

00 96872

JD DE
E DE
ION

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicación : 0096872 0000000 Folios: 67
Fecha (AMD): 2000-12-21 10:49:35
Trámite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 411 PRESENTAC.
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

DATOS DEL SOLICITANTE

(71) Nombres y Apellidos o Razón Social

Aventis CropScience GmbH ✓

No. de Identificación

Representante Legal (Persona Jurídica)

País de Domicilio

ALEMANIA ✓

Departamento o Estado

Dirección

Ciudad

FRANKFURT

Teléfono

(74) DATOS DEL APODERADO

Nombre

GUSTAVO HOLLMANN RESTREPO ✓

Dirección y Domicilio

Carrera 11A No. 94-76 - Of. 308

Ciudad

Bogotá, D.C.

Teléfono 6161948

DATOS DEL INVENTOR

(72) Nombre del Inventor(es)

1. Dr. Wolfgang Schaper, 2. Dr. Henricus Maria Martinus Bastiaans, 3. Dr. Sven Harmsen, 4. Dr. Uwe Düller, 5. Dr. Jörg Tiebes, 6. Dr. Daniela Jans, 7. LTA Waltraud Hempel, 8. Dr. Ulrich Sanft y 9. Dr. Maria-Theresia Thünessen.

Identificación

Dirección

1. Diedorf, Alemania, 2. Usingen, Alemania, 3. Lübeck, Alemania, 4. Rodgau, Alemania, 5. Frankfurt, Alemania, 6. Bad Homburg v. d. H., v. d. H., Alemania, 7. Liederbach, Alemania, 8. Eppstein/Ts., Alemania y 9. Heidesheim, Alemania.

Ciudad

Teléfono

DATOS DE LA PATENTE DE INVENCION

(54) Título de la Invención **"DERIVADOS DE AZOLIL-ALQUIL-AZOLES, PROCEDIMIENTO PARA SU PREPARACION Y SU UTILIZACION COMO AGENTES PLAGUICIDAS".**

PRIORIDAD REIVINDICADA SI ☒ NO ☐ TIPO DE PRIORIDAD ANDINA ☐ UNIONISTA ☒

(33) País Alemania

(32) Fecha

Diciembre 23, 1999 ✓

(31) No. Solicitud

19962901.3

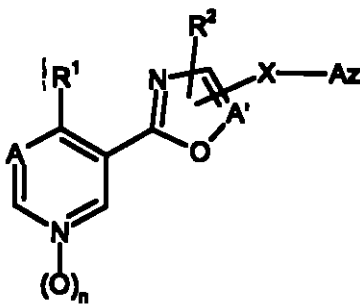
Para Publicar a los ☐ 6 meses ☐ 12 meses ☐ 18 meses a partir de la fecha de la presente solicitud

(51) CLASIFICACION INTERNACIONAL

19A A 01 N 43/78

RESUMEN CON EL OBJETO Y LA FINALIDAD DE LA PATENTE DE MODELO DE UTILIDAD

Derivados de azolilalquil-oxazoles y oxadiazoles de la fórmula general (I)



en la que los símbolos e índices están definidos como en la memoria descriptiva, además de tener una buena compatibilidad con las plantas y una favorable toxicidad para animales de sangre caliente, se adecuan muy bien para la represión de plagas de animales, tales como insectos, ácaros, nematodos, helmintos y moluscos así como para la represión de endo- y ecto-parásitos en el sector médico veterinario.

ANEXOS DE LA SOLICITUD

Certificado de Existencia y Representación Legal cuando el solicitante sea Persona Jurídica	☐
Los poderes debidamente otorgados, o mención de su protocolización ante la SIC	☐
Recibo de la tasa respectiva	☒
Recibo de la tasa por concepto de excedente de palabras en la publicación	☐
Si se reivindica prioridad Andina:	
Copia de la primera solicitud	☐
Traducción oficial	☐
Si se reivindica prioridad Unionista: Convenio de Paris	
Copia certificada primera solicitud:	☐
Nota: Debe presentarse dentro de los tres (3) meses, contados a partir de la fecha de radicación de la solicitud posterior	
Traducción simple	☐
Capítulo descriptivo	☒
Dibujos, planos necesarios	☐
Capítulo reivindicatorio	☒
Tarjeta archivo propietario según formato	☒
Tarjeta archivo temático según formato	☒
Extracto para publicación según formato	☒
Arte final 12 x 12 cms y 6x6 cms	☐
Otros Documentos	☐

SOLICITO LA CONCESION DE LA PATENTE DE MODELO DE UTILIDAD Y DECLARO QUE LA INVENCION ES NUEVA Y DE MI PROPIEDAD

FIRMA

NOMBRE GUSTAVO HOLLMANN RESTREPO

CC. 2.878.023 de Bogotá

T.P.No. 5803



2

Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

NIT : 000176089-2

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicación : 00016872 00000000

Folios: 67

Fecha (RD): 2000-12-21 10:49:35

Trámite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 411 PRESENTAC

Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 76,981

FECHA : DICIEMBRE 18 DE 2000

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	SUCURSAL	CUENTA	Nº. PAGO	Vr. PAGO
GUSTAVO KOLLNAN	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	BOGOTA	050-00110-6	3057963	5,388,600.00

***** CONCEPTO *****

CANT. HISTORICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	600,000.00
	TOTAL :	\$ 608,600.00

SON: SEISCIENTOS OCHO MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Carrera 13 No. 27-00 Pisos 5, 7 y 10
Conmutador: 382 0840
Fax: 350 5220
e-mail: info@sic.gov.co
www.sic.gov.co
Bogotá, D.C., Colombia

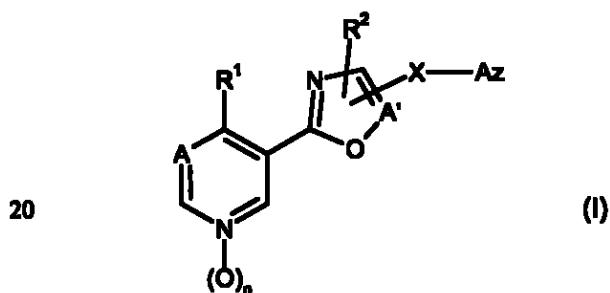
**Derivados de azolil-alquil-azoles, procedimiento para su preparación
y su utilización como agentes plaguicidas**

El invento se refiere a derivados de azolil-alquilo, a procedimientos para su preparación y a su utilización para reprimir plagas de animales, particularmente insectos, ácaros, ectoparásitos y helmintos.

Ya es conocido que determinados heterocicli-alquil-azoles, particularmente el 3-[2-(pirrol-1-il)-etil]-5-(4-trifluorometil-3-piridil)-1,2,4-oxadiazol, presentan un efecto insecticida (documento de solicitud de patente internacional WO-A98/57969). sin embargo, el efecto biológico de estos compuestos, particularmente en el caso de cantidades consumidas y concentraciones bajas, no es satisfactorio en todos los sectores de aplicaciones.

Se han encontrado por fin derivados de azolilalquil-oxazoles y -oxadiazoles de la fórmula general (I),

15



20

en la que los símbolos e índices son como se definen seguidamente, los cuales, al mismo tiempo que presentan una buena compatibilidad con las plantas y una favorable toxicidad para animales de sangre caliente, se adecuan para reprimir plagas de animales, tales como insectos y ácaros, así como para reprimir endoparásitos en el sector médico veterinario.

El invento concierne por lo tanto a compuestos de la fórmula (I), en los que los símbolos e índices tienen los siguientes significados:

R¹ es halógeno-alquilo (C₁-C₄), particularmente fluoro-alquilo (C₁-C₄);

R² es hidrógeno, halógeno, alquilo (C₁-C₄), cicloalquilo (C₃-C₆) o halógeno-alquilo (C₁-C₄);

A y A' son iguales o diferentes y en cada caso CH ó N;

n es 0 ó 1;

35

- X** es una unidad de alquileo (C₁-C₈) ramificada o sin ramificar, en la que eventualmente un enlace simple de C-C puede estar reemplazado por un enlace doble o triple y en la que además uno o varios grupos CH₂ pueden estar reemplazados por un grupo carbonilo o una unidad con heteroátomo(s), tal como oxígeno, S(O)_x, con x = 0, 1 ó 2, NR³, con R³ = H, alquilo (C₁-C₄), alqueno o alquino C₃ ó C₄, alquil (C₁-C₄)-sulfonilo, alcanilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-carbonilo o dimetil-sililo, y en la que, además, de 3 a 8 átomos de este radical hidrocarbilo, eventualmente modificado como antes se menciona, pueden formar un ciclo;
- Az** es un grupo de la fórmula general (II),



en la que los símbolos tienen los siguientes significados:

- E, D, G y L** son iguales o diferentes y significan en cada caso CH ó N, siendo CH en cada caso por lo menos uno de los sitios E, D, G y L y siendo N por lo menos uno de ellos; y estando los átomos de carbono eventualmente sustituidos y pudiendo formar un anillo los sustituyentes de átomos de carbono contiguos, eventualmente junto con los carbonos del grupo Az.

