b},
 fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5, preferiblemente 1, 2 o 3, en particular 1, sustituyentes R¹⁶, y un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o máximamente insaturado de 3, 4, 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados de N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico está opcionalmente sustituido con uno o más, preferiblemente 1, 2 o 3, en particular 1, sustituyentes R¹⁶,
 45 en el que n, R⁹, R^{10a}, R^{10b}, R¹³ y R¹⁶ tienen uno de los significados generales anteriores o, en particular, uno de los siguientes significados preferidos.

Más preferiblemente, R⁸ en -C(=O)R⁸ como un significado de los radicales R⁵ y R⁶ del grupo A³ se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₃, haloalqueno C₂-C₃, alquino C₂-C₃, haloalquino C₂-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalqueno C₃-C₆, halocicloalqueno C₃-C₆, donde los restos alifáticos y cicloalifáticos en los diez últimos radicales mencionados pueden estar sustituidos con uno o más, preferiblemente 1, 2 o 3, en particular 1, radicales R¹³;

50 -C(=O)N(R^{10a})R^{10b}, -N(R^{10a})R^{10b}, fenilo que opcionalmente está sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5, preferiblemente 1, 2 o 3, en particular 1, sustituyentes seleccionados cada uno independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₄, haloalqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, haloalquino C₂-C₄; y un anillo heterocíclico seleccionado de anillos de fórmulas E-1 a E-54, específicamente E-1 a E-51 como se definió anteriormente.

60 En particular, R⁸ en -C(=O)R⁸ como un significado de los radicales R⁵ y R⁶ del grupo A³ se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquilo C₁-C₆ que lleva un radical R¹³, cicloalquilo C₃-C₆ y halocicloalquilo C₃-C₆.

65 R^{10a} y R^{10b} en -C(=O)N(R^{10a})R^{10b} y -N(R^{10a})R^{10b} como un significado de R⁸ en el grupo -C(=O)R⁸ como un significado de los radicales R⁵ y R⁶ del grupo A³ son, independientemente entre sí, seleccionados preferiblemente de hidrógeno,

alquilo C₁-C₆, haloalqueno C₁-C₆, alqueno C₂-C₃, haloalqueno C₂-C₃, alquino C₂-C₃, haloalquino C₂-C₃, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, donde los restos alifáticos y cicloalifáticos en los ocho últimos radicales mencionados pueden estar sustituidos con uno o más radicales R¹³; y -C(=O)NR^(14a)R^{14b}.

5 R¹³ en R⁸ en los radicales R⁵ y R⁶ del grupo A³ se selecciona preferiblemente de CN, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquil C₁-C₆ sulfinilo, haloalquil C₁-C₆ sulfinilo, alquil C₁-C₆ sulfonilo, haloalquil C₁-C₆ sulfonilo, NR^(14a)R^{14b}, y un anillo heterocíclico seleccionado de anillos de fórmulas E-1 a E-54, específicamente E-1 a E-51 como se definió anteriormente; o dos R¹³ presentes en el mismo átomo de carbono de un grupo alquilo pueden ser juntos =NOR¹⁷; y se selecciona preferiblemente de alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquil C₁-C₆ sulfonilo y haloalquil C₁-C₆ sulfonilo; y es en particular alquil C₁-C₆ sulfonilo o haloalquil C₁-C₆ sulfonilo.

15 R^{14a} y R^{14b} en -C(=O)NR^(14a)R^{14b} como un significado para R^{10a} y R^{10b}, así como en NR^(14a)R^{14b} como un significado para R¹³, independientemente entre sí e independientemente de cada caso, se seleccionan preferiblemente de hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, en los que los seis últimos radicales alifáticos mencionados pueden llevar 1 sustituyente seleccionado de ciano, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄ que puede estar sustituido con 1 grupo ciano; y halocicloalquilo C₃-C₄; Cicloalquilo C₃-C₈ que puede llevar 1 grupo ciano; halocicloalquilo C₃-C₈; y -C(=O)NR^{18a}R^{18b}.

20 Preferiblemente, cada R¹⁶ como un sustituyente en el fenilo o anillos heterocíclicos de fórmulas E-1 a E-54 se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₄, haloalqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄ y haloalquino C₂-C₄; o dos R¹⁶ presentes en el mismo átomo de carbono de un anillo heterocíclico saturado pueden formar juntos =O o =S.

30 R¹⁷ en =NOR¹⁷ como un significado de R¹³; R^{18a} y R^{18b} en -C(=O)NR^{18a}R^{18b} como un significado para R^{14a} y R^{14b}, independientemente entre sí e independientemente de cada caso, se seleccionan preferiblemente de hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, alquilo C₁-C₆ que lleva 1 sustituyente seleccionado de ciano, cicloalquilo C₃-C₄ que puede estar sustituido por 1 grupo ciano; y halocicloalquilo C₃-C₄; cicloalquilo C₃-C₈ que puede llevar 1 grupo ciano; y halocicloalquilo C₃-C₈.

B¹, B² y B³ son CR².

35 En el presente documento se describe que, preferiblemente, R² se selecciona entre hidrógeno, halógeno, ciano, azido, nitro, -SCN, -SF₅, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, en el que los cuatro últimos radicales alifáticos y cicloalifáticos mencionados pueden estar parcial o completamente halogenados y/o pueden estar sustituidos por uno o más radicales R⁸, -OR⁹, -S(O)_nR⁹ y -NR^{10a}R^{10b}, en donde n, R⁸, R⁹, R^{10a} y R^{10b} tienen uno de los significados generales anteriores o, en particular, uno de los siguientes significados preferidos.

40 En los compuestos de la invención, R² se selecciona entre hidrógeno, halógeno y haloalquilo C₁-C₂, preferiblemente de hidrógeno, F, Cl, Br y CF₃, más preferiblemente de hidrógeno, F, Cl y CF₃, y específicamente de hidrógeno, F y Cl.

45 Específicamente, B¹ y B³ son C-Cl y B² es C-Fo C-Cl.

G¹ y G² son CR⁴, donde R⁴ tiene uno de los significados anteriores generales, o, en particular, uno de los siguientes significados preferidos.

50 En el presente documento se describe que, preferiblemente, R⁴ se selecciona entre hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₅, halocicloalquilo C₃-C₅, alqueno C₂-C₄, haloalqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, haloalquino C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄ y haloalquiltio C₁-C₄, y en particular hidrógeno.

55 En el presente documento se describe, preferiblemente, R¹ se selecciona entre alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ alquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆ o C(=O)OR¹³; más preferiblemente, de alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆ y C(=O)OR¹⁶, incluso más preferiblemente de alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y -C(=O)OR¹⁶, y de forma especialmente preferible de haloalquilo C₁-C₄ y -C(=O)OR¹⁶, donde R¹⁵ es preferiblemente alquilo C₁-C₄. En particular, R¹ es haloalquilo C₁-C₄, específicamente haloalquilo C₁-C₂ y más específicamente halometilo, en particular fluorometilo, tal como fluorometilo, difluorometilo y trifluorometilo, y muy específicamente trifluorometilo.

60 En el presente documento se describe que, preferiblemente, R^{3a} y R^{3b} se seleccionan, independientemente entre sí, de hidrógeno, halógeno, hidroxilo, alquilo C₁-C₃, alqueno C₁-C₃, alquino C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃,

alquiltio C₁-C₃ y alquil C₁-C₃ sulfonilo. En los compuestos de la invención, R^{3a} y R^{3b} se seleccionan, independientemente entre sí, entre hidrógeno y halógeno, en particular entre hidrógeno y flúor y son específicamente hidrógeno.

5 En el presente documento se describe que, si no se especifica lo contrario anteriormente, R⁸, R⁹, R^{10a}, R^{10b}, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁵, R¹⁶, R¹⁷, R^{18a} y R^{18b} tienen los siguientes significados preferibles:

en el caso de que R⁸ sea un sustituyente en un grupo alquilo, alquenilo o alquinilo, se selecciona preferiblemente del grupo que consiste en ciano, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, -OR⁹, -SR⁹, -C(=O)N(R^{10a})R^{10b}, -C(=S)N(R^{10a})R^{10b}, -C(=O)OR⁹, fenilo que puede estar sustituido por 1, 2, 3, 4 o 5 radicales R¹⁶, y un anillo heterocíclico aromático, parcialmente insaturado o saturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico puede estar sustituido con uno o más radicales R¹⁶; donde R⁹, R^{10a}, R^{10b} y R¹⁶ tienen uno de los significados indicados anteriormente o en particular uno de los significados preferidos indicados a continuación.

15 En caso de que R⁸ sea un sustituyente en un grupo alquilo, alquenilo o alquinilo, incluso se selecciona más preferiblemente del grupo que consiste en ciano, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, -C(=O)N(R^{10a})R^{10b}, -C(=S)N(R^{10a})R^{10b}, -C(=O)OR⁹, fenilo que puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 radicales R¹⁶, y un Anillo heterocíclico aromático, parcialmente insaturado o saturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico puede estar sustituido por uno o más radicales R¹⁶; donde R⁹, R^{10a}, R^{10b} y R¹⁶ tienen uno de los significados indicados anteriormente o en particular uno de los significados preferidos indicados a continuación. En particular, se selecciona del grupo que consiste en ciano, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, -C(=O)N(R^{10a})R^{10b}, -C(=S)N(R^{10a})R^{10b}, -C(=O)OR⁹, fenilo que puede estar sustituido por 1, 2, 3, 4 o 5 radicales R¹⁶, y un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o aromático de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico puede estar sustituido con uno o más radicales R¹⁶; donde R⁹, R^{10a}, R^{10b} y R¹⁶ tienen uno de los significados indicados anteriormente o en particular uno de los significados preferidos indicados a continuación.

30 En caso de que R⁸ sea un sustituyente en un grupo cicloalquilo, éste se selecciona preferiblemente del grupo que consiste en ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆, -OR⁹, -OSO₂R⁹, -SR⁹, -N(R^{10a})R^{10b}, -C(=O)N(R^{10a})R^{10b}, -C(=S)N(R^{10a})R^{10b}, -C(=O)OR⁹, fenilo que puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 radicales R¹⁶, y un anillo heterocíclico aromático, parcialmente insaturado o saturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico puede estar sustituido por uno o más radicales R¹⁶; donde R⁹, R^{10a}, R^{10b} y R¹⁶ tienen uno de los significados indicados anteriormente o en particular uno de los significados preferidos indicados a continuación.

40 En caso de que R⁸ sea un sustituyente en un grupo cicloalquilo, incluso se selecciona más preferiblemente del grupo que consiste en ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-3. En particular, R⁸ como un sustituyente en un grupo cicloalquilo se selecciona entre ciano, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₃.

45 En el caso de R⁸ en un grupo -C(=O)R⁸, =C(R⁸)₂ o -C(=NR⁶)R⁸, R⁸ se selecciona preferiblemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, -OR⁹, -SR⁹, -N(R^{10a})R^{10b}, fenilo que puede estar sustituido por 1, 2, 3, 4 o 5 radicales R¹⁶, y un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o aromático de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados de N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico puede estar sustituido con uno o más radicales R¹⁶; donde R⁹, R^{10a}, R^{10b} y R¹⁶ tienen uno de los significados indicados anteriormente o en particular uno de los significados preferidos indicados a continuación.

50 En el caso de R⁸ en un grupo -C(=O)R⁸, =C(R⁸)₂ o -C(=NR⁶)R⁸, R⁸ se selecciona más preferiblemente del grupo haloalcoxi que consiste en alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, alcoxi C₁-C₆, C₁-C₆, -N(R^{10a})R^{10b}, fenilo que puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 radicales R¹⁶ y un anillo heterocíclico aromático, parcialmente insaturado o saturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico puede estar sustituido con uno o más radicales R¹⁶; donde R^{10a}, R^{10b} y R¹⁶ tienen uno de los significados indicados anteriormente o en particular uno de los significados preferidos indicados a continuación.

55 Preferiblemente, cada R⁹ se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalquil C₃-C₈ alquilo C₁-C₄, fenilo que puede estar sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 radicales R¹⁶; y un anillo heterocíclico aromático, parcialmente insaturado o saturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico puede estar sustituido con uno o más, por

ejemplo, 1, 2, 3 o 4, preferiblemente 1 o 2, más preferiblemente 1, radicales R¹⁶, donde R¹⁶ tiene uno de los significados indicados anteriormente o, en particular, uno de los significados preferidos que se indican a continuación.

5 Más preferiblemente, cada R⁹ se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, fenilo que puede estar sustituido por 1, 2, 3, 4 o 5 radicales R¹⁶; y un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados entre N, O y S, como miembros del anillo, donde el anillo heteroaromático puede estar sustituido con uno o más radicales R¹⁶; donde R¹⁶ tiene uno de los significados indicados anteriormente o, en particular, uno de los significados preferidos indicados a continuación.

10 R^{10a} y R^{10b} son, independientemente entre sí, seleccionados preferiblemente de hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, haloalqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, haloalquino C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄, alquilaminocarbonilo C₁-C₄, haloalquilaminocarbonilo C₁-C₄, cicloalquilaminocarbonilo C₃-C₆, halocicloalquilaminocarbonilo C₃-C₆, y un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o máximamente insaturado de 3, 4, 5, 6 ó 7 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico está opcionalmente sustituido con uno o más, preferiblemente 1, 2 o 3, en particular 1, sustituyentes seleccionados de halógeno, CN, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, haloalqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, haloalquino C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄ y haloalquiltio C₁-C₄; o, R^{10a} y R^{10b}, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un anillo heterocíclico aromático, parcialmente insaturado o saturado de 5 o 6 miembros, que adicionalmente puede contener 1 o 2 heteroátomos o grupos de heteroátomos adicionales seleccionados entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico puede llevar 1 o 2, en particular 1, sustituyentes seleccionados entre halógeno, CN, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, haloalqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, haloalquino C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄ y haloalquiltio C₁-C₄.

Más preferiblemente, R^{10a} y R^{10b} son, independientemente entre sí, seleccionados de hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, y un anillo heterocíclico saturado de 3 o 4 miembros que comprende 1 heteroátomo o grupo de heteroátomos seleccionado entre N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembro del anillo, donde el anillo heterocíclico está opcionalmente sustituido con uno o más, preferiblemente 1, 2 o 3, en particular 1, sustituyentes seleccionados de halógeno, CN, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄; y son específicamente, independientemente entre sí, seleccionados de hidrógeno, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄.

35 Cada R¹¹ y cada R¹⁶ son seleccionados independientemente de cada caso e independientemente entre sí preferiblemente de halógeno, CN, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquil C₁-C₄ sulfinilo, haloalquil C₁-C₄ sulfinilo, alquil C₁-C₄ sulfonilo y haloalquil C₁-C₄ sulfonilo, y más preferiblemente de halógeno, CN, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄.

40 Cada R¹² se selecciona preferiblemente de alquilo C₁-C₄ y es en particular metilo.

45 En caso de que R¹³ sea un sustituyente en un grupo alquilo, alqueno o alquino, se selecciona preferiblemente del grupo que consiste en ciano, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, -OH, -SH, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquil C₁-C₄ sulfinilo, haloalquil C₁-C₄ sulfinilo, alquil C₁-C₄ sulfonilo, haloalquil C₁-C₄ sulfonilo y fenilo que puede estar sustituido por 1, 2 o 3 radicales seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄.

50 En caso de que R¹³ sea un sustituyente en un grupo cicloalquilo, éste se selecciona preferiblemente del grupo que consiste en ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, -OH, -SH, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquil C₁-C₄ sulfinilo, haloalquil C₁-C₄ sulfinilo, alquil C₁-C₄ sulfonilo, haloalquil C₁-C₄ sulfonilo y fenilo que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 radicales seleccionados entre halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄.

55 En caso de que R¹³ sea un sustituyente en un grupo cicloalquilo, incluso se selecciona más preferiblemente del grupo que consiste en halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₃. En particular, R¹³ como sustituyente en un grupo cicloalquilo se selecciona entre halógeno, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₃.

60 En el caso de R¹³ en un grupo -C(=O)R¹³, -C(=S)R¹³, =C(R¹³)₂ o -C(=NR¹⁴)R¹³, R⁸ es preferiblemente seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, -OH, -SH, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆ y fenilo que puede estar sustituido con 1, 2 o 3 radicales seleccionados entre halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄.

65 R¹⁴, R^{14a} y R^{14b} son, independientemente entre sí, seleccionados preferiblemente de hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, haloalqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, haloalquino C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆ y bencilo, donde el anillo fenilo en bencilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3, en

particular 1, sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

o, R^{14a} y R^{14b}, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un anillo heterocíclico aromático, parcialmente insaturado o saturado de 5 o 6 miembros, que además puede contener 1 o 2 heteroátomos adicionales o grupos de heteroátomos seleccionados de N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico puede llevar 1 o 2, en particular 1, sustituyentes seleccionados entre halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄.

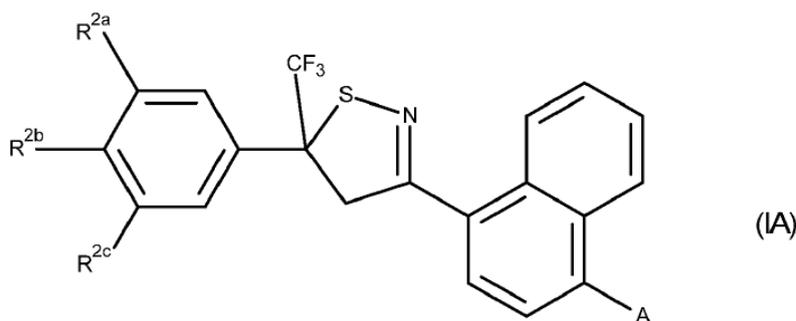
Más preferiblemente, R¹⁴, R^{14a} y R^{14b} son, independientemente entre sí, seleccionados de hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆ y bencilo, donde el anillo fenilo en bencilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3, en particular 1, sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

o, R^{14a} y R^{14b}, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un anillo heterocíclico aromático, parcialmente insaturado o saturado de 5 o 6 miembros, que además puede contener 1 o 2 heteroátomos adicionales o grupos de heteroátomos seleccionados de N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo, donde el anillo heterocíclico puede llevar 1 o 2, en particular 1, sustituyentes seleccionados entre halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄.

Cada R¹⁵ se selecciona preferiblemente de hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, fenilo, bencilo, piridilo y fenoxi, en donde los cuatro últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos y/o llevar 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados de alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ y haloalcoxi C₁-C₆.

R¹⁷, R^{18a} y R^{18b}, independientemente entre sí e independientemente de cada caso, se seleccionan preferiblemente de hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, alquilo C₁-C₆ que lleva 1 sustituyente seleccionado de ciano, cicloalquilo C₃-C₄ que puede estar sustituido con 1 grupo ciano; y halocicloalquilo C₃-C₄; cicloalquilo C₃-C₈ que puede llevar 1 grupo ciano; y halocicloalquilo C₃-C₈.

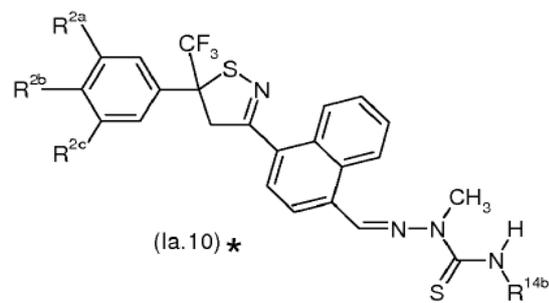
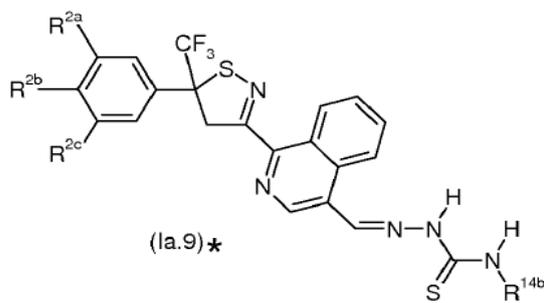
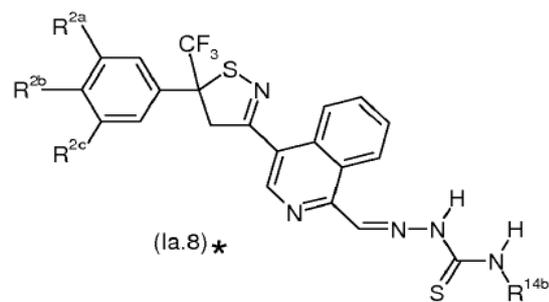
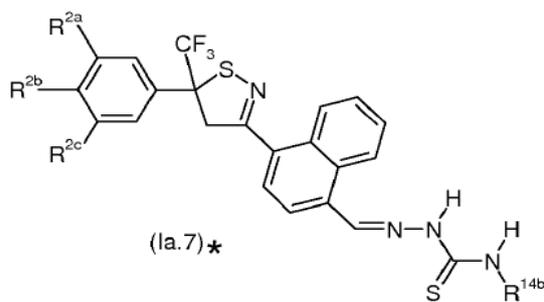
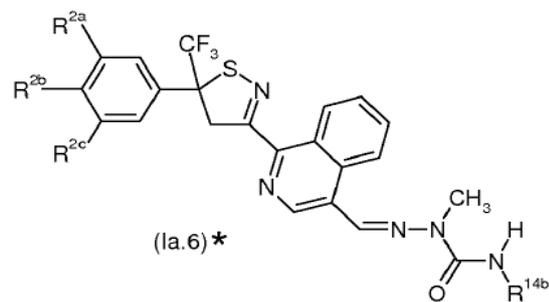
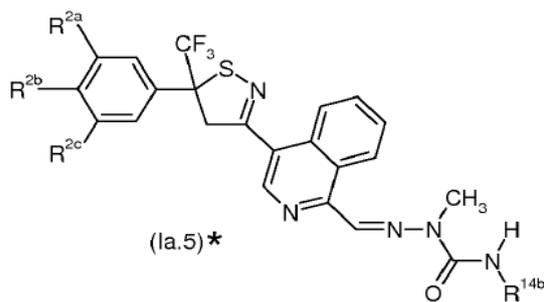
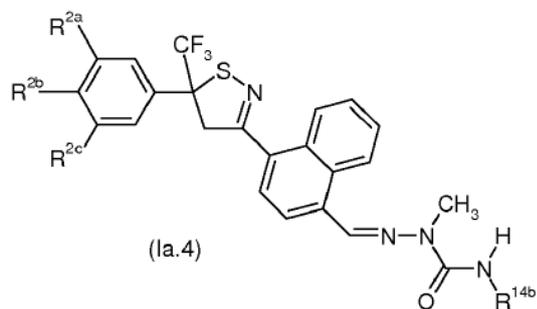
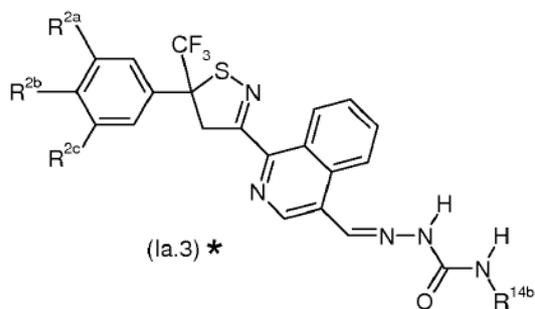
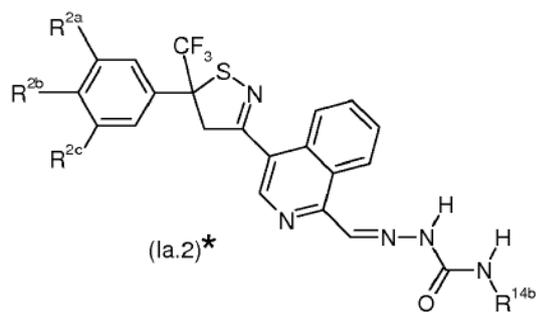
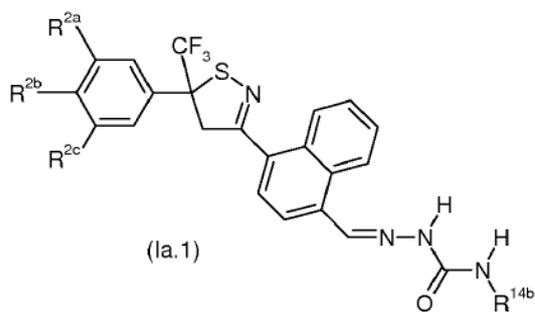
En una realización particular de la invención, el compuesto I es un compuesto de fórmula IA

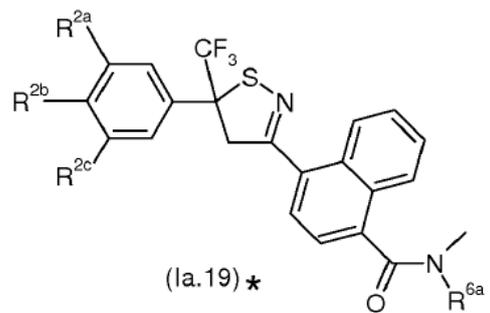
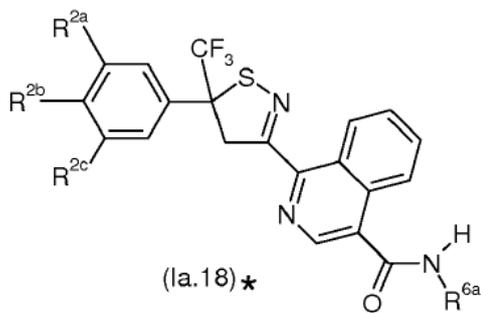
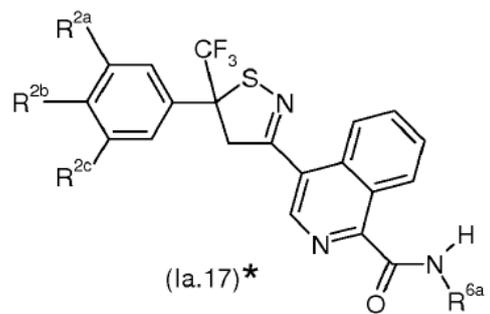
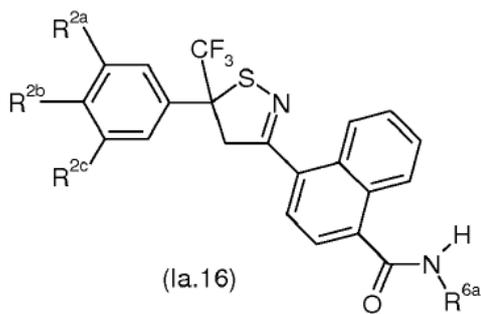
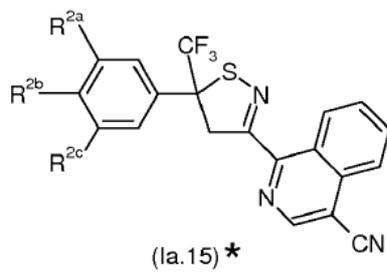
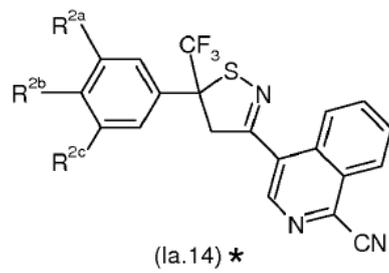
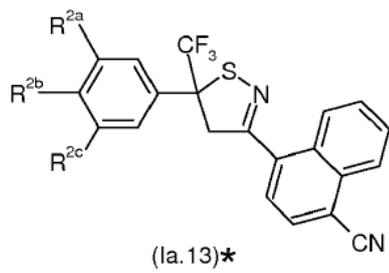
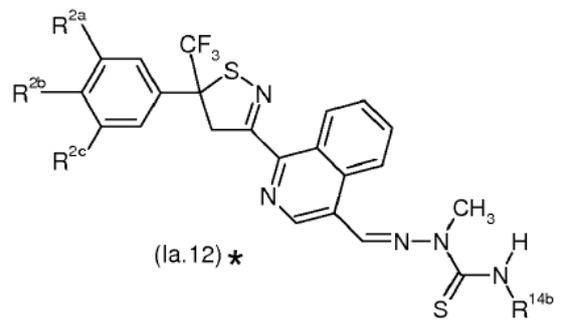
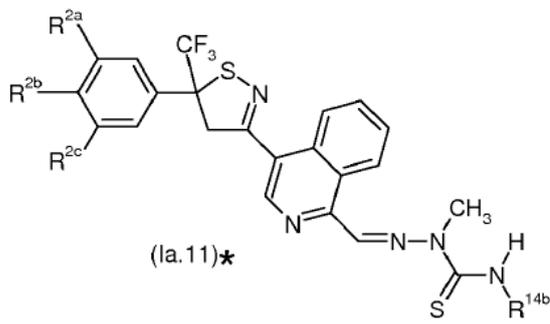


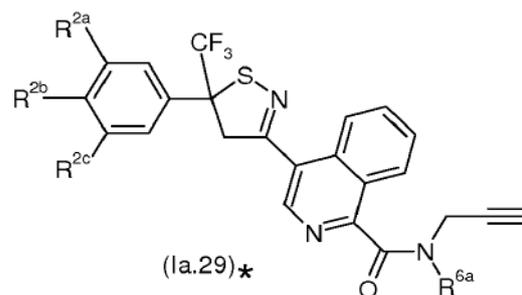
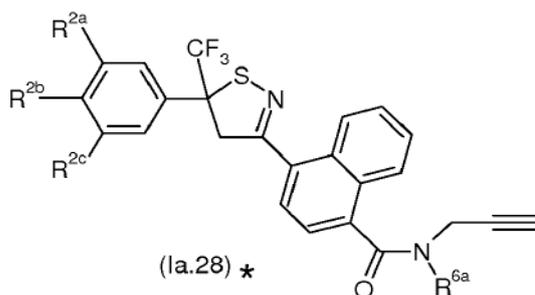
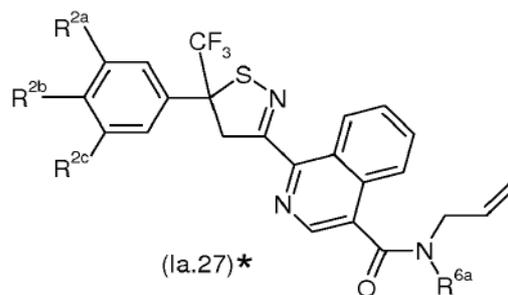
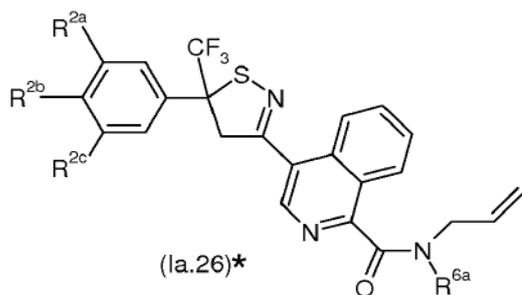
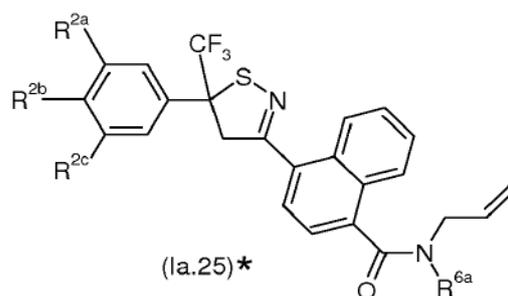
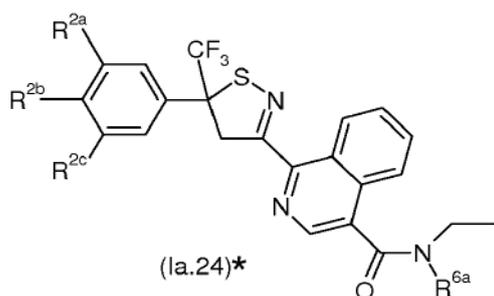
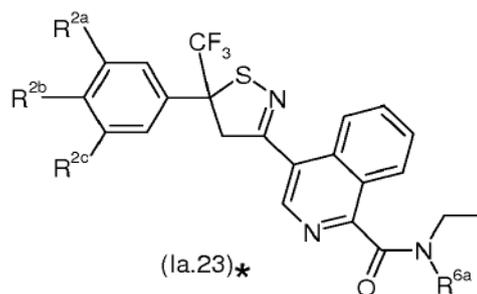
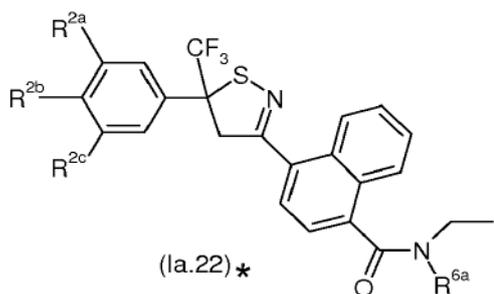
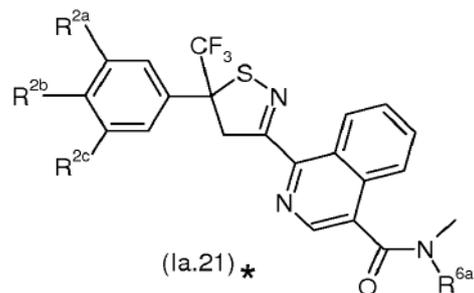
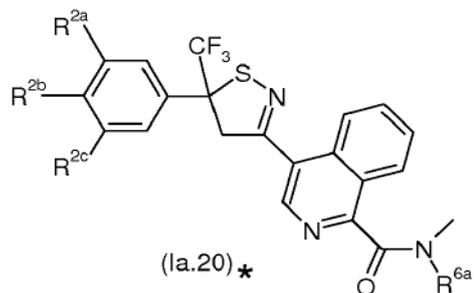
donde A tiene uno de los significados generales indicados anteriormente o, en particular, uno de los significados preferidos indicados anteriormente, y R^{2a}, R^{2b} y R^{2c}, independientemente entre sí, tienen uno de los significados generales o, en particular, uno de los significados preferidos indicados anteriormente para R².