Preferiblemente, los símbolos e índices tienen en la fórmula (I) los siguientes significados:

- R¹** es preferiblemente fluoro-alquilo (C₁-C₄), particularmente trifluorometilo.
- R²** es preferiblemente hidrógeno o metilo, particularmente hidrógeno.
- n** es preferiblemente 0.
- A** es preferiblemente CH.
- A'** es preferiblemente N.
- X** es preferiblemente alquileo (C₁-C₄), particularmente -(CH₂)-, -(CH₂)₂- o -(CH₂)₃-.
- Az** es preferiblemente un radical imidazolilo, pirazolilo o triazolilo, que puede estar sustituido con uno, dos o tres radicales, de modo especialmente

preferido el radical imidazolilo, pirazolilo o 1,2,4-triazol-1-ilo, particularmente el radical pirazolilo o 1,2,4-triazol-1-ilo.

Como radicales (R^4), iguales o diferentes, con los que puede estar
5 sustituido Az, se prefieren:

a) halógeno, hidroxilo, ciano, tiociano;

b) alquilo (C_1-C_8), alquenilo (C_2-C_8), alquinilo (C_2-C_8), cicloalquilo (C_3-C_8), cicloalquenilo (C_4-C_8), arilo, heterociclilo, alcoxi (C_1-C_8),
10 alquenil (C_2-C_8)-oxi, alquinil (C_2-C_8)-oxi, alquil (C_1-C_8)-tio, alquil (C_1-C_8)-sulfinilo, alquil (C_1-C_8)-sulfonilo, alquenil (C_2-C_8)-tio, alquinil (C_2-C_8)-tio; COY, en que Y significa hidrógeno, alquilo (C_1-C_8), alcoxi (C_1-C_8), amino, alquil (C_1-C_8)-amino o di-alquil (C_1-C_8)-amino;
15 $C(NOR^6)W$, en que R^6 significa hidrógeno, alquilo (C_1-C_8), aril-alquilo (C_1-C_4) o arilo y W significa hidrógeno, alquilo (C_1-C_8) o arilo; $C(NNR^6R^7)$, en que R^6 y R^7 , iguales o diferentes, significan hidrógeno, alquilo (C_1-C_8), alcanofilo (C_1-C_8), alcoxi (C_1-C_8)-carbonilo o arilo; $C(O(CH_2)_{1,2,3}O)$, en que la unidad de alquilendioxi puede estar sustituida con hasta cuatro grupos alquilo (C_1-C_4); $-NZ^1Z^2$, en que Z^1 significa hidrógeno o alquilo (C_1-C_8) y Z^2 significa alcanofilo (C_1-C_8), alcoxi (C_1-C_8)-carbonilo, alquilo (C_1-C_8), alquil (C_1-C_4)-sulfinilo o hidrógeno; o tri-alquil (C_1-C_8)-sililo,
25

realizándose en los diferentes radicales alquilo, cicloalquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquenilo, o en los grupos derivados de ellos, tales como los grupos alcoxi, alquenil-oxi, alquinil-oxi, alquil-tio, alquil-sulfinilo, alquil-sulfonilo, alquenil-tio, alquinil-tio, alquil-amino, dialquil-amino, trialquil-sililo, alcanofilo o alcoxi-carbonilo, que se han
30 mencionado para R^4 , que eventualmente una unidad saturada con carbonos puede estar reemplazada por un grupo carbonilo o una unidad con heteroátomo(s), tal como oxígeno, $S(O)_x$ con $x = 0, 1$ ó 2 , o dimetil-sililo, y en que
35

además de ello de 3 a 8 átomos de estos radicales hidrocarbilo, eventualmente modificados como precedentemente, pueden formar un ciclo, y estos radicales hidrocarbilo, con o sin las variaciones indicadas, están sustituidos eventualmente con uno o varios, preferiblemente con uno a tres, en el caso del flúor hasta con el número máximo, de radicales iguales o diferentes, tomados entre la serie constituida por halógeno, arilo, aril-oxi, aril-tio, cicloalcoxi, cicloalquil-tio, heterociclilo, heterociclil-oxi, heterociclil-tio, alcanoflo, cicloalcanoflo, halógeno-alcanoflo, aroflo, aril-alcanoflo, cicloalquil-alcanoflo, alcoxi-carbonilo, halógeno-alcoxi-carbonilo, cicloalcoxi-carbonilo, cicloalquil-alcoxi-carbonilo, aril-alcoxi-carbonilo, heterociclil-alcoxi-carbonilo, aril-oxi-carbonilo, heterociclil-oxi-carbonilo, alcanofl-oxi, halógeno-alcanofl-oxi, cicloalcanofl-oxi, cicloalquil-alcanofl-oxi, aril-oxi, aril-alcanofl-oxi, heterociclofl-alcanofl-oxi, alquil-sulfonil-oxi, aril-sulfonil-oxi, hidroxí, ciano, tiociano o nitro, y que los sistemas anulares cicloalifáticos, aromáticos o heterocíclicos, mencionados para R^4 , pueden estar sin sustituir o eventualmente provistos de hasta tres, en el caso del flúor también hasta con el número máximo, de sustituyentes iguales o diferentes, tomados preferiblemente entre el grupo constituido por halógeno, nitro, ciano, di-alquil (C_1-C_4)-amino, alquilo (C_1-C_4), cicloalquilo (C_3-C_6), tri-alquil (C_1-C_4)-silo, alcoxi (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_2)- $[\text{CH}_2\text{CH}_2]_{0.1.2}$ -etoxi, alquil (C_1-C_4)-tio, alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, realizándose en los radicales alquilo, y en los radicales derivados de ellos, que uno o varios átomos de hidrógeno, en el caso del flúor también hasta el número máximo, pueden estar reemplazados por halógeno, preferiblemente cloro o flúor, realizándose, en el caso de que estos sustituyentes signifiquen alquilo (C_1-C_4), que éstos pueden también estar unidos en forma cíclica y que

en estos sistemas anulares condensados, tales como p.ej. los sistemas de indano, di-, tetra- o deca-hidro-naftilo o el de benzo-cicloheptano, una o dos unidades alifáticas con carbonos pueden estar reemplazadas por unidades con heteroátomo(s), tales como oxígeno o azufre, y en las unidades alifáticas con átomos de carbono uno o varios átomos de hidrógeno, en el caso del flúor también hasta el número máximo, pueden estar reemplazados por halógeno o alquilo (C₁-C₄);

10

(c) dos radicales R⁴, que están unidos a átomos de carbono contiguos (D, E; L, D ó G, L) forman en común con estos átomos de carbono un anillo carbocíclico insaturado de 5 ó 6 miembros, que, caso de que se trate de un anillo de 5 miembros, puede contener, en lugar de CH₂, un átomo de oxígeno o azufre, o, caso de que se trate de un anillo de 6 miembros, en lugar de una o dos unidades de CH puede contener uno o dos átomos de nitrógeno, y que eventualmente está sustituido con 1, 2 ó 3 radicales iguales o diferentes, significando estos radicales alquilo (C₁-C₄), halógeno-alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄) o hidroxilo, preferiblemente metilo, trifluorometilo, halógeno, preferiblemente fluoro o cloro, o metoxi, realizándose en el caso de que se trate de un heterociclo con nitrógeno y de que en el caso de que el o los sustituyentes consistan en grupos hidroxilo, el sistema anular puede presentarse también en la forma ceto tautómera, y en este caso un eventual sustituyente alquilo (C₁-C₄) puede estar situado también junto a un átomo de nitrógeno, o

25

d) dos radicales R⁴ en común con los átomos de carbono (GL, LD, DE) a los que están unidos, forman un anillo carbocíclico saturado de 5, 6 ó 7 miembros, que eventualmente está sustituido con 1, 2 ó 3 grupos alquilo (C₁-C₄).

30

De modo especialmente preferido,

R⁴ es hidrógeno, alquilo (C₁-C₄), particularmente metilo, trifluorometilo, fluoro, cloro, bromo, ciano o nitro, o dos radicales R⁴ están unidos para la condensación con benzo, de modo muy especialmente preferido hidrógeno, metilo, cloro, bromo, ciano, nitro o trifluorometilo.

5

Por lo tanto, son preferidos los compuestos de la fórmula (I), para los que

R¹ significa fluoro-alquilo, particularmente trifluorometilo;

R² significa hidrógeno o metilo;

10 **n** significa O; y

A significa CH.

Son más grandemente preferidos los compuestos de la fórmula (I), para los que

15 **R¹** significa trifluorometilo;

R² significa hidrógeno;

n significa O; y

A significa CH.

20 Son todavía más grandemente preferidos los compuestos de la fórmula (I), para los que

R¹ significa trifluorometilo;

n significa O;

A significa CH y

25 **A'** significa nitrógeno.

Son preferidos además los compuestos de la fórmula (I), para los que
X significa alquileo (C₁-C₄), preferiblemente alquileo (C₁-C₃) sin ramificar.

30 Son preferidos además los compuestos de la fórmula (I), para los que

Az significa un radical imidazolilo, pirazolilo o 1,2,4-triazol-1-ilo, y eventualmente

R⁴ significa alquilo (C₁-C₄), particularmente metilo, trifluorometilo, fluoro, cloro, bromo, ciano o nitro, o dos radicales R⁴ están unidos para la condensación con benzo.

35

Son más grandemente preferidos además los compuestos de la fórmula (I), para los que

- Az** significa un radical pirazolilo o 1,2,4-triazol-1-ilo, y eventualmente
R⁴ significa metilo, cloro, bromo, ciano, nitro o trifluorometilo.

En la fórmula anterior, por "halógeno" se ha de entender un átomo de flúor, cloro, bromo o yodo;

- por la expresión "alquilo (C₁-C₄)" se ha de entender un radical hidrocarbilo sin
 10 ramificar o ramificado con 1 a 4 átomos de carbono, tal como p.ej. el radical metilo, etilo, propilo, isopropilo, 1-butilo, 2-butilo, 2-metil-propilo o terc.-butilo;
 por la expresión "alquilo (C₁-C₈)" se han de entender los radicales alquilo antes mencionados, así como p.ej. el radical pentilo, 2-metil-butilo, 1,1-dimetil-propilo, hexilo, heptilo, octilo o 1,1,3,3-tetrametil-butilo;
 15 por la expresión "halógeno-alquilo (C₁-C₄)" se ha de entender un grupo alquilo mencionado para la expresión "alquilo (C₁-C₄)", en el que uno o varios átomos de hidrógeno están reemplazados por los átomos de halógenos antes mencionados, preferiblemente cloro o flúor, tales como por ejemplo, el grupo trifluorometilo, el grupo 1-fluoro-etilo, el grupo 2,2,2-trifluoro-etilo, el grupo
 20 cloro-metilo o fluoro-metilo, el grupo difluoro-metilo, el grupo 1,1,2,2-tetrafluoro-etilo, o el grupo difluoro-cloro-metilo; por la expresión "unidad de alquilenos (C₁-C₈) ramificada o sin ramificar" se ha de entender p.ej. la unidad - (CH₂)-, -(CH₂)₂-, -CH(CH₃)-, -(CH₂)₃-, -CH₂CH(CH₃)-, -(CH₂)₄-,
 -CH₂-CH(CH₃)CH₂-, -(CH₂)₂-CH(CH₃)-, -(CH₂)₆-, -(CH₂)₇-, -(CH₂)₈- ó -(CH₂)₉-;
 25 por el radical Az de la fórmula general (II) se ha de entender p.ej. el radical imidazol-1-ilo, pirazol-1-ilo, 1,2,4-triazol-1-ilo, 1,2,4-triazol-4-ilo, 1,2,3-triazol-1-ilo, 1,2,3-triazol-2-ilo o 1,2,3,4-tetrazol-1-ilo.

- Las designaciones de "alqueno" y "alquino" con una indicación adjunta de margen de átomos de carbono significan un radical hidrocarbilo lineal o
 30 ramificado con un número de átomos de carbono correspondiente a esta indicación de margen, que implica por lo menos a un enlace múltiple, pudiendo encontrarse éste en cualquier posición del radical insaturado correspondiente.
 Por la expresión "cicloalquilo (C₃-C₈)" se han de entender los grupos ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo o ciclooctilo,

por la expresión "arilo" se ha de entender un radical aromático carbocíclico preferiblemente con 6 a 14, particularmente con 6 a 12 átomos de C, por ejemplo fenilo, naftilo o bifenililo, preferiblemente fenilo;

por la expresión "heterociclilo" se ha de entender preferiblemente un sistema anular heteroaromático o heteroalifático, habiéndose de entender por "sistema anular heteroaromático" preferiblemente un radical arilo, en el que por lo menos un grupo CH ha sido reemplazado por N y/o por lo menos dos grupos CH contiguos han sido reemplazados por S, NH u O, p.ej. un radical de tiofeno, furano, pirrol, tiazol, oxazol, imidazol, isotiazol, isoxazol, pirazol, 1,3,4-oxadiazol, 1,3,4-tiadiazol, 1,3,4-triazol, 1,2,4-oxadiazol, 1,2,4-tiadiazol, 1,2,4-triazol, 1,2,3-triazol, 1,2,3,4-tetrazol, benzo[b]-tiofeno, benzo[b]furano, indol, benzo[c]tiofeno, benzo[c]furano, isoindol, benzoxazol, benzotiazol, bencimidazol, benzoisoxazol, benzoisotiazol, benzopirazol, benzo-tiadiazol, benzotriazol, dibenzofurano, dibenzotiofeno, carbazol, piridina, pirazina, 15 pirimidina, piridazina, 1,3,5-triazina, 1,2,4-triazina, 1,2,4,5-triazina, quinolina, isoquinolina, quinoxalina, quinazolina, cinolina, 1,8-naftiridina, 1,5-naftiridina, 1,6-naftiridina, 1,7-naftiridina, ftalazina, piridopirimidina, purina, pteridina o 4H-quinollizina;

y por la expresión "sistema anular heteroalifático" se ha de entender preferiblemente un radical cicloalquilo (C₃-C₈), en el que por lo menos una unidad de carbono está reemplazada por O, S o un grupo NR^R, y R^R significa hidrógeno, alquilo (C₁-C₄), alcanoflo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-carbonilo, alquil (C₁-C₄)-sulfonilo, alcoxi (C₁-C₄) o arilo;

por la expresión "cicloalquenilo (C₄-C₈)" se ha de entender p.ej. el grupo ciclobutenilo, ciclopentenilo, ciclohexenilo, cicloheptenilo, o ciclooctenilo;

por la expresión "alcoxi (C₁-C₈)" se ha de entender un grupo alcoxi, cuyo radical hidrocarbilo tiene el significado indicado para la expresión "alquilo (C₁-C₄)";

por la expresión "alquenil (C₃-C₈)-oxi" se ha de entender p.ej. el grupo alil-oxi, crotil-oxi, 3-buten-1-il-oxi, 1-penten-3-il-oxi, 1-penten-4-il-oxi o 3-penten-2-il-oxi;

por la expresión "alquinil (C₃-C₈)-oxi" se ha de entender p.ej. el grupo propargil-oxi, 1 butin-3-il-oxi, 2-butin-1-il-oxi o 3-butin-1-il-oxi;

por la expresión "alquil (C₁-C₈)-tio" se ha de entender el grupo alquil-tio, cuyo radical alquilo tiene el significado indicado para la expresión "alquilo (C₁-C₈)";

por la expresión "alquil (C₁-C₈)-sulfonilo" se ha de entender p.ej. el grupo metil-, etil-, propil-, isopropil-, butil-, isobutil-, sec.-butil-, terc.-butil- u octil-sulfonilo; y

- por la expresión "alquil (C₁-C₈)-sulfonilo" se ha de entender p.ej. el grupo metil-, etil-, propil-, isopropil-, butil-, isobutil-, sec.-butil-, terc.-butil- u octil-sulfonilo;
- por la expresión "alquenil (C₃-C₈)-tio" se ha de entender p.ej. el grupo alil-tio, crotil-tio, 3-buten-1-il-tio o 3-penten-2-il-tio;
- 5 por la expresión "alquinil (C₃-C₈)-tio" se ha de entender p.ej. el grupo propargil-tio, 1 butin-3-il-tio o 3-butin-1-il-tio;
- por la expresión "alquil (C₁-C₈)-amino" se ha de entender p.ej. el grupo metil-amino, etil-amino, propil-amino, isopropil-amino, butil-amino, isobutil-amino, sec.-butil-amino, terc.-butil-amino, pentil-amino, n-octil-amino o terc.-octil-
- 10 amino;
- por la expresión "di-alquil (C₁-C₈)-amino" se ha de entender p.ej. el grupo dimetil-amino, metil-etil-amino, dietil-amino, dipropil-amino o dibutil-amino, pero también sistemas cíclicos, tales como el grupo pirrolidino o piperidino, y también los sistemas cíclicos, que contienen un heteroátomo adicional, tales
- 15 como p.ej. el grupo morfolino, tiomorfolino o piperazino;
- por la expresión "trialquil-sililo" se ha de entender preferiblemente el grupo trimetil-sililo;
- por la expresión "alcanolfo (C₁-C₈)" se ha de entender p.ej. el grupo formilo, acetilo, propionilo, 2-metil-propionilo, butirilo, valerolfo, pivalolfo, hexanolfo,
- 20 heptanolfo u octanolfo;
- por la expresión "alcoxi (C₁-C₈)-carbonilo" se ha de entender p.ej. el grupo metoxi-carbonilo, etoxi-carbonilo, propoxi-carbonilo, butoxi-carbonilo, terc.-butoxi-carbonilo, pentiloxi-carbonilo, hexiloxi-carbonilo u octiloxi-carbonilo.
- Entre los sustituyentes, con los que pueden estar provistos los diferentes
- 25 sistemas anulares alifáticos, cicloalifáticos, aromáticos y heterocíclicos, se cuentan p.ej. halógeno, nitro, ciano, di-alquil (C₁-C₄)-amino, alquilo (C₁-C₄), cicloalquilo (C₃-C₈), tri-alquil (C₁-C₄)-sililo, alcoxi (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₂)-[CH₂CH₂O]_{0,1,2}-etoxi, alquil (C₁-C₄)-tio, alquil (C₁-C₄)-sulfinilo, alquil (C₁-C₄)-sulfonilo, fenilo, bencilo, fenoxi, halógeno-fenoxi, alquil
- 30 (C₁-C₄)-fenoxi, alcoxi (C₁-C₄)-fenoxi, fenil-tio, heterociclilo, heterociclil-tio o heterociclil-oxi, realizándose en los radicales alquilo, y en los radicales que se derivan de ellos, que uno o varios átomos de hidrógeno, en el caso del flúor hasta el número máximo, pueden estar reemplazados por halógeno, preferiblemente cloro o flúor, realizándose en el caso de que estos sustituyentes
- 35 signifiquen alquilo (C₁-C₄), que éstos también pueden estar unidos en forma

cíclica, y en estos sistemas anulares condensados, tales como p.ej. el sistema de indano, di-, tetra- o deca-hidro-naftilo o benzocicloheptano, que una o dos unidades alifáticas con carbonos pueden estar reemplazadas por unidades con heteroátomo(s), tales como oxígeno o azufre, y en las unidades de átomos de carbono alifáticos que uno o varios átomos de hidrógeno, en el caso de flúor hasta el número máximo, pueden estar reemplazados por halógeno o alquilo (C₁-C₄).