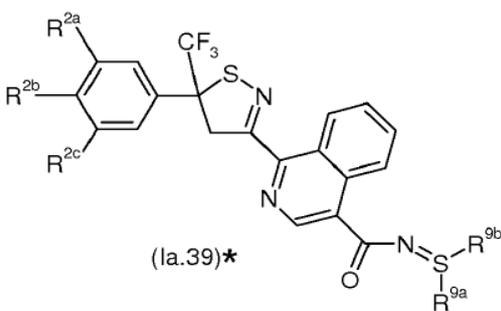
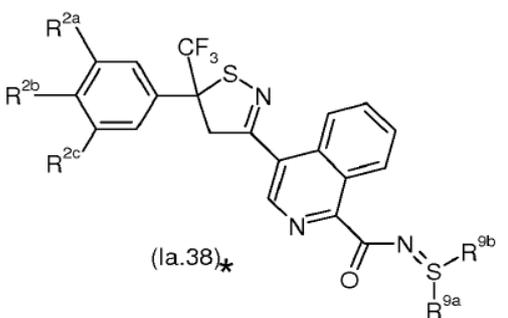
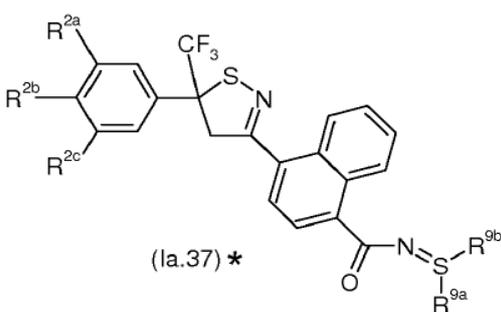
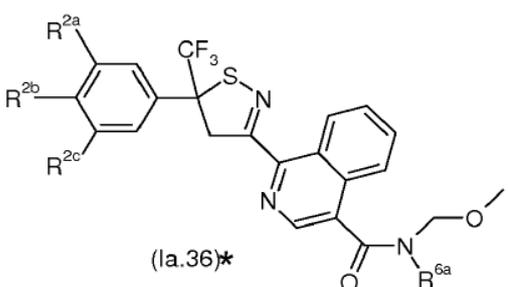
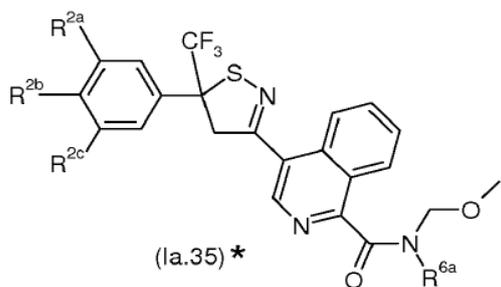
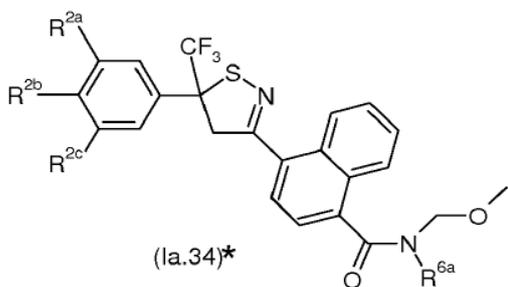
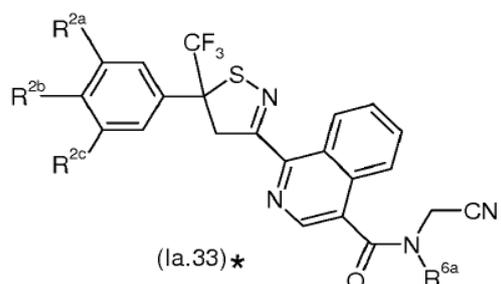
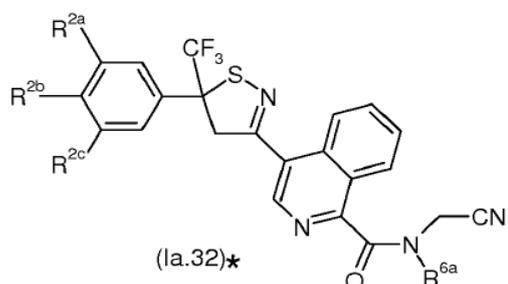
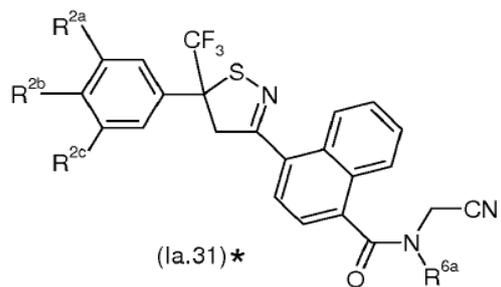
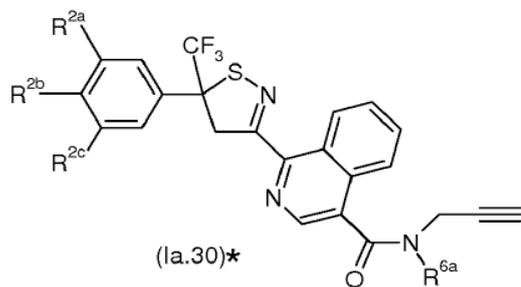
Los ejemplos de compuestos preferidos son compuestos de las siguientes fórmulas Ia.1 a Ia.63, en las que las variables tienen uno de los significados generales o preferidos indicados anteriormente. Ejemplos de compuestos preferidos son los compuestos individuales recopilados en las tablas 1 a 24232, a continuación. Además, los significados mencionados a continuación para las variables individuales en las tablas son per se, independientemente de la combinación en la que se mencionan, una realización particularmente preferida de los sustituyentes en cuestión.

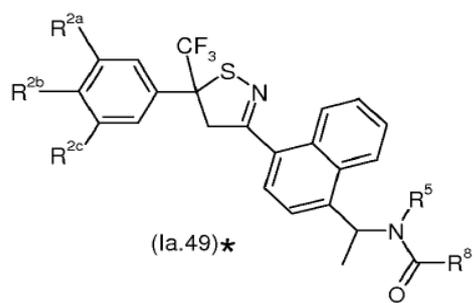
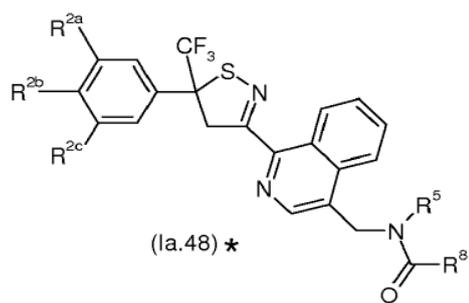
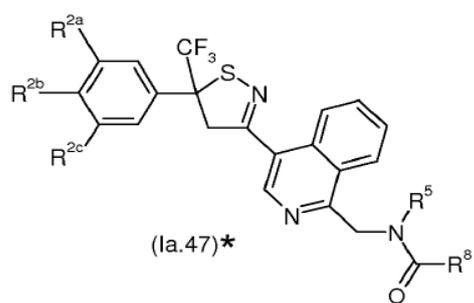
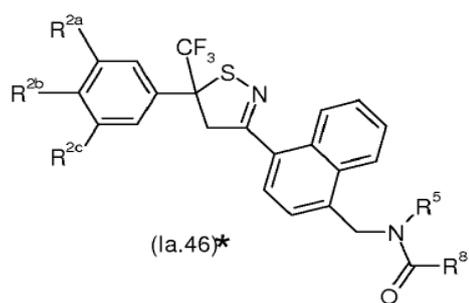
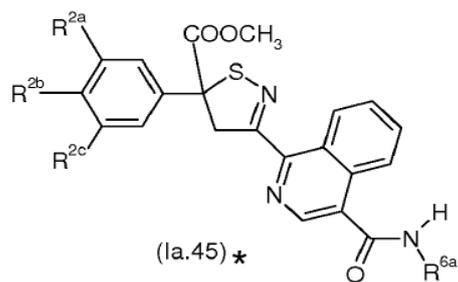
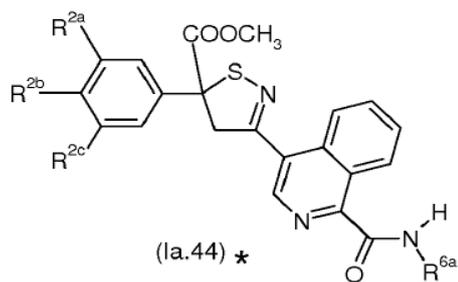
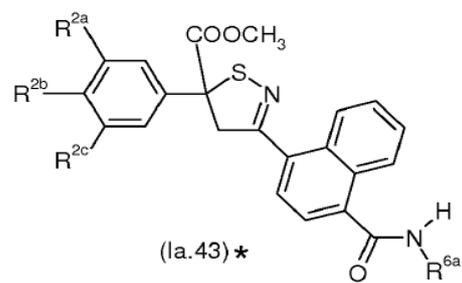
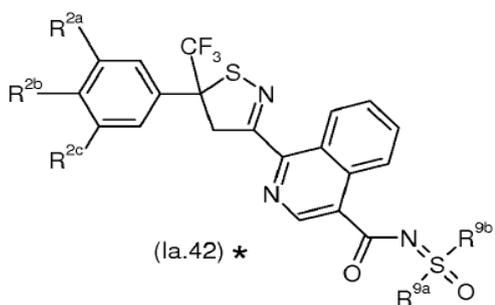
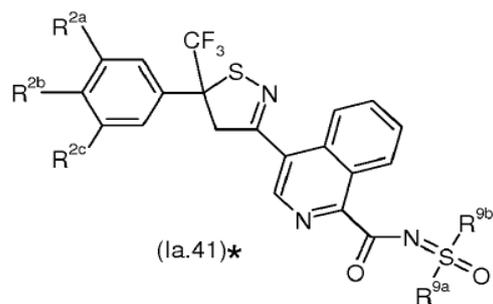
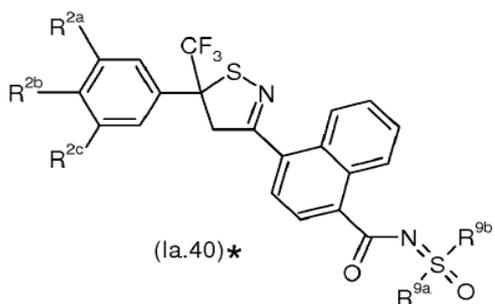
Los ejemplos indicados con* están fuera del alcance de la invención.

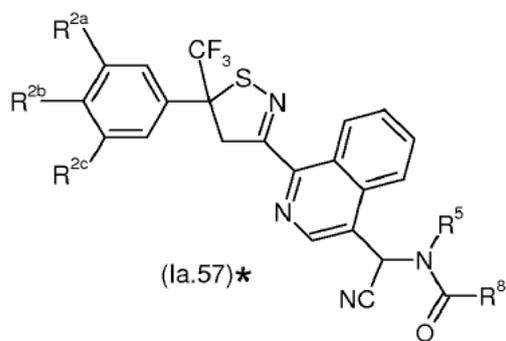
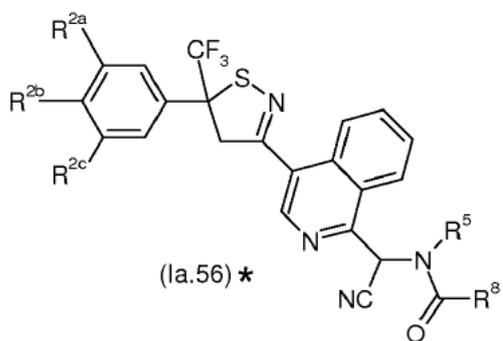
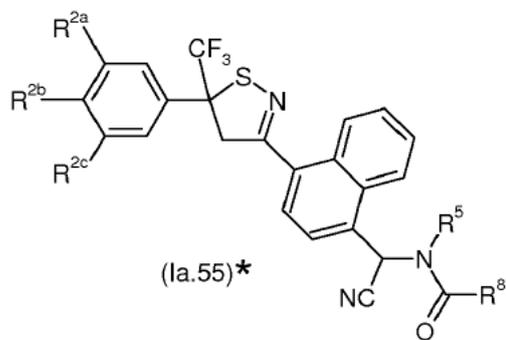
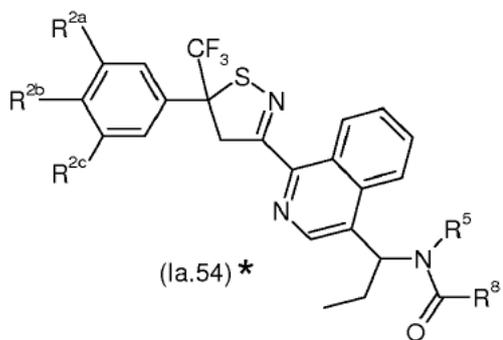
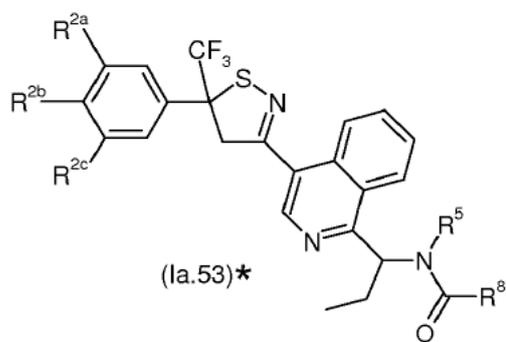
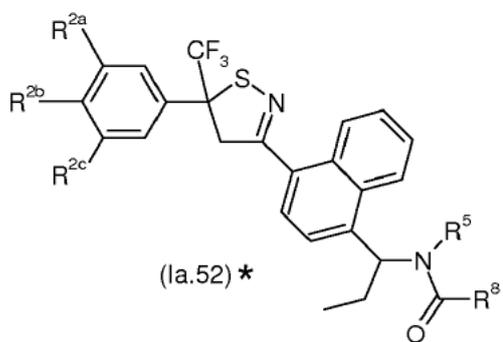
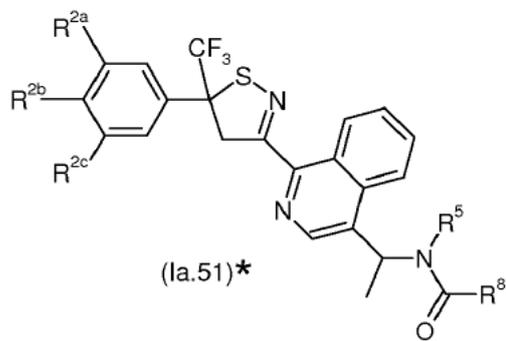
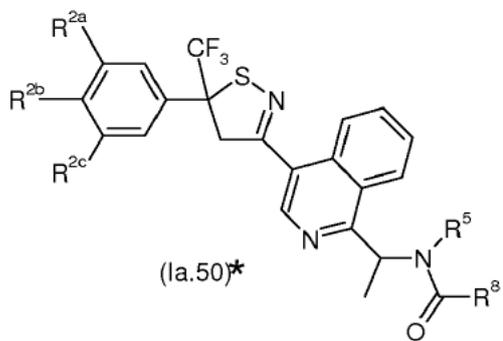


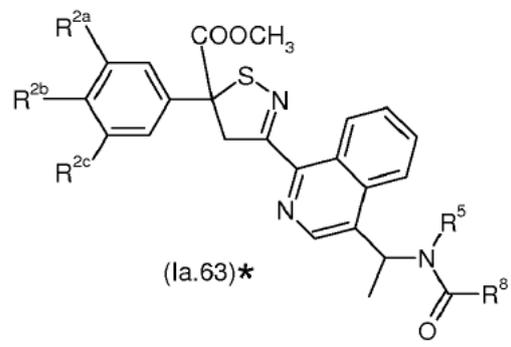
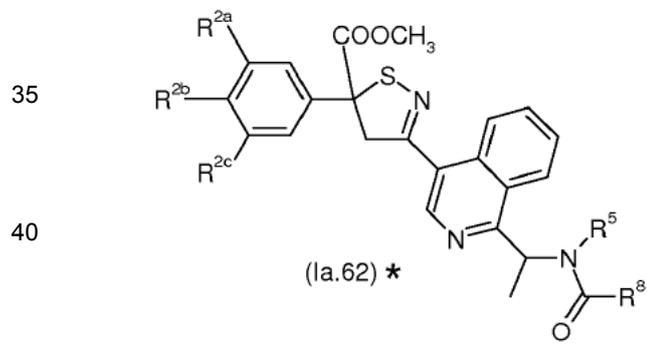
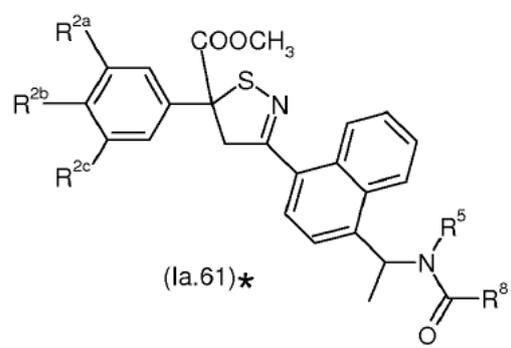
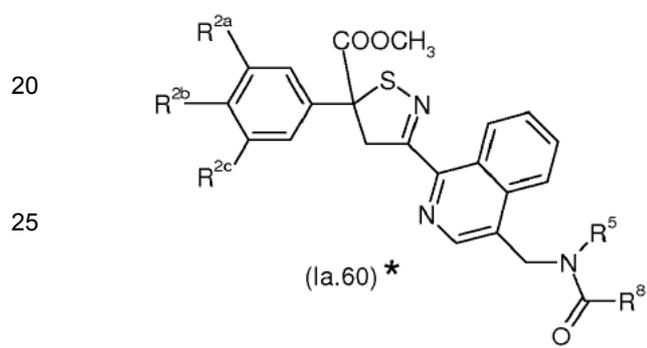
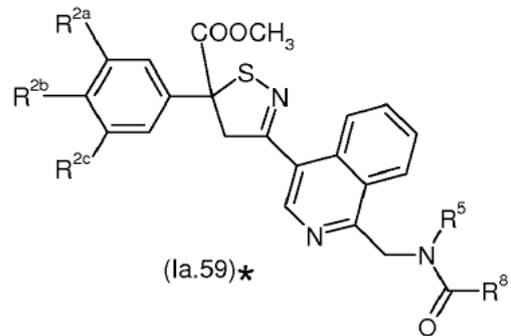
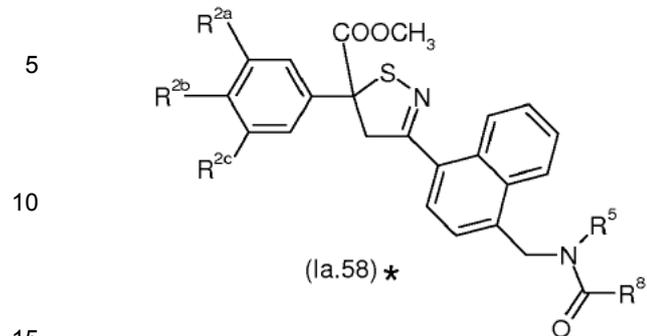












- 50
- 55
- 60
- 65
- Tabla 1 Compuestos de la fórmula Ia.1 en la que R^{14b} es hidrógeno y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
 - Tabla 2 Compuestos de la fórmula Ia.1 en la que R^{14b} es metilo y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
 - Tabla 3 Compuestos de la fórmula Ia.1 en la que R^{14b} es etilo, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
 - Tabla 4 Compuestos de la fórmula Ia.1 en la que R^{14b} es propilo, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
 - Tabla 5 Compuestos de la fórmula Ia.1 en la que R^{14b} es isopropilo, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
 - Tabla 6 Compuestos de la fórmula Ia.1 en la que R^{14b} es n-butilo, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
 - Tabla 7 Compuestos de la fórmula Ia.1 en la que R^{14b} es sec-butilo, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
 - Tabla 8 Compuestos de la fórmula Ia.1 en la que R^{14b} es isobutilo y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
 - Tabla 9 Compuestos de la fórmula Ia.1 en la que R^{14b} es terc-butilo, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
 - Tabla 10 Compuestos de la fórmula Ia.1 en la que R^{14b} es 2,2-difluoroetilo, y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

- Tabla 2002* Compuestos de la fórmula la.46 en la que R⁵ es hidrógeno, R⁸ es -NH-C(O)-N(H)-CH₂-(1-cianociclopropilo) y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
- 5 Tabla 2003* Compuestos de la fórmula la.46 en la que R⁵ es hidrógeno, R⁸ es -CH=N-OCH₃ y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
- Tabla 2004* Compuestos de la fórmula la.46 en la que R⁵ es hidrógeno, R⁸ es -CH=N-OCH₂CH₃ y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
- Tabla 2005* Compuestos de la fórmula la.46 en la que R⁵ es hidrógeno, R⁸ es -CHN-OCH₂CHF₂ y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
- 10 Tabla 2006* Compuestos de la fórmula la.46 en la que R⁵ es hidrógeno, R⁸ es -CHN-OCH₂CF₃ y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
- Tabla 2007* Compuestos de la fórmula la.46 en donde R⁵ es hidrógeno, R⁸ es -CH=N-OCH₂CH=CH₂ y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
- 15 Tabla 2008* Compuestos de la fórmula la. 46 en el que R⁵ es hidrógeno, R⁸ es -CH=N-OCH₂C≡CH y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
- Tabla 2009* Compuestos de la fórmula la.46 en la que R⁵ es hidrógeno, R⁸ es -CH=N-OCH₂CN y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
- Tabla 2010* Compuestos de la fórmula la.46 en la que R⁵ es hidrógeno, R⁸ es -CH=N-O-ciclopropilo y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
- 20 Tabla 2011* Compuestos de la fórmula la.46 en la que R⁵ es hidrógeno, R⁸ es -CH=N-O-(1-cianociclopropilo) y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
- Tabla 2012* Compuestos de la fórmula la.46 en la que R⁵ es hidrógeno, R⁸ es -CH=N-O-CH₂-ciclopropilo y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
- 25 Tabla 2013* Compuestos de la fórmula la.46 en la que R⁵ es hidrógeno, R⁸ es -CH=N-O-CH₂-(1-cianociclopropilo) y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
- Tablas 2014 a 2151* Compuestos de la fórmula la.46 en la que R⁵ es metilo, R⁸ es como se define en cualquiera de las tablas 1876 a 2013 y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
- 30 Tablas 2152 a 2289* Compuestos de la fórmula la.46 en la que R⁵ es etilo, R⁸ es como se define en cualquiera de las tablas 1876 a 2013 y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
- Tablas 2290 a 2427* Compuestos de la fórmula la.46 en la que R⁵ es alilo, R⁸ es como se define en cualquiera de las tablas 1876 a 2013 y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
- 35 Tablas 2428 a 2565* Compuestos de la fórmula la.46 en la que R⁵ es propargilo, R⁸ es como se define en cualquiera de las Tablas 1876 a 2013 y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
- Tablas 2566 a 2703* Compuestos de la fórmula la.46 en la que R⁵ es CH₂CHF₂, R⁸ es como se define en cualquiera de las Tablas 1876 a 2013 y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
- 40 Tablas 2704 a 2841* Compuestos de la fórmula la.46 en la que R⁵ es CH₂CF₃, R⁸ es como se define en cualquier de las tablas 1876 a 2013 y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
- 45 Tablas 2842 a 2979* Compuestos de la fórmula la.46 en la que R⁵ es CH₂CN, R⁸ es como se define en cualquiera de las tablas 1876 a 2013 y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
- Tablas 2980 a 3117* Compuestos de la fórmula la.46 en la que R⁵ es CH₂OCH₃, R⁸ es como se define en cualquiera de las tablas 1876 a 2013 y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
- 50 Tablas 3118 a 4360* Compuestos de la fórmula la.47 en la que los significados combinados de R⁵ y R⁸ son los definidos en cualquiera de las tablas 1876 a 3117 y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
- Tablas 4361 a 5602* Compuestos de la fórmula la.48 en la que los significados combinados de R⁵ y R⁸ son los definidos en cualquiera de las Tablas 1876 a 3117 y el peine La generación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto
- 55 corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
- Tablas 5603 a 6844* Compuestos de la fórmula la.49 en la que los significados combinados de R⁵ y R⁸ son como se definen en cualquiera de las tablas 1876 a 3117 y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A
- 60 Tablas 6845 a 8086* Compuestos de la fórmula la.50 en la que los significados combinados de R⁵ y R⁸ son como se definen en cualquiera de las tablas 1876 a 3117 y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
- Tablas 8087 a 9328* Compuestos de la fórmula la.51 en la que los significados combinados de R⁵ y R⁸ son los definidos en cualquiera de las tablas 1876 a 3117 y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto
- 65 corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
- Tablas 9329 a 10570* Compuestos de la fórmula la.52 en la que los significados combinados de R⁵ y R⁸ son los

ES 2 817 098 T3

- definidos en cualquiera de las tablas 1876 a 3117 y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
- 5 Tablas 10571 a 11812* Compuestos de la fórmula la.53 en la que los significados combinados de R⁵ y R⁸ son como se definen en cualquiera de las tablas 1876 a 3117 y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A
- 10 Tablas 11813 a 13054* Compuestos de la fórmula la.54 en la que los significados combinados de R⁵ y R⁸ son como se definen en cualquiera de las tablas 1876 a 3117 y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A
- 15 Tablas 13.055-14.296* compuestos de la fórmula la. 55 en la que los significados combinados de R⁵ y R⁸ son los definidos en cualquiera de las tablas 1876 a 3117 y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
- 20 Tablas 14297 a 15538* Compuestos de la fórmula la.56 en la que los significados combinados de R⁵ y R⁸ son los definidos en cualquiera de las tablas 1876 a 3117 y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
- 25 Tablas 15539 a 16780* Compuestos de la fórmula la.57 en la que los significados combinados de R⁵ y R⁸ son los definidos en cualquiera de las tablas 1876 a 3117 y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A
- 30 Tablas 16781 a 18022* Compuestos de la fórmula la.58 en la que los significados combinados de R⁵ y R⁸ son como se definen en cualquiera de las tablas 1876 a 3117 y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A
- 35 Tablas 18023 a 19264* compuestos de la fórmula la.59 en la que los significados combinados de R⁵ y R⁸ son los definidos en cualquiera de las tablas 1876 a 3117 y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
- Tablas 19265 a 20506* Compuestos de la fórmula la.60 en la que los significados combinados de R⁵ y R⁸ son los definidos en cualquiera de las tablas 1876 a 3117 y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A
- Tablas 20507 a 21748* Compuestos de la fórmula la.61 en la que los significados combinados de R⁵ y R⁸ son como se definen en cualquiera de las tablas 1876 a 3117 y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A
- Tablas 21749 a 22990* Compuestos de la fórmula la.62 en la que los significados combinados de R⁵ y R⁸ son como se definen en cualquiera de las tablas 1876 a 3117 y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la tabla A
- Tablas 22991 hasta 24232* compuestos de la fórmula la.63 en la que los significados combinados de R⁵ y R⁸ son los definidos en cualquiera de las tablas 1876 a 3117 y la combinación de R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla A

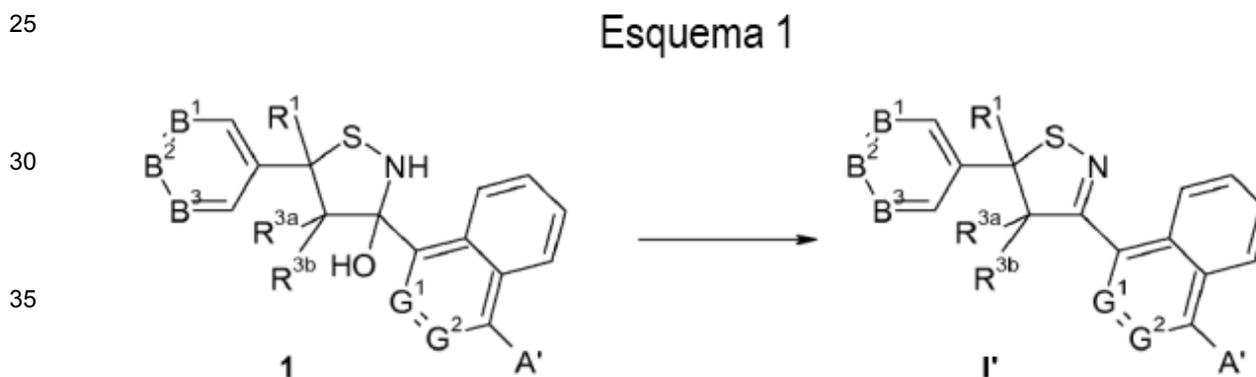
Tabla A

No.	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}
A-1	F	H	F
A-2	F	F	F
A-3	F	Cl	F
A-4	F	Br	F
A-5	F	H	Cl
A-6	F	H	Br
A-7	Cl	H	Cl
A-8	Cl	Cl	Cl
A-9	Cl	F	Cl
A-10	Cl	Br	Cl
A-11	Cl	H	Br
A-12	Br	H	Br
A-13	Br	F	Br
A-14	Br	Cl	Br
A-15	CF ₃	H	F
A-16	CF ₃	H	Cl
A-17	CF ₃	H	Br
A-18	CF ₃	H	CF ₃
A-19	CF ₃	F	F
A-20	CF ₃	Cl	Cl
A-21	CF ₃	Br	Br
A-22	SF ₅	H	F
A-23	SF ₅	H	Cl
A-24	SF ₅	H	Br

A-25	SF ₅	H	CF ₃
A-26	SF ₅	H	H
A-27	CF ₃	H	H
A-28	Br	H	H
A-20	Cl	H	H
A-30	F	H	H

Entre los compuestos anteriores, se da preferencia a compuestos IA.1,* IA.13*, la.16, y la.46*, donde se prefiere especialmente la.16.

- 5 Los compuestos de la fórmula (I) se pueden preparar mediante los procedimientos como se describe en los siguientes esquemas o en las descripciones de síntesis de los ejemplos de trabajo, o mediante procedimientos estándar de química orgánica. Los sustituyentes, variables e índices son como se definieron anteriormente para la fórmula (I), si no se especifica lo contrario.
- 10 Los Compuestos de la fórmula I se pueden preparar por deshidratación de un compuesto de fórmula 1, tal como se muestra en el esquema 1 a continuación. A' es A o un precursor de A. Los precursores típicos de A son un átomo de halógeno, CN, carboxi, terc-butoxicarbonilo, un grupo acetal, un grupo aldehído protegido o -OSO₂-R^{z1}, donde R^{z1} es alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ o fenilo que puede estar sustituido por 1, 2 o 3 radicales seleccionados de alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄. Los compuestos I' corresponden a los compuestos I cuando A' es A. La deshidratación se produce espontáneamente o con la ayuda de agentes deshidratantes, tales como tamices moleculares, tamices moleculares lavados con ácido, sulfato de magnesio, sulfato de sodio, gel de sílice, SOCl₂, POCl₃, reactivo de Burgess, anhídrido trifluoroacético, ácido p-toluenosulfónico, HCl anhidro o ácido sulfúrico. Preferiblemente, se utilizan ácido p-toluenosulfónico o tamices moleculares de lavados con ácido. El agua formada se puede eliminar alternativamente, por ejemplo, mediante destilación azeotrópica, por ejemplo, con benceno/tolueno como agente de arrastre, por ejemplo, utilizando una trampa Dean Stark. Si es necesario (es decir, si A' es un precursor de A), A' se convierte en un grupo A.



- 40 Los compuestos 1, en donde R^{3b} es hidrógeno se pueden preparar por reacción de un compuesto 3 con un agente de aminación para dar un compuesto de fórmula 2, que reacciona espontáneamente al compuesto 1, tal como se muestra en el esquema 2. Dependiendo de los agentes de aminación utilizados, la aminación se puede llevar a cabo en una reacción de un etapa, en la que el compuesto 3 reacciona directamente con el compuesto 2, o como una reacción de dos etapas, en la que el grupo SH del compuesto 3 se oxida primero a un grupo S-Cl, que, a continuación, reacciona posteriormente a un grupo S-NH₂, dando así el compuesto 2.

- 45 Los agentes de aminación adecuados para la reacción de una etapa son, por ejemplo HOSA (ácido hidroxilamina-O-sulfónico), que se utiliza generalmente en presencia de una base (las bases adecuadas son por ejemplo hidrógenofosfato de sodio, hidrógenofosfato de potasio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, metanolato de sodio, trietilamina y similares), O-(difenilfosforil)hidroxilamina, que generalmente también se usa en presencia de una base (las bases adecuadas son, por ejemplo, hidrogenofosfato de sodio, hidrogenofosfato de potasio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, metanolato de sodio, trietilamina y similares), 2,4-dinitrofenilhidroxilamina, O-mesitilensulfonylhidroxilamina y 2-oxa-1-azaespiro[2,5] octano, entre los cuales se prefieren HOSA y O-(difenilfosforil) hidroxilamina. La aminación se lleva a cabo generalmente en un disolvente, siendo disolventes adecuados, por ejemplo, alcanos clorados, tales como cloruro de metileno o cloroformo, disolventes aromáticos, tales como benceno, tolueno, xilenos, clorobenceno o diclorobenceno, y éteres, tales como dietiléter, dipropiléter, metil terc-butil éter, metil isobutil éter, etilenglicol dimetil

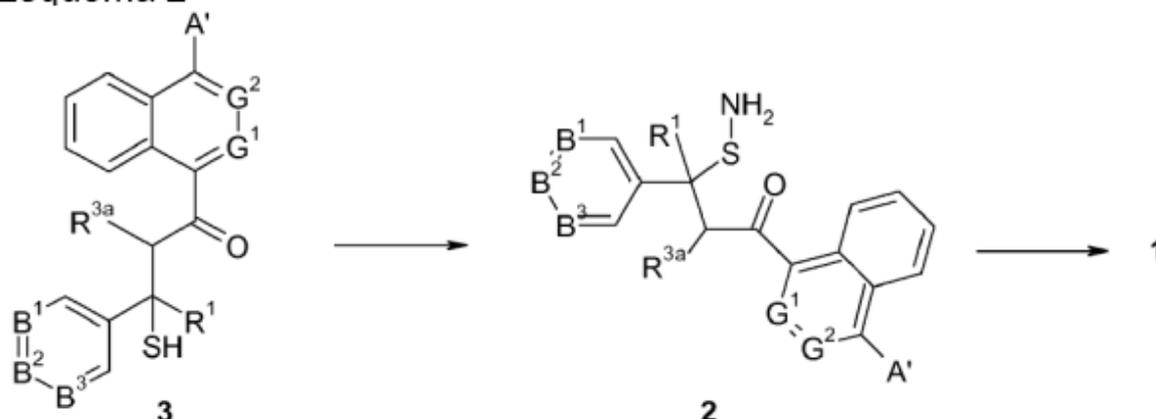
éter, tetrahidrofurano (THF) o dioxano y similares. La reacción se lleva a cabo adecuadamente a baja temperatura, por ejemplo, de -100 a 0 °C o de -78 a 0 °C. Generalmente, el compuesto **3** se dispersa en un disolvente y se enfría a la temperatura deseada y se agrega la base, seguido del agente de aminación, o se agrega el agente de aminación, seguido de la base, o la base y el agente de aminación se agregan simultáneamente. HOSA se usa adecuadamente en combinación con una base amina, tal como trietilamina. En este caso, se prefiere enfriar el compuesto **3** a de -30 a 0 °C, preferiblemente de -20 a -10 °C, para agregar la base amina a esta temperatura y a continuación HOSA y mantener la reacción a aproximadamente de -10 a 0 °C.

Alternativamente, se puede utilizar O-(difenilfosforil)hidroxil amina en combinación con una base, por ejemplo, con una base inorgánica, tal como hidrogenofosfato sódico, hidrógenofosfato de potasio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio o carbonato de potasio y específicamente hidrogenofosfato de sodio. En este caso, es conveniente enfriar el compuesto **3** a de -80 a -30 °C, especialmente de -80 a -70 °C, para agregar la base a esta temperatura y a continuación O-(difenilfosforil) hidroxilamina y mantener la reacción a aproximadamente de 0 °C a temperatura ambiente.

En la reacción de dos etapas, el compuesto **3** se hace reaccionar primero con un agente de cloración que convierte el grupo SH en un grupo S-Cl. Los agentes de cloración adecuados son, por ejemplo, cloruro de sulfurilo, N-cloro succinimida (NCS), hipoclorito de sodio, monocloroamina (NH₂Cl) o cloro, que se usa preferiblemente en presencia de FeCl₃. La cloración se puede llevar a cabo de manera análoga al procedimiento descrito en Synthesis 1987, 1987, 683-688, Tetrahedron 66 (36), 2010, 7279-7287, J. Org. Chem. 59 (4), 1994, 914-921, J. Org. Chem. 63, 1998, 4878-4888 o J. Chem Soc. 1938, 2114-2117. La cloración se realiza generalmente en un disolvente. Los disolventes adecuados son, por ejemplo, éteres, tales como éter dietílico, éter dipropílico, terc-butil metil éter, isobutil metil éter, éter dimetílico de etilenglicol, tetrahidrofurano o dioxano. La temperatura de reacción puede variar en amplios intervalos y es generalmente de 0 °C al punto de ebullición de la mezcla de reacción (si se usa un disolvente). A continuación, el compuesto clorado se hace reaccionar sin aislamiento con amoníaco o hidróxido de amonio. Si se usa amoníaco anhidro, la reacción se lleva a cabo generalmente entre -78 y -33 °C. Si se usa amoníaco acuoso o hidróxido de amonio, la reacción también se puede llevar a cabo a temperaturas más altas, tales como 0 a 25 °C. La reacción se lleva a cabo generalmente en un disolvente. Los disolventes adecuados son, por ejemplo, los éteres indicados anteriormente, entre los que se prefieren los éteres miscibles en agua, tales como THF y dioxano. En general, el compuesto clorado se disuelve en un disolvente al que se le añade amoníaco o hidróxido de amonio. La reacción se puede llevar a cabo, tal como se describe, por ejemplo, en Synthesis, 1987, 8, 683-688. La cloración/aminación también se puede llevar a cabo como una reacción en un solo recipiente. Por ejemplo, el tiol **3** se hace reaccionar simultáneamente con un agente clorante (como NCS o hipoclorito de sodio acuoso) y amoníaco anhidro o acuoso en disolventes etéreos (tales como THF o Et₂O) o agua. Se prefiere la reacción con NCS en una mezcla de THF y amoníaco líquido anhidro a -33°C. Por ejemplo, se agrega una solución del tiol **3** en THF a una solución de NCS (N-clorosuccinimida) en THF/amoníaco líquido a -78 °C. La solución se calienta a -30 °C y se agita hasta que se evapora el amoníaco. Alternativamente, a 0 °C, se agrega una solución del tiolato de sodio (NaSR) en agua a una mezcla de amoníaco acuoso (25%) e hipoclorito de sodio acuoso (1 N). La reacción de cloración/aminación en un recipiente se puede llevar a cabo como se describe, por ejemplo, en Tetrahedron 2010, 66, 7279-7287 o en J. Org. Chem. 1994, 59, 914-921.

El compuesto **2** prácticamente no se puede aislar ya que generalmente reacciona espontáneamente en una reacción de cierre de anillo al compuesto **1**.

Esquema 2



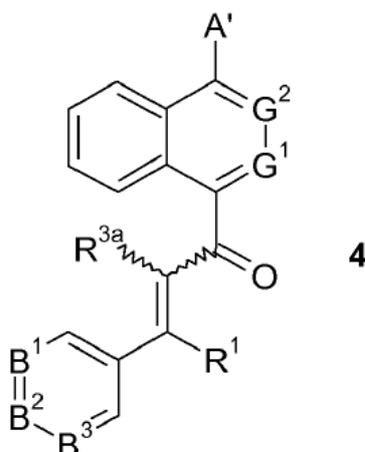
El compuesto de fórmula **3** se puede preparar mediante reacción de un compuesto de fórmula **4**

5

10

15

20



25

30

35

40

45

50

55

60

con una fuente de azufre. Las fuentes de azufre adecuadas son, por ejemplo, H₂S, hidroenosulfuros metálicos, como NaSH o KSH, sulfuros metálicos, como Na₂S, K₂S, Li₂S, Cu₂S, MgS, CaS, CuS, FeS y similares, sulfuro de amonio [(NH₄)₂S], sulfuros de tetraalquilamonio (R₄NSH), tales como sulfuro de tetrametilamonio, sulfuro de tetraetilamonio, sulfuro de tetrapropilamonio y similares, o sulfuro de bistrimetilsililo. El H₂S como fuente de azufre se usa generalmente en presencia de una base, tal como Na₂CO₃, K₂CO₃, Cs₂CO₃, acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de cesio, aminas, tal como dietilamina, dipropilamina, trietilamina, diisopropiletilamina y similares, o heterociclos que contienen nitrógeno básico, tales como pirrolidina, piperidina, piperazina, piridina, lutidina y similares. Alternativamente, se puede utilizar H₂S como fuente de azufre en presencia de un ácido de Lewis, como AlCl₃ o FeCl₃. La reacción del compuesto **4** con una fuente de azufre se lleva a cabo generalmente en un disolvente, siendo los disolventes adecuados, por ejemplo, alcanos clorados, tales como cloruro de metileno o cloroformo, y disolventes aromáticos, tales como benceno, tolueno, xilenos, clorobenceno o diclorobenceno. La temperatura de reacción puede variar en un amplio rango, tal como de -78 °C a temperatura ambiente. En general, el compuesto **4** se disuelve en un disolvente, opcionalmente se enfría, a continuación se agrega la base (si se usa) y posteriormente la fuente de azufre. El compuesto **4** se puede hacer reaccionar alternativamente con una fuente de azufre que proporciona un compuesto **3** que está protegido en el grupo tiol SH por un grupo protector (S-PG). Esto es ventajoso si el compuesto **3** se somete, por ejemplo, a condiciones de purificación más duras o se deriva, por ejemplo, para convertir el grupo precursor A en un grupo -NR⁵R⁶ o para modificar el grupo A en esta etapa. Además, la purificación del producto protegido es más fácil. Los reactivos de sulfuración adecuados que dan tales tioles protegidos son, por ejemplo, tiourea (NH₂-C(=S)-NH₂), bencil tioles opcionalmente sustituidos, tales como benciltiol, o- o p-metoxi-benciltiol, o- o p-hidroxibenciltiol, o- o p-acetoxibenciltiol, o- o p-nitrobenciltiol o 2,4,6-trimetilbenciltiol, piridin-4-il-metiltiol, quinolin-2-il-metiltiol, sulfuros de bencil-metal, tales como bencilsulfuro de sodio, feniltiol, 2,4-dinitrofeniltiol, tritiltiol, terbutiltiol, compuestos de fórmula RC(=O)-NH-CH₃-SH, donde R es metilo, terc-butilo, alilo, fenilo o bencilo, 2-trimetil-etanotiol, 2-(2,4-dinitrofenil)-etanotiol, 2-fenilsulfonil-etanotiol, tioles acilados, tales como metilcarboniltiol o fenilcarboniltiol, y tiocarbamatos R-NH-C(=O)-SH, donde R es, por ejemplo, metilo o etilo. Los bencil y alquiltioles se utilizan generalmente en presencia de una base, tal como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, fosfato de sodio, fosfato de potasio, hidrogenofosfato de sodio, hidrogenofosfato de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio, hidruro de sodio, hidruro de potasio, diisopropil amida de litio (LDA), metanolato de sodio, etanolato de sodio, terc-butóxido de potasio, tetraborato de sodio acuoso, n-butil-litio, terc-butil-litio, fluoruro de tetrabutilamonio (TBAF), NaHMDS y similares, o en presencia de un ácido de Lewis o Bronsted, como FeCl₃, Zn(ClO₄)₂, Cu(BF₄)₂, HBF₄ o HClO₄. La reacción se lleva a cabo generalmente en un disolvente, siendo los disolventes adecuados, por ejemplo, alcanos clorados, como cloruro de metileno o cloroformo, y éteres, como éter dietílico, éter dipropílico, metil terc-butil éter, metil isobutil éter, etilenglicol dimetil éter, tetrahidrofurano (THF) o dioxano y similares. La temperatura de reacción puede variar en un amplio intervalo, como desde -25 °C hasta el punto de ebullición de la mezcla de reacción. Los tioles acilados pueden hacerse reaccionar puros o en un disolvente, siendo los disolventes adecuados, por ejemplo, alcanos clorados, como cloruro de metileno o cloroformo, y éteres, como éter dietílico, éter dipropílico, metil terc-butil éter, metil isobutil éter, etilenglicol dimetil éter, tetrahidrofurano (THF) o dioxano y similares. Se pueden utilizar con o sin base. El compuesto **3** protegido con S puede desprotegerse a continuación al tiol **3** libre en condiciones generalmente conocidas para el grupo protector respectivo, como se describe, por ejemplo, en Peter GM Wuts, Theodora Greene, Protective Groups in Organic Synthesis, 4a edición, John Wiley & Sons, Inc., 2007, Capítulo 6.

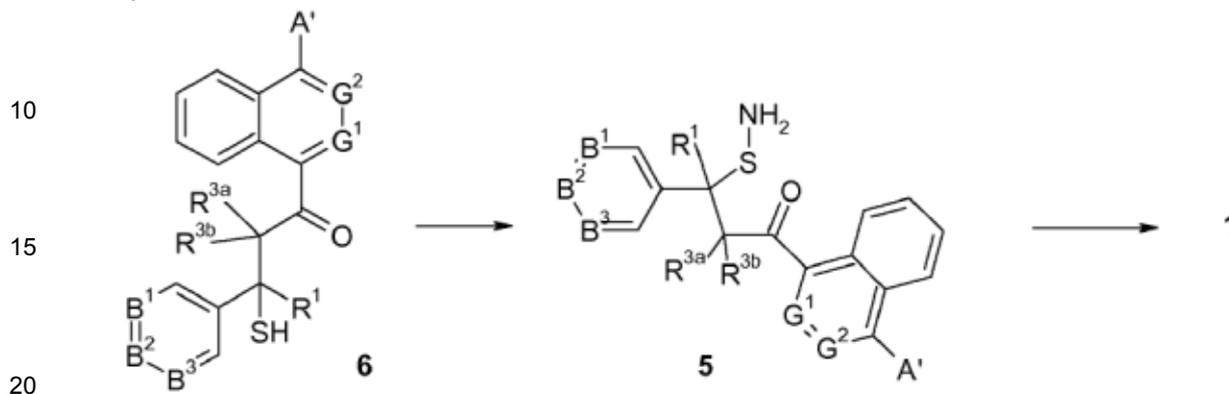
El compuesto **4** se puede preparar de forma análoga al procedimiento descrito en el documento EP-A-2172462.

65 Los compuestos **1** (en los que R^{3b} no es necesariamente hidrógeno) se pueden preparar alternativamente por

reacción de un compuesto de fórmula **6** con un agente de aminación en un compuesto de fórmula **5**, que reacciona espontáneamente con el compuesto **1**, tal como se muestra en esquema 3. La reacción puede realizarse de forma análoga a la de los compuestos **3** y **2**.

5

Esquema 3

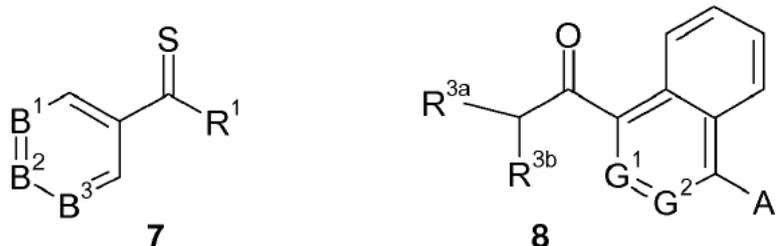


El compuesto de fórmula **6** se puede obtener por reacción de un compuesto de fórmula **7** con un compuesto de fórmula **8**.

25

30

35



40

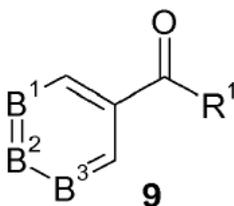
La reacción se lleva a cabo preferiblemente como una reacción aldólica de Mukaiyama. Con este fin, el derivado de trialquilsilil-enolato de **8** se hace reaccionar con **7** en presencia de un ácido de Lewis, tal como TiCl_4 o $\text{BF}_3[\text{O}(\text{C}_2\text{H}_5)_2]$. Alternativamente, la reacción se puede llevar a cabo en presencia de una base fuerte, tal como diisopropilamida de litio (LDA), bistrimetilsililamida de sodio (hexametildisilazida de sodio; NaHMDS) y aminas, tales como trietilamina, tripropilamina o diisopropiletilamina. La reacción se lleva a cabo generalmente en un disolvente. Si se usa una base de litio o sodio, el disolvente es adecuadamente un éter, tal como éter dietílico, éter dipropílico, metil terc-butil éter, metil isobutil éter, éter dimetílico de etilenglicol, tetrahidrofurano (THF) o dioxano y similares. Las temperaturas de reacción adecuadas oscilan entre -78 y 25 °C. Si se usa una base de amina, el disolvente es adecuadamente un éter, tal como dietil éter, dipropil éter, metil terc-butil éter, metil isobutil éter, etilenglicol dimetil éter, tetrahidrofurano (THF) o dioxano, o un alcano, tal como pentano, hexano o heptano. Las temperaturas de reacción adecuadas oscilan entre 25 y 100 °C.

50

El compuesto de fórmula **7** se puede obtener por reacción de un compuesto de fórmula **9** con un agente de sulfuración, tal como el reactivo de Lawesson o P_2S_5 .

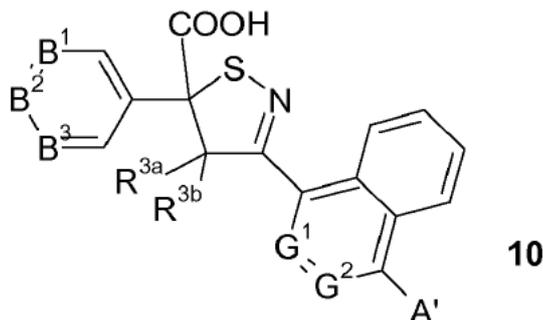
55

60



La reacción se efectúa generalmente en un disolvente, siendo los disolventes adecuados, por ejemplo, disolventes aromáticos, tales como benceno, tolueno, xilenos, clorobenceno o diclorobenceno, éteres, tales como dietil éter, dipropil éter, metil terc-butil éter, isobutil metil éter, etilenglicol de dimetil éter, tetrahidrofurano (THF) o dioxano, y triamida de ácido hexametilfosfórico (HMPA). La reacción se lleva a cabo generalmente a una temperatura de 25 °C al punto de ebullición de la mezcla de reacción.

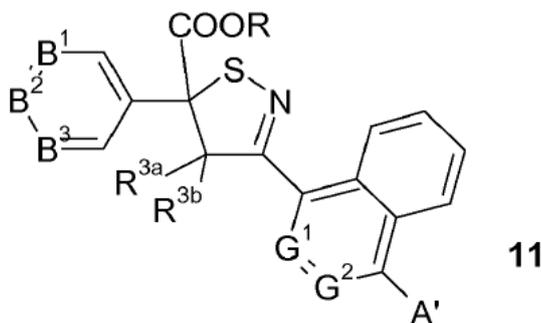
Los Compuestos de la fórmula I en la que R¹ es CF₃ por otra parte se pueden preparar por reacción de un compuesto de fórmula **10** con un agente de fluoración y, si es necesario (es decir, si A' es un precursor de A), la conversión del grupo A' en un grupo A.



Los agentes de fluoración adecuados son, por ejemplo, SF₄, preferiblemente en combinación con HF o BF₃[O(C₂H₅)₂], trifluoruro de fenilsulfuro (Ph-SF₃), preferiblemente en combinación con HF y piridina, trifluoruro de 4-terc-butil-2,6-dimetilfenilsulfuro ("Fluoled") y trifluoruro de bis(2-metoxietil)aminosulfuro [(CH₃OCH₂CH₂)₂NSF₃]. Entre estos, se da preferencia al SF₄ en combinación con HF. Si se usa SF₄ en combinación con HF, la reacción se lleva a cabo limpia, es decir, sin más disolventes. La reacción se lleva a cabo generalmente a presión elevada derivada de los reactivos, por ejemplo, a una presión de 2 a 10 bar, preferiblemente de 5 a 8 bar. La temperatura de reacción puede variar en amplios intervalos, tales como de 25 a 120 °C, preferiblemente de 60 a 100 °C.

Alternativamente, la fluoración se puede llevar a cabo mediante un procedimiento de dos etapas, en el que el grupo carboxilo en el anillo de isotiazolina se convierte primero en un grupo CCl₃ y este es posteriormente fluorado al grupo CF₃. La conversión del grupo COOH al grupo CCl₃ se lleva a cabo preferiblemente haciendo reaccionar el compuesto VI con PCl₅ y dicloruro de fenil-fosforoxi (Ph-P(=O)Cl₂). La reacción se puede llevar a cabo pura, es decir, sin más disolventes. De forma adecuada, la reacción se lleva a cabo a temperaturas elevadas, por ejemplo, de 50° a reflujo y preferiblemente a reflujo. Los agentes de fluoración para convertir el grupo CCl₃ en un grupo CF₃ son los mencionados anteriormente, y además HF y HF en combinación con SbCl₅ y HF en combinación con Cl₂ y SbF₃. La reacción se puede llevar a cabo pura, es decir, sin más disolventes. La temperatura de reacción puede variar en amplios intervalos, por ejemplo de 25 a 300 °C, preferiblemente de 50 a 200 °C y en particular de 80 a 120 °C. Si el agente de fluoración es HF o HF en combinación con otro agente, la reacción tiene lugar generalmente a la presión que proviene del HF y que varía generalmente de 2 a 10 bar, preferiblemente de 5 a 8 bar.

El compuesto de fórmula **10** se obtiene preferentemente por hidrólisis de un compuesto de fórmula **11**, en la que R es alquilo C₁-C₄.



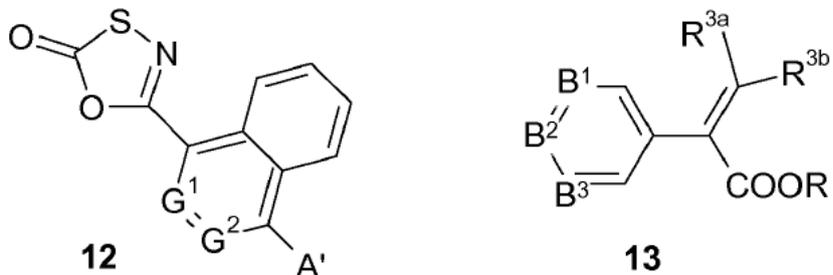
La hidrólisis se puede llevar a cabo mediante cualquier medio adecuado conocido para hidrolizar grupos éster, tales como condiciones ácidas, por ejemplo, usando ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido sulfúrico, ácido trifluoroacético, etc., o mediante condiciones básicas, por ejemplo, usando un hidróxido de metal alcalino, tal como LiOH, NaOH o KOH, o un carbonato de metal alcalino, tal como carbonato de sodio o carbonato de potasio.

El compuesto de fórmula **11** a su vez puede obtenerse haciendo reaccionar un compuesto **12** con un compuesto **13**.

5

10

15



20

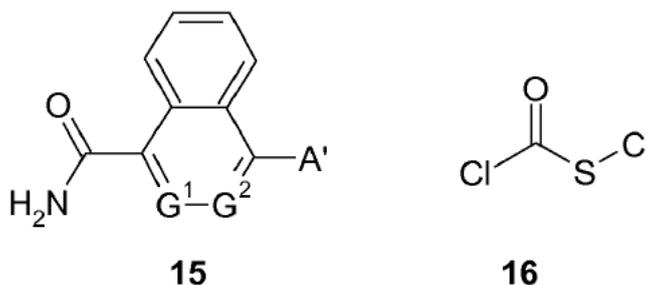
La reacción se lleva a cabo a temperatura elevada, por ejemplo de 90 a 200 °C, preferiblemente de 100 a 180 °C y en particular de 120 a 160 °C, por ejemplo a aproximadamente 140 °C.

El compuesto de fórmula **12** puede obtenerse a su vez puede haciendo reaccionar un compuesto **15** con un compuesto **16**

25

30

35



40

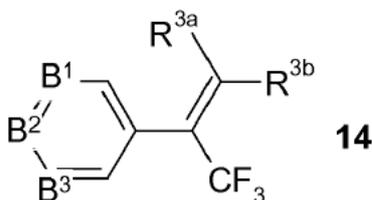
La reacción se lleva a cabo generalmente en un disolvente, siendo los disolventes adecuados, por ejemplo, disolventes aromáticos, tales como benceno, tolueno, los xilenos, clorobenceno y diclorobenceno. La temperatura de reacción es preferiblemente de 80 a 140 °C, más preferiblemente de 100 a 120 °C.

45

Los Compuestos de la fórmula I en la que sin embargo R¹ es CF₃ por otra parte se pueden preparar por reacción de un compuesto de fórmula **12**, como se define anteriormente, con un compuesto de fórmula **14** y, si es necesario, la conversión del grupo A' en un grupo A.

50

55



La reacción se lleva a cabo a temperatura elevada, por ejemplo, de 90 a 200 °C, preferiblemente de 100 a 180 °C y en particular de 120 a 160 °C, por ejemplo, a aproximadamente 140 °C.

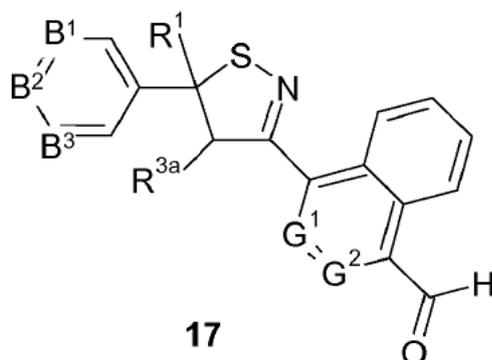
60

Los compuestos I', en la que A' es un precursor de A, se pueden convertir como se muestra a continuación en los diferentes grupos A¹ a A³.

65

Los compuestos I' en la que A' es Cl, Br, I o -OSO₂-R^{z1}, donde R^{z1} es como se define anteriormente, se pueden convertir en los compuestos I en donde A es un grupo A¹, en donde A¹ es un grupo imino -C(=NR⁶)R⁸, por reacción con monóxido de carbono y una fuente de hidruro, tal como trietilsilano, en presencia de un catalizador de un

complejo de metal de transición, preferiblemente un catalizador de paladio, en un compuesto de carbonilo **17**. Esta reacción convierte el grupo de partida A' en un grupo carbonilo -C=O.

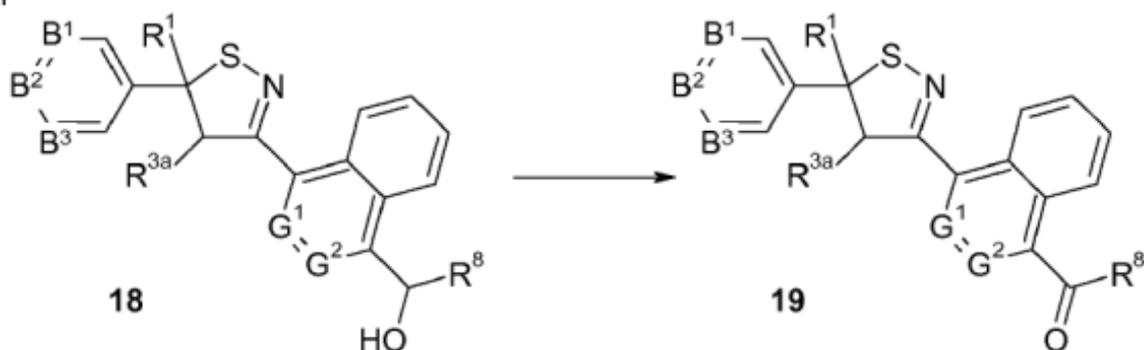


20 El aldehído **17** puede también obtenerse mediante la reducción del éster **20** (ver más abajo; R= alquilo C₁-C₄) con hidruro de diisobutilaluminio (DIBAL-H), ya sea directamente en el aldehído **17** o mediante el correspondiente alcohol, que a continuación se oxida al aldehído.

25 Para la obtención de compuestos en los que R⁸ en el grupo imino es H, tales compuestos de carbonilo **17** se hacen reaccionar entonces con una amina (derivado) NH₂R⁶. Alternativamente, el compuesto I', en el que A' es Cl, Br, I o -OSO₂-R²¹, donde R²¹ es como se definió anteriormente, se puede hacer reaccionar en una reacción "one pot" con monóxido de carbono e hidrógeno en presencia de un catalizador de complejo de metal de transición y la amina NH₂R⁶.

30 Para la obtención de compuestos en los que R⁸ en el grupo imino no es H, los compuestos de carbonilo se hacen reaccionar con un reactivo de Grignard R⁸-MgHal, donde Hal es Cl, Br o I, o un compuesto de organolitio R⁸-Li para obtener un alcohol de fórmula **18**, que a continuación se oxida en un compuesto de carbonilo de fórmula **19**, tal como se muestra en el esquema 4. A continuación, se hace reaccionar con una amina NH₂R⁶ para dar el respectivo compuesto de imina.

Esquema 4

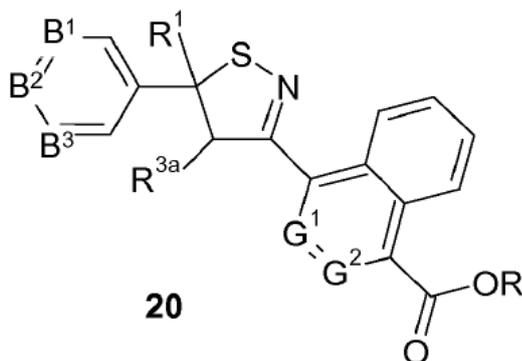


55 Estas reacciones pueden llevarse a cabo en analogía a los procedimientos descritos en el documento PCT/EP2011/060388 o en el documento WO 2010/072781 y en las referencias citadas en los mismos, especialmente el documento WO 2006135763, Fattorusso et al, J. Med. Chem. 2008, 51, 1333-1343 y WO 2008/122375.

60 Los compuestos I en los que A es un grupo A', en donde A' es -S(O)_nR⁹ o -N(R⁵)R⁶, puede por ejemplo prepararse por reacción de un compuesto I', en el que A' es Cl, Br o I en una reacción de tipo Ullmann con una amina NHR⁵R⁶ o un tiol SHR⁹ en presencia de un catalizador de Cu (I). Para obtener un compuesto en el que A' es -S(O)_nR⁹, en el que n no es 0, el tiol puede oxidarse, por ejemplo, con peróxido de hidrógeno. Los grupos amina y tiol se pueden introducir adicionalmente en una reacción de Buchwald-Hartwig haciendo reaccionar un compuesto I', en el que A' es Cl, Br o I con una amina NHR⁵R⁶ o un tiol HSR⁹ en presencia de un catalizador de paladio, tal como PdCl₂(dppf) en presencia de una base, tal como carbonato de cesio o N, N-diisopropiletilamina, y opcionalmente en presencia de un ligando de fosfina, tal como Xantphos ("4,5-Bis(difenilfosfino)-9,9-dimetilxanteno").

Los tioéteres ($A^1 = -SR^9$) pueden introducirse además haciendo reaccionar un compuesto I' en el que A' es F en una reacción S_NAr (reacción de sustitución aromática nucleófila) con un tiol HSR^9 en presencia de una base, tal como el carbonato de potasio (K_2CO_3) o con un tiolato (por ejemplo, $NaSR^9$).

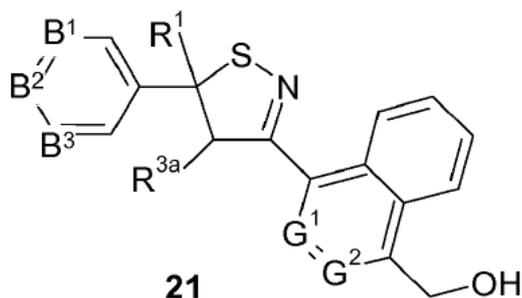
Los compuestos I, en los que A es un grupo A^2 , en los que W es O, se pueden preparar por reacción de un compuesto I' en los que A' es Cl, Br, I o triflato con monóxido de carbono en presencia de un catalizador de paladio y un alcohol ROH, donde R es alquilo C_1-C_4 , en un compuesto de fórmula **20**. Los catalizadores de paladio adecuados son por ejemplo los descritos en el documento PCT/EP 2011/060388.



Este éster se hidroliza a continuación en el ácido carboxílico correspondiente, que a continuación reacciona en condiciones de amidación estándar con una amina NHR^5R^{6a} . La hidrolización se puede llevar a cabo en condiciones estándar, por ejemplo, en condiciones ácidas usando, por ejemplo, ácido clorhídrico, ácido sulfúrico o ácido trifluoroacético, o en condiciones básicas usando, por ejemplo, un hidróxido de metal alcalino, tal como LiOH, NaOH o KOH. La amidación se lleva a cabo preferiblemente mediante activación de los ácidos carboxílicos con cloruro de oxalilo $[(COCl)_2]$ o cloruro de tionilo $(SOCl_2)$ en los respectivos cloruros de ácido, seguido de reacción con una amina NHR^5R^6 . Alternativamente, la amidación se lleva a cabo en presencia de un reactivo de acoplamiento. Los reactivos de acoplamiento adecuados (activadores) son bien conocidos y se seleccionan, por ejemplo, de carbodiimidas, tales como DCC (diciclohexilcarbodiimida) y DCI (diisopropilcarbodiimida), derivados de benzotriazol, tales como HATU (Hexafluorofosfato de O-(7-azabenzotriazol-1-il) -N, N, N', N'-tetrametiluronio), HBTU (hexafluorofosfato de O-benzotriazol-1-il)-N, N, N', N'-tetrametiluronio) y HCTU (tetrafluoroborato de 1H-benzotriazol-1-[bis(dimetilamino) metileno]-5-cloro) y activadores derivados de fosfonio, tales como BOP (hexafluorofosfato de (benzotriazol-1-iloxi)-tris (dimetilamino) fosfonio), Py-BOP (hexafluorofosfato de (benzotriazol-1-iloxi)-tripirrolidinofosfonio) y Py-BrOP (hexafluorofosfato de bromotripirrolidinofosfonio). Generalmente, el activador se usa en exceso. Los reactivos de acoplamiento de benzotriazol y fosfonio se utilizan generalmente en un medio básico.

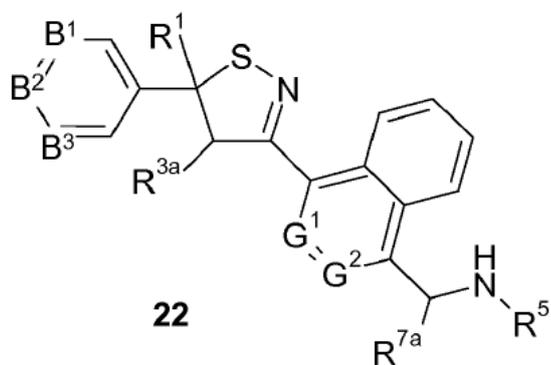
Los compuestos I en donde A es un grupo A^2 , en el que W es S, se pueden preparar haciendo reaccionar el compuesto oxo correspondiente (W es O) con el reactivo de Lawesson (CAS 19172-47-5), véase por ejemplo Jesberger et al., *Synthesis*, 2003, 1929-1958 y referencias en el mismo. Se pueden utilizar disolventes, tales como HMPA o THF a una temperatura elevada, tales como de 60 °C a 100 °C. Las condiciones de reacción preferidas son THF a 65 °C.

Los compuestos I en donde A es un grupo A^3 , en el que R^{7a} y R^{7b} son hidrógeno, se pueden preparar por reducción de un compuesto **20** o **17** por ejemplo con LAH (hidruro de litio y aluminio) o DIBAL-H (hidruro de diisobutil aluminio) a un compuesto **21**.



20 Este se hace reaccionar a continuación en una reacción S_N con una amina NHR^5R^6 . Para este propósito, el grupo OH se puede convertir primero en un mejor grupo saliente, por ejemplo, en un sulfonato (por ejemplo, mesilato, tosilato o un grupo triflato). Si R^6 es un grupo $-C(O)R^8$, es posible alternativamente hacer reaccionar el compuesto **21** con una amina NH_2R^5 y a continuación reaccionar la amina bencílica resultante con un ácido R^8-COOH o un derivado del mismo, tal como su cloruro de ácido R^8-COCl , en una reacción de amidación.

25 Los compuestos I en donde A es un grupo A^3 , en el que R^{7a} es alquilo opcionalmente sustituido o cicloalquilo opcionalmente sustituido y R^{7b} es hidrógeno, se pueden preparar sometiendo una cetona **19**, en la que R^8 corresponde a R^{7a} que es alquilo C_1-C_6 opcionalmente sustituido o cicloalquilo C_3-C_8 opcionalmente sustituido, a una aminación reductora para proporcionar los compuestos **22**. Las condiciones típicas para la aminación reductora son: Reacción de la cetona **19** con una amina H_2NR^5 para producir la correspondiente imina que se reduce a amina **22** con un reactivo agente reductor, tal como $Na(CN)BH_3$. La reacción de la cetona **19** a amina **22** también se puede llevar a cabo como un procedimiento "one pot".

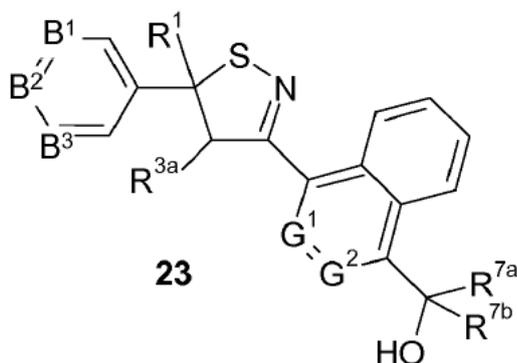


50 Para obtener compuestos en los que R^{7a} y R^{7b} son alquilo opcionalmente sustituido, cicloalquilo opcionalmente sustituido, alqueno opcionalmente sustituido o alquino opcionalmente sustituido, compuestos de carbonilo, tales como **19**, en los que R^8 corresponde a R^{7a} que es alquilo C_1-C_6 opcionalmente sustituido, cicloalquilo C_3-C_8 opcionalmente sustituido, alqueno C_2-C_6 opcionalmente sustituido o alquino C_2-C_6 opcionalmente sustituido, se hacen reaccionar con un reactivo de Grignard $R^{7b}-MgHal$, donde Hal es Cl, Br o I, o un compuesto de organolitio $R^{7b}-Li$, donde R^{7b} es alquilo C_1-C_6 opcionalmente sustituido, cicloalquilo C_3-C_8 opcionalmente sustituido, alqueno C_2-C_6 opcionalmente sustituido o alquino C_2-C_6 opcionalmente sustituido, para obtener un alcohol de fórmula **23**.

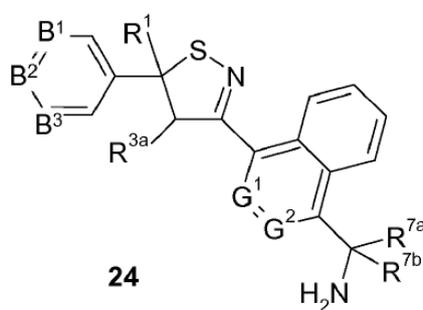
55

60

65

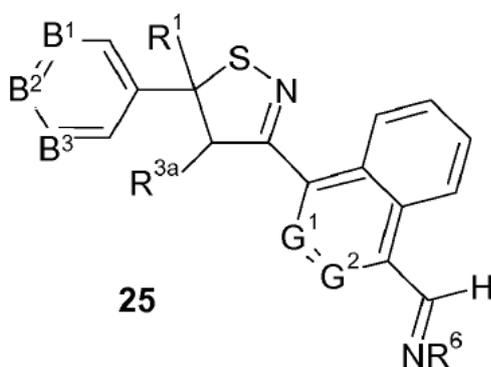


El alcohol **23** se puede convertir entonces en la amina **24** mediante la azida correspondiente, tal como se describe, por ejemplo, en *Organic Letters*, 2001, 3 (20), 3145-3148.



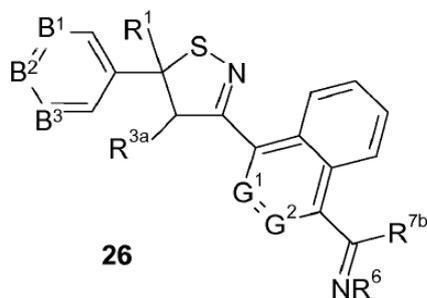
Si se desea, se puede convertir en los compuestos I en los que R⁵ y R⁶ son diferentes de hidrógeno, por ejemplo, mediante reacciones de alquilación o de acilación estándar.

Los compuestos I en donde A es un grupo A³, en el que R^{7a} es alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo opcionalmente sustituidos o CN y R^{7b} es hidrógeno, se pueden preparar mediante la conversión de un aldehído **17** en una imina **25** mediante reacción con un derivado de amina NH₂R⁶, en el que R⁶ es terc-butil sulfinilo, o, para preparar un compuesto con R^{7a} = CN, tosilato.



Esta imina se hace reaccionar a continuación con un compuesto H-R^{7a} en una reacción de adición en condiciones, tal como se describe por ejemplo en *J. Am. Chem. Soc.* 2009, 3850-3851 y las referencias allí citadas, o, para introducir CN como grupo R^{7a}, *Chemistry – A European Journal* 2009, 15, 11642-11659.

Los compuestos I en donde A es un grupo A³, en el que tanto R^{7a} como R^{7b} son alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo opcionalmente sustituidos o CN, se pueden preparar de manera análoga mediante la conversión de una cetona **19**, en la que R⁹ tiene el significado deseado para R^{7b} y es alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo opcionalmente sustituidos o CN, en una imina mediante reacción con un derivado de amina NH₂R⁶, donde R⁶ es terc-butil sulfinilo, o, para preparar un compuesto **26** con R^{7a} = CN, tosilato.



15 Esta imina se hace reaccionar a continuación con un compuesto H-R^{7a} en una reacción de adición en condiciones, tal como se describe, por ejemplo, en J. Org. Chem 2002, 67, 7819-7832 y las referencias allí citadas, o, para introducir CN como grupo R^{7a}, Chemistry – A European Journal 2009, 15, 11642-11659. Si se desea, entonces se puede eliminar R⁶ para producir un grupo amino NH₂.