Además, dentro de la definición de que "en los diferentes radicales alquilo, cicloalquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquenilo, o en los grupos derivados de ellos, tales como los grupos alcoxi, alquenil-oxi, alquinil-oxi, alquil-tio, alquil-sulfinilo, alquil-sulfonilo, alquenil-tio, alquinil-tio, alquil-amino, dialquil-amino, trialquil-sililo, alcanoflo o alcoxi, que se han mencionado para R⁴, eventualmente una unidad saturada con carbonos puede estar reemplazada por un grupo carbonilo o por una unidad con heteroátomo(s), tal como oxígeno, S(O)_x con x = 0,1 ó 2, o dimetil-sililo, y en que además de ello de 3 a 8 átomos de estos radicales hidrocarbilo, eventualmente modificados como precedentemente se ha mencionado, pueden formar un ciclo, y estos radicales hidrocarbilo con o sin las variaciones indicadas, pueden estar sustituidos eventualmente con uno o varios, preferiblemente hasta 3, en el caso del flúor hasta el número máximo, de radicales iguales o diferentes tomados entre la serie constituida por halógeno, arilo, aril-oxi, aril-tio, cicloalcoxi, cicloalquil-tio, heterociclilo, heterociclil-oxi, heterociclil-tio, alcanoflo, cicloalcanoflo, halógeno-alcanoflo, aroflo, aril-alcanoflo, cicloalquil-alcanoflo, heterociclil-alcanoflo, alcoxi-carbonilo, halógeno-alcoxi-carbonilo, cicloalcoxi-carbonilo, cicloalquil-alcoxi-carbonilo, aril-alcoxi-carbonilo, heterociclil-alcoxi-carbonilo, aril-oxi-carbonilo, heterociclil-oxi-carbonilo, alcanoflo-oxi, halógeno-alcanoflo-oxi, cicloalcanoflo-oxi, cicloalquil-alcanoflo-oxi, aroflo-oxi, aril-alcanoflo-oxi, heterocicloflo-alcanoflo-oxi, alquil-sulfonyl-oxi, aril-sulfonyl-oxi, hidroxi, ciano, tiociano o nitro", se han de entender p.ej.:

radicales alcoxi-alquilo, tales como p.ej. el grupo metoxi-metilo, metoxi-etilo o etoxi-etilo; o

radicales alcoxi-alcoxi-alquilo, tales como p.ej. el grupo metoxi- o etoxi-(etoxi-etilo); o radicales alquil-tio-alquilo, tales como p.ej. el grupo metil- o etil-(tio-etilo), o

radicales alquil-sulfinil-alquilo, tales como p.ej. el grupo metil- o etil-(sulfinil-etilo); o radicales alquil-sulfonyl-alquilo, tales como p.ej. el grupo metil- o etil-

- (sulfonil-etilo); o radicales alquil-dimetil-silil-alquilo, tales como p.ej. el grupo trimetil-silil-metilo o trimetil-silil-etilo; o
- radicales alquil-dimetil-sililo, tales como p.ej. el grupo trimetil-sililo, etil-dimetil-sililo, terc.-butil-dimetil-sililo u octil-dimetil-sililo; o
- 5 radicales cicloalquil-dimetil-sililo, tales como p.ej. el grupo ciclohexil-dimetil-sililo; o radicales aril-dimetil-sililo, tales como p.ej. el grupo fenil-dimetil-sililo; o radicales (aril-alquil)-dimetil-sililo, tales como p.ej. el grupo bencil-dimetil-sililo o (fenil-etil)-dimetil-sililo; o
- radicales alcanofl-alquilo, tales como p.ej. el grupo acetil-metilo o pivalofl-metilo;
- 10 o radicales cicloalcanofl-alquilo, tales como p.ej. el grupo ciclopropil-carbonil-metilo o ciclohexil-carbonil-metilo; o
- radicales halógeno-alcanofl-alquilo, tales como p.ej. el grupo trifluoro- o tricloro-acetil-metilo; o
- radicales arofl-alquilo, tales como p.ej. los radicales benzofl- o naftofl-alquilo,
- 15 tales como p.ej. el grupo fenil-acetil-metilo; o
- radicales heterocicil-carbonil-alquilo, tales como p.ej. los grupos tienil- o piridil-acetil-metilo); o
- radicales aril-alquilo, tales como p.ej. los grupos bencilo, 2-fenil-etilo, 1-fenil-etilo, 1 metil-1-fenil-etilo, 3-fenil-propilo, 4-fenil-butilo, 2-metil-2-fenil-etilo o
- 20 bien 1-metil- o 2-metil-naftilo; o
- radicales heterocicil-alquilo, tales como p.ej. el grupo tienil-metilo, piridil-metilo, furfurilo, tetrahidro-furfurilo, tetrahidro-pirani-metilo o 1,3-dioxolan-2-metilo; o
- radicales aril-oxi-alquilo, tales como p.ej. el grupo fenoxi-metilo o naftoxi-metilo;
- o radicales cicloalquilo, monocíclicos, tales como p.ej. el radical ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo o ciclooctilo, bicíclicos, tales
- 25 como p.ej. el radical norbornilo o bicio[2,2,2]octilo, o condensados, tales como el radical decahidro-naftilo; radicales alquil-cicloalquilo, tales como p.ej. el grupo 4-metil- o 4-terc.-butil-ciclohexilo o el grupo 1-metil-ciclopropilo, -ciclobutilo, -ciclopentilo o -ciclohexilo;
- 30 radicales cicloalquil-alquilo, tales como p.ej. el grupo ciclohexil-metilo o -etilo;
- radicales cicloalquenilo, monocíclicos, tales como p.ej. el radical ciclopentenilo, ciclohexenilo, cicloheptenilo o ciclooctenilo, bicíclicos, tales como p.ej. el radical norbornenilo o biciclo[2,2,2]octenilo, o condensados, tales como los diferentes radicales dihidro- o tetrahidro-naftenilo;

radicales cicloalquenil-alquilo, tales como p.ej. el radical 1-ciclohexenil-metilo o -etilo; o también derivados con halo-alquilo de los correspondientes grupos, tales como por ejemplo los radicales halo-alquilo, halo-alcoxi-alquilo, alcoxi-halo-alquilo, halo-alquil-cicloalquilo o halo-cicloalquilo.

- 5 Además, dentro de la expresión de que dos radicales R^* , que están unidos a átomos de carbono contiguos (D, E; LD ó GL), forman en común con estos átomos de carbono un anillo carbocíclico insaturado de 5 ó 6 miembros, que, caso de que se trate de un anillo de 5 miembros, puede contener un átomo de oxígeno o azufre en lugar de CH_2 , o, caso de que se trate de un anillo de 6 miembros, puede contener uno o dos átomos de nitrógeno en lugar de una o dos unidades CH , y que eventualmente está sustituido con 1, 2 ó 3 radicales iguales o diferentes, significando estos radicales alquilo (C_1-C_4), halógeno-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4) o hidroxí, preferiblemente metilo, trifluorometilo, halógeno, preferiblemente fluoro o cloro, o metoxi, realizándose, en el caso de
- 10 que se trate de un heterociclo con nitrógeno y de que el o los sustituyentes consistan en grupos hidroxí, que el sistema anular puede presentarse también en la forma ceto tautómera, y que para este caso un eventual sustituyente alquilo (C_1-C_4) puede situarse también junto a un átomo de nitrógeno; o que dos radicales R^* forman en común con los átomos de carbono (GL, LD, DE), a los
- 15 que están unidos, un anillo carbocíclico saturado de 5, 6 ó 7 miembros, que eventualmente está sustituido con 1, 2 ó 3 grupos alquilo (C_1-C_4). Para el radical Az de la fórmula general (II) se han de entender por tal p.ej. azoles condensados con benzo, tales como bencimidazol o benzotriazol, o pirido-azoles tales como 1H-imidazo[4,5-b]piridina, o cicloalqueno-azoles, tales como
- 20 4,5,6,7-tetrahydro-indazol, 4,5,6,7-tetrahydro-1H-benzo[d]imidazol, 2,4,5,6-tetrahydro-ciclopenta-pirazol o 4,5,6,7-tetrahydro-2H-indazol, u otros sistemas condensados, tales como los de purina o teofilina.

La explicación antes indicada es válida correspondientemente para homólogos o para radicales derivados de ellos.