20 Por regla general, los compuestos de fórmula (I), incluyendo sus estereoisómeros, sales y N-óxidos, y sus precursores en el proceso de síntesis, se pueden preparar por los procedimientos descritos anteriormente. Si los compuestos individuales no se pueden preparar mediante las rutas descritas anteriormente, se pueden preparar mediante derivatización de otros compuestos (I) o el precursor respectivo o mediante modificaciones habituales de las rutas de síntesis descritas. Por ejemplo, en casos individuales, ciertos compuestos de fórmula (I) pueden prepararse ventajosamente a partir de otros compuestos de fórmula (I) mediante derivatización, por ejemplo, mediante hidrólisis de ésteres, amidación, esterificación, escisión de éteres, olefinación, reducción, oxidación y similares o mediante modificaciones habituales de las rutas de síntesis descritas.

30 Las mezclas de reacción se elaboran en la forma habitual, por ejemplo mediante mezclado con agua, separación de las fases, y, si procede, purificando los productos crudos por cromatografía, por ejemplo sobre alúmina o sobre gel de sílice. Algunos de los productos intermedios y finales se pueden obtener en forma de aceites viscosos incoloros o de color marrón pálido que se liberan o purifican de componentes volátiles a presión reducida y a temperatura moderadamente elevada. Si los productos intermedios y finales se obtienen como sólidos, pueden purificarse mediante recristalización o trituración.

35 Debido a su excelente actividad, los compuestos de la presente invención se pueden usar para controlar plagas de invertebrados.

40 Por consiguiente, la presente invención también proporciona un procedimiento para controlar plagas de invertebrados, cuyo procedimiento comprende tratar las plagas, su suministro de alimentos, su hábitat o su caldo de cultivo o una planta cultivada, materiales de propagación vegetal (tales como semillas), suelo, área, material o entorno en el que las plagas crecen o pueden crecer, o los materiales, plantas cultivadas, materiales de propagación vegetal (tales como semillas), suelos, superficies o espacios que deben protegerse del ataque o infestación de plagas con una cantidad plaguicidamente eficaz de un compuesto de la presente invención o una composición, tal como se define anteriormente. En el presente documento se describe el uso de un compuesto de la invención, de un estereoisómero y/o de una sal del mismo agrícola o veterinariamente aceptable para combatir plagas de invertebrados.

50 Preferiblemente, el procedimiento de la invención sirve para la protección de material de propagación vegetal (tal como semillas) y la planta que crece a partir de la misma del ataque o infestación de plagas de invertebrados y comprende el tratamiento del material de propagación vegetal (tales como semillas) con una cantidad plaguicidamente efectiva de un compuesto de la presente invención, tal como se definió anteriormente, o con una cantidad plaguicidamente eficaz de una composición agrícola, tal como se define anteriormente y a continuación. El procedimiento de la invención no se limita a la protección del "sustrato" (planta, materiales de propagación vegetal, material del suelo, etc.) que ha sido tratado según la invención, sino que también tiene un efecto preventivo, así, por ejemplo, según protección a una planta que crece a partir de materiales de propagación vegetales tratados (tales como semillas), sin que la planta misma haya sido tratada.

60 De manera alternativa preferible, el procedimiento de la invención sirve para proteger las plantas del ataque o infestación por plagas de invertebrados, procedimiento que comprende el tratamiento de las plantas con una cantidad plaguicidamente eficaz de al menos un compuesto de la invención, un estereoisómero del mismo y/o al menos una sal agrícolamente aceptable del mismo.

65 En el sentido de la presente invención, "plagas de invertebrados" se seleccionan preferiblemente de artrópodos y

nematodos, más preferiblemente de insectos nocivos, arácnidos y nematodos, y aún más preferiblemente de insectos, ácaros y nematodos. En el sentido de la presente invención, las "plagas de invertebrados" son más preferiblemente insectos.

5 La invención proporciona además una composición agrícola para combatir las plagas de invertebrados, que comprende dicha cantidad de al menos un compuesto de este tipo según la invención y al menos un líquido inerte y/o portador agrónomicamente aceptable sólido que tiene una acción plaguicida y, si se desea, al menos un tensioactivo.

10 Tal composición puede comprender un único compuesto activo de la presente invención o una mezcla de varios compuestos activos de la presente invención. La composición según la presente invención puede comprender un isómero individual o mezclas de isómeros o una sal, así como tautómeros individuales o mezclas de tautómeros.

15 Los compuestos de la presente invención, incluyendo sus sales, estereoisómeros y tautómeros, son en particular adecuados para controlar eficientemente plagas de artrópodos, tales como arácnidos, miriápodos e insectos, así como nematodos. Son especialmente adecuados para combatir o controlar eficientemente las siguientes plagas:

insectos del orden de los lepidópteros (Lepidoptera), por ejemplo *Acronicta major*, *Adoxophyes orana*, *Aedia leucomelas*, *Agrotis* spp., tal como *Agrotis fucosa*, *Agrotis segetum*, *Agrotis ypsilon*; *Alabama argillacea*, *Anticarsia gemmatalis*, *Anticarsia* spp., *Argyresthia conjugella*, *Autographa gamma*, *Barathra brassicae*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia murinana*, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Carpocapsa pomonella*, *Cheimatobia*
20 *brumata*, *Chilo* spp., tal como *Chilo suppressalis*; *Choristoneura fumiferana*, *Choristoneura occidentalis*, *Cirphis unipuncta*, *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocerus* spp., *Cydia pomonella*, *Dendrolimus pini*, *Diaphania nitidalis*, *Diatraea grandiosella*, *Earias insulana*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Ephestia cautella*, *Ephestia kuehniella*, *Eupoecilia ambiguella*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Euxoa* spp., *Evetria bouliana*, *Feltia* spp., tal como *Feltia subterranean*; *Galleria mellonella*, *Grapholitha funebrana*, *Grapholitha molesta*, *Helicoverpa* spp., tal como *Helicoverpa armigera*,
25 *Helicoverpa zea*; *Heliiothis* spp., tal como *Heliiothis armigera*, *Heliiothis virescens*, *Heliiothis zea*; *Hellula undalis*, *Hibernia defoliaria*, *Hofmannophila pseudospretella*, *Homona magnanima*, *Hyphantria cunea*, *Hyponomeuta padella*, *Hyponomeuta malinellus*, *Keiferia lycopersicella*, *Lambdina fiscellaria*, *Laphygma* spp., tal como *Laphygma exigua*; *Leucoptera coffeella*, *Leucoptera scitella*, *Lithocolletis blancardella*, *Lithophane antennata*, *Lobesia botrana*, *Loxagrotis albicosta*, *Loxostege sticticalis*, *Lymantria* spp., tal como *Lymantria dispar*, *Lymantria monacha*; *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*, *Mamestra* spp., tal como *Mamestra brassicae*; *Mocis repanda*, *Mythimna separata*,
30 *Orgyia pseudotsugata*, *Oria* spp., *Ostrinia* spp., tal como *Ostrinia nubilalis*; *Oulema oryzae*, *Panolis flammea*, *Pectinophora* spp., tal como *Pectinophora gossypiella*; *Peridroma saucia*, *Phalera bucephala*, *Phthorimaea* spp., tal como *Phthorimaea operculella*; *Phyllocnistis citrella*, *Pieris* spp., tal como *Pieris brassicae*, *Pieris rapae*; *Plathypena scabra*, *Plutella maculipennis*, *Plutella xylostella*, *Prodenia* spp., *Pseudaletia* spp., *Pseudoplusia includens*, *Pyrausta nubilalis*, *Rhyacionia frustrana*, *Scrobipalpula absoluta*, *Sitotroga cerealella*, *Sparganothis pilleriana*, *Spodoptera*
35 spp., tal como *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera litoralis*, *Spodoptera litura*; *Thaumatopoea pityocampa*, *Thermesia gemmatalis*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia* spp., tal como *Trichoplusia ni*; *Tuta absoluta*, y *Zeiraphera canadensis*,

40 *escarabajos (Coleópteros)*, por ejemplo *Acanthoscehdes obtectus*, *Adoretus* spp., *Agelastica alni*, *Agrilus sinuatus*, *Agriotes* spp., tal como *Agriotes fuscicollis*, *Agriotes lineatus*, *Agriotes obscurus*; *Amphimallus solstitialis*, *Anisandrus dispar*, *Anobium punctatum*, *Anomala rufocuprea*, *Anoplophora* spp., tal como *Anoplophora glabripennis*; *Anthonomus* spp., tal como *Anthonomus grandis*, *Anthonomus pomorum*; *Anthrenus* spp., *Aphthona euphoridae*, *Apogonia* spp., *Athous haemorrhoidalis*, *Atomaria* spp., tal como *Atomaria linearis*; *Attagenus* spp., *Aulacophora femoralis*, *Blastophagus piniperda*, *Blitophaga undata*, *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., tal como *Bruchus lentis*,
45 *Bruchus pisorum*, *Bruchus rufimanus*; *Byctiscus betulae*, *Callosobruchus chinensis*, *Cassida nebulosa*, *Cerotoma trifurcata*, *Cetonia aurata*, *Ceuthorrhynchus* spp., tal como *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Ceuthorrhynchus napi*; *Chaetocnema tibialis*, *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., tal como *Conoderus vespertinus*; *Cosmopolites* spp., *Costelytra zealandica*, *Crioceris asparagi*, *Cryptorhynchus lapathi*, *Ctenicera* ssp., tal como *Ctenicera destructor*; *Curculio* spp., *Dectes texanus*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., tal como *Diabrotica 12-punctata* *Diabrotica speciosa*, *Diabrotica longicornis*, *Diabrotica semi-punctata*, *Diabrotica virgifera*; *Epilachna* spp., tal como *Epilachna varivestis*, *Epilachna vigintioctomaculata*; *Epitrix* spp., tal como *Epitrix hirtipennis*; *Eutinobothrus brasiliensis*, *Faustinus cubae*, *Gibbium psylloides*, *Heteronychus arator*, *Hylamorpha elegans*, *Hylobius abietis*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera brunneipennis*, *Hypera postica*, *Hypothenemus* spp., *Ips typographus*, *Lachnosterna consanguinea*,
50 *Lema bilineata*, *Lema melanopus*, *Leptinotarsa* spp., tal como *Leptinotarsa decemlineata*; *Limonium californicus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lixus* spp., *Lyctus* spp., tal como *Lyctus bruneus*; *Melanotus communis*, *Meligethes* spp., tal como *Meligethes aeneus*; *Melolontha hippocastani*, *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp., tal como *Monochamus alternatus*; *Naupactus xanthographus*, *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Otiorrhynchus ovatus*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Oulema oryzae*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllobius pyri*, *Phyllopertha horticola*, *Phyllophaga* spp.,
60 *Phyllotreta* spp., tal como *Phyllotreta chrysocephala*, *Phyllotreta nemorum*, *Phyllotreta striolata*; *Phyllophaga* spp., *Phyllopertha horticola*, *Popillia japonica*, *Premnotrypes* spp., *Psylliodes chrysocephala*, *Ptinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizopertha dominica*, *Sitona lineatus*, *Sitophilus* spp., tal como *Sitophilus granaria*, *Sitophilus zeamais*; *Sphenophorus* spp., tal como *Sphenophorus levis*; *Sternechus* spp., tal como *Sternechus subsignatus*; *Symphyletes* spp., *Tenebrio molitor*, *Tribolium* spp., tal como *Tribolium castaneum*; *Trogoderma* spp., *Tychius* spp., *Xylotrechus*
65 spp., and *Zabrus* spp., tal como *Zabrus tenebrioides*, *fmoscas*, mosquitos (Dípteros), por ejemplo, *Aedes* spp., tal

como *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes vexans*; *Anastrepha ludens*, *Anopheles* spp., tal como *Anopheles albimanus*, *Anopheles crucians*, *Anopheles freeborni*, *Anopheles gambiae*, *Anopheles leucosphyrus*, *Anopheles maculipennis*, *Anopheles minimus*, *Anopheles quadrimaculatus*, *Anopheles sinensis*; *Bibio hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*, *Calliphora vicina*, *Ceratitis capitata*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomya* spp., tal como *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*; *Chrysops atlanticus*, *Chrysops discalis*, *Chrysops silacea*, *Cochliomyia* spp., tal como *Cochliomyia hominivorax*; *Contarinia* spp., tal como *Contarinia sorghicola*; *Cordylobia anthropophaga*, *Culex* spp., tal como *Culex nigripalpus*, *Culex pipiens*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex tarsalis*, *Culex tritaeniorhynchus*; *Culicoides furens*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Cuterebra* spp., *Dacus cucurbitae*, *Dacus oleae*, *Dasineura brassicae*, *Delia* spp., tal como *Delia antique*, *Delia coarctata*, *Delia platura*, *Delia radicum*; *Dermatobia hominis*, *Drosophila* spp., *Fannia* spp., tal como *Fannia canicularis*; *Gastrophilus* spp., tal como *Gastrophilus intestinalis*; *Geomyza tripunctata*, *Glossina fuscipes*, *Glossina morsitans*, *Glossina palpalis*, *Glossina tachinoides*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hippelates* spp., *Hylemyia* spp., tal como *Hylemyia platura*; *Hypoderma* spp., tal como *Hypoderma lineata*; *Hyppobosca* spp., *Leptoconops torrens*, *Liriomyza* spp., tal como *Liriomyza sativae*, *Liriomyza trifolii*; *Lucilia* spp., tal como *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*; *Lycoria pectoralis*, *Mansonia titillanus*, *Mayetiola* spp., tal como *Mayetiola destructor*; *Musca* spp., tal como *Musca autumnalis*, *Musca domestica*; *Muscina stabulans*, *Oestrus* spp., tal como *Oestrus ovis*; *Opomyza florum*, *Oscinella* spp., tal como *Oscinella frit*; *Pegomya hysocyami*, *Phlebotomus argentipes*, *Phorbia* spp., tal como *Phorbia antiqua*, *Phorbia brassicae*, *Phorbia coarctata*; *Prosimulium mixtum*, *Psila rosae*, *Psorophora columbiae*, *Psorophora discolor*, *Rhagoletis cerasi*, *Rhagoletis pomonella*, *Sarcophaga* spp., tal como *Sarcophaga haemorrhoidalis*; *Simulium vittatum*, *Stomoxys* spp., tal como *Stomoxys calcitrans*; *Tabanus* spp., tal como *Tabanus atratus*, *Tabanus bovinus*, *Tabanus lineola*, *Tabanus similis*; *Tannia* spp., *Tipula oleracea*, *Tipula paludosa*, y *Wohlfahrtia* spp., arañuela (*Thysanoptera*), por ejemplo *Baliothrips biformis*, *Dichromothrips corbetti*, *Dichromothrips* spp., *Enneothrips flavens*, *Frankliniella* spp., tal como *Frankliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella tritici*; *Heliethrips* spp., *Hercinothrips femoralis*, *Kakothrips* spp., *Rhipiphorothrips cruentatus*, *Scirtothrips* spp., tal como *Scirtothrips citri*; *Taeniothrips cardamoni*, *Thrips* spp., tal como *Thrips oryzae*, *Thrips palmi*, *Thrips tabaci*;

termitas (*Isoptera*), por ejemplo *Calotermes flavicollis*, *Coptotermes formosanus*, *Heterotermes aureus*, *Heterotermes longiceps*, *Heterotermes tenuis*, *Leucotermes flavipes*, *Odontotermes* spp., *Reticulitermes* spp., tal como *Reticulitermes speratus*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes grassei*, *Reticulitermes lucifugus*, *Reticulitermes santonensis*, *Reticulitermes virginicus*; *Termes natalensis*,

cucarachas (*Blattaria - Blattodea*), por ejemplo *Acheta domesticus*, *Blatta orientalis*, *Blattella asahinae*, *Blattella germanica*, *Grylotalpa* spp., *Leucophaea maderae*, *Locusta* spp., *Melanoplus* spp., *Periplaneta americana*, *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta japonica*,

bichos, áfidos, saltahojas, moscas blancas, escamas, cigarras (*Hemiptera*), por ejemplo, *Acrosternum* spp., tal como *Acrosternum hilare*; *Acyrtosiphon* spp., tal como *Acyrtosiphon onobrychis*, *Acyrtosiphon pisum*; *Adelges laricis*, *Aeneolamia* spp., *Agonoscena* spp., *Aleurodes* spp., *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus* spp., *Amrasca* spp., *Anasa tristis*, *Antestiopsis* spp., *Anuraphis cardui*, *Aonidiella* spp., *Aphanostigma piri*, *Aphidula nasturtii*, *Aphis* spp., tal como *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis gossypii*, *Aphis grossulariae*, *Aphis pomi*, *Aphis sambuci*, *Aphis schneideri*, *Aphis spiraeicola*; *Arboridia apicalis*, *Arilus critatus*, *Aspidiella* spp., *Aspidiotus* spp., *Atanus* spp., *Aulacorthum solani*, *Bemisia* spp., tal como *Bemisia argentifolii*, *Bemisia tabaci*; *Blissus* spp., tal como *Blissus leucopterus*; *Brachycaudus cardui*, *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycaudus persicae*, *Brachycaudus prunicola*, *Brachycolus* spp., *Brevicoryne brassicae*, *Calligypona marginata*, *Calocoris* spp., *Campylomma livida*, *Capitophorus horni*, *Carneocephala fulgida*, *Cavelerius* spp., *Ceraplastes* spp., *Ceratovacuna lanigera*, *Cercopidae*, *Cerosiphia gossypii*, *Chaetosiphon fragaefolii*, *Chionaspis tegalensis*, *Chlorita onukii*, *Chromaphis juglandicola*, *Chrysomphalus ficus*, *Cicadulina mbila*, *Cimex* spp., tal como *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*; *Coccomytilus halli*, *Coccus* spp., *Creontiades dilutus*, *Cryptomyzus ribis*, *Cryptomyzus ribis*, *Cyrtopeltis notatus*, *Dalbulus* spp., *Dasynus piperis*, *Dialeurades* spp., *Diaphorina* spp., *Diaspis* spp., *Dichelops furcatus*, *Diconocoris hewetti*, *Doralis* spp., *Dreyfusia nordmanniana*, *Dreyfusia piceae*, *Drosicha* spp., *Dysaphis* spp., tal como *Dysaphis plantaginea*, *Dysaphis pyri*, *Dysaphis radicola*; *Dysaulacorthum pseudosolani*, *Dysdercus* spp., tal como *Dysdercus cingulatus*, *Dysdercus intermedius*; *Dysmicoccus* spp., *Empoasca* spp., tal como *Empoasca fabae*, *Empoasca solana*; *Eriosoma* spp., *Erythroneura* spp., *Eurygaster* spp., tal como *Eurygaster integriceps*; *Euscelis bilobatus*, *Euschistus* spp., tal como *Euschistus heros*, *Euschistus impictiventris*, *Euschistus servus*; *Geococcus coffeae*, *Halyomorpha* spp., tal como *Halyomorpha halys*; *Heliopeltis* spp., *Homalodisca coagulata*, *Horcias nobilellus*, *Hyalopterus pruni*, *Hyperomyzus lactucae*, *Icerya* spp., *Idiocerus* spp., *Idioscopus* spp., *Laodelphax striatellus*, *Lecanium* spp., *Lepidosaphes* spp., *Leptocorisa* spp., *Leptoglossus phyllopus*, *Lipaphis erysimi*, *Lygus* spp., tal como *Lygus hesperus*, *Lygus lineolaris*, *Lygus pratensis*; *Macropes excavatus*, *Macrosiphum* spp., tal como *Macrosiphum rosae*, *Macrosiphum avenae*, *Macrosiphum euphorbiae*; *Mahanarva fimbriolata*, *Megacopta cribraria*, *Megoura viciae*, *Melanaphis pyramis*, *Melanaphis sacchari*, *Metcafiella* spp., *Metopolophium dirhodum*, *Miridae* spp., *Monella costalis*, *Monelliopsis pecanis*, *Myzus* spp., tal como *Myzus ascalonicus*, *Myzus cerasi*, *Myzus persicae*, *Myzus varians*; *Nasonovia ribis-nigri*, *Nephotettix* spp., tal como *Nephotettix malayanus*, *Nephotettix nigropictus*, *Nephotettix parvus*, *Nephotettix virescens*; *Nezara* spp., tal como *Nezara viridula*; *Nilaparvata lugens*, *Oebalus* spp., *Oncometopia* spp., *Orthezia praelonga*, *Parabemisia myricae*, *Paratrioza* spp., *Parlatoria* spp., *Pemphigus* spp., tal como *Pemphigus bursarius*; *Pentomidae*, *Peregrinus maidis*, *Perkinsiella saccharicida*, *Phenacoccus* spp., *Phloeomyzus passerinii*, *Phorodon humuli*, *Phylloxera* spp., *Piesma quadrata*, *Piezodorus* spp., tal como *Piezodorus guildinii*, *Pinnaspis aspidistrae*, *Planococcus* spp., *Protospulvinaria pyriformis*, *Psallus seriatus*, *Pseudacysta perseae*, *Pseudaulacaspis pentagona*,

Pseudococcus spp., tal como *Pseudococcus comstocki*; *Psylla* spp., tal como *Psylla mali*, *Psylla piri*; *Pteromalus* spp., *Pyrilla* spp., *Quadraspidiotus* spp., *Quesada gigas*, *Rastrococcus* spp., *Reduvius senilis*, *Rhodnius* spp., *Rhopalomyzus ascalonicus*, *Rhopalosiphum* spp., tal como *Rhopalosiphum pseudobrassicae*, *Rhopalosiphum insertum*, *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum padi*; *Sagatodes* spp., *Sahlbergella singularis*, *Saissetia* spp.,
 5 *Sappaphis mala*, *Sappaphis mali*, *Scaphoides titanus*, *Schizaphis graminum*, *Schizoneura lanuginosa*, *Scotinophora* spp., *Selenaspis articulatus*, *Sitobion avenae*, *Sogata* spp., *Sogatella furcifera*, *Solubea insularis*, *Stephanitis nashi*, *Stictocephala festina*, *Tenalaphara malayensis*, *Thyanta* spp., tal como *Thyanta perditor*; *Tibraca* spp., *Tinocallis caryaefoliae*, *Tomaspis* spp., *Toxoptera* spp., tal como *Toxoptera aurantii*; *Trialeurodes* spp., tal como *Trialeurodes vaporariorum*; *Triatoma* spp., *Trioza* spp., *Typhlocyba* spp., *Unaspis* spp., tal como *Unaspis yanonensis*;
 10 y *Viteus vitifolii*,
 hormigas, abejas, avispas, moscas de sierra (Himenópteros), por ejemplo *Athalia rosae*, *Atta capiguara*, *Atta cephalotes*, *Atta cephalotes*, *Atta laevigata*, *Atta robusta*, *Atta sexdens*, *Atta texana*, *Bombus* spp., *Camponotus floridanus*, *Crematogaster* spp., *Dasymutilla occidentalis*, *Diprion* spp., *Dolichovespula maculata*, *Hoplocampa* spp., tal como *Hoplocampa minuta*, *Hoplocampa testudinea*; *Lasius* spp., tal como *Lasius niger*, *Linepithema humile*,
 15 *Monomorium pharaonis*, *Paravespula germanica*, *Paravespula pennsylvanica*, *Paravespula vulgaris*, *Pheidole megacephala*, *Pogonomyrmex barbatus*, *Pogonomyrmex californicus*, *Polistes rubiginosa*, *Solenopsis geminata*, *Solenopsis invicta*, *Solenopsis richteri*, *Solenopsis xyloni*, *Vespa* spp., tal como *Vespa crabro*, y *Vespula squamosa*
 grillos, saltamontes, langostas (Ortópteros), por ejemplo *Acheta domestica*, *Calliptamus italicus*, *Chortoicetes terminifera*,
 20 *Dociostaurus maroccanus*, *Gryllotalpa africana*, *Gryllotalpa gryllotalpa*, *Hieroglyphus daganensis*, *Kraussaria angulifera*, *Locusta migratoria*, *Locustana pardalina*, *Melanoplus bivittatus*, *Melanoplus femurrubrum*, *Melanoplus mexicanus*, *Melanoplus sanguinipes*, *Melanoplus spretus*, *Nomadacris septemfasciata*, *Oedaleus senegalensis*, *Schistocerca americana*, *Schistocerca gregaria*, *Tachycines asynamorus*, y *Zonozerus variegatus*,
 25 arácnidos (Arachnida), tales como ácaros, por ejemplo de las familias *Argasidae*, *Ixodidae* and *Sarcoptidae*, tal como *Amblyomma* spp. (por ejemplo *Amblyomma americanum*, *Amblyomma variegatum*, *Amblyomma maculatum*),
Argas spp. (por ejemplo *Argas persicus*), *Boophilus* spp. (por ejemplo *Boophilus annulatus*, *Boophilus decoloratus*, *Boophilus microplus*), *Dermacentor silvarum*, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor variabilis*, *Hyalomma* spp. (por ejemplo *Hyalomma truncatum*), *Ixodes* spp. (por ejemplo *Ixodes ricinus*, *Ixodes rubicundus*, *Ixodes scapularis*, *Ixodes holocyclus*, *Ixodes pacificus*), *Ornithodoros* spp. (por ejemplo *Ornithodoros moubata*, *Ornithodoros hermsi*,
 30 *Ornithodoros turicata*), *Ornithonyssus bacoti*, *Otobius megnini*, *Dermanyssus gallinae*, *Psoroptes* spp. (por ejemplo *Psoroptes ovis*), *Rhipicephalus* spp. (por ejemplo *Rhipicephalus sanguineus*, *Rhipicephalus appendiculatus*, *Rhipicephalus evertsi*), *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp. (por ejemplo *Sarcoptes scabiei*), and *Eriophyidae* spp., tal como *Acaria sheldoni*, *Aculops* spp. (por ejemplo *Aculops pelekassi*) *Aculus* spp. (por ejemplo *Aculus schlechtendali*), *Epitrimerus pyri*, *Phyllocoptura oleivora* and *Eriophyes* spp. (por ejemplo *Eriophyes sheldoni*);
 35 *Tarsonemidae* spp., tal como *Hemitarsonemus* spp., *Phytonemus pallidus* and *Polyphagotarsonemus latus*, *Stenotarsonemus* spp.; *Tenuipalpidae* spp., tal como *Brevipalpus* spp. (por ejemplo *Brevipalpus phoenicis*); *Tetranychidae* spp., tal como *Eotetranychus* spp., *Eutetranychus* spp., *Oligonychus* spp., *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus kanzawai*, *Tetranychus pacificus*, *Tetranychus telarius* and *Tetranychus urticae*; *Bryobia praetiosa*, *Panonychus* spp. (por ejemplo *Panonychus ulmi*, *Panonychus citri*), *Metatetranychus* spp. and *Oligonychus* spp. (por ejemplo *Oligonychus pratensis*), *Vasates lycopersici*; *Araneida*, por ejemplo *Latrodectus mactans*, and *Loxosceles*
 40 *reclusa*. And *Acarus siro*, *Chorioptes* spp., *Scorpio maurus*
 pulgas (Sifonápteros), por ejemplo *Ceratophyllus* spp., *Ctenocephalides felis*, *Ctenocephalides canis*, *Xenopsilla cheopis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, y *Nosopsillus fasciatus*,
 45 *lepisma*, insecto de fuego (*Thysanura*), por ejemplo *Lepisma saccharina* y *Thermobia domestica*,
 ciempiés (Chilopoda), por ejemplo, *Geophilus* spp., *Scutigera* spp. tal como *Scutigera coleoptrata*;
 milpiés (Diplopoda), por ejemplo, *Blaniulus guttulatus*, *Narceus* spp.,
 tijeretas (Dermaptera), por ejemplo *forficula auricularia*,
 piojos (Phthiraptera), por ejemplo *Damalinea* spp., *Pediculus* spp. tal como *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*; *Pthirus pubis*, *Haematopinus* spp. tal como *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus suis*; *Linognathus* spp. tal como *Linognathus vituli*; *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*, *Menacanthus stramineus* y
 50 *Solenopotes capillatus*, *Trichodectes* spp.,
 Colémbolos (Collembola), por ejemplo *Onychiurus* ssp. tal como *Onychiurus armatus*,

También son adecuados para el control de nematodos: nematodos parásitos de plantas, tales como nematodos de los nudos de la raíz, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica*, 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 "seed gall", especies de *Anguina*; Nematodos del tallo y foliares, especies de *Aphelenchoides besseyi* tales como *Aphelenchoides*; nematodos sting, *Belonolaimus longicaudatus* y otras especies de *Belonolaimus*; nematodos del pino, *Bursaphelenchus lignicolus* Mamiya et Kiyohara, *Bursaphelenchus xilophilus* y otras especies *Bursaphelenchus*; nemátodos de anillo, especies de *Criconema*, especies de *Criconemella*, especies de *Criconemoides*, especies de *Mesocriconema*; nematodos de tallo bulbo, *Ditilenchus destructor*, *Ditilenchus dipsaci* y otras especies de *Ditilenchus*; nematodos lezna, especie *Dolichodorus*; nematodos de espiral, *Helicotilenchus multinctus* y otras especies *Helicotilenchus*; nematodos de vaina y vainoides, especies de *Hemicyclophora* y especies de *Hemicriconemoides*; especie *Hirshmanniella*; nemátodos de lanza, especie

5 Hoploaimus; nematodos de nudo de la raíz falsa, especie *Nacobbus*; nematodos aguja, *Longidorus elongatus* y otras especies *Longidorus*; nematodos de lesiones, *Pratilenchus brachyurus*, *Pratilenchus neglectus*, *Pratilenchus penetrans*, *Pratilenchus curvatus*, *Pratilenchus goodeyi* y otras especies de *Pratilenchus*; Nematodos barrenadores, *Radopholus similis* y otras especies de *Radopholus*; nematodos reniformes, *Rotilenchus robustus*, *Rotilenchus reniformis* y otras especies *Rotilenchus*; especies *Scutellonema*; nematodos de las raíces cortas, *Trichodorus primitivus* y otras especies *Trichodorus*, especie *Paratrichodorus*; nemátodos "Stunt", *Tilenchorhynchus claytoni*, *Tilenchorhynchus dubius* y otras especies *Tilenchorhynchus*; nematodos de cítricos, especies *Tilenchulus* tales como *Tilenchulus semipenetrans*; nematodos daga, especie *Xiphinema*; y otra especies de nematodos parásitos.

10 Ejemplos de otros especies de plagas que pueden ser controladas por los compuestos de fórmula (I) incluyen: de la clase de Bivalva, por ejemplo, *Dreissena* spp.; de la clase de Gastropoda, por ejemplo, *Arion* spp., *Biomphalaria* spp., *Bulinus* spp., *Deroceras* spp., *Galba* spp., *Lymnaea* spp., *Oncomelania* spp., *Succinea* spp.; de la clase de los helmintos, por ejemplo, *Ancilostoma duodenale*, *Ceilanicum Ancilostoma*, *Acilostoma braziliensis*, *Ancilostoma* spp., *Ascaris lubricoides*, *Ascaris* spp., *Brugia malayi*, *Brugia timori*, *Bunostomum* spp., *Chabertia* spp., *Clonorchis* spp.,
 15 *Cooperia* spp., *Dicrocoelium* spp., *Dictyocaulus filaria*, *Diphilobothrium latum*, *Dracunculus medinensis*, *Echinococcus granulosus*, *Echinococcus multilocularis*, *Enterobius vermicularis*, *Faciola* spp., *Haemonchus* spp. tales como *Haemonchus contortus*; *Heterakis* spp., *Hymenolepis nana*, *Hyostrongulus* spp., *Loa Loa*, *Nematodirus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Opisthorchis* spp., *Onchocerca volvulus*, *Ostertagia* spp., *Paragonimus* spp., *Schistosomen* spp., *Strongiloides fuelleborni*, *Strongiloides stercora lis*, *Stroniloides* spp., *Taenia saginata*,
 20 *Taenia solium*, *Trichinella spiralis*, *Trichinella nativa*, *Trichinella britovi*, *Trichinella nelsoni*, *Trichinella pseudopsiralis*, *Trichostrongulus* spp, *Trichuris trichuria*, *Wuchereria bancrofti*.; del orden de los isópodos, por ejemplo, *Armadillidium vulgare*, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*; del orden de los sínfilos, por ejemplo, *Scutigera* *immaculata*;

25 Otros ejemplos de especies de plagas que pueden ser controladas por los compuestos de fórmula (I) incluyen: *Anisoplia austriaca*, *Apamea* spp, *Austroasca viridigrisea*, *Baliothrips biformis*, *Caenorhabditis elegans*, *Cephus* spp, *Ceutorhynchus napi*, *Chaetocnema Aridula*, *Chilo auricilius*, *Chilo indicus*, *Chilo polychrysus*, *Chortiocetes terminifera*, *Cnaphalocroci medinalis*, *Cnaphalocrosis* spp., *Colias eurytheme*, *Collops* spp., *Cornitermes cumulans*, *Creontiades* spp., *Cyclocephala* spp., *Dalbulus maidis*, *Deraceras reticulatum*, *Diatrea saccharalis*, *Dichelops furcatus*, *Dicladispa armigera*, *Diloboderus* spp. tales como *Diloboderus Abdero*; *Edesa* spp., *Epinotia* spp.,
 30 *Formicidae*, *Geocoris* spp., *Globitermes sulfureus*, *Grillotalpidae*, *Halotydeus destructor*, *Hipnodes bicolor*, *Hydrellia philippina*, *Julus* spp., *Laodelphax* spp., *Leptocorsia acuta*, *Leptocorsia oratorius*, *Liogenys fuscus*, *Lucillia* spp., *Lyogenys fuscus*, *Mahanarva* spp., *Maladera matrida*, *Marasmia* spp., *Mastotermes* spp., *cochinillas*, *Megascelis* ssp, *Metamasius hemipterus*, *Microtheca* spp., *Mocis latipes*, *Murgantia* spp., *Mythemina separata*, *Neocapritermes opacus*, *Neocapritermes parvus*, *Neomegalotomus* spp., *Neotermes* spp., *Nymphula depunctalis*, *Oebalus pugnax*,
 35 *Orseolia* spp. tales como *Orseolia oryzae*; *Oxycaraenus hyalinipennis*, *Plusia* spp., *Pomacea canaliculata*, *Procornitermes ssp*, *Procornitermes triacifer*, *Psilloides* spp., *Rachiplusia* spp., *Rhodopholus* spp., *Scaptocoris castanea*, *Scaptocoris* spp., *Scirpophaga* spp. tales como *Scirpophaga incertulas*, *Scirpophaga innotata*; *Scotinophara* spp. tales como *Scotinophara coarctata*; *Sesamia* spp. tales como *Sesamia inferens*, *Sogaella frucifera*, *Solenapsis geminata*, *Spissistilus* spp., barrenador de tallo, *Stenchaetothrips biformis*,
 40 *Steneotarsonemus spinki*, *Silepta derogata*, *Telehin licus*, *Trichostrongilus* sp.

Los compuestos de la presente invención, incluyendo sus sales, estereoisómeros y tautómeros, son particularmente útiles para controlar insectos, preferiblemente chupadores o insectos que perforan y masticar y muerden, tales como
 45 insectos de los géneros *Lepidoptera*, *Coleoptera* y *Hemiptera*, en particular, *Lepidoptera*, *Coleoptera* e insectos verdaderos.

Los compuestos de la presente invención, incluyendo sus sales, estereoisómeros y tautómeros, son además útiles para controlar insectos de los órdenes *Thysanoptera*, *Diptera* (moscas especialmente, mosquitos), *Hymenoptera* (especialmente hormigas) y *Isoptera* (especialmente termitas).

50 Los compuestos de la presente invención, incluyendo sus sales, estereoisómeros y tautómeros, son particularmente útiles para controlar insectos de los órdenes *Lepidoptera* y *Coleoptera*.

La invención también se refiere a composiciones agroquímicas que comprenden un auxiliar y al menos un compuesto I de acuerdo con la invención.

55 Una composición agroquímica comprende una cantidad plaguicida eficaz de un compuesto I. El término "cantidad eficaz" indica una cantidad de la composición o de los compuestos I, que es suficiente para controlar hongos dañinos en plantas de cultivo o en la protección de materiales y que no da como resultado un daño sustancial a las plantas tratadas. Tal cantidad puede variar en un amplio intervalo y depende de varios factores, tales como las
 60 especies a controlar, la planta o material cultivado tratado, las condiciones climáticas y del compuesto I específico que se ha usado.