- 30 El presente invento concierne a los compuestos de la fórmula (I) en forma de la base libre o de una sal por adición de ácido. Los ácidos que se pueden utilizar para la formación de sales, son ácidos inorgánicos, tales como ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido nítrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico, o ácidos orgánicos, tales como ácido fórmico, ácido acético, ácido
- 35 propiónico, ácido malónico, ácido oxálico, ácido fumárico, ácido adípico, ácido

esteárico, ácido oleico, ácido metano-sulfónico, ácido benceno-sulfónico o ácido tolueno-sulfónico.

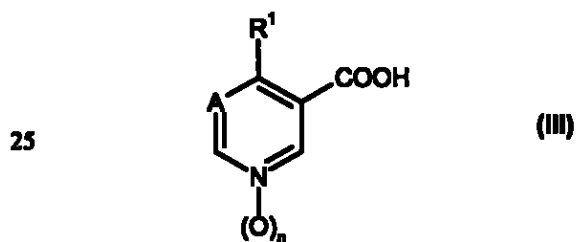
Los compuestos de la fórmula (I) tienen en parte uno o varios átomos de carbono asimétricos o estereoisómeros en dobles enlaces. Pueden aparecer por lo tanto enantiómeros o diastereoisómeros. El invento abarca tanto los isómeros puros como también sus mezclas. Las mezclas de diastereoisómeros se pueden separar en los componentes según métodos habituales, p.ej. mediante cristalización selectiva a partir de disolventes apropiados o mediante cromatografía. Los racematos se pueden separar de acuerdo con métodos usuales en los enantiómeros, así como p.ej. por formación de una sal con un ácido quiral puro en cuanto a los enantiómeros, separación de las sales diastereoisómeras y liberación de los enantiómeros puros mediante una base.

El presente invento concierne también a procedimientos para la preparación de compuestos de la fórmula general (I).

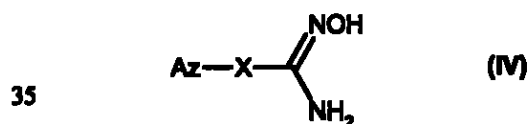
Por ejemplo, un procedimiento para la preparación de compuestos de la fórmula general (I), en que

a) A, R¹, X, n y Az tienen los significados indicados para la fórmula (I), y A' significa nitrógeno, está caracterizado porque

A. un compuesto de la fórmula (III),



en la que A, R¹ y n tienen los significados antes indicados, eventualmente en forma de un derivado activado de este ácido, se hace reaccionar en presencia de una base con un compuesto de la fórmula (IV),

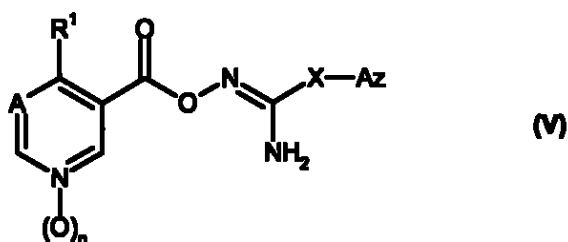


en la que X y Az tienen los significados antes indicados.

Como derivado activado se puede emplear por ejemplo un halogenuro de ácido, un éster o un anhídrido. Como bases se adecuan por ejemplo aminas tales como trietil-amina, diisopropil-etil-amina, piridina o lutidina, hidróxidos de metales alcalinos, alcoholatos de metales alcalinos, tales como metanolato de sodio o terc.-butanolato de potasio, o compuestos de alquilo y metales tales como butil-litio.

La reacción descrita, dependiendo de la elección de las condiciones, se puede llevar a cabo como procedimiento de una sola etapa o como procedimiento de dos etapas, pasándose por compuestos de la fórmula (V),

15



20

en la que A, R¹, n, X y Az tienen los significados antes indicados.

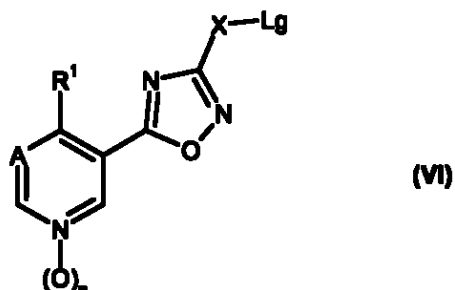
Los compuestos de la fórmula (V) se pueden ciclicizar p.ej. por calentamiento en el seno de un disolvente inerte para dar los 1,2,4-oxadiazoles a temperaturas hasta de 180°C. Los compuestos de la fórmula (V) son obtenibles también directamente a partir del ácido de la fórmula (III) y amidoximas de la fórmula (IV) por utilización de un reactivo sustractor de agua, tal como díciclohexil-carbodiimida, 1 etil-3-(3-dimetilamino-propil)carbodiimida o N,N'-carbonil-diimidazol.

Tanto los ácidos de la fórmula (III) como también las amidoximas de la fórmula (IV) se conocen o se pueden preparar de acuerdo con procedimientos conocidos por la bibliografía (véase por ejemplo: Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, tomo X/4, páginas 209-212; el documento EP-A 0.580.374; G.F. Holland, J.N. Pereira, J. Med. Chem. 1967, 10, 149).

Los compuestos de la fórmula (I), en los que los radicales están definidos igual que anteriormente en el apartado a), se pueden preparar además de acuerdo con un procedimiento, en el que

B. un compuesto de la fórmula (VI),

5



10

en la que A, R¹, n y X tienen los significados indicados para la fórmula (I) y Lg significa un grupo lábil, tal como por ejemplo halógeno, alcano-sulfonil-oxi, aril-sulfonil-oxialquil-sulfonilo o aril-sulfonilo, con un azol eventualmente sustituido de la fórmula general (VII),



15

en la que B, C, D, E y m tienen los significados antes indicados para la fórmula (II).

La reacción de sustitución antes descrita es conocida en principio. El grupo lábil Lg puede hacerse variar dentro de amplios límites y puede significar por ejemplo un átomo de halógeno, tal como flúor, cloro, bromo o yodo, o alcano-sulfonil-oxi, tal como metano-, trifluorometano- o etano-sulfonil-oxi, o aril-sulfonil-oxi, tal como benceno-sulfonil-oxi o tolueno-sulfonil-oxi, o alquil-sulfonilo, tal como metil- o etil-sulfonilo, o aril-sulfonilo, tal como fenil- o tolueno-sulfonilo.

25

La reacción antes mencionada se lleva a cabo por lo general en un margen de temperaturas de 20 a 150°C, convenientemente en presencia de una base y eventualmente en el seno de un disolvente orgánico inerte, tal como N,N-dimetil-formamida, N,N-dimetil-acetamida, dimetil-sulfóxido, N-metil-

pirrolidin-2-ona, dioxano, tetrahydrofurano, 4-metil-2-pentanona, metanol, etanol, butanol, etilenglicol, etilenglicol-dimetil-éter, tolueno, cloro-benceno o xileno. Se pueden utilizar también mezclas de los disolventes mencionados.

5 Bases apropiadas son por ejemplo carbonatos, hidrógeno-carbonatos, hidróxidos, amiduros o hidruros de metales alcalinos o alcalino-térreos, tales como carbonato de sodio, hidrógeno-carbonato de sodio, carbonato de potasio, hidróxido de sodio, amiduro de sodio o hidruro de sodio, o bases orgánicas, tales como trietil-amina o piridina. También se puede emplear como base auxiliar un segundo equivalente del azol (VII).

10

Para la preparación de compuestos de la fórmula (I), en los que

b) A, R¹, R², X, n y Az tienen los significados indicados para la fórmula (I) y A' significa CH, se procede convenientemente de manera análoga a la
15 reacción de intercambio antes descrita en el apartado B. Los correspondientes productos de partida han sido descritos (en el documento de patente alemana DE-198 58 192) o se pueden preparar de manera análoga a procedimientos conocidos.

20 Las colecciones de compuestos de la fórmula (I), que se pueden sintetizar de acuerdo con los esquemas antes mencionados, se pueden preparar también de una manera paralelizada, pudiendo suceder esto de un modo manual, parcialmente automático o totalmente automático. En tal caso, es posible por ejemplo automatizar la realización de la reacción, el tratamiento o la
25 purificación de los productos o compuestos intermedios. En total se entiende por tal concepto un modo de proceder, tal como ha sido descrito por ejemplo por S.H. DeWitt en "Annual Reports in Combinatorial Chemistry and Molecular Diversity: Automated synthesis", tomo 1, editorial Escom 1997, páginas 69 a 77.

30 Para la realización paralelizada de las reacciones y del tratamiento se pueden utilizar toda una serie de aparatos obtenibles en el comercio, tal como se ofrecen por ejemplo por las entidades Stem Corporation, Woodrolfe road, Tollesbury, Essex, Inglaterra, H+P Labortechnik GmbH, Bruckmannring 28, 85764 Oberschleißheim, Alemania, o la entidad Radleys, Shirehill, Saffron
35 Walden, Essex, CB-11:3AZ, Inglaterra. Para la purificación paralelizada de

compuestos de la fórmula general (II) o de los productos intermedios que resultan durante la preparación, están a disposición, entre otras, instalaciones de cromatografía, por ejemplo de la entidad ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, EE.UU.

5 Las instalaciones señaladas conducen a un modo de proceder modular, en el que están automatizadas las etapas de trabajo individuales, pero entre estas etapas de trabajo se tienen que realizar operaciones manuales. Esto se puede evitar mediante el empleo de sistemas de automatización parcial o totalmente integrados, en los que los respectivos módulos de automatización se
10 pueden servir por ejemplo mediante autómatas (robots). Tales sistemas de automatización se pueden adquirir por ejemplo de la entidad Zymark Corporation, Zymark Center, Hopkinton, MA 01748, EE.UU.

Junto a los métodos aquí descritos, la preparación de compuestos de la fórmula general (IV) se puede efectuar mediante métodos total o parcialmente
15 apoyados en fases sólidas. Con esta finalidad, compuestos intermedios individuales o todos los compuestos intermedios de la síntesis o de una de la síntesis adaptadas para el correspondiente modo de proceder se pueden fijar a una resina sintética. Los métodos de síntesis apoyados en fases sólidas han sido suficientemente descritos en la bibliografía especializada, p.ej. por Barry A.
20 Bunin en "The Combinatorial Index", editorial Academic Press, 1998.

La utilización de métodos de síntesis apoyados en fases sólidas permite toda una serie de protocolos conocidos por la bibliografía, que a su vez se pueden realizar de un modo manual o automático. Por ejemplo el "método de la bolsa de té" (documento de patente de los EE.UU. US 4.631.211 de Houghthen;
25 Houghthen y colaboradores, Proc. Natl. Acad. Sci. 1985, 82, 5.131-5.135) se puede automatizar parcialmente con productos de la entidad IRORI, 11149 North Torrey Pines Road, La Jolla, CA 92037, EE.UU. La automatización de síntesis paralelas apoyadas en fases sólidas se consigue por ejemplo mediante instalaciones de las entidades Argonaut Technologies, Inc., 887 Industrial Road,
30 San Carlos, CA 94070, EE.UU, o MultiSyn Tech GmbH, Wullener Feld 4, 58454 Witten, Alemania.

La preparación de acuerdo con los procedimientos aquí descritos proporciona compuestos de la fórmula (I) en forma de colecciones de sustancias, que se denominan bibliotecas. Son objeto del presente invento

también las bibliotecas que contienen por lo menos dos compuestos de la fórmula (I).

Las sustancias activas de la fórmula (I), además de presentar una buena compatibilidad con las plantas y una favorable toxicidad para animales de sangre caliente, se adecuan para reprimir plagas de animales, particularmente insectos, ácaros, helmintos y moluscos, de modo muy especialmente preferido para la represión de insectos y ácaros, que se presentan en la agricultura, en la ganadería, en la economía forestal, en la protección de existencias y materiales, así como en el sector de la higiene. Son eficaces contra especies normalmente sensibles y resistentes, así como todos o algunos estadios de desarrollo. A las plagas antes mencionadas pertenecen:

Del orden de los acarinos, p.ej. *Acarus siro*, *Argas spp.*, *Ornithodoros spp.*, *Dermanyssus gallinae*, *Eriophyes ribis*, *Phyllocoptruta oleivora*, *Boophilus spp.*, *Rhipicephalus spp.*, *Amblyomma spp.*, *Hyalomma spp.*, *Ixodes spp.*, *Psoroptes spp.*, *Chorioptes spp.*, *Sarcoptes spp.*, *Tarsonemus spp.*, *Bryobia praetiosa*, *Panonychus spp.*, *Tetranychus spp.*, *Eotetranychus spp.*, *Oligonychus spp.*, *Eutetranychus spp.*.

Del orden de los isópodos, p.ej. *Oniscus aselus*, *Armadium vulgare*, *Porcellio scaber*.

Del orden de los diplópodos, p.ej. *Blaniulus guttulatus*.

Del orden de los quilópodos, p.ej. *Geophilus carpophagus*, *Scutigera spp.*.

Del orden de los sínfilos, p.ej. *Scutigera immaculata*.

Del orden de los tisanuros, p.ej. *Lepisma saccharina*.

Del orden de los colémbolos, p.ej. *Onychiurus asmatua*.

Del orden de los ortópteros, p.ej. *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Leucophaea maderae*, *Blattella germanica*, *Acheta domesticus*, *Gryllotalpa spp.*, *Locusta migratoria migratorioides*, *Melanoplus differentialis*, *Schistocerca gregaria*.

Del orden de los isópteros, p.ej. *Reticulitermes spp.*.

Del orden de los anopluros, p.ej. *Phylloxera vastatrix*, *Pemphigus spp.*,

Pediculus humanus corporis, *Haematopinus spp.*, *Linognathus spp.*.

Del orden de los mallófagos, p.ej. *Trichodectes pp.*, *Damelinea spp.*.

Del orden de los tisanópteros, p.ej. *Hercinothrips femoralis*, *Thrips tabaci*.

Del orden de los heterópteros, p.ej. Eurygaster spp., Dysdercus intermedius, Piesma quadrata, Cimex lectularius, Rhodnius prolixus, Triatoma spp..

- Del orden de los homópteros, p.ej. Aleurodes brassicae, Bemisia tabaci,
 5 Trialeurodes vaporariorum, Aphis gossypii, Brevicoryne brassicae, Cryptomyzus ribis, Doralis fabae, Doralis pomi, Eriosoma lanigerum, Hyalopterus arundinis, Macrosiphum avenae, Myzus spp., Phorodon humuli, Rhopalosiphum padi, Empoasca spp., Euscelus bilobatus, Nephrotettix cincticeps, Lecanium corni, Saiaetia oleae, Laodelphax striatellus, Nilaparvata lugens, Aonidiella aurantii,
 10 Aspidiotus hederae, Pseudococcus spp., Psylla spp..

- Del orden de los lepidópteros, p.ej. Pectinophora gossypiella, Bupalus piniarius, Cheimantobia brumata, Lithocolletis blancardella, Hyponomeuta padella, Plutella maculipennis, Malacosoma neustria, Euproctis chrysorrhoea, Lymantria spp., Bucculatrix thurberiella, Phyllocnistis
 15 citrella, Agrotis spp., Euxoa spp., Feltia spp., Earias insulana, Heliothis spp., Laphygma exigua, Mamestra brassicae, Panolis flammea, Prodenia litura, Spodoptera spp., Trichoplusia ni, Carpocapsa pomonella, Pieris spp., Chilo spp., Pyrausta nubilalis, Ephestia kuehniella, Galleria mellonella, Cacoecia podana, Capua reticulana, Choristoneura fumiferana, Clysia ambiguella, Homona magnanima, Tortrix viridiana.
 20

- Del orden de los coleópteros, p.ej. Anobium punctatum, Rhizophorthera dominica, Bruchidius obtectus, Acanthoscelides obtectus, Hylotrupes bajulus, Agelastica alni, Leptinotarsa decemlineata, Phaeton cochleariae, Diabrotica spp.,
 25 Psylliodes chrysocephala, Epilachna varivestis, Atomaria spp., Oryzaephilus surinamensis, Anthonomus spp., Sitophilus spp., Otiorhynchus sulcatus, Cosmopolites sordidus, Ceuthorrhynchus assimilis, Hypera postica, Dermestes spp., Trogoderma, Anthrenus spp., Attagenus spp., Lyctus spp., Meligethes aeneus, Ptinus spp., Niptus hololeucus, Gibbium psyllioides, Tribolium spp., Tenebrio molitor, Agriotes spp., Conoderus spp.,
 30 Melolontha melolontha, Amphimallon solstitialis, Costelytra zealandica.

Del orden de los himenópteros, p.ej. Diprion spp., Hoplocampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Vespa spp..

- Del orden de los dípteros, p.ej. Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp.,
 35 Drosophila melanogaster, Musca spp., Fannia spp., Calliphora erythrocephala,

- Lucilia spp., Chrysomya spp., Cuterebra spp., Gastrophilus spp., Hypobosca spp.,
Stomoxys spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Tabanus spp., Tannia spp.,
Bibio hortulanus, Oscinella frit, Phorbia spp., Pegomyia hyoscyami, Ceratitis
5 capitata, Dacus oleae, Tipula paludosa.
Del orden de los sifonápteros, p.ej. Xenopsylla cheopsis, Ceratophyllus spp..
Del orden de los arácnidos, p.ej. Scorpio maurus, Latrodectus mactans.
De la clase de los helmintos, p.ej. Haemonchus, Trichostrongylus,
10 Ostertagia, Cooperia, Chabertia, Strongyloides, Oesophagostomum, Hyostrongylus,
Ancylostoma, Ascaris y Heterakis así como Fasciola.
De la clase de los gastrópodos, p.ej. Deroceras spp., Arion spp.,
Lymnaea spp., Galba spp., Succinea spp., Biomphalaria pp., Bulinus spp.,
15 Oncomelania spp..
De la clase de los bivalvos, p.ej. Dreissena spp..
El invento se refiere también a agentes, particularmente agentes insecticidas y acaricidas, que contienen los compuestos de la fórmula (I) junto con uno o varios apropiados agentes coadyuvantes de formulación.
20 Los agentes conformes al invento contienen las sustancias activas de la fórmula (I) por lo general en una proporción de 1 a 95 % en peso.
Éstos se pueden formular de diferente modo, dependiendo de cómo se haya preestablecido por los parámetros biológicos y/o químico-físicos. Como posibilidades de formulación entran en cuestión preferiblemente:
25 Polvos para proyectar (WP), concentrados emulsionables (EC), soluciones acuosas (SL), emulsiones, soluciones atomizables, dispersiones a base de aceites o agua (SC), suspo-emulsiones (SE), agentes para espolvorear (DP), agentes desinfectantes, granulados en forma de microgranulados o granulados formados por atomización, extensión y adsorción, granulados dispersables con
30 agua (WG), formulaciones (ULV = de volumen ultra-bajo), microcápsulas, ceras o cebos.
Estos tipos individuales de formulaciones son conocidos en principio y se describen por ejemplo en las obras:
Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie" (tecnología química), tomo 7,
35 editorial C. Hauser Munich, 40 edición 1986; van Falkenberg, "Pesticides

Formulations" (formulaciones plaguicidas), Marcel Dekker N.Y., 20 edición 1972-73; K. Martens, "Spray Drying Handbook" (manual del secado por atomización), 30 edición 1979, G. Goodwin Ltd., Londres.