Los compuestos I, sus N-óxidos y las sales se pueden convertir en los tipos habituales de composiciones agroquímicas, por ejemplo soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, polvos, pastas, gránulos, prensados,
 65 cápsulas, y mezclas de los mismos. Ejemplos de tipos de composición son suspensiones (por ejemplo SC, OD, FS),

concentrados emulsionables (por ejemplo EC), emulsiones (por ejemplo, EW, EO, ES, ME), cápsulas (por ejemplo, CS, ZC), pastas, pastillas, polvos humectables o polvos (por ejemplo, WP, SP, WS, DP, DS), prensados (por ejemplo, BR, TB, DT), gránulos (por ejemplo, WG, SG, GR, FG, GG, MG), artículos insecticidas (por ejemplo, LN), así como formulaciones en gel para el tratamiento de materiales de propagación de plantas, tales como semillas (por ejemplo, GF). Estas y otras composiciones tipos se definen en el "Catálogo de tipos de formulación de plaguicidas y sistema de codificación internacional", Technical Monograph No. 2, sexta ed. Mayo 2008, CropLife International.

Las composiciones se preparan de una manera conocida, tal como se describe por Mollet y Grubemann, Formulation technology, Wiley VCH, Weinheim, 2001; o Knowles, New developments in crop protection product formulation, Agron Informes DS243, T & F Informa, Londres, 2005.

Los agentes auxiliares adecuados son disolventes, portadores líquidos, portadores sólidos o cargas, agentes tensioactivos, dispersantes, emulsionantes, humectantes, adyuvantes, solubilizantes, potenciadores de la penetración, coloides protectores, agentes de adherencia, espesantes, humectantes, repelentes, atrayentes, estimulantes de la alimentación, compatibilizadores, bactericidas, agentes anticongelantes, agentes antiespumantes, colorantes, agentes de pegajosidad y aglutinantes.

Los disolventes adecuados y portadores líquidos son agua y disolventes orgánicos, tales como fracciones de aceite mineral de medio a alto punto de ebullición, por ejemplo, queroseno, aceite diesel; aceites de origen vegetal o animal; hidrocarburos alifáticos, cíclicos y aromáticos, por ejemplo tolueno, parafina, tetrahidronaftaleno, naftalenos alquilados; alcoholes, por ejemplo etanol, propanol, butanol, alcohol bencílico, ciclohexanol; glicoles; DMSO; cetonas, por ejemplo ciclohexanona; ésteres, por ejemplo lactatos, carbonatos, ésteres de ácidos grasos, gamma-butirolactona; ácidos grasos; fosfonatos; aminas; amidas, por ejemplo N-metilpirrolidona, dimetilamidas de ácidos grasos; y mezclas de los mismos.

Los portadores sólidos adecuados o cargas son tierras minerales, por ejemplo, silicatos, geles de sílice, talco, caolines, piedra caliza, cal, creta, arcillas, dolomita, tierra de diatomeas, bentonita, sulfato de calcio, sulfato de magnesio, óxido de magnesio; polisacáridos, por ejemplo celulosa, almidón; fertilizantes, por ejemplo sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, ureas; productos de origen vegetal, por ejemplo, harina de cereales, harina de corteza de árbol, harina de madera, harina de cáscara de nuez, y mezclas de los mismos.

Los tensioactivos adecuados son compuestos activos de superficie, tales como tensioactivos aniónicos, catiónicos, no iónicos y anfóteros, polímeros de bloque, polielectrolitos, y mezclas de los mismos. Tales tensioactivos se pueden utilizar como emulsionantes, dispersantes, solubilizantes, humectantes, potenciador de la penetración, coloide protector, o adyuvante. Ejemplos de tensioactivos se enumeran en McCutcheon, Vol.1: Emulsifier & Detergents, McCutcheon's Directories, Glen Rock, EE.UU., 2008 (edición internacional o de Norteamérica).

Los tensioactivos aniónicos adecuados son sales con metales alcalinos, alcalinotérreos o amonio de sulfonatos, sulfatos, fosfatos, carboxilatos y mezclas de los mismos. Ejemplos de sulfonatos son alquilarilsulfonatos, difenilsulfonatos, sulfonatos de alfa-olefina, sulfonatos de lignina, sulfonatos de ácidos grasos y aceites, sulfonatos de alquilfenoles etoxilados, sulfonatos de arilfenoles alcoxilados, sulfonatos de naftalenos condensados, sulfonatos de dodecibencenos y tridecibencenos, sulfonatos de naftalenos y alquilnaftalenos, sulfosuccinatos o sulfosuccinamatos. Ejemplos de sulfatos son los sulfatos de ácidos grasos y aceites, de alquilfenoles etoxilados, de alcoholes, de alcoholes etoxilados, o de ésteres de ácido graso.

Ejemplos de fosfatos son ésteres de fosfato. Los ejemplos de carboxilatos son carboxilatos de alquilo, y etoxilatos de alcohol o alquilfenol carboxilados.

Los tensioactivos no iónicos adecuados son los alcoxilatos, amidas de ácidos grasos sustituidas en N, óxidos de aminas, ésteres, agentes tensioactivos a base de azúcar, agentes tensioactivos poliméricos, y mezclas de los mismos. Ejemplos de alcoxilatos son compuestos tales como alcoholes, alquilfenoles, aminas, amidas, arilfenoles, ácidos grasos o ésteres de ácidos grasos que han sido alcoxilados con 1 a 50 equivalentes. El óxido de etileno y/u óxido de propileno pueden emplearse para la alcoxilación, preferentemente óxido de etileno. Ejemplos de amidas de ácidos grasos sustituidas en N son glucamidas de ácidos grasos o alcanolamidas de ácidos grasos. Ejemplos de ésteres son ésteres de ácidos grasos, ésteres de glicerol o monoglicéridos. Ejemplos de tensioactivos a base de azúcar son sorbitanos, sorbitanos etoxilados, sacarosa y ésteres de glucosa o alquilpoliglucósidos. Ejemplos de tensioactivos poliméricos son homopolímeros o copolímeros de vinilpirrolidona, vinil-alcoholes, o acetato de vinilo.

Los tensioactivos catiónicos adecuados son tensioactivos cuaternarios, por ejemplo compuestos de amonio cuaternario con uno o dos grupos hidrófobos, o sales de aminas primarias de cadena larga. Los tensioactivos anfóteros adecuados son alquilbetainas e imidazolininas. Los polímeros de bloque adecuados son polímeros de bloque de tipo A-B o A-B-A que comprenden bloques de óxido de polietileno y óxido de polipropileno, o de tipo A-B-C que comprende alcanol, óxido de polietileno y óxido de polipropileno. Los polielectrolitos adecuados son poliácidos o polibases. Ejemplos de poliácidos son sales alcalinas de ácido poliacrílico o polímeros combinados de poliácido. Ejemplos de polibases son polivinilaminas o polietilenaminas.

- 5 Los adyuvantes adecuados son compuestos, que tienen una actividad plaguicida despreciable o incluso ninguna en sí mismos, y que mejoran el rendimiento biológico del compuesto I en el objetivo. Los ejemplos son tensioactivos, aceites minerales o vegetales, y otros agentes auxiliares. Otros ejemplos son enumerados por Knowles, Adjuvants and additives, Agrow Reports DS256, T & F Informa UK, 2006, capítulo 5.
- 10 Los agentes espesantes adecuados son polisacáridos (por ejemplo, goma de xantano, carboximetilcelulosa), arcillas inorgánicas (orgánicamente modificadas o sin modificar), policarboxilatos, y silicatos.
- Los agentes anticongelantes adecuados son etilenglicol, propilenglicol, urea y glicerina.
- 15 Los agentes antiespumantes son siliconas, alcoholes de cadena larga, y sales de ácidos grasos.
- Los colorantes adecuados (por ejemplo, en rojo, azul, o verde) son pigmentos de baja solubilidad en agua y colorantes solubles en agua. Los ejemplos son colorantes inorgánicos (por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, hexacianoferrato de hierro) y colorantes orgánicos (por ejemplo, colorantes de alizarina, azoicos y de ftalocianina).
- 20 Los agentes de pegajosidad o aglutinantes adecuados son polivinilpirrolidona, acetatos de polivinilo, alcoholes de polivinilo, poliacrilatos, ceras biológicas o sintéticas, y éteres de celulosa.
- Los ejemplos de tipos de composición y su preparación son:
- 25 i) Concentrados solubles en agua (SL, LS)
Se disuelven 10-60% en peso de un compuesto I según la invención y 5-15% en peso de agente humectante (por ejemplo alcohilatos de alcohol) en agua y/o en un disolvente soluble en agua (por ejemplo alcoholes) hasta 100% en peso. La sustancia activa se disuelve por dilución con agua.
- 30 ii) Concentrados dispersables (DC)
Se disuelven 5-25% en peso de un compuesto I según la invención y 1-10% en peso de dispersante (por ejemplo, polivinilpirrolidona) en un disolvente orgánico (por ejemplo ciclohexanona) hasta 100% en peso. La dilución con agua da una dispersión.
- 35 iii) Concentrados emulsionables (EC)
Se disuelven 15-70% en peso de un compuesto I según la invención y 5-10 % en peso de emulsionantes (por ejemplo dodecibencenosulfonato de calcio y etoxilato de aceite de ricino) en un disolvente orgánico insoluble en agua (por ejemplo, hidrocarburo aromático) hasta 100% en peso. La dilución con agua da una emulsión.
- 40 iv) Emulsiones (EW, EO, ES)
Se disuelven 5-40% en peso de un compuesto I según la invención y 1-10% en peso de emulsionantes (por ejemplo, dodecibencenosulfonato de calcio y etoxilato de aceite de ricino) en 20-40% en peso de disolvente orgánico insoluble en agua (por ejemplo, hidrocarburo aromático). Esta mezcla se introduce en agua hasta el 100% en peso por medio de una máquina emulsionante y se convierte en una emulsión homogénea. La dilución con agua da una emulsión.
- 45 v) Suspensiones (SC, OD, FS)
En un molino de bolas agitado, se trituran 20-60% en peso de un compuesto I según la invención con adición de 2-10% en peso de dispersantes y agentes humectantes (por ejemplo, lignosulfonato de sodio y etoxilato de alcohol), 0,1-2 % en peso de espesante (por ejemplo, goma de xantano) y agua hasta el 100% en peso para dar una suspensión de partículas finas de sustancia activa. La dilución con agua da una suspensión estable de la sustancia activa. Para la composición de tipo FS se añade hasta un 40% en peso de aglutinante (por ejemplo, alcohol polivinílico).
- 50 vi) Gránulos dispersables en agua y gránulos solubles en agua (WG, SG)
Se muelen finamente 50-80% en peso de un compuesto I según la invención con adición de dispersantes y agentes humectantes (por ejemplo, lignosulfonato de sodio y etoxilato de alcohol) hasta 100% en peso y se preparan como gránulos dispersables en agua o gránulos solubles en agua por medio de dispositivos técnicos (por ejemplo extrusión, torre de pulverización, lecho fluidizado). La dilución con agua da una dispersión o solución de la sustancia activa estable.
- 55 vii) Polvos dispersables en agua y polvos solubles en agua (WP, SP, WS)
Se muelen en un molino de rotor-estator 50-80% en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención con adición de 1-5% en peso de agentes dispersantes (por ejemplo, lignosulfonato de sodio), 1-3 wt% de agentes humectantes (por ejemplo, etoxilato de alcohol) y portador sólido (por ejemplo, gel de sílice) hasta 100% en peso. La dilución con agua da una dispersión o solución de la sustancia activa estable.
- 60 viii) Gel (GW, GF)
En un molino de bolas agitado, se trituran 5-25% en peso de un compuesto I según la invención con adición de 3-10% en peso de dispersantes (por ejemplo, lignosulfonato de sodio), 1-5% en peso de espesante (por ejemplo carboximetilcelulosa) y agua hasta el 100% en peso para dar una suspensión de partículas finas de la sustancia activa. La dilución con agua da una suspensión estable de la sustancia activa.
- 65

iv) Microemulsión (ME)

Se añaden 5-20% en peso de un compuesto I según la invención a 5-30% en peso de la mezcla de disolventes orgánicos (por ejemplo, dimetilamida del ácido graso y ciclohexanona), 10-25% en peso de mezcla de tensioactivos (por ejemplo alcohol etoxilato y etoxilato de arifenol), y agua hasta el 100%. Esta mezcla se agitó durante 1 h para producir espontáneamente una microemulsión termodinámicamente estable.

iv) Microcápsulas (CS)

Se dispersan una fase oleosa que comprende 5-50% en peso de un compuesto I según la invención, 0-40% en peso de disolvente orgánico insoluble (por ejemplo, hidrocarburos aromáticos), 2-15% en peso de monómeros acrílicos (por ejemplo, metacrilato de metilo, ácido metacrílico y un diacrilato o triacrilato) en una solución acuosa de un coloide protector (por ejemplo, alcohol de polivinilo). La polimerización radical iniciada por un iniciador de radicales da lugar a la formación de microcápsulas de poli(met)acrilato. Alternativamente, se dispersan una fase de aceite que comprende 5-50% en peso de un compuesto I según la invención, 0-40% en peso de disolvente orgánico insoluble (por ejemplo, hidrocarburo aromático), y un monómero de isocianato (por ejemplo difenilmeteno-4,4'-diisocianato) en una solución acuosa de un coloide protector (por ejemplo, alcohol de polivinilo). La adición de una poliamina (por ejemplo, hexametildiamina) da lugar a la formación de microcápsulas de poliurea. Los monómeros representan 1-10% en peso. El % en peso se refiere a la composición total de las CS.

ix) Polvos espolvoreados (DP, DS)

1-10% en peso de un compuesto I según la invención se muelen finamente y se mezclan íntimamente con un vehículo sólido (por ejemplo, caolín finamente dividido) hasta un 100% en peso.

x) Gránulos (GR, FG)

0,5-30% en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención se muele finamente y se asocia con un vehículo sólido (por ejemplo, silicato) hasta un 100% en peso. La granulación se consigue mediante extrusión, secado por pulverización o lecho fluidizado.

xi) Líquidos de volumen ultrabajo (UL)

Se disuelven 1-50% en peso de un compuesto I según la invención en un disolvente orgánico (por ejemplo, hidrocarburo aromático) hasta un 100% en peso.

Los tipos de composiciones i) a xi) pueden comprender opcionalmente otras sustancias auxiliares, tales como 0,1-1% en peso de bactericidas, 5-15% en peso de agentes anticongelantes, 0,1-1% en peso de antiespumantes, y 0,1-1% en peso de colorantes.

Las composiciones agroquímicas comprenden generalmente entre 0,01 y 95%, preferentemente entre 0,1 y 90%, y en particular entre 0,5 y 75%, en peso de sustancia activa. Las sustancias activas se emplean con una pureza del 90% al 100%, preferiblemente del 95% al 100% (según el espectro de RMN).

Las soluciones para tratamiento de semillas (LS), suspoemulsiones (SE), concentrados fluidos (FS), polvos para tratamiento en seco (DS), polvos dispersables en agua para tratamiento en suspensión (WS), polvos solubles en agua (SS), emulsiones (ES), concentrados emulsionables (EC) y geles (GF) se emplean normalmente para los fines de tratamiento de materiales de propagación de plantas, en particular de semillas. Las composiciones en cuestión proporcionan, después de dos a diez veces la dilución, las concentraciones de sustancia activa del 0,01 a 60% en peso, preferiblemente del 0,1 a 40% en peso, en las preparaciones listas para el uso. La aplicación puede llevarse a cabo antes o durante la siembra. Los procedimientos para la aplicación de compuesto I y composiciones del mismo, respectivamente, sobre materiales de propagación de plantas, especialmente semillas, incluyen limpieza, recubrimiento, granulación, espolvoreo, remojo y procedimientos de aplicación en surcos del material de propagación. Preferiblemente, el compuesto I o las composiciones del mismo, respectivamente, se aplican sobre el material de propagación de plantas mediante un procedimiento tal que la germinación no se induce, por ejemplo mediante limpieza, granulación, recubrimiento y espolvoreo de las semillas.

Cuando se emplea en la protección de plantas, las cantidades de sustancias activas aplicadas son, dependiendo del tipo de efecto deseado, de 0,001 a 2 kg por ha, preferentemente de 0,005 a 2 kg por ha, más preferiblemente de 0,05 a 0,9 kg por ha, y en particular de 0,1 a 0,75 kg por ha.

En el tratamiento de materiales de propagación vegetal, tales como semillas, por ejemplo, espolvoreando, recubriendo o empapando semillas, generalmente se requieren cantidades de sustancia activa de 0,1 a 1000 g, preferiblemente de 1 a 1000 g, más preferiblemente de 1 a 100 g y lo más preferiblemente de 5 a 100 g, por 100 kilogramos de material de propagación vegetal (preferiblemente semillas). Cuando se usa en la protección de materiales o productos almacenados, la cantidad de sustancia activa aplicada depende del tipo de área de aplicación y del efecto deseado. Las cantidades aplicadas habitualmente en la protección de materiales son de 0,001 g a 2 kg, preferiblemente de 0,005 g a 1 kg, de sustancia activa por metro cúbico de material tratado.

Se pueden añadir diversos tipos de aceites, humectantes, adyuvantes, fertilizantes, o micronutrientes, y otros plaguicidas (por ejemplo, herbicidas, insecticidas, fungicidas, reguladores del crecimiento, protectores) a los principios activos o las composiciones que los comprenden como premezcla o, si es apropiado, no hasta inmediatamente antes de su uso (mezcla de tanque). Estos agentes pueden mezclarse con las composiciones según la invención en una relación en peso de 1:100 a 100:1, preferiblemente de 1:10 a 10:1.

El usuario aplica la composición según la invención por lo general a partir de un dispositivo de predosificación, un pulverizador de mochila, un depósito de pulverización, un avión de pulverización, o un sistema de riego. Habitualmente, la composición agroquímica se prepara con agua, tampón y/o auxiliares adicionales hasta la concentración de aplicación deseada y así se obtiene el licor de pulverización listo para usar o la composición agroquímica según la invención. Por lo general, se aplican de 20 a 2000 litros, preferiblemente de 50 a 400 litros, del licor de pulverización listo para usar por hectárea de área útil agrícola.

Según una realización, los componentes individuales de la composición de acuerdo con la invención, tales como partes de un kit o partes de una mezcla binaria o ternaria se pueden mezclar por el propio usuario en un tanque de pulverización y se pueden añadir otros agentes auxiliares, si es apropiado. En una realización adicional, el usuario puede mezclar componentes individuales de la composición de acuerdo con la invención o componentes parcialmente premezclados, por ejemplo, componentes que comprenden compuestos I y/o sustancias activas de los grupos M) o F) (ver más abajo) en un tanque de aspersión y se pueden añadir otros auxiliares y aditivos, si es apropiado.

En una realización adicional, los componentes individuales de la composición de acuerdo con la invención o componentes de premezcla parcial, por ejemplo, componentes que comprende compuestos I y/o sustancias activas de los grupos M.1 a M.UN.X o F.I a F.XII, se pueden aplicar de forma conjunta (por ejemplo, después de la mezcla en tanque) o consecutivamente.

La siguiente lista M de plaguicidas, agrupados según la Clasificación del modo de acción del Comité de Acción Resistencia a los Insecticidas (IRAC), junto con los que se pueden utilizar los compuestos según la invención, y con los que pueden producirse potenciales efectos sinérgicos, pretenden ilustrar las posibles combinaciones, pero sin imponer ninguna limitación:

M.1 Inhibidores de acetilcolina esterasa (AChE) de la clase de

M.1A carbamatos, por ejemplo aldicarb, alanicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbarilo, carbofuran, carbosulfán, etiofencarb, fenobucarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, trimetacarb, XMC, xililcarb y triazamato;

o de la clase de

M.1B organofosfatos, por ejemplo acefato, azametifos, azinfos-etilo, azinfos metilo, cadusafos, cloretoxifos, clorfenvinfos, clormefos, clorpirifos, clorpirifos-metilo, cumafos, cianofos, demeton-S-metilo, diazinon, diclorvos/DDVP, dicrotofos, dimetoato, dimetilvinfos, disulfotón, EPN, etián, etoprofos, famfur, fenamifos, fenitrotión, fentión, fostiazato, heptenofos, imiciafos, isofenfos, O-(methoxyaminotio-fosforil)salicilato de isopropilo, isoxatián, malatián, mecarbam, metamidofos, metidatián, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemetón-metilo, paratián, paratián-metilo, fentoato, forato, fosalona, fosmet, fosfamidón, foxim, pirimifos-metilo, profenofos, propetamfos, protiofos, piraclofos, piridafentión, quinalfos, sulfotep, tebupirimfos, temefos, terbufos, tetraclorvinfos, tiometón, triazofos, triclorfón y vamidotión;

M.2. Antagonistas de canales de cloro mediados por GABA, tales como:

M.2A compuestos de ciclodieno organoclorados, como por ejemplo endosulfan o clordano; o
M.2B fiproles (fenilpirazoles), como por ejemplo, etiprol, fipronilo, flufiprol, pirafuprol y piriprol;

M.3 moduladores de los canales de sodio de la clase de

M.3A, piretroides, por ejemplo acrintrina, aletrina, d-cis-trans aletrina, d-trans aletrina, bifentrina, bioaletrina, bioaletrina S-ciclopropenilo, bioresmetrina, cicloprotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, gamma-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, beta-cipermetrina, theta-cipermetrina, zetacipermetrina, cifenotrina, deltametrina, empentrina, esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flumetrina, tau-fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, meperfluthrin, metoflutrina, momfluorothrin, permetrina, fenotrina, praletrina, proflutrina, piretrina (piretro), resmetrina, silafluofeno, teflutrina, tetrametilfluthrin, tetrametrina, tralometrina y transflutrina; o

M.3B moduladores de los canales de sodio, tales como DDT o metoxicloro;

M.4 Agonistas de receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR) de la clase de

M.4A neonicotinoides, por ejemplo acetamiprid, clotianidina, dinotefuran, imidacloprid, nitenpiram, tiacloprid y tiametoxam; o los compuestos

M.4A.1: 1-[(6-cloro-3-piridinil)metil]-2,3,5,6,7,8-hexahidro-9-nitro-(5S, 8R)-5,8-epoxi-1H-imidazo [1,2-a]azepina; o

M.4A.2: 1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-nitro-1-[(E)-pentilideneamino]guanidina; o

M.4.A.3: 1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-7-metil-8-nitro-5-propoxi-3,5,6,7-tetrahidro-2H-imidazo[1,2-a]piridina;

o M.4B nicotina.

M.5 activadores alostéricos de receptor nicotínico de acetilcolina de la clase de espinosinas, por ejemplo spinosad o spinetoram;

M.6 Activadores de canales de cloruro de la clase de las avermectinas y milbemicinas, por ejemplo abamectina, benzoato de emamectina, ivermectina, lepimectina o milbemectina;

- 5 M.7 Mimetizadores de la hormona juvenil, tales como
M.7A análogos de la hormona juvenil como hidropreno, kinopreno y metopreno; u otros como M.7B fenoxicarb o M.7C piriproxifeno;
- 5 M.8 Inhibidores (multisitio) no específicos diversos, por ejemplo
M.8A haluros de alquilo como bromuro de metilo y otros haluros de alquilo, o M.8B cloropicrina o M.8C fluoruro de sulfurilo, o M.8D bórax, o M.8E tártaro emético;
- 10 M.9 bloqueadores de la alimentación selectivos de homopteran, por ejemplo
M.9B pimetrozina o M.9C flonicamid;
- 15 M.10 inhibidores del crecimiento de ácaros, por ejemplo
M.10A clofentezina, hexitiazox y diflovidazina, o M.10B etoxazol;
- 20 M.11 Alteradores microbianos de las membranas del intestino medio de insectos, por ejemplo *Bacillus thuringiensis* o *Bacillus sphaericus* y las proteínas insecticidas que producen tales como *Bacillus thuringiensis subsp. israelensis*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis subsp. aizawai*, *Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki* y *Bacillus thuringiensis subsp. tenebrionis*, o las proteínas de los cultivos de Bt: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry2Ab, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb y Cry34/35AB²;
- 25 M.12 inhibidores de la ATP sintasa mitocondrial, por ejemplo
M.12A diafentiurón o
M.12B acaricidas orgánicos de estaño, tales como azociclotina, cihexatina u óxido de fenbutatina, o M.12C propargita o M.12D tetradifon;
- 30 M.13 Desacopladores de la fosforilación oxidativa mediante interrupción del gradiente de protones, por ejemplo clorfenapir, DNOC o sulfluramid;
- 35 M.14 bloqueadores de los canales del receptor nicotínico acetilcolina (nAChR), por ejemplo análogos de nereistoxina como bensultap, clorhidrato de cartap, tiociclam o tiosultap de sodio;
- 40 M.15 Inhibidores de la biosíntesis de quitina tipo 0, tales como benzoilureas como por ejemplo bistriflurón, clorfluazurón, diflubenzurón, flucicloxurón, flufenoxurón, hexaflumurón, lufenurón, novalurón, noviflumurón, teflubenzurón o triflumurón;
- 45 M.16 Inhibidores de la biosíntesis de quitina tipo 1, como por ejemplo buprofezin;
- 50 M.17 alteradores de la muda, dípteros, como por ejemplo ciromazina;
- 55 M.18 Agonistas del receptor de ecdisoma, tales como diacilhidrazinas, por ejemplo metoxifenoazida, tebufenoazida, halofenoazida, fufenoazida o cromafenoazida;
- 60 M.19 Agonistas del receptor de octopamina como por ejemplo amitraz;
- 65 M.20 Inhibidores del transporte de electrones en el complejo III mitocondrial, por ejemplo
M.20A hidrametilnon o M.20B acequinocilo o M.20C fluacipirim;
- M.21 Inhibidores del transporte de electrones en el complejo I mitocondrial, por ejemplo
M.21A acaricidas e insecticidas METI tales como fenazaquin, fenpiroximato, pirimidifeno, piridaben, tebufenpirad o tolfenpirad, o M.21B rotenona;
- M.22 bloqueadores de los canales de sodio dependientes de la tensión, por ejemplo
M.22A indoxacarb, o M.22B metaflumizona o M.22C 1-[(E)-[2-(4-cianofenil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etilidén]amino]-3-[4-(difluorometoxi) fenil] urea;
- M.23 inhibidores de la acetil CoA carboxilasa, tales como derivados de ácido tetrónico y tetrámico, por ejemplo espirodiclofeno, espiromesifeno o spirotetramat;
- M.24 Inhibidores del transporte de electrones en el complejo IV mitocondrial, por ejemplo
M.24A fosfina, tal como fosfuro de aluminio, fosfuro de calcio, fosfina o fosfuro de zinc, o M.24B cianuro.
- M.25 Inhibidores del transporte de electrones en el complejo II mitocondrial, tales como derivados de beta-cetonitrilo, por ejemplo cienopirafeno o ciflumetofeno;
- M.28 moduladores del receptor de rianodina de la clase de diamidas, como por ejemplo flubendiamida,

- clorantraniliprol (rinaxipir®), ciantraniliprol (cyazypyr®), o los compuestos de ftalamida
- M.28.1: (R)-3-Cloro-N1-{2-metil-4-[1,2,2,2-Tetrafluor-1-(trifluorometil) etil] fenil}-N2-(1-metil-2-metilsulfoniletil)ftalamida y
- M.28.2: (S)-3-Cloro-N1-{2-metil-4-[1,2,2,2-Tetrafluor-1-(trifluorometil) etil] fenil}-N2-(1-metil-2-metilsulfoniletil)ftalamida, o el compuesto
- M.28.3: 3-bromo-N-{2-bromo-4-cloro-6-[(1-ciclopropiletil)carbamoil]fenil}-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-carboxamida (nombre propuesto ISO: ciclaniliprolo), o el compuesto
- M.28.4: metil-2-[3,5-dibromo-2-([3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil)amino]benzoil]-1,2-dimetilhidrazinacarboxilato; o un compuesto seleccionado de M.28.5a) a M.28.5l):
- M.28.5a) N-[4,6-dicloro-2-[(dietil-lambda-4-sulfaniliden)carbamoil] fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil)pirazol-3-carboxamida;
- M.28.5b) N-[4-cloro-2-[(dietil-lambda-4-sulfaniliden)carbamoil]-6-metil-fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil)pirazol-3-carboxamida;
- M.28.5c) N-[4-cloro-2-[(di-2-propil-lambda-4-sulfaniliden)carbamoil]-6-metil-fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil)pirazol-3-carboxamida;
- M.28.5d) N-[4,6-dicloro-2-[(di-2-propil-lambda-4-sulfaniliden)carbamoil]fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil)pirazol-3-carboxamida;
- M.28.5e) N-[4,6-dicloro-2-[(dietil-lambda-4-sulfaniliden)carbamoil]fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(difluorometil)pirazol-3-carboxamida;
- M.28.5f) N-[4,6-dibromo-2-[(di-2-propil-lambda-4-sulfaniliden)carbamoil]fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil)pirazol-3-carboxamida;
- M.28.5g) N-[4-cloro-2-[(di-2-propil-lambda-4-sulfaniliden)carbamoil]-6-cianofenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil)pirazol-3-carboxamida;
- M.28.5h) N-[4,6-dibromo-2-[(dietil-lambda-4-sulfaniliden)carbamoil]-fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil)pirazol-3-carboxamida;
- M.28.5i) N-[2-(5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-il)-4-cloro-6-metil-fenil]-5-bromo-2-(3-cloro-2-piridil)pirazol-3-carboxamida;
- M.28.5j) 5-cloro-2-(3-cloro-2-piridil)-N-[2,4-dicloro-6-[(1-ciano-1-metiletil)carbamoil]fenil]pirazol-3-carboxamida;
- M.28.5k) 5-bromo-N-[2,4-dicloro-6-(metilcarbamoil)fenil]-2-(3,5-dicloro-2-piridil)pirazol-3-carboxamida;
- M.28.5l) N-[2-(terc-butylcarbamoil)-4-cloro-6-metil-fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(fluorometoxi)pirazol-3-carboxamida; o un compuesto seleccionado de
- M.28.6 N2-(1-ciano-1-metil-etil)-N1-(2,4-dimetilfenil)-3-yodo-ftalimida; o
- M.28.7 3-cloro-N2-(1-ciano-1-metil-etil)-N1-(2,4-dimetilfenil)ftalamida;
- M.UN.X compuestos activos insecticidas de modo desconocido o incierto de acción, como por ejemplo azadiractina, amidoflumet, benzoximato, bifenazato, bromopropilato, quinometionato, criolita, dicofol, flufenerim, flometoquin, fluensulfona, flupiradifurona, butóxido de piperonilo, piridalilo, pirifluquinazona, sulfoxaflor, piflubumida o los compuestos
- M.UN.X.1: 4-[5-(3,5-dicloro-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-isoxazol-3-il]-2-metil-N-[(2,2,2-trifluoro-etilcarbamoil)-metil]-benzamida, o el compuesto
- M.UN.X.2: 1,1 - [(3S, 4R, 4aR, 6S, 6aS, 12R, 12aS, 12bS)-4-[[2-ciclopropilacetil]oxi]metil] 1,3,4,4a, 5,6,6a, 12,12a, 12b-decahidro-12-hidroxi-4, 6a, 12b-trimetil-11-oxo-9-(3-piridinil)-2H,11H-nafto [2,1-b]pirano [3,4-e] piran-3,6-dil] éster del ácido ciclopropanoacético, o el compuesto
- M.UN.X.3: 11-(4-cloro-2,6-dimetil-fenil)-12-hidroxi-1,4-dioxa-9-azadispiro [4.2.4.2]tetradec-11-en-10-ona, o el compuesto
- M.UN.X.4: 3-(4'-fluoro-2,4-dimetilbifenil-3-il)-4-hidroxi-8-oxa-1-azaespiro [4.5]dec-3-en-2-ona, o el compuesto
- M.UN.X.5: 1-[2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfonil]fenil]-3-(trifluorometil)-1H-1,2,4-triazol-5-amina, o activos sobre la base de *Bacillus firmus* (Votivo, I-1582); o
- M.UN.X.6: un compuesto seleccionado del grupo de
- M.UN.X.6a) (E/Z)-N-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-2,2,2-trifluoroacetamida;
- M.UN.X.6b) (E/Z)-N-[1-[(6-cloro-5-fluoro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]2,2,2-trifluoroacetamida;
- M.UN.X.6c) (E/Z)-2,2,2-trifluoro-N-[1-[(6-fluoro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]acetamida;
- M.UN.X.6d) (E/Z)-N-[1-[(6-bromo-3-piridil)metil]-2-piridiliden]2,2,2-trifluoroacetamida;
- M.UN.X.6e) (E/Z)-N-[1-[(6-cloro-3-piridil)etil]-2-piridiliden]2,2,2-trifluoroacetamida;
- M.UN.X.6f) (E/Z)-N-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-2,2-difluoroacetamida;
- M.UN.X.6g) (E/Z)-2-cloro-N-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-2,2-difluoroacetamida;
- M.UN.X.6h) (E/Z)-N-[1-[(2-cloropirimidin-5-il)metil]-2-piridiliden]2,2,2-trifluoroacetamida y
- M.UN.X.6i) (E/Z)-N-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]2,2,3,3,3-pentafluoropropanamida; o los compuestos
- M.UN.X.7: 3-[3-cloro-5-(trifluorometil)fenil]-4-oxo-1-(pirimidin-5-ilmetil)pirido[1,2-a]pirimidin-1-ilo-2-olato; o
- M.UN.X.8: 8-cloro-N-[2-cloro-5-metoxifenil]sulfonil]-6-trifluorometilimidazo[1,2-a]piridina-2-carboxamida; o
- M.UN.X.9: 4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il]-2-metil-N-(1-oxothietan-3-il)benzamida; o
- M.UN.X.10: 5-[3-[2,6-dicloro-4-(3,3-dicloroaliloxi)fenoxi]propoxi]-1H-pirazol; o
- M.UN.X.11: 4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il]-2-metil-N-[2-oxo-2-(2,2,2-trifluoroetilamino)etil]benzamida; o
- M.UN.X.12: 4-[5-[3-cloro-5-(trifluorometil)fenil]-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il]-N-[2-oxo-2-(2,2,2-trifluoroetilamino)etil]naftaleno-1-carboxamida.

Los compuestos comercialmente disponibles del grupo M enumerados anteriormente pueden encontrarse en The Pesticide Manual, 15ª Edición, CDS Tomlin, British Crop Protection Council (2011) entre otras publicaciones.

El derivado de quinolina flometoquin ase muestra en el documento WO2006/013896. Los compuestos de aminofuranona flupiradifuronas se conocen en el documento WO 2007/115644. El compuesto de sulfoximina sulfoxaflor se conoce en el documento WO2007/149134. El acaricida piflubumida se conoce de WO2007/020986. Los compuestos de isoxazolina se han descrito: M.UN.X.1 en el documento WO2005/085216, M.UN.X.9 en WO2013/050317, M.UN.X.11 en el documento WO2005/085216 y M.UN.X. en los documentos WO2009/002809 y WO2011/149749. El derivado de piriropeno M.UN.X.2 se ha descrito en el documento WO 2006/129714. El derivado de cetoenol cíclico sustituido con espiroacetálico M.UN.X.3 se conoce en WO2006/089633 y el derivado de cetoenol espirocíclico sustituido con bifenilo M.UN.X.4 en WO2008/067911. Finalmente el triazoilfenilsulfuro como M.UN.X.5 se ha descrito en el documento WO2006/043635 y agentes de control biológico en base de *bacillus firmus* en WO2009/124707. Los neonicotinoides 4A.1 se conocen en WO2012/069266 y WO2011/06946, el M.4.A.2 de WO2013/003977, el M4.A.3. de WO2010/069266.

El análogo de metaflumizona M.22.C se describe en CN 10171577. Las ftalamidas M.28.1 y M.28.2 son ambas conocidos en el documento WO 2007/101540. La antranilamida M.28.3 se ha descrito en el documento WO2005/077934. El compuesto de hidrazida M.28.4 se ha descrito en el documento WO 2007/043677. Las antranilamidas M.28.5a) a M.28.5h) se pueden preparar tal como se describen en los documentos WO 2007/006670, WO2013/024009 y WO2013/024010, la antranilamida M.28.5i) se describe en WO2011/085575, el M.28.5 j) en el documento WO2008/134969, el M.28.5k) en US2011/046186 y el M.28.5l) en WO2012/034403. Los compuestos de diamida M.28.6 y M.28.7 se pueden encontrar en CN102613183. Los compuestos M.UN.X.6a) a M.UN.X.6i) enumerados en M.UN.X.6 se han descrito en WO2012/029672. El compuesto antagonista mesoiónico M.UN.X.7 se describe en WO2012/092115, el nematocida M.UN.X.8 en WO2013/055584 y el análogo de tipo piridililo M.UN.X.10 en WO2010/060379.