Los necesarios agentes coadyuvantes de formulaciones, tales como
5 materiales inertes, agentes tensioactivos, disolventes y otros materiales
aditivos, son asimismo conocidos y se describen por ejemplo en las obras:
Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers" (manual de los
diluyentes y vehículos de polvos insecticidas", 20 edición, Darland Books,
Caldwell N.J.; H. v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry"
10 (introducción a la química de los coloides de arcillas), 20 edición, J. Wiley &
Sons, N.Y; Marsden, "Solvents Guide" (guia de disolventes), 20 edición,
Interscience, N.Y. 1950; "Detergents and Emulsifiers Annual" (anual de
detergentes y emulsionantes) de McCutcheon, MC Publ. Corp., Ridgewood
N.J.; Sisley y Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents" Chem. Publ. Co.
15 Inc., N.Y. 1964; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte" (aductos
con óxido de etileno interfacialmente activos), Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart
1967; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie" (tecnología química), tomo
7, editorial C. Hauser Munich, 40 edición 1986.

Sobre la base de estas formulaciones, se pueden producir también
20 combinaciones con otras sustancias activas como plaguicidas, agentes
fertilizantes y/o reguladores del crecimiento, p.ej. en forma de una formulación
acabada o como una mezcla de depósito. Los polvos para proyectar constituyen
preparados dispersables uniformemente en agua que, junto con la sustancia
activa, aparte de un material diluyente o inerte, contienen además agentes
25 humectantes, p.ej. alquil-fenoles poli(oxietilados), alcoholes grasos
poli(oxietilados), alquil- o alquilfenol-sulfonatos, y agentes dispersantes, p.ej.
una sal de sodio de ácido lignina-sulfónico o una sal de sodio de ácido 2,2'-
dinaftilmetano-6,6'-disulfónico.

Los concentrados emulsionables se producen por disolución de la
30 sustancia activa en un disolvente orgánico, p.ej. butanol, ciclohexanona,
dimetil-formamida, xileno o también compuestos aromáticos o hidrocarburos de
elevado punto de ebullición mediando adición de uno o varios emulsionantes.
Como emulsionantes se pueden utilizar por ejemplo: sales de calcio de ácidos
alquil-aril-sulfónicos, tales como dodecil-benceno-sulfonato de calcio, o
35 emulsionantes no iónicos, tales como ésteres poliglicólicos de ácidos grasos,

alquil-aril-poliglicol-éteres, (alcohol graso)-poliglicol-éteres, productos de condensación de óxido de propileno y óxido de etileno, alquil-poliéteres, ésteres de ácidos grasos de sorbitán, ésteres de ácidos grasos de poli(oxietilén)-sorbitán o ésteres de poli(oxietilén)-sorbitol.

- 5 Se obtienen agentes para espolvorear mediante molienda de la sustancia activa con sustancias sólidas finamente divididas, p.ej. talco, arcillas naturales, tales como caolín, bentonita, pirofilita, o tierra de diatomeas. Los granulados se pueden producir o bien o por inyección de la sustancia activa sobre un material inerte granulado, capaz de adsorción, o por aplicación de concentrados de
- 10 sustancias activas mediante pegamentos, p.ej. poli(alcohol vinílico), una sal de sodio de poli(ácido acrílico) o también aceites minerales, sobre la superficie de materiales de soporte, tales como arena, caolinitas, o de un material inerte granulado. También se pueden granular sustancias activas apropiadas del modo que es usual para la producción de granallas de agentes fertilizantes - en caso
- 15 deseado en mezcla con agentes fertilizantes -.

- En polvos para proyectar, la concentración de sustancias activas asciende p.ej. a aproximadamente 10 hasta 90 % en peso y el resto hasta 100 % en peso consta de constituyentes usuales de formulaciones. En el caso de concentrados emulsionables, la concentración de sustancias activas puede
- 20 ascender a aproximadamente 5 hasta 80 % en peso. Las formulaciones en forma de polvos finos contienen en la mayor parte de los casos de 5 a 20 % en peso de una sustancia activa, las soluciones atomizables contienen aproximadamente de 2 a 20 % en peso de ésta. En el caso de granulados, el contenido de sustancias activas depende en parte de que el compuesto activo
- 25 se presente en estado líquido o sólido y de cuales sean los agentes auxiliares de granulación, materiales de carga, etc., que se utilicen.

- Junto a ello, las mencionadas formulaciones de sustancias activas contienen eventualmente los agentes adhesivos, humectantes, dispersantes, emulsionantes, penetrantes, disolventes, materiales de carga o de vehículo, en
- 30 cada caso usuales.

Para la aplicación, los concentrados presentes en forma usual en el comercio se diluyen eventualmente de un modo usual, p.ej. mediante agua en el caso de polvos para proyectar, concentrados emulsionables, dispersiones y parcialmente también en el caso de microgranulados. Los preparados en forma

de polvos finos y granulados, así como las soluciones atomizables, usualmente ya no se diluyen con otras sustancias inertes antes de la aplicación.

Con las condiciones externas, tales como temperatura, humedad, entre otras, varía la necesaria cantidad a consumir. Ésta puede fluctuar dentro de amplios límites, p.ej. entre 0,0005 y 10,0 kg/ha o más de sustancia activa, pero preferiblemente está situada entre 0,001 y 5 kg/ha.

Las sustancias activas conformes al invento se pueden presentar en sus formulaciones usuales en el comercio así como en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones, correspondientemente a solas o en mezclas con otras sustancias activas, tales como insecticidas, materiales de cebos, esterilizadores, acaricidas, nematocidas, fungicidas, sustancias reguladoras del crecimiento o herbicidas.

Entre los agentes de represión de plagas, con los que se pueden combinar los compuestos de la fórmula (I), se cuentan por ejemplo ésteres de ácidos fosfóricos, carbamatos, ésteres de ácidos carboxílicos, formamidinas, compuestos de estaño y sustancias preparadas mediante microorganismos.

Participes preferidos en las mezclas son:

1. del grupo de los compuestos de fósforo
 - acefate, azametifos, azinfos-etilo-, azinfos-metilo, bromofos, bromofos-etilo, cadusafos (F-67825), cloroetoxifos, clorofenvinfos, cloromefos, cloropirifos, cloropirifos-metilo, demetón, demetón-S-metilo, demetón-S-metil-sulfona, dialifos, diazinón, diclorvos, dicrotofos, dimetoate, disulfotón, EPN, etión, etoprofos, etrimfos, famfur, fenamifos, fenitriotión, fensulfotión, fentión, fonofos, formotió, fostiazate (ASC-86824), heptenofos, isazofos, isotioate, isoxatión, malatión, metacrifos, metamidofos, metidatión, salitión, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoate, oxidemetón-metilo, paratión, paratión-metilo, fentoate, forate, fosalone, fosfolan, fosfocarb (BAS-301), fosmet, fosfamidón, foxlm, pirimifos, pirimifos-etilo, pirimifos-metilo, profenofos, propafos, protamfos, protiofos, piraclofos, piridapentión, quinalfos, sulprofos, temefos, terbufos, tebupirimfos, tetraclorovinfos, tiometón, triazofos, triclorofón, vamidotión;

2. del grupo de los carbamatos

alanicarb (OK-135), aldicarb, 2-sec.-butil-fenil-metil-carbamato (BPMC), carbaril, carbofuran, carbosulfan, cloetocarb, benfuracarb, etiofencarb, furatiocarb, HCN-801, isoprocarb, metomil, 5-metil-m-cumenil-butil(metil)carbamato, oxamil, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, 1-metil-tio(etilidenamino)-N-metil-N-
5 (morfolinotio)carbamato (UC 51717), triazamato;

3. del grupo de los ésteres de ácidos carboxílicos
acrinatrin, alletrin, 5-bencil-3-furilmetil-(E)-, (1R)-cis-2,2-di-metil-3-(2-oxotiolan-3-iliden-metil)ciclopropano-carboxilato, beta-ciflutrin, beta-cipermetrin,
10 bioalletrin, bioalletrin-(isómero (S)-ciclopentílico), bioresmetrin, bifentrin, (RS)-1-ciano-1-(6-fenoxi-2-piridil)metil-(1RS)-trans-3-(4-terc.-2,2-dimetil-ciclopropano-carboxilato (NCI 85193), cicloprotrin, ciflutrin, cihalotrin, cititrin, cipermetrin, cifenotrin, deltametrin, empentrin, esfenvalerato, fenflutrin, fenpropatrin, fenvalerato, flucitrinato, flumetrin, fluvalinato (isómero D), imiprotrin (S-41311),
15 lambda-cihalotrin, permetrin, fenotrin (isómero (R)), pralletrin, piretrinas (productos naturales), resmetrin, teflutrin, tetrametrin, theta-cipermetrin (TD-2344), tralometrin, transflutrin, zeta-cipermetrin (F-56701);