Los ingredientes plaguicidas activos adicionales preferidos son los seleccionados del grupo IRAC 1, los inhibidores de acetilcolinesterasa (AChE), en el presente documento del grupo 1A (Carbamatos) tiodicarb, metomil y carbarilo, y del grupo 1B (organofosfatos), especialmente acefato, clorpirifos y dimetoato, del grupo 2B, los fiproles, aquí especialmente etiprol y fipronilo, del grupo 3, los piretroides, aquí especialmente lambda-cihalotrina, alfa-cipermetrina o deltametrina, y del grupo 4A, los neonicotinoides, aquí especialmente acetamiprid, clotianidina, dinotefurano, imidacloprid, nitenpiram, tiacloprid o tiametoxam.

Especialmente, las combinaciones de compuestos de la invención con fiproles, neonicotinoides o piretroides, posiblemente pueden exhibir un control sinérgico de chinches apestosas (de acuerdo con la fórmula de Colby), en particular Euschistus, por ejemplo, Euschistus heros.

La siguiente lista F de sustancias activas, junto con los que se pueden utilizar los compuestos según la invención, pretende ilustrar las posibles combinaciones, pero no se limita a las mismas:

F.I) Inhibidores de respiración

F.I-1) Inhibidores del complejo III en el sitio Qo:

estrobilurinas: azoxistrobina, coumetoxiestrobina, coumoxiestrobina, dimoxiestrobina, enestroburina, fluoxaestrobina, cresoxim-metilo, metominoestrobina, orisaestrobina, picoxiestrobina, piraclóestrobina, pirametoestrobina, piraoxiestrobina, piribencarb, triclopircarb/clorodincarb, trifloxistrobina, éster metílico del ácido 2-[2-(2,5-dimetil-fenoximetil)-fenil]-3-metoxi-acrílico y 2(2-(3-(2,6-diclorofenil)-1-metil-alilidenaminoximetil)-fenil)-2-metoxiimino-N-metil acetamida; oxazolidindionas y imidazolinonas: famoxadona, fenamidona;

F.I-2) Inhibidores de complejo II FI-2) (por ejemplo carboxamidas)

carboxanilidas: benodanilo, benzovindiflupir, bixafen, boscalid, carboxin, fenfuram, fenhexamida, fluopiram, flutolanilo, furametpir, isopirazam, isotianilo, mepronilo, oxicarboxin, penflufeno, pentiopirad, sedaxano, teclotalam, tifluzamida, tiadinilo, 2-amino-4-metil-tiazol-5-carboxanilida, N-(3',4',5'-trifluorobifenil-2-il)-3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida (fluxaproxad), N-(4'-trifluorometiltiobifenil-2-il)-3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, N-(2-(1,3,3-trimetil-butyl)-fenil)-1,3-dimetil-5-fluoro-1H-pirazol-4-carboxamida, 3-(difluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida, 3-(trifluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida, 1,3-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida, 3-(trifluorometil)-1,5-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida, 3-(difluorometil)-1,5-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida, 1,3,5-trimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida, 3-(difluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida, 3-(trifluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida, 1,3-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida, 3-(trifluorometil)-1,5-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida, 3-(difluorometil)-1,5-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida, 1,3,5-trimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida;

F.I-3) Inhibidores de complejo III en el sitio Qi: ciazofamida, amisulbrom, [(3S, 6S, 7R, 8R)-8-bencil-3-[(3-acetoxi-4-metoxi-piridina-2-carbonil)amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-il]2-metilpropanoato, [(3S, 6S, 7R, 8R)-8-bencil-3-[[3-(acetoximetoxi)-4-metoxi-piridina-2-carbonil] amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-il]-2-metilpropanoato, [(3S, 6S, 7R, 8R)-8-bencil-3-[(3-isobutoxicarboniloxi-4-metoxi-piridina-2-carbonil)amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-il]-2-metilpropanoato, [(3S, 6S, 7R, 8R)-8-bencil-3-[[3-(1,3-benzodioxol-5-ilmetoxi)-4-metoxi-piridina-2-carbonil]

- amino] -6-metil-4, 9-dioxo-1,5-dioxonan-7-il]-2-metilpropanoato, 3S, 6S, 7R, 8R)-3-[[[3-hidroxi-4-metoxi-2-piridinil] carbonil] amino] -6 metil-4,9-dioxo-8-(fenilmetil)-1,5-dioxonan-7-il-2-metilpropanoato;
- F.I-4) Otros inhibidores de la respiración (complejo I, desacopladores) diflumetorim; (5,8-difluoro-quinazolin-4-il)-{2-[2-fluoro-4-(4-trifluorometil-piridin-2-iloxi)-fenil]-etil}-amina; tecnazen; ametoctradina; siltiofam; derivados de nitrofenilo: binapacril, dinobuton, dinocap, fluazinam, ferimzona, nitrtral-isopropilo, y que incluyen compuestos organometálicos: sales de fentina, tales como fentin-acetato, cloruro de fentina o hidróxido de fentina;
- F.II) Inhibidores de la biosíntesis de esteroles (fungicidas SBI)
- F.II-1) inhibidores de C₁₄ desmetilasa (fungicidas DMI, por ejemplo, triazoles, imidazoles) triazoles: azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanilo, paclobutrazol, penconazol, propiconazol, protioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, triticonazol, uniconazol, 1- [rel-(2S, 3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiranilmetil]-5-tiocianato-1H-[1,2,4] triazol, 2-[rel-(2S, 3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiranilmetil]2H-[1,2,4] triazol-3-tiol; imidazoles: imazalilo, pefurazoato, oxpoconazol, procloraz, triflumizol; pirimidinas, piridinas y piperazinas: fenarimol, nuarimol, pirifenox, triforina, 1-[rel-(2S, 3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiranilmetil]-5-tiocianato-1H- [1,2,4] triazol, 2-[rel-(2S,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiranilmetil]2H-[1,2,4] triazol-3-tiol;
- F.II-2) Inhibidores de Delta¹⁴-reductasa (Aminas, por ejemplo morfollinas, piperidinas) morfollinas: aldimorf, dodemorf, dodemorf acetato, fenpropimorf, tridemorf; piperidinas: fenpropidin, piperalina; espirocetalaminas: espiroxamina;
- F.II-3) Inhibidores de 3-cetoreductasa: hidroxianilidas: fenhexamida;
- F.III) Inhibidores de la síntesis de ácido nucleico
- F.III-1) fenilamidas de síntesis de ADN o ARN o fungicidas de acil aminoácidos: benalaxilo, benalaxil-M, kiralaxilo, metalaxilo, metalaxilo-M (mefenoxam), ofurace, oxadixilo; isoxazoles y iosotiazolonas: himexazol, octilina;
- F.III-2) Inhibidores de ADN topoisomerasas: ácido oxolínico;
- F.III-3) metabolismo de nucleótidos (por ejemplo, adenosina-desaminasa), hidroxil (2-amino)pirimidinas: bupirinato;
- F.IV) inhibidores de la división celular y/o citoesqueleto
- F.IV-1) inhibidores de tubulina: benzimidazoles y tiofanatos: benomilo, carbendazim, fuberidazol, tiabendazol, tiofanato-metilo; triazolopirimidinas: 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)-[1,2,4]triazolo[1,5a]pirimidina;
- F.IV-2) Otros inhibidores de la división celular
- benzamidas y fenilacetamidas: dietofencarb, etaboxam, pencicurón, fluopicolide, zoxamida;
- F.IV-3) Inhibidores de actina: Benzofenonas: metrafenona, piriofenona;
- F.V) inhibidores de la síntesis de aminoácidos y proteínas
- F.V-1) inhibidores de la síntesis de metionina (anilino-pirimidinas) anilino-pirimidinas: ciprodinilo, mepanipirim, nitrapirina, pirimetanilo;
- F.V-2) Inhibidores de la síntesis de proteínas (anilino-pirimidinas) antibióticos: blasticidina-S, kasugamicina, clorhidrato-hidrato kasugamicina, mildiomicina, estreptomocina, oxitetraciclina, polioxina, validamicina A;
- F.VI) inhibidores de la transducción de señales
- F.VI-1) Inhibidores de MAP/histidina quinasa (por ejemplo, anilino-pirimidinas) dicarboximidias: fluoroimid, iprodiona, procimidona, vinclozolina; fenilpirroles: fencipclonilo, fludioxonilo;
- F.VI-2) inhibidores de la proteína G: quinolinas: quinoxifeno;
- F.VII) Inhibidores de la síntesis de lípidos y membrana
- F.VII-1) inhibidores de la biosíntesis de fosfolípidos
- compuestos organofosforados: edifenfos, iprobenfos, pirazofos; ditiolanos: isoprotiolano;
- F.VII-2) peroxidación de lípidos: hidrocarburos aromáticos: dicloran, quintoceno, tecnaceno, tolclofos-metilo, bifenilo, cloroneb, etridiazol;
- F.VII-3) Amidas de ácido carboxílico (fungicidas CAA)
- amidas de ácido cinámico o mandélico: dimetomorf, flumorf, mandiproamid, pirimorf; carbamatos de valinamida: bentiavalicarb, iprovalicarb, piribencarb, valifenalato y éster 4-fluorofenílico del ácido N-(1-(1-(4-ciano-fenil)etanosulfonilo)-but-2-il)carbámico;
- F.VII-4) compuestos que afectan a la permeabilidad de la membrana celular y ácidos grasos: 1-[4-[4-[5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, carbamatos: propamocarb, propamocarb clorhidrato,
- F.VII-5) inhibidores de la hidrolasa de amida de ácido graso: 1-[4-[4-[5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona;
- F.VIII) inhibidores con acción multisitio
- F.VIII 1) sustancias activas inorgánicas: caldo bordelés, acetato de cobre, hidróxido de cobre, oxiclورو de cobre,

sulfato de cobre básico, azufre;

F.VIII-2) tio y ditiocarbamatos: ferbam, mancozeb, maneb, metam, methasulphocarb, metiram, propineb, tiram, zineb, ziram;

5 F.VIII-3) Compuestos organoclorados (por ejemplo ftalimidias, sulfamidias, cloronitrilos): anilazina, clorotalonilo, captafol, captan, folpet, diclofluanida, diclorofeno, flusulfamida, hexaclorobenceno, pentaclorofenol y sus sales, ftalida, tolilfluanida, N-(4-cloro-2-nitro-fenil)-N-etil-4-metil-bencenosulfonamida;

F.VIII-4) Guanidinas y otros: guanidina, dodina, base libre de dodina, guazatina, guazatina-acetato, iminocadina, iminocadina triacetato, iminocadina-tris (albesilato), 2,6-dimetil-1H,5H-[1,4] ditiino [2,3-c: 5,6-c']dipirrol-1,3,5,7 (2H, 6H) -tetraona;

10 F.VIII-5) Antraquinonas: ditianona;

F.IX) inhibidores de la síntesis de la pared celular

F.IX-1) inhibidores de la síntesis de glucano: validamicina, polioxina B;

15 F.IX-2) Inhibidores de la síntesis de melanina: piroquilon, triciclazol, carpropamida, diciclotmet, fenoxanilo;

FX) inductores de defensa de la planta

FX-1) ruta del ácido salicílico: acibenzolar-S-metilo;

20 FX-2) Otros: probenazol, isotianilo, tiadinilo, prohexadiona de calcio; fosfonatos: fosetilo, fosetil-aluminio, ácido fosforoso y sus sales;

F.XI) modo de acción desconocido: bronopol, quinometionato, ciflufenamida, cimoxanilo, dazomet, debacarb, diclomezina, difenzoquat, difenzoquat-metilsulfato, diphenilamin, fenpirazamina, flumetover, flusulfamida, flutianilo, metasulfocarb, nitrapirina, nitrotal-isopropilo, oxatiapiprolina, Oxin-cobre, proquinazid, tebufloquin, tecloftalam, triazóxido, 2-butoxi-6-yodo-3-propilcromen-4-ona, N-(ciclopropilmetoxiimino-(6-difluoro-metoxi-2,3-difluoro-fenil)-metil)-2-fenil acetamida, N'-(4-(4-cloro-3-trifluorometil-fenoxi)-2,5-dimetil-fenil)-N-etil-N-metil-formamidina, N'(4-(4-fluoro-3-trifluorometil-fenoxi)-2,5-dimetil-fenil)-N-etil-N-metil formamidina, N'-(2-metil-5-trifluorometil-4-(3-trimetil-propoxi)-fenil)-N-etil-N-metil formamidina, N'-(5-difluorometil-2 metil-4-(3-trimetil-propoxi)-fenil)-N-etil-N-metil formamidina, (1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-il)-amida de ácido 2-[1-[2-(5-metil-3-trifluorometil-pirazol-1-il)-acetil]-piperidin-4-il]metil-tiazol-4-carboxílico, metil-(R)-1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-il-amida del ácido 2-[1-[2-(5-metil-3-trifluorometil-pirazol-1-il) -acetil]-piperidin-4-il]tiazol-4-carboxílico, éster 6-terc-butyl-8-fluoro-2,3-dimetil-quinolin-4-ílico del ácido metoxi-acético y N-metil-2-[1-[(5-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-1-il)-acetil]-piperidin-4-il]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il]-4-tiazolcarboxamida, 3-[5-(4-cloro-fenil)-2,3-dimetil-isoxazolidin-3-il]-piridina, pirisoxazol, éster S-alílico del ácido 5-amino-2-isopropil-3-oxo-4-orto-tolil-2,3-dihidro-pirazol-1-carbotioico, amida del ácido N-(6-metoxi-piridin-3-il)ciclopropanocarboxílico, 5-cloro-1-(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)-2-metil-1H-benzoimidazol, 2-(4-cloro-fenil)-N-[4-(3,4-dimetoxi-fenil)isoxazol-5-il]-2-prop-2-iniloxi-acetamida,

25
30
35

F.XII) Reguladores de crecimiento: ácido abscísico, amidoclor, ancimidol, 6-bencilaminopurina, brasinolida, butralina, clormecuat (cloruro de clormecuat), cloruro de colina, ciclanilida, daminozida, dikegulac, dimetipin, 2,6-dimetilpuridina, etefon, flumetralina, flurprimidol, flutiacet, forclorfenurón, ácido giberélico, inabenfida, ácido indol-3-acético, hidrazida maleica, mefluidida, mepiquat (cloruro de mepiquat), ácido naftalenacético, N 6-benciladenina, paclobutrazol, prohexadiona (prohexadiona de calcio), prohidrojasmon, tidiazurón, triapentenol, fosforotritioato de tributilo, ácido 2,3,5-triyodobenzoico, trinexapac-etilo y uniconazol;

40

F.XIII) Agentes de control biológico

45 *Ampelomyces quisqualis* (por ejemplo, AQ 10® de Intrachem Bio GmbH & Co. KG, Alemania), *Aspergillus flavus* (por ejemplo AFLAGUARD® de Syngenta, CH), *Aureobasidium pullulans* (por ejemplo BOTECTOR® de bio-ferm GmbH, Alemania), *Bacillus pumilus* (por ejemplo, N° de Acceso NRRL B-30087 en SONATA® y BALLAD® Plus de AgraQuest Inc., EE.UU.), *Bacillus subtilis* (por ejemplo, NRRL-Nr. B- 21661 aislado en RHAPSODY®, SERENADE®MAX y SERENADE® ASO de AgraQuest Inc., EE.UU.), *Bacillus subtilis* var. *amiloliquefaciens* FZB24 (por ejemplo TAEGRO® de Novozyme Biologicals, Inc., EE.UU.), *Candida oleophila* I-82 (por ejemplo ASPIRE® de Ecogen Inc., EE.UU.), *Candida saitoana* (por ejemplo BIOCURE® (en mezcla con liozima) y BIOCOAT® de Micro Flo Company, EE.UU. (BASF SE) y Arysta), quitosano (por ejemplo, ARMOR-ZEN de BotriZen Ltd., NZ), *Clonostachys rosea* f. *catenulata*, también llamado *Gliocladium catenulatum* (por ejemplo, aislado de J1446: PRESTOP® de Verdera, Finlandia), *Coniothyrium minitans* (por ejemplo CONTANS® de Prophyta, Alemania),

50
55
60
65

Cryphonectria parasitica (por ejemplo *Endothia parasitica* de CNICM, Francia), *Cryptococcus albidus* (por ejemplo, YIELD PLUS® de Anchor Bio-Technologies, Sudáfrica), *Fusarium oxysporum* (por ejemplo BIOFOX® de S.I.A.P.A., Italia), FUSACLEAN® de Natural Plant Protection, Francia), *Metschnikowia fructicola* (por ejemplo SHERMER® de AgroGreen, Israel), *Microdochium dimerum* (por ejemplo ANTIBOT® de Agrauxine, Francia), *Phebiopsis gigantea* (por ejemplo ROTSOP® de Verdera, Finlandia), *Pseudozyma flocculosa* (por ejemplo SPORODEX® Plant Products Co. Ltd., Canadá), *Pythium oligandrum* DV74 (por ejemplo POLYVER-SUM® de Remeslo SSRO, Biopreparaty, Czech Rep.), *Reynoutria sachlinensis* (por ejemplo REGALIA® de Marrone BioInnovations, EE.UU.), *Talaromyces flavus* V117b (por ejemplo, PRO-TUS® de Prophyta, Alemania), *Trichoderma asperellum* SKT-1 (por ejemplo, ECO-HOPE® de Kumiai Chemical Industry Co., Ltd., Japón), *T. atroviride* LC52 (por ejemplo SENTINEL® de Agrimm Technologies Ltd, NZ), *T. harzianum* T-22 (por ejemplo PLANTSHIELD® der Firma BioWorks Inc., EE.UU.), *T. harzianum* TH 35 (por ejemplo ROOT PRO® de MyControl Ltd., Israel), *T. harzianum* T-39 (por ejemplo

TRICHODEX® y TRICHODERMA 2000® de MyControl Ltd., Israel y Makhteshim Ltd., Israel), *T. harzianum* y *T. viride* (por ejemplo TRI-CHOPEL de Agrimm Technologies Ltd, NZ), *T. harzianum* ICC012 y *T. viride* ICC080 (por ejemplo REMEDIER®WP de Isagro Ricerca, Italia), *T. polysporum* y *T. harzianum* (por ejemplo BINAB® de BINAB Bio-Innovation AB, Suecia), *T. stromaticum* (por ejemplo TRICOVAB® de C.E.P.L.A.C., Brasil), *T. virens* GL-21 (por ejemplo SOILGARD® de Certis LLC, EE.UU.), *T. viride* (por ejemplo TRIECO® de Ecosense Labs. (India) Pvt. Ltd., Indien, BIOSECURE® F de T. Stanes & Co. Ltd., India), *T. viride* TV1 (por ejemplo, T. viride TV1 de Agribiotec srl, Italia), *Ulocladium oudemansii* HRU3 (por ejemplo BOTRY-ZEN® de Botry-Zen Ltd, NZ).

Los compuestos disponibles comercialmente II del grupo F enumerados anteriormente se pueden encontrar en The Pesticide Manual, 15ª Edición, CDS Tomlin, British Crop Protection Council (2011) entre otras publicaciones. Su preparación y su actividad contra los hongos dañinos son conocidas (cf.: <http://www.alanwood.net/pesticides/>); estas sustancias están disponibles comercialmente. Los compuestos descritos mediante la nomenclatura de la IUPAC, su preparación y su actividad fungicida son también conocidos (cf. Can J. Plant Sci 48 (6), 587-94, 1968;.. EP A 141 317; EP-A 152 031; EP- A 226 917; EP A 243 970; EP A 256 503; EP-A 428 941; EP-A 532 022; EP-A 1 028 125; EP-A 1 035 122; EP A 1 201 648; EP A 1 122 244, JP 2002316902; DE 19650197; DE 10021412; DE 102 005 009 458, US 3.296.272, US 3.325.503; WO 98/46608; WO 99/14187; WO 99/24413; WO 99/27783; WO 00/29404; WO 00/46148; El documento WO 00/65913; WO 01/54501; WO 01/56358; WO 02/22583; WO 02/40431; WO 03/10149; WO 03/11853; WO 03/14103; WO 03/16286; WO 03/53145; El documento WO 03/61388; WO 03/66609; WO 03/74491; WO 04/49804; WO 04/83193; WO 05/120234; WO 05/123689; WO 05/123690; WO 05/63721; WO 05/87772; WO 05/87773; WO 06/15866; WO 06/87325; WO 06/87343; WO 07/82098; WO 07/90624, WO 11/028657).

Los compuestos de la invención se pueden mezclar con tierra, turba u otros medios de enraizamiento para la protección de plantas contra enfermedades fúngicas transmitidas por semillas, suelo o foliar.

Los ejemplos de agentes sinérgicos adecuados para uso en las composiciones incluyen butóxido de piperonilo, sesamex, safroxan y dodecil imidazol.

Los herbicidas y reguladores del crecimiento de las plantas para su inclusión en las composiciones dependerán del objetivo pretendido y del efecto requerido.

Un ejemplo de un herbicida selectivo de arroz que puede incluirse es propanil. Un ejemplo de un regulador del crecimiento vegetal para su uso en el algodón es PIX®.

Algunas mezclas pueden comprender ingredientes activos que tienen significativamente diferentes propiedades biológicas, físicas, químicas, de manera que no se prestan fácilmente a la misma.

La plaga de invertebrados (también referido como "plaga animal"), es decir, los insectos, arácnidos y nemátodos, la planta, el suelo o el agua en la que la planta está creciendo o puede crecer puede ponerse en contacto con los compuestos de la presente invención o la composición o composiciones que los comprenden mediante cualquier procedimiento de aplicación conocido en la técnica. Como tal, "poner en contacto" incluye tanto contacto directo (aplicar los compuestos/composiciones directamente sobre la plaga de invertebrados o planta, típicamente al follaje, tallo o raíces de la planta) como contacto indirecto (aplicar los compuestos/composiciones al locus de la plaga de invertebrados o plantas).

Los compuestos de la presente invención o las composiciones plaguicidas que los comprenden se pueden utilizar para proteger las plantas y los cultivos en crecimiento del ataque o infestación por plagas animales, especialmente insectos, acáridos o arácnidos por contacto de la planta/cultivo con una cantidad plaguicida eficaz de compuestos de la presente invención. El término "cultivo" se refiere tanto a cultivos en crecimiento como cultivos cosechados.

Los compuestos de la presente invención y las composiciones que los comprenden son particularmente importantes en el control de una multitud de insectos en diversas plantas cultivadas, tales como cereales, cultivos de raíz, cultivos oleaginosos, vegetales, especias, plantas ornamentales, por ejemplo semillas de trigo duro y otras semillas de trigo, cebada, avena, centeno, maíz (maíz forrajero maíz de azúcar/dulce y maíz de campo), soja, cultivos de aceite, crucíferas, algodón, girasoles, bananas, arroz, colza de semilla oleaginosa, nabo colza, remolacha azucarera, remolacha forrajera, berenjenas, patatas, hierba, césped, pasto, hierba forrajera, tomates, puerros, calabaza, col, lechuga iceberg, pimiento, pepinos, melones, especies de Brassica, melones, judías, guisantes, ajo, cebollas, zanahorias, plantas tuberculosas tales como patatas, caña de azúcar, tabaco, uvas, petunias, geranios/pelargonios, pensamientos y alegría de la casa.

Los compuestos de la presente invención se emplean como tales o en forma de composiciones por tratamiento de los insectos o las plantas, materiales de propagación de plantas, tales como semillas, suelos, superficies, materiales o espacios a proteger del ataque insecticida con una cantidad insecticida eficaz de los compuestos activos. La aplicación puede llevarse a cabo tanto antes como después de la infección de las plantas, materiales de propagación de plantas, tales como semillas, suelos, superficies, materiales o espacios por los insectos.

Además, las plagas de invertebrados pueden ser controladas poniendo en contacto la plaga objetivo, su suministro de alimentos, hábitat, lugar de reproducción o su locus con una cantidad plaguicida eficaz de compuestos de la presente invención. Como tal, la aplicación puede llevarse a cabo antes o después de la infección del locus, de los

cultivos en crecimiento, o cultivos cosechados por la plaga.

Los compuestos de la presente invención también se pueden aplicar preventivamente a lugares en los que se espera la aparición de las plagas.

5 Los compuestos de la presente invención se pueden también utilizar para proteger plantas en crecimiento del ataque o infestación por plagas poniendo en contacto la planta con una cantidad plaguicida eficaz de los compuestos de la presente invención. Como tal, "poner en contacto" incluye tanto contacto directo (aplicar los compuestos/composiciones directamente sobre la plaga y/o planta, típicamente al follaje, tallo o raíces de la planta) como contacto indirecto (aplicar los compuestos/composiciones al locus de la plaga y/o planta).

10 "Locus" significa un hábitat, lugar de reproducción, planta, semilla, suelo, área, material o entorno en el cual una plaga o parásito está creciendo o puede crecer.

En general, "cantidad plaguicida eficaz" significa la cantidad de ingrediente activo necesaria para lograr un efecto observable sobre el crecimiento, incluyendo los efectos de necrosis, muerte, retardo, prevención, y eliminación, destrucción, o bien disminución de la aparición y la actividad del organismo objetivo. La cantidad plaguicida eficaz puede variar para los diversos compuestos/composiciones usados en la invención. Una cantidad plaguicida eficaz de las composiciones variará también de acuerdo con las condiciones imperantes, tales como el efecto plaguicida deseado y la duración, el clima, especies objetivo, locus, modo de aplicación, y similares.

15 En el caso de tratamiento del suelo o de aplicación al hábitat o nido de las plagas, la cantidad de ingrediente activo varía de 0,0001 a 500 g por 100 m², preferiblemente de 0,001 a 20 g por 100 m².

Las tasas de aplicación habituales en la protección de materiales son, por ejemplo, de 0,01 g a 1000 g de compuesto activo por m² de material tratado, deseablemente de 0,1 g a 50 g por m².

Las composiciones insecticidas para uso en la impregnación de materiales contienen típicamente de 0,001 a 95% en peso, preferiblemente de 0,1 a 45% en peso, y más preferiblemente de 1 a 25% en peso de al menos un repelente y/o insecticida.

25 Para el uso en el tratamiento de plantas de cultivo, la tasa de aplicación de los ingredientes activos de esta invención puede estar en el intervalo de 0,1 g a 4000 g por hectárea, deseablemente de 5 g a 500 g por hectárea, más deseablemente de 5 g a 200 g por hectárea.

Los compuestos de la presente invención son eficaces tanto a través de contacto (a través del suelo, vidrio, pared, mosquitero, alfombra, partes de plantas o partes de animales), como ingestión (cebo, o parte de planta).

30 Los compuestos de la presente invención también se pueden aplicar contra plagas de insectos no de cultivos, tales como hormigas, termitas, avispas, moscas, mosquitos, grillos, o cucarachas. Para uso contra dichas plagas no agrícolas, los compuestos de la presente invención se usan preferiblemente en una composición cebo.

El cebo puede ser un líquido, un sólido o una preparación semisólida (por ejemplo un gel). Los cebos sólidos se pueden formar en varias formas y formas adecuadas para la respectiva aplicación, por ejemplo gránulos, bloques, barras, discos. Los cebos líquidos se pueden llenar en varios dispositivos para asegurar la aplicación apropiada, por ejemplo recipientes abiertos, dispositivos de pulverización, fuentes de goteo, o fuentes de evaporación. Los geles pueden basarse en matrices acuosas u oleosas y se pueden formular para necesidades particulares en términos de pegajosidad, retención de humedad o características de envejecimiento. El cebo empleado en la composición es un

40 producto, que es suficientemente atractivo para incitar a insectos tales como hormigas, termitas, avispas, moscas, mosquitos, grillos etc., o cucarachas a comerlo. El atractivo se puede manipular mediante el uso de estimulantes de la alimentación o feromonas sexuales. Los estimulantes de la alimentación se escogen, por ejemplo, pero no exclusivamente, a partir de proteínas animales y/o vegetales (harina de carne, pescado o sangre, partes de insectos, yema de huevo), a partir de grasas y aceites de origen animal y/o vegetal, o monosacáridos, oligosacáridos o poliorganosacáridos, especialmente de sacarosa, lactosa, fructosa, dextrosa, glucosa, almidón, pectina o incluso melaza o miel. Partes frescas o en descomposición de frutas, cultivos, plantas, animales, insectos o partes específicas de los mismos también pueden servir como un estimulante de la alimentación. Las feromonas sexuales son conocidas por ser más específicas para los insectos. Feromonas específicas se describen en la literatura y son conocidas por los expertos en la técnica.

50 Para uso en composiciones de cebo, el contenido típico de ingrediente activo es de 0,001% en peso a 15% en peso, deseablemente de 0,001% en peso a 5% en peso de ingrediente activo.

Las formulaciones de compuestos de la presente invención en forma de aerosoles (por ejemplo en latas de aerosol), aerosoles de aceite o aerosoles de bomba son altamente adecuados para el usuario no profesional para controlar plagas tales como moscas, pulgas, garrapatas, mosquitos o cucarachas. Las recetas en aerosol se componen preferiblemente del compuesto activo, disolventes, tales como alcoholes inferiores (por ejemplo metanol, etanol, propanol, butanol), cetonas (por ejemplo acetona, metil etil cetona), hidrocarburos parafínicos (por ejemplo querosenos) que tienen intervalos de punto de ebullición de aproximadamente 50 a 250°C, dimetilformamida, N-metilpirrolidona, dimetilsulfóxido, hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno, xileno, agua, otros agentes auxiliares tales como emulsionantes, tales como monooleato de sorbitol, etoxilato de oleilo que tiene 3-7 moles de óxido de etileno, etoxilato de alcohol graso, aceites de perfume, tales como aceites etéreos, ésteres de ácidos grasos medios con alcoholes inferiores, compuestos aromáticos de carbonilo, si es apropiado, estabilizantes, tales como benzoato sódico, tensioactivos anfóteros, epóxidos inferiores, ortoformiato de trietilo y, si se requiere, propelentes, tales como propano, butano, nitrógeno, aire comprimido, dimetil éter, dióxido de carbono, óxido nitroso, o mezclas de estos gases.

65 Las formulaciones de pulverización en aceite difieren de las recetas de aerosol en que no se utilizan propelentes.

Para uso en composiciones de pulverización, el contenido de ingrediente activo es del 0,001 al 80% en peso, preferiblemente del 0,01 al 50% en peso y lo más preferiblemente del 0,01 al 15% en peso.

Los compuestos de la presente invención y sus respectivas composiciones también se pueden utilizar en mosquitos y bobinas de fumigación, cartuchos de humo, placas de vaporizador o vaporizadores a largo plazo y también en papeles contra las polillas, almohadillas para polillas u otros sistemas de vaporizador independiente de calor.

Los procedimientos para el control de enfermedades infecciosas transmitidas por insectos (por ejemplo, la malaria, el dengue y la fiebre amarilla, la filariasis linfática y leishmaniasis) con compuestos de la presente invención y sus respectivas composiciones también comprenden el tratamiento de superficies de chozas y casas, fumigación aérea y la impregnación de cortinas, tiendas de campaña, artículos de ropa, mosquiteros, trampa de la mosca tsetsé o similares. Las composiciones insecticidas para aplicación a fibras, telas, tejidos, telas no tejidas, material de red o láminas y lonas preferiblemente comprenden una mezcla que incluye el insecticida, opcionalmente un repelente y al menos un aglutinante. Los repelentes adecuados son por ejemplo, N,N-dietil-meta-toluamida (DEET), N,N-dietilfenilacetamida N-(DEPA), 1-(3-ciclohexan-1-carbonil-il)-2-metilpiperina, lactona del ácido (2-hidroximetilciclohexil)acético, 2-etil-1,3-hexanodiol, Indalona, metil neodecanamida (MNDA), un piretroide no utilizado para el control de insectos tal como {(+/-)-3-alil-2-metil-4-oxociclopent-2-(+)-enil-(+)-trans-crisantemato (esbiotrina), un repelente derivado de o idéntico con extractos de plantas como el limoneno, eugenol, (+)-Eucamalol (1), (-)-1-epi-eucamalol o extractos de crudos de plantas de planta como el eucalipto maculata, Vitex rotundifolia, Cymbopogon martinii, Cymbopogon citratus (hierba de limón), Cymbopogon nardus (citronela). Los aglutinantes adecuados se seleccionan por ejemplo a partir de polímeros y copolímeros de ésteres de vinilo de ácidos alifáticos (tales como acetato de vinilo y versatato de vinilo), ésteres acrílicos y metacrílicos de alcoholes, tales como acrilato de butilo, acrilato de 2-etilhexilo, y acrilato de metilo, hidrocarburos monoetilénicamente y dietilénicamente insaturados, tales como estireno, y dienos alifáticos, tales como butadieno.

La impregnación de cortinas y mosquiteros se hace en general sumergiendo el material textil en emulsiones o dispersiones del insecticida o rociándolos sobre las redes. Los compuestos de la presente invención y sus composiciones pueden usarse para proteger materiales de madera, tales como árboles, cercas de madera, peles, etc., y edificios, tales como casas, letrinas, fábricas, pero también materiales de construcción, muebles, cueros, fibras, artículos de vinilo, cables eléctricos y cables, de las hormigas y/o termitas, y para el control de hormigas y termitas por hacer daño a los cultivos o al ser humano (por ejemplo, cuando las plagas invaden casas e instalaciones públicas). Los compuestos de la presente invención se aplican no sólo a la superficie del suelo circundante o al suelo debajo del piso con el fin de proteger los materiales de madera, sino también se pueden aplicar a artículos cubiertos de madera, tales como superficies de hormigón bajo el suelo, postes de alcoba, vigas, maderas contrachapadas, muebles, etc., artículos de madera, tales como tableros de partículas, medios tableros, etc. y artículos de vinilo, tales como alambres revestidos eléctricos, láminas de vinilo, material aislante del calor, tales como espumas de estireno, etc. En caso de aplicación contra hormigas que hacen daño a los cultivos o seres humanos, el controlador de hormigas de la presente invención se aplica a los cultivos o al suelo circundante, o se aplica directamente al nido de las hormigas o similares.

Los compuestos de la presente invención son también adecuados para el tratamiento de material de propagación de plantas, especialmente semillas, con el fin de protegerlos de las plagas de insectos, en particular de plagas de insectos que viven en el suelo y las raíces de la planta resultante y brotes contra plagas del suelo e insectos foliares. Los compuestos de la presente invención son particularmente útiles para la protección de la semilla de plagas del suelo y las raíces y brotes de la planta resultante contra plagas del suelo e insectos foliares. Se prefiere la protección de las raíces y brotes de la planta resultante. Se prefiere más la protección de brotes resultantes de la planta de los insectos perforadores y chupadores, en el que la protección de los áfidos es el más preferido.

La presente invención comprende por lo tanto un procedimiento para la protección de semillas de insectos, en particular de insectos del suelo y de las raíces de las plantas de semillero y brotes de los insectos, en particular insectos de suelo y foliares, comprendiendo dicho procedimiento poner en contacto las semillas antes de la siembra y/o después de pregerminación con un compuesto de la presente invención, incluyendo una sal del mismo. Se prefiere particularmente un procedimiento, en el que se protegen las raíces y los brotes de plantas, más preferiblemente un procedimiento, en el que los brotes de las plantas se protegen de insectos chupadores y perforadores, más preferiblemente un procedimiento, en el que los brotes de plantas se protegen de los áfidos.

El término semilla abarca semillas y propágulos de plantas de todo tipo incluyendo, pero no limitado, a semillas verdaderas, trozos de semillas, retoños, cormos, bulbos, frutas, tubérculos, granos, esquejes, brotes cortados y similares y significa en una realización preferida semillas verdaderas.

El término tratamiento de semillas comprende técnicas de tratamiento de semillas adecuadas conocidas en la técnica, tales como limpieza de semillas, recubrimiento de semillas, espolvoreo de semillas, remojo de semillas y granulación de las semillas.

La presente invención también comprende semillas recubiertas con o que contienen el compuesto activo.

El término "recubierto con y/o que contiene" significa generalmente que el ingrediente activo está en su mayor parte sobre la superficie del producto de propagación en el momento de aplicación, aunque una parte mayor o menor del ingrediente puede penetrar en el producto de propagación, dependiendo del procedimiento de aplicación. Cuando dicho producto de propagación es (re)plantado, puede absorber el ingrediente activo.

Una semilla adecuada es semilla de cereales, tubérculos, oleaginosas, hortalizas, especias, plantas ornamentales, por ejemplo semillas de trigo y otras semillas de trigo, cebada, avena, centeno, maíz (maíz forrajero y maíz de

azúcar/dulce y maíz de campo), soja, cultivos oleaginosos, crucíferas, algodón, girasoles, bananas, arroz, colza de semilla oleaginosa, colza, nabo, remolacha azucarera, remolacha forrajera, berenjenas, patatas, hierba, césped, pasto, hierba forrajera, tomates, puerros, calabaza, col, lechuga iceberg, pimiento, pepinos, melones, especies de Brassica, melones, judías, guisantes, ajo, cebollas, zanahorias, plantas tuberculosas, tales como patatas, caña de

5 azúcar, tabaco, uvas, petunias, geranios/pelargonios, pensamientos y alegría de la casa. Además, el compuesto activo también puede ser utilizado para las semillas de tratamiento de plantas, que toleran la acción de herbicidas o fungicidas o insecticidas debido a la reproducción, incluyendo los procedimientos de ingeniería genética.

10 Por ejemplo, el compuesto activo se puede emplear en el tratamiento de semillas de las plantas, que son resistentes a herbicidas del grupo que consiste en las sulfonilureas, imidazolinonas, glufosinato-amonio o glifosato-isopropilamónio y sustancias activas análogas (ver por ejemplo, EP-A 242 236, EP-a 242 246) (documento WO 92/00377) (EP-A 257 993, US 5,013,659) o en plantas de cultivos transgénicos, por ejemplo algodón, con la capacidad de producir toxinas de *Bacillus thuringiensis* (toxinas Bt) que hacen las plantas resistentes a ciertas plagas (EP-A 142 924, EP-A 193 259).

15 Además, el compuesto activo se puede utilizar también para el tratamiento de semillas de las plantas que han modificado características en comparación con las plantas existentes, que pueden generarse por ejemplo por procedimientos tradicionales de reproducción y/o generación de mutantes, o mediante procedimientos recombinantes). Por ejemplo, se han descrito un número de casos de modificaciones recombinantes de plantas de cultivo para el propósito de modificar el almidón sintetizado en las plantas (por ejemplo WO 92/11376, WO 92/14827, WO 91/19806) o de plantas de cultivo transgénicas que tienen una composición de ácidos grasos modificadas (WO 91/13972).

La aplicación de tratamiento de semillas del compuesto activo se lleva a cabo mediante pulverización o espolvoreando las semillas antes de la siembra de las plantas y antes de la aparición de las plantas.

25 Las composiciones que son especialmente útiles para el tratamiento de semillas son por ejemplo:

A Concentrados solubles (SL, LS)

D Emulsiones (EW, EO, ES)

E Suspensiones (SC, OD, FS)

F Gránulos dispersables en agua y gránulos solubles en agua (WG, SG)

30 G Polvos dispersables en agua y polvos solubles en agua (WP, SP, WS)

H Formulaciones de Gel-(GF)

I Polvos espolvoreables (DP, DS).

35 Las formulaciones de tratamiento de semillas convencionales incluyen por ejemplo concentrados fluidos FS, soluciones LS, polvos para tratamiento en seco DS, polvos dispersables en agua para tratamiento de purines WS, polvos solubles en agua SS y emulsión ES y EC y formulación de gel GF. Estas formulaciones se pueden aplicar a la semilla diluida o sin diluir. La aplicación a las semillas se lleva a cabo antes de la siembra, ya sea directamente sobre las semillas o después de haber pregerminado éstas últimas.

40 En una realización preferida una formulación FS se utiliza para el tratamiento de semillas. Típicamente, una formulación FS puede comprender 1-800 g/l de ingrediente activo, 1-200 g/l de tensioactivo, 0 a 200 g/l de agente anticongelante, de 0 a 400 g/l de aglutinante, de 0 a 200 g/l de un pigmento y hasta 1 litro de un disolvente, preferiblemente agua.

45 Las formulaciones FS especialmente preferidas de compuestos de la presente invención para el tratamiento de semillas usualmente comprenden de 0,1 a 80% en peso (1 a 800 g/l) del ingrediente activo, de 0,1 a 20% en peso (1 a 200 g/l) de al menos un tensioactivo, por ejemplo de 0,05 a 5% en peso de un humectante y de 0,5 a 15% en peso de un agente dispersante, hasta 20% en peso, por ejemplo de 5 a 20%, de un agente anticongelante, de 0 a 15% en peso, por ejemplo de 1 a 15% en peso, de un pigmento y/o un colorante, de 0 a 40% en peso, por ejemplo de 1 a 40% en peso de un aglutinante (agente de unión/adhesión), opcionalmente hasta 5% en peso, por ejemplo de 0,1 a 5% en peso de un espesante, opcionalmente de 0,1 a 2% de un agente antiespumante, y opcionalmente un conservante, tal como un biocida, antioxidante o similar, por ejemplo en una cantidad de 0,01 a 1% en peso y un relleno/vehículo hasta 100% en peso.

Las formulaciones de tratamiento de semillas pueden contener adicionalmente también aglutinantes y opcionalmente colorantes.

55 Los aglutinantes se pueden agregar para mejorar la adhesión de los materiales activos sobre las semillas después del tratamiento. Los aglutinantes adecuados son homopolímeros y copolímeros de óxidos de alquileo, tales como óxido de etileno u óxido de propileno, acetato de polivinilo, alcoholes polivinílicos, polivinilpirrolidonas, y copolímeros de los mismos, copolímeros de etileno-acetato de vinilo, homocopolímeros y copolímeros acrílicos, polietilenamidas, polietilenamidas y polietileniminas, polisacáridos, tales como celulosas, tilosa y almidón, homopolímeros y copolímeros de poliolefina, tales como olefina/anhídrido maleico, poliuretanos, poliésteres, homopolímeros y copolímeros de poliestireno.

60 Opcionalmente, también se pueden incluir colorantes en la formulación. Los colorantes o tintes adecuados para formulaciones para tratamiento de semillas son Rodamina B, C.I. Pigmento Rojo 112, C.I. Disolvente rojo 1, pigmento azul 15:4, pigmento azul 15:3, pigmento azul 15:2, pigmento azul 15:1, pigmento azul 80, pigmento amarillo 1, pigmento amarillo 13, pigmento rojo 112, pigmento rojo 48:2, pigmento rojo 48:1, pigmento rojo 57:1, pigmento rojo 53:1, pigmento naranja 43, pigmento naranja 34, pigmento naranja 5, pigmento verde 36, pigmento

65 pigmento rojo 53:1, pigmento naranja 43, pigmento naranja 34, pigmento naranja 5, pigmento verde 36, pigmento

verde 7, pigmento blanco 6, pigmento marrón 25, violeta básico 10, violeta básico 49, rojo ácido 51, rojo ácido 52, rojo ácido 14, azul ácido 9, amarillo ácido 23, rojo básico 10, rojo básico 108.

Un ejemplo de un agente gelificante es carragenina (Satiagel®)

5 En el tratamiento de semillas, las tasas de aplicación de los compuestos de la presente invención son generalmente de 0,01 g a 10 kg por 100 kg de semilla, preferiblemente de 0,05 g a 5 kg por 100 kg de semilla, más preferiblemente de 0,1 g a 1000 g por 100 kg de semilla y en particular de 0,1 g a 200 g por 100 kg de semilla.

10 La invención por lo tanto también se refiere a las semillas que comprenden un compuesto de la presente invención, incluyendo una sal agrícolamente útil del mismo, tal como se define en el presente documento. La cantidad del compuesto de la presente invención, incluyendo una sal agrícolamente útil del mismo en general es de 0,01 g a 10 kg por 100 kg de semilla, preferiblemente de 0,05 g a 5 kg por 100 kg de semilla, en particular de 0,1 g a 1000 g por 100 kg de semilla. Para cultivos específicos, tales como lechuga, la tasa puede ser mayor.

15 Los procedimientos que pueden emplearse para el tratamiento de la semilla son, en principio, todos los tratamientos de semilla adecuados y, especialmente, las técnicas del relleno de semillas conocidas en la técnica, tales como recubrimiento de semillas (por ejemplo, granulación de las semillas), espolvoreo de semillas y la imbibición de las semillas (por ejemplo, remojo de semillas). En el presente documento, "tratamiento de semillas" se refiere a todos los procedimientos que ponen en contacto las semillas y los compuestos de la presente invención unos con otros, y "relleno de semillas" a los procedimientos de tratamiento de semillas que proporcionan las semillas con una cantidad de los compuestos de la presente invención, es decir, que generan una semilla que comprende el compuesto de la presente invención. En principio, el tratamiento se puede aplicar a la semilla en cualquier momento desde la cosecha de la semilla hasta la siembra de la semilla. La semilla se puede tratar inmediatamente antes o durante la siembra de la semilla, por ejemplo, usando el procedimiento de "caja de jardinera". Sin embargo, el tratamiento también puede llevarse a cabo de varias semanas o meses, por ejemplo hasta 12 meses, antes de plantar la semilla, por ejemplo en forma de un tratamiento de relleno de semillas, sin observar una reducción sustancial de la eficacia.

25 Convenientemente, el tratamiento se aplica a las semillas sin sembrar. Tal como se utiliza en el presente documento, el término "semilla no sembrada" significa que incluye la semilla en cualquier período de la cosecha de la semilla para la siembra de la semilla en la tierra con el propósito de la germinación y el crecimiento de la planta.

30 Específicamente, se sigue un procedimiento en el tratamiento en el que se mezcla la semilla, en un dispositivo adecuado, por ejemplo un dispositivo de elementos de mezcla sólidos o sólido/líquido, con la cantidad deseada de formulaciones de tratamiento de semillas, ya sea como tal o después de la dilución previa con agua, hasta que la composición se distribuye uniformemente sobre la semilla. Si es apropiado, esto va seguido por una etapa de secado.

35 Los compuestos de la presente invención, incluyendo sus estereoisómeros, sales veterinariamente aceptables o N-óxidos, son en particular también adecuados para ser utilizados para combatir parásitos en y sobre animales.

40 Un objetivo de la presente descripción es también proporcionar nuevos procedimientos para el control de parásitos en y sobre animales. Otro objetivo de la descripción es proporcionar pesticidas más seguros para los animales. Otro objetivo de la descripción es además proporcionar pesticidas para animales que puedan usarse en dosis más bajas que los pesticidas existentes. Y otro objetivo de la descripción es proporcionar pesticidas para animales que proporcionen un control residual prolongado de los parásitos.

45 En el presente documento se describen composiciones que comprenden una cantidad parasiticida eficaz de compuestos de la presente invención, incluyendo sus estereoisómeros, sales veterinariamente aceptables o N-óxidos, y un portador aceptable, para usar en la lucha contra los parásitos en y sobre animales.

50 En el presente documento se describe un procedimiento para el tratamiento, control, prevención y protección de animales contra la infestación e infección por parásitos, que comprende la administración o aplicación por vía oral, tópica o parenteral a los animales de una cantidad parasiticida eficaz de un compuesto de la presente invención, incluyendo sus estereoisómeros, sales veterinariamente aceptables o N-óxidos, o una composición que lo comprende.

55 En el presente documento se describe es el uso de un compuesto de la presente invención, incluyendo sus estereoisómeros, sales veterinariamente aceptables o N-óxidos, para el tratamiento o protección de un animal de la infestación o infección por plagas de invertebrados.

60 En el presente documento se describe un proceso para la preparación de una composición para tratar, controlar, prevenir o proteger animales contra la infestación o infección por parásitos que comprende una cantidad parasiticida eficaz de un compuesto de la presente invención, incluyendo sus estereoisómeros, sales veterinariamente aceptables o N-óxidos, o una composición que lo comprende.

65 La actividad de los compuestos contra plagas agrícolas no sugiere su idoneidad para el control de endoparásitos y ectoparásitos en y sobre animales que requiere, por ejemplo, dosis bajas, no eméticas en el caso de la aplicación oral, la compatibilidad metabólica con el animal, baja toxicidad, y una manipulación segura.

Sorprendentemente, se ha encontrado ahora que los compuestos de fórmula (I) y sus estereoisómeros, sales veterinariamente aceptables, tautómeros y N-óxidos, son adecuados para la lucha contra endoparásitos y ectoparásitos en y sobre animales.

Los compuestos de la presente invención, especialmente los compuestos de fórmula (I) y sus estereoisómeros,

sales veterinariamente aceptables, tautómeros y N-óxidos, y composiciones que los comprenden se usan preferiblemente para controlar y prevenir infestaciones e infecciones en animales que incluyen animales de sangre caliente (incluidos los humanos) y peces. Son, por ejemplo adecuados para usar en controlar y prevenir las infestaciones e infecciones en mamíferos, tales como ganado vacuno, ovejas, cochinos, camellos, ciervos, caballos, cerdos, aves de corral, conejos, cabras, perros y gatos, búfalo de agua, burros, gamos y renos, y también en animales con piel, como el visón, chinchilla, mapaches, aves como gallinas, gansos, pavos y patos y peces, tales como el pescado dulce y de agua salada como la trucha, la carpa y anguilas. Los compuestos de la presente invención, incluyendo sus estereoisómeros, sales veterinariamente aceptables, o N-óxidos, y composiciones que los comprenden se usan también para controlar y prevenir infestaciones e infecciones en animales domésticos, tales como perros o gatos.

Las infestaciones en animales de sangre caliente y peces incluyen, pero no se limitan a, piojos, piojos masticadores, garrapatas, larvas nasales, garrapatas, moscas mordedoras, moscas muscoides, moscas, larvas de mosca miasóticas, niguas, jejenes, mosquitos y pulgas.

Los compuestos de la presente invención, incluyendo sus estereoisómeros, sales veterinariamente aceptables o N-óxidos, y las composiciones que los comprenden son adecuados para su uso en el control sistémico y/o no sistémico de ectoparásitos y/o endoparásitos. Son activos contra todos o algunos estadios de desarrollo.

Los compuestos de la presente invención son especialmente útiles para combatir parásitos de los siguientes órdenes y especies, respectivamente:

pulgas (Siphonaptera), por ejemplo, *Ctenocephalides felis*, *Ctenocephalides canis*, *Xenopsilla cheopis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans* y *Nosopsillus fasciatus*,

cucarachas (Blattaria-Blattodea), por ejemplo *Blattella germanica*, *Blattella asahinae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta japonica*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta aus-tralasiae* y *Blatta orientalis*,

moscas, mosquitos (Diptera), por ejemplo *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *vexans Aedes*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Anopheles crucians*, *Anopheles albimanus*, BIAE *Anopheles GAM-*, *Anopheles freeborni*, *Anopheles leucosphyrus*, *Anopheles minimus*, *Anopheles quadrimaculatus*, *Calliphora Vicina*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macel-malaria*, *Chrysops discalis*, *Chrysops silacea*, *Chrysops atlanticus*, *Cochliomyia hominivorax*, *anthropophaga dilobia Cor-*, *furens Culicoides*, *Culex pipiens*, *Culex nigripalpus*, *ciatus Culex quinquefas-*, *tarsalis Culex*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Dermatobia hominis*, *Fannia canicularis*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Glossina palpalis*, *Glossina fuscipes*, *Glossina tachinoides*,

Haematobia irritans, *Haplodiplosis equestris*, *Hippelates spp.*, *Hypoderma lineata*, *Leptoconops Torrens*, *caprina Lucilia*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *pectorales Lycoria*, *Mansonia spp.*, *Musca domestica*, *stabulans Muscina*, *estro ovis*, *argentipes Phlebotomus*, *Psorophora columbiae*, *Psorophora discolor*, *Prosimulium mixtum*, *Sarcophaga haemorrhoidalis*, *Sarcophaga sp.*, *Simulium vittatum*, *Stomoxys calcitrans*, *Tabanus bovinus*, *Tabanus atratus*, *Tabanus lineola* y *Tabanus similis*,

piojos (Phthiraptera), por ejemplo, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pthirus pubis*, *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus suis*, *Linognathus vituli*, *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*, *Menacanthus stramineus* y *Solenopotes capillatus*, garrapatas y ácaros parásitos (Parasitiformes): garrapatas (Ixodida), por ejemplo *Ixodes scapularis*, *Ixodes holocyclus*, *Ixodes pacificus*, *Rhipicephalus sanguineus* *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor variabilis*, *Amblyomma americanum*, *Amblyomma maculatum*, *Ornithodoros hermsi*, *Ornithodoros Turicata* y ácaros parásitos (Mesostigmata), por ejemplo *Ornithonyssus bacoti* y *Dermanyssus gallinae*, *Actiniedida (Prostigmata)* y *Acaridida (Astigmata)* por ejemplo *Acarapis spp.*, *Cheyletiella spp.*, *Ornithocheyletia spp.*, *Myobia spp.*, *Psorergates spp.*, *Demodex spp.*, *Trombicula spp.*, *Listrophorus spp.*, *Acarus spp.*, *Tyrophagus spp.*, *Caloglyphus spp.*, *Hypodectes spp.*, *Pterolichus spp.*, *Psoroptes spp.*, *Chorioptes spp.*, *Otodectes spp.*, *Sarcoptes spp.*, *Notoedres spp.*, *Knemidocoptes spp.*, *Cytodites spp.*, y *Laminosioptes spp.*,

hemíptero (Heteroptera): *Cimex lectularius*, *Cimex hemipterus*, *Reduvius senilis*, *Triatoma spp.*, *Rhodnius ssp.*, *Panstrongylus ssp.* y *Arilus critatus*,

Anoplurida, por ejemplo *Haematopinus spp.*, *Linognathus spp.*, *Pediculus spp.*, *Pthirus spp.*, y *Solenopotes spp.*,

Mallophagida (subórdenes *Armblycerina* y *Ischnocerina*) *Trimenopon* por ejemplo *spp.*, *Menopon spp.*, *Trinoton spp.*, *Bovicola spp.*, *Werneckiella spp.*, *Lepikentron spp.*, *Trichodectes spp.*, y *Felicola spp.*,

nematodos de gusanos redondos:

"Wipeworms" y Triquinosis (*Trichosyringida*), por ejemplo *trichinellidae (Trichinella spp.)*, (*Trichuridae*) *Trichuris spp.*, *Capillaria spp.*,

Rhabditida, por ejemplo *Rhabditis spp.*, *Strongyloides spp.*, *Helicephalobus spp.*,

Strongylida, por ejemplo, *Strongylus spp.*, *Ancylostoma*. *Necator americanus*, *Bunostomum spp.* (*Anquylostoma*), *Trichostrongylus spp.*, *Haemonchus contortus.*, *Ostertagia spp.*, *Cooperia spp.*, *Nematodirus spp.*, *Dictyocaulus spp.*, *Cyathostoma spp.*, *Oesophagostomum spp.*, *Stephanurus dentatus*, *Ollulanus spp.*, *Chabertia spp.*, *Stephanurus dentatus*, *Syngamus tráquea Ancylostoma spp.*, *Uncinaria spp.*, *Globocephalus spp.*, *Necator spp.*, *Metastrongylus spp.*, *Muel-Lerius capillaris*, *Protostrongylus spp.*, *Angiostrongylus spp.*, *Parelaphostrongylus spp.* *Abstrusus strongylus Aleuros-*, y *Dioctophyma renal*

Lombrices intestinales (*Ascaridida*), por ejemplo, *Ascaris lumbricoides*, *Ascaris suum*, *Ascaridia galli*, *Parascaris equorum*, *Enterobius vermicularis (oxiuro)*, *Toxocara canis*, *Toxascaris leoninos*, *Skrjabinema spp.*, y *Oxyuris equi*

Camallanida, por ejemplo, *Dracunculus medinensis (gusano de Guinea)*

Spirurida, por ejemplo *Thelazia spp.* *Wuchereria spp.*, *Brugia spp.*, *Onchocerca spp.*, *Dirofiliari spp. a*, *Dipetalonema spp.*, *Setaria spp.*, *Elaeophora spp.*, *Spirocerca lupi*, y *Habronema spp.*,

Gusanos de cabeza espinosa (acantocéfalos), por ejemplo *Acanthocephalus spp.*, *Macracanthorhynchus*

hirudinaceus y *Oncicola* spp,

Planarias (Platelmintos):

trematodos, por ejemplo, *Fasciolopsis buski*, *Clonorchis sinensis*, *Schistosoma* spp., *Trichobilharzia* spp., *Alaria Alata*, *Paragonimus* spp., y *Nanocyetes* spp,

- 5 *Cercomeromorpha*, en particular, Cestoda (tenias), por ejemplo, *Diphyllobothrium* spp., *Tenia* spp., *Echinococcus* spp., *Dipylidium caninum*, *Multiceps* spp., *Hymenolepis* spp., *Mesocestoides* spp., *Vampirolepis* spp., *Moniezia* spp., *Anoplocephala* spp., *Sirometra* spp., *Anoplocephala* spp., y *Hymenolepis* spp.

10 En el presente documento se describe el uso terapéutico y el uso no terapéutico de compuestos de la presente invención y las composiciones que los comprenden para el control y/o la lucha contra los parásitos en y/o en animales. Los compuestos de la presente invención y las composiciones que los comprenden se pueden utilizar para proteger a los animales del ataque o infestación por parásitos poniéndolos en contacto con una cantidad parasiticida eficaz de compuestos de la presente invención y las composiciones que los contienen.

15 Los compuestos de la presente invención y las composiciones que los comprenden pueden ser efectivos tanto a través de contacto (a través del suelo, vidrio, pared, mosquitero, alfombra, mantas o partes de animales) como la ingestión (por ejemplo, cebos). Como tal, "poner en contacto" incluye tanto contacto directo (aplicación de las mezclas/composiciones pesticidas que contienen los compuestos de la presente invención directamente sobre el parásito, que puede incluir un contacto indirecto en su locus-P, y opcionalmente también la administración de la

20 mezclas/composición pesticida directamente sobre el animal a proteger) como contacto indirecto (aplicar los compuestos/composiciones al locus del parásito). El contacto del parásito mediante la aplicación a su locus es un ejemplo de un uso no terapéutico de los compuestos de la presente invención. "Locus-P" tal como se utiliza anteriormente significa el hábitat, suministro de alimentos, lugar de reproducción, área, material o entorno en el que un parásito está creciendo o puede crecer fuera del animal.

25 En general, "cantidad parasiticida eficaz" significa la cantidad de ingrediente activo necesaria para lograr un efecto observable sobre el crecimiento, incluyendo los efectos de necrosis, muerte, retardo, prevención, y eliminación, destrucción, o bien disminución de la aparición y actividad del organismo objetivo. La cantidad parasiticida eficaz puede variar para los diversos compuestos/composiciones de la presente invención. Una cantidad parasiticida eficaz de las composiciones variará también de acuerdo con las condiciones imperantes, tales como el efecto parasiticida deseado y la duración, la especie objetivo, modo de aplicación, y similares.

30 Los compuestos de la presente invención también se pueden aplicar preventivamente a lugares en los que se espera la aparición de las plagas o parásitos.

La administración puede llevarse a cabo tanto profiláctica como terapéuticamente.

35 La administración de los compuestos activos se realiza directamente o en forma de preparaciones adecuadas, por vía oral, tópica/dérmica o parenteral.

Los compuestos de isotiazolina de la presente invención son menos persistentes, bioacumulativos y/o tóxicos que los compuestos de la técnica anterior, y especialmente los insecticidas de isoxazolina de la técnica anterior, que muestran una alta persistencia en el suelo y por lo tanto se acumulan allí.

40 Ejemplos

Los ejemplos indicados con * están fuera del alcance de la invención.

45 La presente invención se ilustra ahora con más detalle mediante los siguientes ejemplos, sin imponer ninguna limitación a los mismos.

Ejemplos de preparación

50 Los compuestos se pueden caracterizar por ejemplo, por cromatografía líquida de alto rendimiento/espectrometría de masas (HPLC/MS) acoplados, mediante ¹H-RMN y/o por sus puntos de fusión. Columna de HPLC analítica:

Procedimiento A: Columna analítica UPLC: Phenomenex Kinetex 1,7 μm XB-C₁₈ 100A; 50 x 2,1 mm de Phenomenex, Alemania. Elución: acetonitrilo + 0,1% de ácido trifluoroacético (TFA)/agua + 0,1% de ácido trifluoroacético (TFA) en una relación de 5:95 a 100: 0 en 1,5 min a 60°C. Flujo: 0,8 ml/min a 1 ml/min en 1,5

55 min. Procedimiento MS: ESI positivo.¹H-RMN: Las señales se caracterizan por desplazamiento químico (ppm, δ [delta]) frente a tetrametilsilano, respectivamente CDCl₃ para ¹³C-RMN, por su multiplicidad y por su integral (número relativo de átomos de hidrógeno dados). Las siguientes abreviaturas se utilizan para caracterizar la multiplicidad de las señales: m = multiplete, q = cuarteto, t = triplete, d = doblete y s = singlete.

60 Las abreviaturas utilizadas son: d para día(s), h para hora(s), min para minuto(s), rt/temperatura ambiente para 20-25 °C, THF para tetrahidrofurano, OAc para acetato, HATU para hexafluorofosfato de O-(7-Azabenzotriazol-1-il) -N, N, N', N'-tetrametiluronio.

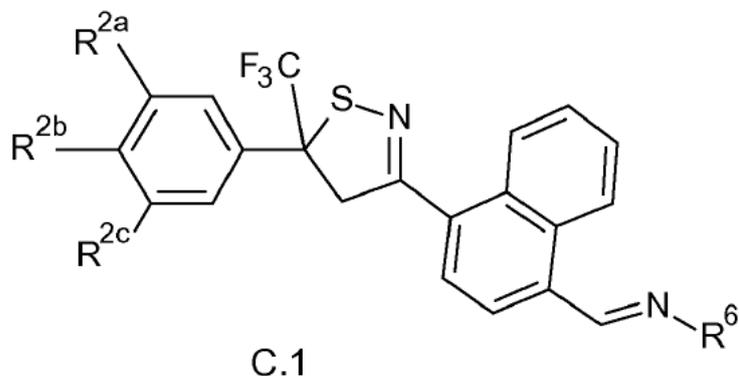
C.1 Ejemplos de compuestos 1

Los ejemplos de compuestos 1-1 a 1-3 corresponden a Compuestos de la fórmula C.1:

5

10

15



20 en la que R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y R⁶ de cada compuesto sintetizado se define en una fila de la tabla C.1 siguiente.

Los compuestos se sintetizaron en analogía con el Ejemplo de síntesis S.1.

Tabla C.1

25

Ejemplo	R ^{2a} , R ^{2b} , R ^{2c}	R ⁶	HPLC-MS		
			Método, R _t (min) y [M + H] ⁺		
1-1	Cl, Cl, Cl	-NHC(=O)-NHCH ₂ CF ₃	A	1,561	629,1
1-2	Cl, Cl, Cl	-NHC(=O)-NHCH ₂ CCH	A	1,526	585,1
1-3	Cl, Cl, Cl	-NHC(=O)-NHCH ₂ CHF ₂	A	1,536	609,4

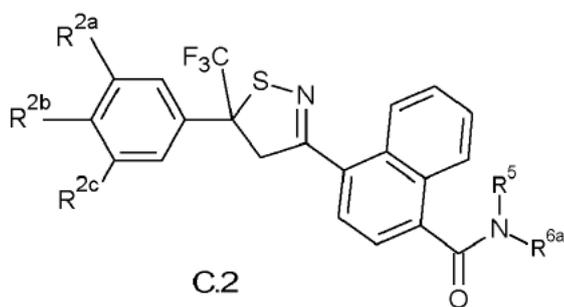
C.2 Ejemplos de compuestos 2

Los ejemplos de compuestos 2-1 a 2-13 corresponden a Compuestos de la fórmula C.2:

30

35

40



45 en la que R^{2a}, R^{2b}, R^{2c}, R⁵ y R^{6a} de cada compuesto sintetizado se define en una fila de la tabla C.2 siguiente.

Los compuestos se sintetizaron en analogía con el Ejemplo de síntesis S.2.

Tabla C.2

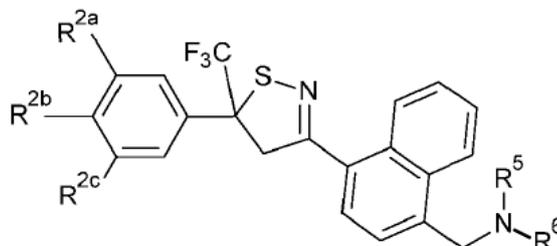
50

Ejemplo	R ^{2a} , R ^{2b} , R ^{2c}	R ⁵	R ⁶	HPLC-MS		
				Método, R _t (min) y [M + H] ⁺		
2-1	Cl, Cl, Cl	H	-CH ₂ -(3,3-difluorociclobut-1-ilo)	A	1,524	608,9
2-2	Cl, Cl, Cl	H	-CH ₂ -(1-ciano-cicloprop-1-ilo)	A	1,466	582,0

2-3	Cl, F, Cl	H	1-ciano-cicloprop-1-ilo	A	1,420	551,8
2-4	Cl, F, Cl	H	CH ₂ CH=CH ₂	A	1,454	526,8
2-5	Cl, F, Cl	H	-CH ₂ C(=O)NHCH ₂ CH=CH ₂	A	1,388	583,9
2-6	Cl, F, Cl	H	-CH ₂ C(=O)NHCH ₂ C≡CH	A	1,366	581,9
2-7	Cl, F, Cl	H	-NH-C(=O)NHCH ₂ CF ₃	A	1,371	626,8
2-8	Cl, F, Cl	H	H	A	1,361	486,8
2-9	Cl, F, Cl	H	CH ₂ -ciclopropilo	A	1,490	540,8
2-10	Cl, F, Cl	H	CH ₂ C≡CH	A	1,431	524,8
2-11	Cl, F, Cl	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH=CH ₂	A	1,483	570,8
2-12	Cl, F, Cl	H	CH ₂ C(=O)NHCH ₂ (ciclopropilo)	A	1,430	598,2
2-13	Cl, F, Cl	H	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ CH ₂ (ciclopropilo)	A	1,449	633,1

C.3 Ejemplos de compuestos 3*

Los ejemplos de compuestos 3-1 a 3-9 corresponden a Compuestos de la fórmula C.3:



C.3

en la que R^{2a}, R^{2b}, R^{2c}, R⁵, y R⁶ de cada compuesto sintetizado se define en una fila de la tabla C.3 a continuación.

Los compuestos se sintetizaron en analogía con el Ejemplo de síntesis S.3.

Tabla C.3

Ejemplo	R ^{2A} , R ^{2B} , R ^{2c}	R ⁵	-R ⁶	HPLC-MS Método, R _t (min) y [M + H] ⁺ o ¹ H RMN		
3-1	Br, H, CF ₃	H	C(=O)OC(CH ₃) ₃	¹ H RMN (400 MHz, CDCl ₃): δ 8,3 (d, 1H), 8,1 (m, 2H), 7,9-7,7 (m, 3H), 7,7-7,5 (m, 3H), 4,9 (br. s., 1H), 4,8 (m, 2H), 4,4 (d, 1H), 4,1 (d, 1H), 1,5 (s, 9H)		
3-2	Br, H, CF ₃	H	H	¹ H RMN (400 MHz, CDCl ₃): δ 8,0 (m, 2H), 7,9-7,75 (m, 3H), 7,65 (s, 1H), 7,4-7,3 (m, 2H), 6,9-6,8 (m, 1H), 4,45 (d, 1H), 4,3 (br s., 2H), 4,05 (d, 1H)		
3-3	Br, H, CF ₃	H	C(=O)CH ₃	A	1,420	576,7
3-4	Br, H, CF ₃	H	C(=O)CH ₂ CH ₃	A	1,470	590,9
3-5	Br, H, CF ₃	H	C(=O)CH ₂ CF ₃	A	1,485	644,6
3-6	Br, H, CF ₃	H	C(=O)CH ₂ CH ₂ CH ₃	A	1,492	604,7
3-7	Br, H, CF ₃	H	C(=O)ciclopropilo	A	1,474	600,9
3-8	Br, H, CF ₃	H	C(=O)CH ₂ SO ₂ CH ₃	A	1,402	654,6

3-9	Br, H, CF ₃	H	C(=O)CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	A	1,427	668,6
-----	------------------------	---	--	---	-------	-------

Ejemplo de síntesis S.1

1-[(E)-[4-[5-(3,4,5-triclorofenil)-5-(trifluorometil)-4H-isotiazol-3-il]-1-naftil] metilnamino]-3-(2, 2,2-trifluoroetil) urea

(Ejemplo de compuesto 1-1; compuesto de fórmula IA, en la que R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} son Cl y A es A¹ = -CH[=N-NH-C(=O)-NH-CH₂CF₃].

Etapa 1: 4-bromonaftalen-1-carboxilato de terc-butilo

A una solución de ácido 4-bromonaftaleno-1-carboxílico (50 g, 0,2 mol, CAS 16650-55-8) en tolueno (500 ml) se añadió SOCl₂ (93 g). La mezcla se calentó a reflujo durante la noche y se concentró. El "cloruro de acilo" bruto se utilizó en el siguiente etapa sin ninguna purificación adicional.

Una solución del "cloruro de acilo" bruto (0,2 mol) en THF (500 ml) se añadió a una solución de terc-butanolato de potasio (33,6 g) en THF (500 ml), y la reacción se agitó durante la noche. A continuación, se añadió agua (500 ml) y la mezcla se extrajo con terc-butil-metil éter (MTBE) (2 x 1 L). Las capas orgánicas combinadas se lavaron con salmuera (2 x 500 ml), se secaron (Na₂SO₄), se filtraron y se concentraron para dar el compuesto del título en bruto (40 g, 65%), que se usó en la siguiente etapa sin purificación adicional.

Etapa 2: 4-acetilnaftaleno-1-carboxilato de terc-butilo

El producto bruto de la etapa 1 (18 g), tris(dibencilidenaacetona) dipaladio (0) ("Pd₂(dba)₃", 1,5 g), 1,1'-binaftalen-2,2'-diilbis(difenilfosfina) ("BINAP", 1,5 g) y tributil (1-etoxivinil)estaño (54,2 g) en tolueno (300 ml) se agitaron bajo N₂ a reflujo durante la noche. La mezcla se concentró y el residuo se disolvió en THF (100 ml) y una solución acuosa de HCl 1 M (100 ml) y se agitó a t.a. durante 2 h. A continuación, la mezcla se extrajo con MTBE (2 x 200 ml) y las capas orgánicas combinadas se lavaron con salmuera (2 x 100 ml), se secaron (Na₂SO₄), se filtraron y se concentraron para dar un residuo, que se purificó mediante cromatografía ultrarrápida sobre gel de sílice para proporcionar el producto (12 g, 80%).

¹H RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 8,8 (m, 1H), 8,6-8,5 (m, 1H), 8,0 (m, 1H), 7,8 (m, 1H), 7,7-7,6 (m, 2H), 2,8 (s, 3 H), 1,7 (s, 9 H).

Etapa 3: 4-[4,4,4-trifluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-2-enoil]naftalen-1-carboxilato de terc-butilo

A una solución de producto de la etapa 2 (4,3 g) y 2,2,2-trifluoro-1-(3,4,5-triclorofenil) etanona (6,6 g) en una mezcla de MTBE (100 ml) y se añadió dimetilformamida (DMF) (50 ml) se añadió Ca(OH)₂ (0,98 g). La reacción se agitó a 100 °C durante la noche usando un aparato Dean-Stark para eliminar el agua formada. A continuación, se concentró la mezcla. Se agregaron agua (50 ml) y MTBE y la capa orgánica se lavó con salmuera, se secó (Na₂SO₄), se filtró y se concentró para dar un residuo, que se purificó por cromatografía ultrarrápida en gel de sílice para producir el producto (4 g, 48%).

¹H RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 8,7 (m, 1H), 8,3 (m, 1H), 7,9 (d, 1H), 7,7-7,5 (m, 2H), 7,3 (m, 1H), 7,0 (s, 2 H, s), 1,7 (s, 9 H).

Etapa 4: 4-[4,4,4-trifluoro-3-sulfanil-3-(3,4,5-triclorofenil)butanoil]naftalen-1-carboxilato de terc-butilo

El producto de la etapa 3 (19,1 g, mezcla de isómeros E/Z) en CH₂Cl₂ (250 ml) se trató con trietilamina (19,1 g). A 0 °C, se burbujeó sulfuro de hidrógeno gaseoso (H₂S) a través de la solución hasta que se saturó la solución. La mezcla se agitó durante otra 1 h a 0 °C, y después se diluyó con CH₂Cl₂ (200 ml). La capa orgánica se lavó con una solución acuosa de ácido clorhídrico al 10% (3x), se secó (Na₂SO₄), se filtró y se concentró para producir el producto bruto (10,6 g, cuant.), que se utilizó en la siguiente etapa sin purificación adicional.

¹H RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 8,8 (d, 1H), 8,1 (d, 1H), 8,0 (d, 1H), 7,8-7,5 (m, 5H), 4,3 (d, 1H), 4,0 (d, 1 H), 3,3 (s, 1 H (SH)), 1,7 (s, 9 H).

Etapa 5: 4-[5-(3,4,5-triclorofenil)-5-(trifluorometil)-4H-isotiazol-3-il]naftalen-1-carboxilato de terc-butilo

A -15 °C, el producto de la etapa 4 (10,6 g) en CH₂Cl₂ (200 ml) se trató con trietilamina (7,6 g) y con una solución de ácido hidroxilamina-O-sulfónico ("HOSA", 2,6 g) en agua (10 ml). La reacción se calentó a 0°C y se agitó a 0°C durante 1 h, y a continuación se diluyó con CH₂Cl₂ (300 ml). La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de NH₄Cl (3 x), se secó (Na₂SO₄) y se filtró. A la solución obtenida, se le añadieron tamices moleculares lavados con ácido (AW 300, 100 g) y la mezcla se agitó vigorosamente durante 3 h a t.a. A continuación, los tamices moleculares se separaron por filtración y el filtrado se concentró para dar un residuo que se purificó por trituración (acetato de etilo/éter de petróleo). El producto obtenido (7,85 g, 74%) se utilizó en la siguiente etapa sin ninguna purificación adicional.

¹H RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 8,8 (d, 1H), 8,6 (m, 1H), 8,0 (d, 1H), 7,7-7,5 (m, 3H), 7,4 (s, 2H), 4,3 (d, 1 H), 4,1 (d, 1 H), 1,7 (s, 9 H).

Etapa 6: ácido 4-[5-(3,4,5-triclorofenil)-5-(trifluorometil)-4H-isotiazol-3-il] naftalen-1-carboxílico

A 0 °C, el producto de la etapa 5 (7,7 g) en CH₂Cl₂ (100 ml) se trató con ácido trifluoroacético ("TFA", 50 ml), y la mezcla se agitó durante la noche a t.a. La reacción se concentró y se coevaporó con CH₂Cl₂ (5x) para proporcionar el producto como un sólido amarillo pálido (5,91 g, 85%) que se usó en la siguiente etapa sin ninguna purificación adicional.

¹H RMN (400 MHz, d₆-DMSO): δ 8,9 (m, 1H), 8,8 (m, 1H), 8,2 (m, 1H), 8,0 (m, 1H) 7,9 (s, 2H), 7,8-7,6 (m, 2 H), 7,4 (s, 2 H), 4,8-4,5 (m, 2 H).

Etapa 7: [4-[5-(3,4,5-Triclorofenil)-5-(trifluorometil)-4H-isotiazol-3-il]-1-naftil] metanol

A una solución del producto de la etapa 6 (2 g) en CH₂Cl₂/tolueno (1:1, 20 ml) a t.a. se le añadió N, N-dimetilformamida ("DMF", 1 gota) y de cloruro de oxalilo (1 g). La reacción se agitó durante la noche a t.a. y se concentró. El residuo se co-evaporó con CH₂Cl₂ y se usó en la siguiente etapa sin ninguna purificación adicional (1,8 g, "cloruro de ácido"). A una solución del "cloruro de ácido" (1,8 g) en CH₂Cl₂ (20 ml) a 0 °C se añadió una solución de hidruro de diisobutilaluminio en tolueno (1,5 M, 6,2 ml). La solución resultante se agitó a 0 °C durante 3 horas y se inactivó añadiendo metanol. Se añadió una solución saturada de sal de Rochelle (tartrato de sodio y potasio, CAS 304-59-6), seguido de agitación vigorosa a t.a. durante 2 h. A continuación, se añadió CH₂Cl₂ y la capa orgánica se lavó con agua (2x), se secó (Na₂SO₄) se filtró y se concentró. El residuo se purificó mediante cromatografía ultrarrápida sobre gel de sílice (acetato de etilo/ciclohexano) para obtener el producto (1,05 g, 61%).

¹H RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 8,9 (m, 1H), 8,1 (d, 1H), 7,7-7,6 (m, 4H) 7,4 (s, 2H), 5,2 (s, 2H), 4,3 (d, 1 H), 4,1 (d, 1 H).

Etapa 8: 4-[5-(3,4,5-Triclorofenil)-5-(trifluorometil)-4H-isotiazol-3-il]naftalen-1-carbaldehído

A una solución del producto de la etapa 7 (1,35 g) en CH₂Cl₂ (30 ml) a t.a. se le añadió Dess-Martin-peryodinano (1,31 g, CAS 87413-09-0). La reacción se agitó durante la noche, se filtró y se concentró. El residuo se purificó mediante cromatografía ultrarrápida sobre gel de sílice (acetato de etilo/ciclohexano) para proporcionar el producto (0,78 g, 58%).

¹H RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 10,5 (s, 1H), 9,3 (d, 1H), 8,6 (d, 1H), 8,0 (d, 1H), 7,8-7,6 (m, 3H), 7,4 (s, 2 H), 4,3 (d, 1 H), 4,1 (d, 1 H).

Etapa 9: 1-[(E)-[4-[5-(3,4,5-Triclorofenil)-5-(trifluorometil)-4H-isotiazol-3-il]-1-naftil]metilnamino]-3-(2,2,2-trifluoroetil) urea

Una solución del producto de la etapa 8 (0,2 g) y 1-amonio-3-(2,2,2-trifluoroetil) urea (70 mg) en EtOH (5 ml) y ácido acético (1 gota) se agitó a 70 °C durante 3 h, y durante la noche a t.a. A continuación, se agregaron agua y acetato de etilo y se separaron las capas. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa de K₂CO₃ al 5%, se secó (Na₂SO₄) y se concentró. El residuo se purificó mediante cromatografía ultrarrápida sobre gel de sílice (acetato de etilo/ciclohexano) para proporcionar el producto (0,12 g, 48%).

¹H RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 8,9-8,7 (m, 2H), 8,5 (s, 1H), 8,3 (m, 1H), 7,9 (d, 1H), 7,7-7,6 (m, 3H), 7,4 (s, 2 H), 6,5 (m, 1 H), 4,3 (d, 1 H), 4,2-4,0 (m, 3 H).

Ejemplo de síntesis S.2

N-[(3,3-difluorociclobutil)metil]-4-[5-(3,4,5-triclorofenil)-5-(trifluorometil)-4H-isotiazol-3-il] naftalen-1-carboxamida

(Ejemplo de compuesto 2-1; compuesto de fórmula IA, en la que R^{2a}, R^{2b} y R^{2c} son Cl, y A es A² = -C(=O)-NH-CH₂-(3,3-difluorociclobut-1-ilo))

A una solución de ácido 4-[5-(3,4,5-triclorofenil)-5-(trifluorometil)-4H-isotiazol-3-il]naftalen-1-carboxílico (es decir, el producto del ejemplo de síntesis 1, etapa 6) (0,2 g), cloruro de (3,3-difluorociclobutil)metilammonio (70 mg, CAS 1159813-93-0) y hexafluorofosfato de bromotripirrolidino fosfonio ("PyBroP", 0,22 g) en CH₂Cl₂ (20 ml) a 0° C se añadió N, N-diisopropiletilamina (0,2 g). La reacción se agitó a t.a. durante 66 h. A continuación, la mezcla se concentró y el residuo se purificó mediante cromatografía ultrarrápida en gel de sílice (acetato de etilo/ciclohexano) para proporcionar el producto (0,18 g, 75%).

¹H RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 8,7 (m, 1H), 8,2 (m, 1H), 7,7-7,4 (m, 6H), 6,0 (m, 1H), 4,3 (d, 1H), 4,1 (d, 1 H), 3,7 (m, 2 H), 2,9-2,7 (m, 2 H), 2,6-2,5 (m, 1 H), 2,5-2,3 (m, 2 H).

Ejemplo de síntesis S.3*

N-[[4-[5-[3-Bromo-5-(trifluorometil) fenil]-5-(trifluorometil)-4H-isotiazol-3-il]-1-naftil] metil] propanamida

(Ejemplo de compuesto 3-2; compuesto de fórmula IA, en la que R^{2a} es Br, R^{2b} es H, R^{2c} es CF₃ y A es A³ = -CH₂-NH-C(=O)-CH₂CH₃)

5 Para la síntesis de 4-bromonaftalen-1-carbonitrilo (CAS 92616-49-4), ver WO 2007/087488 (pág. 24).

Etapa 1: (4-bromo-1-naftil) metanamina

10 A una solución de 4-bromonaftaleno-1-carbonitrilo (60 g) en THF (500 ml) a 0 °C se añadió una solución del complejo de borano-sulfuro de dimetilo (780 ml, 1 M en THF, H₃B-S(CH₃)₂, CAS 13292-87-0) gota a gota. La solución se agitó a t.a. durante la noche. A continuación, a 0 °C, se añadió metanol (2 L) y la reacción se concentró. Se añadió una solución acuosa saturada de NaHCO₃ y la capa acuosa se extrajo con acetato de etilo (3 x 500 ml). Las capas orgánicas combinadas se lavaron con salmuera, se secaron (Na₂SO₄), se filtraron y se concentraron para proporcionar el producto en bruto (42,5 g, 70%) que se usó en la siguiente etapa sin purificación adicional.

Etapa 2: N-[(4-bromo-1-naftil) metil]carbamato de terc-butilo

20 A una solución del producto de la etapa 1 en THF (1 L) a 0 °C se añadió trietilamina (150 ml), seguido de la adición gota a gota de una solución de dicarbonato de di-terc-butilo ("Boc₂O", 92 g) en THF (200 ml). La solución resultante se agitó a t.a. durante la noche. A continuación, se añadió agua (800 ml) y la solución se extrajo con acetato de etilo (3 x 600 ml). Las capas orgánicas combinadas se lavaron con salmuera, se secaron (Na₂SO₄), se filtraron y se concentraron. El residuo se purificó mediante cromatografía ultrarrápida sobre gel de sílice (éter de petróleo/acetato de etilo) para proporcionar el producto (50 g, 42%).

25 ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 8,31 (dd, 1H), 8,05 (m, 1H), 7,74 (d, 1H), 7,66-7,57 (m, 2H), 7,29 (d, 1H), 4,85 (s, ancho, 1 H), 4,75 (m, 2 H), 1,48 (s, 9 H)

Etapa 3: N-[(4-acetil-1-naftil) metil]carbamato de terc-butilo

30 A una solución del producto de la etapa 2 (36 g) en DMSO (600 ml) se añadió 1-(viniloxi)-butano (40 g), trietilamina (8 ml), 1,3-bis (difenilfosfino) propano ("DPPP", 2,4 g) y Pd(OAc)₂ (2,4 g). La solución resultante se agitó a 100 °C durante la noche. La reacción se enfrió a 0 °C, se trató con una solución acuosa de HCl (1 M, 500 ml) y se extrajo con acetato de etilo (3 x 500 ml). Las capas orgánicas combinadas se lavaron con salmuera, se secaron (Na₂SO₄), se filtraron y se concentraron. El residuo se purificó mediante cromatografía ultrarrápida sobre gel de sílice (éter de petróleo/acetato de etilo) para proporcionar el producto (30 g, 83%).

35 ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 8,75 (dd, 1H), 8,08 (d, 1H), 7,88 (d, 1H), 7,66-7,57 (m, 2H), 7,49 (d, 1H), 4,92 (s ancho, 1 H), 4,82 (m, 2 H), 2,74 (s, 3 H), 1,49 (s, 9 H).

Etapa 4: N-[[4-[3-[3-bromo-5-(trifluorometil)fenil]-4,4,4-trifluoro-but-2-enoil]-1-naftil] metil] carbamato de terc-butilo

40 A una solución del producto de la etapa 3 (32 g) en acetato de etilo (500 ml) se añadió 1-[3-bromo-5- (trifluorometil) fenil]-2,2,2-trifluoro-etanona (CAS 1132701-00-8, 38,5 g), K₂CO₃ (27,5 g) y N, N-diisopropiletilamina (27,5 g). La solución resultante se agitó a 120 °C durante la noche. A continuación, la mezcla se enfrió a t.a., se trató con una solución acuosa saturada de NH₄Cl (400 ml) y se extrajo con acetato de etilo (3 x 400 ml). Las capas orgánicas combinadas se lavaron con salmuera, se secaron (Na₂SO₄), se filtraron y se concentraron. El residuo se purificó mediante cromatografía ultrarrápida sobre gel de sílice (éter de petróleo/acetato de etilo) para proporcionar el producto (31 g, 48%).

45 ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 8,46 (d, 1H), 8,02 (d, 1H), 7,71 (d, 1H), 7,64-7,56 (m, 2H), 7,49-7,40 (m, 4H), 7,29 (m, 1 H), 4,88 (s ancho, 1 H), 4,77 (m, 2 H), 1,49 (s, 9 H).

Etapa 5: N-[[4-[3-[3-bromo-5-(trifluorometil) fenil]-4,4,4-trifluoro-3-sulfanil-butanoil]-1-naftil] metil] carbamato de terc-butilo

55 Se trató una solución del producto de la etapa 4 (15 g, mezcla de isómeros E/Z) en CH₂Cl₂ (250 ml) con N, N-diisopropiletilamina (19,3 g). A -10 °C, se burbujeó sulfuro de hidrógeno gaseoso (H₂S) a través de la solución hasta que se saturó la solución. La mezcla se agitó durante 1 h a -10 °C, se diluyó con CH₂Cl₂ y se añadió a una solución acuosa de tampón fosfato 1 M (pH 4-5). Las capas se separaron. La capa orgánica se lavó dos veces con solución acuosa de tampón fosfato 1 M (pH 4-5), se secó (Na₂SO₄), se filtró y se concentró para producir el producto en bruto (14,3 g, 90%) que se utilizó en la siguiente etapa. sin purificación adicional.

60 ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 8,8-8,7 (m, 1H), 8,1 (m, 1H), 7,8 (s, 1H), 7,7 (s, 1 H), 7,7-7,4 (m, 5 H), 4,9 (s ancho, 1 H), 4,8 (m, 2 H), 4,4 (d, 1 H), 4,1 (d, 1 H), 1,5 (s, 9 H)).

Etapa 6: N-[[4-[5-[3-bromo-5-(trifluorometil)fenil]-5-(trifluorometil)-4H-isotiazol-3-il]-1-naftil]metil] carbamato de terc-butilo (ejemplo de compuesto 3-1)

65

A -10 °C, el producto de la etapa 5 (14,3 g) en CH₂Cl₂ (250 ml) se trató con N, N-diisopropiletilamina (11,7 g) y con una solución de ácido hidroxilamina-O-sulfónico ("HOSA", 3,1 g) en agua (10 ml). La reacción se agitó a -10 °C durante 1,5 h, y a continuación se diluyó con CH₂Cl₂ (300 ml). La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de NH₄Cl (3x). A la capa orgánica se le añadieron Na₂SO₄ y ácido para-toluenosulfónico ("pTsOH", 0,4 g) y la suspensión resultante se agitó a t.a. durante 2 h. A continuación, la reacción se filtró y el filtrado se lavó con una solución acuosa de K₂CO₃ al 5 % (2x), se secó (Na₂SO₄), se filtró y se concentró para producir el producto en bruto que mediante cromatografía ultrarrápida en gel de sílice para proporcionar el producto (9,9 g, 69%).

¹H RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 8,3 (d, 1H), 8,1 (m, 2H), 7,9-7,7 (m, 3H), 7,7-7,5 (m, 3H), 4,9 (s ancho, 1 H), 4,8 (m, 2 H), 4,4 (d, 1 H), 4,1 (d, 1 H), 1,5 (s, 9 H).

Etapa 7: [4-[5-[3-Bromo-5-(trifluorometil)fenil]-5-(trifluorometil)-4H-isotiazol-3-il]-1-naftil] metanamina (ejemplo de compuesto 3-2)

Se trató una solución del producto de la etapa 6 (6,7 g) en CH₂Cl₂ (100 ml) con una solución 1 M de ZnCl₂ en éter dietílico (23 ml) y la mezcla se agitó a t.a. durante la noche. A continuación, se añadió más solución 1 M de ZnCl₂ en Et₂O (11 ml) y la reacción se agitó a 35 °C durante 8 h y a t.a. durante la noche. A continuación, se añadió éter dietílico (400 ml). La capa orgánica se lavó con agua (3 x), se secó (Na₂SO₄), se filtró y se concentró. El residuo se purificó mediante cromatografía ultrarrápida sobre gel de sílice (CH₂Cl₂/metanol) para proporcionar el producto (2,06 g, 36%).

¹H RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 8,0 (m, 2H), 7,9-7,75 (m, 3H), 7,65 (s, 1H), 7,4-7,3 (m, 2H), 6,9-6,8 (m, 1 H), 4,45 (d, 1 H), 4,3 (s ancho, 2 H), 4,05 (d, 1 H).

Etapa 8: N-[4-[5-[3-Bromo-5-(trifluorometil) fenil]-5-(trifluorometil)-4H-isotiazol-3-il]-1-naftil]metil] propanamida

Se añadió cloruro de propionilo (40 mg) a una solución del producto de la etapa 7 (0,2 g) y trietilamina (80 mg) en THF (20 ml) a 0 °C. La reacción se agitó a t.a. durante 66 h. A continuación, la mezcla se filtró y se diluyó con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua (2x), se secó (Na₂SO₄), se filtró y se concentró. El residuo se purificó mediante cromatografía ultrarrápida sobre gel de sílice para proporcionar el producto (0,12 g, 54%).

¹H RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 8,7 (d, 1H), 8,1 (m, 1H), 7,8 (s, 1H), 7,7 (s, 1H), 7,7-7,5 (m, 4H), 7,5 (d, 1 H), 5,7 (s ancho, 1 H), 4,9 (m, 2 H), 4,3 (d, 1 H), 4,1 (d, 1 H), 2,2 (q, 2 H), 1,2 (t, 3 H).

II. Evaluación de la actividad plaguicida:

La actividad de los compuestos de fórmula I de la presente invención puede demostrarse y evaluarse mediante el siguiente ensayo biológico.

B.1 Palomilla doros de diamante (*Plutella xilostella*)

El compuesto activo se disolvió a la concentración deseada en una mezcla de 1:1 (vol:vol) de agua destilada: acetona. Se añadió tensioactivo (Kinetic HV) a una tasa de 0,01% (vol/vol). La solución de prueba se preparó el día de uso.

Se sumergieron hojas de col en la solución de prueba y se secaron al aire. Las hojas tratadas se colocaron en placas de petri revestidas con papel de filtro húmedo y se inocularon con diez larvas en 3er estadio. La mortalidad se registró 72 horas después del tratamiento. Los daños por alimentación también se registraron utilizando una escala de 0-100%.

En esta prueba, los compuestos 1-1, 1-2, 1-3, 2-1, 2-2, 2-3 y 2-4 a 500 ppm, respectivamente, mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

B.2 Pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*)

Para evaluar el control del pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*) por medios sistémicos, la unidad de prueba consistió en placas de 96 pocillos de microtitulación que contienen dieta artificial líquida bajo una membrana artificial.

Los compuestos se formularon utilizando una solución que contiene 75% v/v agua y 25% v/v de DMSO. Se pipetearon diferentes concentraciones de compuestos formulados en la dieta de los áfidos, utilizando un pipeteador personalizado, en dos repeticiones.

Después de la aplicación, 5 - 8 áfidos adultos fueron colocados en la membrana artificial en el interior de los pocillos de la placa de microtitulación. A continuación, se dejó que los pulgones chuparan en la dieta de pulgón tratado y se incubaron a aproximadamente 23 + 1°C y aproximadamente 50 + 5% de humedad relativa durante 3 días. A continuación, se evaluó visualmente la mortalidad y la fecundidad de los áfidos.

En esta prueba, los compuestos 1-1, 1-3, 2-1, 2-2, 2-3 y 2-4 a 2500 ppm, respectivamente, mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

B.3 Mosca mediterránea de la fruta (*Ceratitis capitata*)

Para evaluar el control de mosca mediterránea de la fruta (*Ceratitis capitata*), la unidad de prueba consistió en placas de microtitulación que contienen una dieta de insectos y 50-80 huevos de *C. capitata*.

Los compuestos se formularon utilizando una solución que contiene 75% v/v agua y 25% v/v de DMSO. Se rociaron diferentes concentraciones de compuestos formulados sobre la dieta de insectos a 5 µl usando un microatomizador construido a medida, en dos repeticiones.

Después de la aplicación, las placas de microtitulación se incubaron a aproximadamente 28 + 1 °C y alrededor de 80 + 5% de humedad relativa durante 5 días. A continuación se evaluó visualmente la mortalidad de huevos y larvas.

En esta prueba, los compuestos 1-1, 1-2, 1-3, 2-1, 2-2, 2-3 y 2-4 a 2500 ppm, respectivamente, mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

B.4 Pulgón de la algarroba (*Megoura viciae*)

Para evaluar el control de pulgón de la algarroba (*Megoura viciae*) a través de contacto o medios sistémicos, la unidad de prueba consistió en placas de 24 pocillos de microtitulación que contenían discos amplios de hojas de haba.

Los compuestos se formularon utilizando una solución que contiene 75% v/v agua y 25% v/v de DMSO. Se rociaron diferentes concentraciones de compuestos formulados sobre los discos de hojas a 2,5 µl utilizando un microatomizador construido a medida, en dos repeticiones.

Después de la aplicación, los discos de hojas se secaron al aire y 5 - 8 áfidos adultos se colocaron en los discos de hojas dentro de los pocillos de la placa de microtitulación. A continuación, se dejó que los pulgones chuparan en los discos de hojas tratados y se incubaron a aproximadamente 23 + 1°C y aproximadamente 50 + 5% de humedad relativa durante 5 días. A continuación, se evaluó visualmente la mortalidad y la fecundidad de los áfidos.

En esta prueba, los compuestos 1-3, 2-1, 2-2, 2-3 y 2-4 a 2500 ppm, respectivamente, mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con controles no tratados.

B.5 Gusano de la yema del tabaco (*Heliothis virescens*)

Para evaluar el control de gusano de la yema del tabaco (*Heliothis virescens*), la unidad de prueba consistió en placas de 96 pocillos de microtitulación que contienen una dieta de insectos y 15-25 huevos de *H. virescens*. Los compuestos se formularon usando una solución que contenía 75% v/v de agua y 25% v/v de DMSO. Se rociaron diferentes concentraciones de compuestos formulados sobre la dieta del insecto a 10 µl usando un microatomizador construido a medida, en dos repeticiones. Después de la aplicación, las placas de microtitulación se incubaron a aproximadamente 28 + 1°C y aproximadamente 80 + 5% de humedad relativa durante 5 días. A continuación se evaluó visualmente la mortalidad de huevos y larvas.

En esta prueba, los compuestos 1-1, 1-2, 1-3, 2-1, 2-2, 2-3 y 2-4 a 2500 ppm, respectivamente, mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

B.6 Picudo del algodnero (*Anthonomus grandis*)

Para evaluar el control de picudo del algodnero (*Anthonomus grandis*), la unidad de prueba consistió en placas de 96 pocillos de microtitulación que contienen una dieta para insectos y 5-10 huevos de *A. grandis*.

Los compuestos se formularon utilizando una solución que contiene 75% v/v agua y 25% v/v de DMSO. Se rociaron diferentes concentraciones de compuestos formulados sobre la dieta de insectos a 5 µl usando un microatomizador construido a medida, en dos repeticiones.

Después de la aplicación, las placas de microtitulación se incubaron a aproximadamente 25 ± 1 °C y aproximadamente 75 ± 5% de humedad relativa durante 5 días. A continuación se evaluó visualmente la mortalidad de huevos y larvas.

En esta prueba, los compuestos 1-1, 1-2, 1-3, 2-1, 2-2, 2-3 y 2-4 a 2500 ppm, respectivamente, mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

B.7 Trips de las orquídeas (*dichromothrips corbettii*)

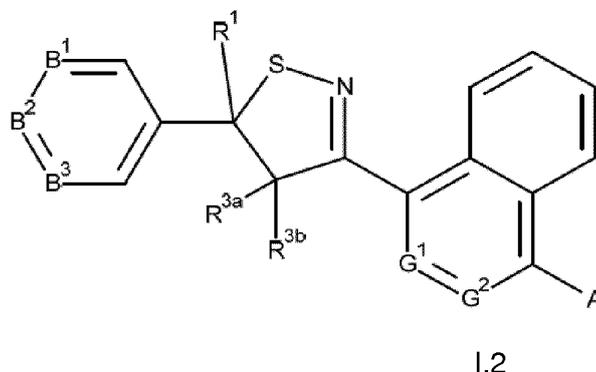
Los adultos de *Dichromothrips corbetti* utilizados para el bioensayo se obtuvieron de una colonia mantenida continuamente en condiciones de laboratorio. Para propósitos de prueba, el compuesto de prueba se diluye en una mezcla 1:1 de acetona: agua (vol:vol), más Kinetic HV a una tasa de 0,01% v/v.

- 5 Se evaluó la potencia de trips de cada compuesto usando una técnica de inmersión floral. Todos los pétalos de las flores de orquídeas intactas individuales se sumergieron en la solución de tratamiento y se dejaron secar en placas de Petri. Los pétalos tratados se colocaron en plástico resellable individual junto con aproximadamente 20 trips adultos. Todas las arenas de prueba se mantuvieron bajo luz continua y una temperatura de aproximadamente 28 °C durante la duración del ensayo. Después de 3 días, se contó el número de trips vivos en cada pétalo. El porcentaje de mortalidad se registró 72 horas después del tratamiento.
- 10

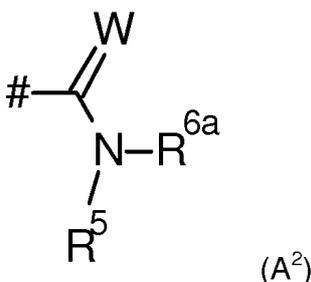
En esta prueba, los compuestos 2-1, 2-2, 2-3 y 2-4 a 500 ppm, respectivamente, mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con controles no tratados.

REIVINDICACIONES

1. Compuestos de isotiazolina de fórmula 1.2



en los que
A es un grupo A², en el que A² es un grupo de la siguiente fórmula:



en el que # indica el enlace al resto de la molécula;

W es O;

B¹, B² y B³ son cada uno independientemente CR²;

G¹ y G² son cada uno independientemente CR⁴;

R¹ es CF₃;

cada R² se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno y haloalquilo C₁-C₂;

R^{3a}, R^{3b} se selecciona cada uno independientemente del grupo que consiste en hidrógeno y halógeno;

cada R⁴ es hidrógeno;

R⁵ es hidrógeno;

R^{6a} se selecciona entre H, -X-R^{6b} y -N(R^{5a})R^{6c}; en el que

X se selecciona entre -C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-C(=O)-NH-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-C(R^a)₂-C(=O)-NH-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂S(O)_n-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-C(R^a)₂-S(O)_n-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-OC(R^a)₂- y -C(R^a)₂-C(R^a)₂-OC(R^a)₂-, en los que cada R^a se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno y metilo;

R^{5a} tiene el significado indicado para R⁵;

R^{6b} se selecciona entre alqueno C₂-C₈, haloalqueno C₂-C₈, alquino C₂-C₈, haloalquino C₂-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈ y cicloalquilo C₃-C₈ sustituido por un grupo ciano;

R^{6c} es -C(=O)N(R^{14a})R^{14b};

R^{14a} se selecciona entre hidrógeno y alquilo C₁-C₆; y

R^{14b} se selecciona entre hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆ y cicloalquilo C₃-C₆ alquilo C₁-C₄, en el que los restos cicloalquilo en los tres últimos grupos mencionados pueden estar sustituidos por un grupo ciano; y alquilo C₁-C₆ sustituido con un grupo CN;

cada n es independientemente 0, 1 o 2 y

los N-óxidos, estereoisómeros y sales agrícola o veterinariamente aceptables de los mismos.

2. Compuestos, según la reivindicación 1, en los que X se selecciona entre -C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-C(=O)-NH-C(R^a)₂-, -C(R^a)₂-C(R^a)₂-S(O)_n-C(R^a)₂- y -C(R^a)₂-C(R^a)₂-OC(R^a)₂-,

en los que cada R^a y n son independientemente, tal como se definen en la reivindicación 1.

3. Compuestos, según la reivindicación 1, en los que R^{14a} es hidrógeno; y R^{14b} se selecciona entre hidrógeno, alquilo

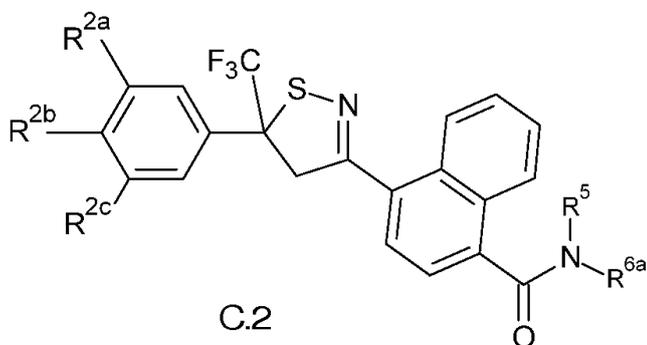
C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄.

4. Compuestos, según la reivindicación 1, que son de fórmula C.2:

5

10

15



20 en la que R^{2a}, R^{2b}, R^{2c}, R⁵ y R^{6a} se definen a continuación:

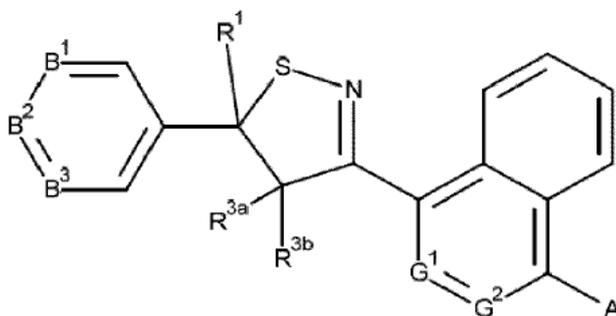
Ejemplo	R ^{2a} , R ^{2b} , R ^{2c}	R ⁵	R ⁶
2-1	Cl, Cl, Cl	H	-CH ₂ -(3,3-difluorociclobut-1-ilo)
2-2	Cl, Cl, Cl	H	-CH ₂ -(1-ciano-cicloprop-1-ilo)
2-4	Cl, F, Cl	H	CH ₂ CH=CH ₂
2-5	Cl, F, Cl	H	-CH ₂ C(=O)NHCH ₂ CH=CH ₂
2-6	Cl, F, Cl	H	-CH ₂ C(=O)NHCH ₂ C≡CH
2-7	Cl, F, Cl	H	-NH-C(=O)NHCH ₂ CF ₃
2-8	Cl, F, Cl	H	H
2-9	Cl, F, Cl	H	CH ₂ -ciclopropilo
2-10	Cl, F, Cl	H	CH ₂ C≡CH
2-11	Cl, F, Cl	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH=CH ₂
2-12	Cl, F, Cl	H	CH ₂ C(=O)NHCH ₂ (ciclopropilo)
2-13	Cl, F, Cl	H	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ CH ₂ (ciclopropilo)

5. Compuestos de isotiazolina de fórmula I.1

25

30

35



I.1

40

en los que

A es un grupo A¹, en el que A¹ es -C(=NR⁶)R⁸;

B¹, B² y B³ son cada uno independientemente CR²;

G¹ y G² son cada uno independientemente CR⁴;

R¹ es CF₃;

cada R² se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno y haloalquilo C₁-C₂;

R^{3a}, R^{3b} se seleccionan cada uno independientemente entre hidrógeno y halógeno;

5 cada R⁴ es hidrógeno;

R⁸ es hidrógeno;

R⁶ es -NR^{10a}R^{10b};

R^{10a} se selecciona entre hidrógeno y alquilo C₁-C₆;

R^{10b} es -C(=O)N(R^{14a})R^{14b};

10 R^{14a} se selecciona entre hidrógeno y metilo; y

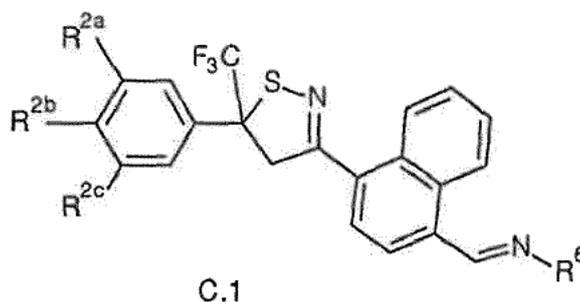
R^{14b} se selecciona entre hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄ y haloalquinilo C₂-C₄.

6. Compuesto, según la reivindicación 5, de fórmula C.1, tal como se define a continuación:

15

20

25



30

Ejemplo	R ^{2a} , R ^{2b} , R ^{2c}	R ⁶
1-1	Cl, Cl, Cl	-NHC(=O)-NHCH ₂ CF ₃
1-2	Cl, Cl, Cl	-NHC(=O)-NHCH ₂ CCH
1-3	Cl, Cl, Cl	-NHC(=O)-NHCH ₂ CHF ₂

35

7. Composición agrícola que comprende al menos un compuesto de fórmula I, tal como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, un estereoisómero del mismo y/o al menos una sal agrícolamente aceptable del mismo, y al menos un líquido inerte y/o portador sólido agrícolamente aceptable.

40

8. Composición veterinaria que comprende al menos un compuesto de fórmula I, tal como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, un estereoisómero del mismo y/o al menos una sal veterinariamente aceptable del mismo, y al menos un líquido inerte y/o portador sólido veterinariamente aceptable.

45

9. Compuesto, tal como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, o un estereoisómero y/o una sal veterinariamente aceptable del mismo, para su uso en el tratamiento o protección de un animal de una infestación o infección por plagas de invertebrados.

50

10. Procedimiento no terapéutico para el control de plagas de invertebrados, cuyo procedimiento comprende tratar las plagas, su suministro de alimentos, su hábitat o su caldo de cultivo o una planta, material de propagación vegetal, suelo, área, material o entorno en el que las plagas están creciendo o pueden crecer, o los materiales, plantas, material de propagación vegetal, suelos, superficies o espacios a proteger del ataque o infestación de plagas de invertebrados con una cantidad plaguicidamente eficaz de al menos un compuesto de imina de fórmula I, tal como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, un estereoisómero del mismo y/o al menos una sal agrícolamente aceptable del mismo.

55

11. Procedimiento según la reivindicación 10, para

(i) proteger plantas del ataque o infestación por plagas de invertebrados, cuyo procedimiento comprende tratar las plantas con una cantidad plaguicidamente eficaz de al menos un compuesto de fórmula I, tal como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, un estereoisómero del mismo y/o al menos una sal agrícolamente aceptable del mismo; o

(ii) proteger el material de propagación vegetal y/o las plantas que crecen a partir del mismo del ataque o infestación

por plagas de invertebrados, cuyo procedimiento comprende tratar el material de propagación vegetal con una cantidad plaguicidamente eficaz de al menos un compuesto de fórmula I, tal como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, un estereoisómero del mismo y/o al menos una sal agrícolamente aceptable del mismo.

- 5 12. Material de propagación vegetal, que comprende al menos un compuesto de fórmula I, tal como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, un estereoisómero del mismo y/o al menos una sal agrícolamente aceptable del mismo.