4.- del grupo de las amidinas
20 amitraz, clorodimeform;

5. del grupo de los compuestos de estaño
cihexatin, fenbutatin-óxidos;

6. de otros tipos
25 abamectin, ABG-9008, acetamiprid, Anagrapta falcitars, AKD-1022, AKD-3059, ANS-118, Bacillus thuringiensis, Beauveria bassiana, bensultap, bifenazato (D-2341), binapacril, BJL-932, bromopropilato, BTG-504, BTG-505, buprofezin, camfecloro, cartap, clorobenzilato, clorofenapir, clorofluazurón, 2-(4-cloro-fenil)-4,5-difenil-tiofeno (UBI-T 930), clorofentazine, cromafenozide
30 (ANS-118), CG-216, CG-217, CG-234, A-184699, éster (2-naftil-metílico) de ácido ciclopropano-carboxílico (Ro12-0470), ciromazin, diaclofen (tiametoxam), diafenthiurón, N-(3,5-dicloro-4-(1,1,2,3,3,3-hexafluoro-1-propiloxi)fenil)carbamoyl)-éster etílico de ácido 2-cloro-benzocarboximídico, DDT, dicofol, diflubenzurón, N-(2,3-dihidro-3-metil-1,3-tiazol-2-iliden)-2,4-xilidina,
35 dinobutón, dinocap, diofenolan, DPX-062, emamectin-benzoato (MK-244),

endosulfan, etiprole (sulfetiprole), etofenprox, etoxazole (YI-5301), fenazaquin, fenoxicarb, fipronil, fluazurón, flumite (flufenzine, SZI-121), 2-fluoro-5-(4-(4-etoxi-fenil)-4-metil-1-pentil)difenil-éter (MTI 800), virus de granulosa y poliedros nucleares, fenpiroximato, fentiocarb, flubenzimine, flucicloxurón, flufenoxurón, 5 flufenprox (ICI-A5683), fluproxifen, gamma-HCH, halofenozide (RH-0345), halofenprox (MTI-732), hexaflumuron (DE_473), hexitiazox, HOI 9004, hidrametilnon (AC 217300), lufenurón, imidacloprid, indoxacarb (DPX-MP062), kanemite (AKD-2023), M-020, MTI-446, ivermectin, M-020, metoxifenozide (Intrepid, RH-2485), milbemectin, NC-196, neemgard, nitenpiram (TI-304), 2- 10 nitrometil-4,5-dihidro-6H-tiazina (DS 52618), 2-nitrometil-3,4-dihidrotiazol (SD 35651), 2-nitrometilen-1,2-tiazinan3-il-carbamaldehído (WL 108477), piriproxifen (S-71639), NC-196, NC-111, NNI-976, novaluron (MCW-275), OK-9701, OK-9601, OK-9602, propargite, pirimifosmethyl, piridaben, pirimidifen (SU-8801), RH-0345, RH-2485, RYI-210, S-1283, S-1833, SB7242, SI-8601, 15 silafluofen, silomadine (CG-177), spinosad, SU-9118, tebufenozide, tebufenpirad (MK-239), teflubenzuron, tetradifón, tetrasul, tiacloprid, tiociclam, TI-435, tolfenpirad (OMI-88), triazamate (RH-7988), triflumurón, verbutin, vertalec (mikotal), YI-5301.

20 Los participantes antes mencionados en las combinaciones constituyen sustancias activas conocidas, que han sido descritas en gran parte en la obra de C.D.S. Tomlin, S.B. Walker, The Pesticide Manual, 110 edición (1997), British Crop Protection Council.

25 El contenido en sustancias activas de las formas de aplicación preparadas a partir de las formulaciones usuales en el comercio, puede variar dentro de amplios límites, la concentración de sustancias activas de las formas de aplicación puede estar situada desde 0,0001 hasta 95 % en peso de una sustancia activa, preferiblemente entre 0,0001 y 1 % en peso. La aplicación se realiza de un modo usual adaptado a las formas de aplicación.

30 Se prefiere la aplicación en cultivos importantes económicamente de plantas útiles y ornamentales, p.ej. de cereales, tales como trigo, cebada, centeno, avena, mijo, arroz, mandioca y maíz, o también cultivos de remolachas azucareras, algodón, soja, colza, patata, tomates, guisantes y otras especies de legumbres.

Junto con los procedimientos de aplicación hasta ahora mencionados, las sustancias activas conformes al invento de la fórmula (I) presentan un efecto sistémico sobresaliente. Por lo tanto, las sustancias activas se pueden incorporar en las plantas también a través de partes de plantas, bajo o sobre la tierra (raíces, tallos y hojas), cuando las sustancias activas se aplican en forma líquida o sólida en el entorno directo de las plantas (por ejemplo granulados en la aplicación a la tierra, aplicación a campos de arroz anegados).

Junto a ello, las sustancias activas conformes al invento se pueden emplear de modo especial para el tratamiento de materiales de reproducción vegetativos y generativos, tales como semillas de por ejemplo cereales, legumbres, algodón, arroz, remolachas azucareras y otras plantas cultivadas y ornamentales, tales como cebollas, plantones y bulbos de otras plantas cultivadas y ornamentales reproducidas vegetativamente. El tratamiento para ello puede efectuarse antes de la siembra o del proceso de plantación (p.ej. mediante técnicas especiales de la desinfección de semillas, por desinfección en forma líquida o sólida o por tratamiento en cajones semilleros) durante el proceso de siembra o la plantación, o después del proceso de siembra o plantación mediante técnicas especiales de aplicación (p.ej. tratamiento en hileras de siembra). La cantidad aplicada de sustancias activas puede fluctuar dentro de un margen grande, correspondientemente a la aplicación. Por lo general, las cantidades consumidas están situadas entre 1 g y 10 kg de sustancia activa por hectárea de la superficie del suelo.

Las sustancias activas conformes al invento se adecuan también para la aplicación en el sector médico veterinario, preferiblemente para la represión de endoparásitos y en el sector de la ganadería.

La aplicación de las sustancias activas conformes al invento se realiza aquí preferiblemente de un modo conocido, tal como por aplicación por vía oral en forma, por ejemplo, de tabletas, cápsulas, bebidas de abrevado, granulados, por aplicación dérmica en forma por ejemplo de inmersión, proyección (rociadura), colada (vertido y moteado) y de espolvoreo así como mediante aplicación por vía parenteral en forma por ejemplo de una inyección.

Los compuestos de la fórmula (I) conformes al invento se pueden emplear por consiguiente también de manera especialmente ventajosa en la ganadería y cría de animales (p.ej. bovinos, corderos, cerdos, y aves de corral tales como gallinas, gansos). En una forma preferida de realización del invento

se administran los compuestos de la fórmula (I) eventualmente en formulaciones apropiadas (compárese más arriba) y eventualmente por vía oral con el agua para beber o el pienso. Puesto que una excreción o eliminación se efectúa en los excrementos de una manera eficaz, de esta manera se puede impedir muy sencillamente el desarrollo de insectos en los excrementos de los animales. Las dosificaciones y formulaciones en cada caso apropiadas son dependientes particularmente del tipo y del estadio de desarrollo de los animales útiles y también de la presión de infestación, y se pueden determinar y establecer con facilidad de acuerdo con los métodos usuales. Los compuestos se pueden emplear en el caso de reses de bovino p.ej. en dosificaciones de 0,01 a 1 mg/kg de peso corporal.

El contenido de sustancias activas de las formas de aplicación, preparadas a partir de las formulaciones veterinarias usuales en el comercio, puede variar dentro de amplios márgenes, la concentración de sustancias activas de las formas de aplicación puede estar situada desde 0,0001 hasta 95 % en peso de sustancia activa, preferiblemente entre 0,0001 y 1 % en peso. La aplicación se realiza por un modo usual adaptado a las formas de aplicación.

Es objeto del invento por lo tanto también la utilización de compuestos de la fórmula (I) para la preparación de un medicamento veterinario, preferiblemente para combatir endoparásitos.

Los compuestos de la fórmula (I) se pueden emplear también para combatir organismos dañinos en cultivos de plantas modificadas por tecnología genética que sean conocidas o que todavía se hayan de desarrollar. Las plantas transgénicas se distinguen por regla general por unas propiedades especialmente ventajosas, por ejemplo por resistencias frente a determinados agentes fitoprotectores, resistencias frente a enfermedades de plantas o patógenos de enfermedades de plantas tales como determinados insectos o microorganismos, tales como hongos, bacterias o virus. Otras propiedades especiales conciernen p.ej. al material cosechado en lo referente a cantidad, calidad, almacenabilidad, composición y sustancias constitutivas especiales. Así, se conocen plantas transgénicas con un contenido aumentado de almidón o una calidad modificada del almidón o las que tienen una composición distinta de ácidos grasos del material cosechado.

Se prefiere la aplicación en cultivos transgénicos económicamente importantes de plantas útiles y ornamentales, p.ej. de cereales, tales como

trigo, cebada, centeno, avena, mijo, arroz, mandioca y maíz, pero también cultivos de remolacha azucarera, algodón, soja, colza, patatas, tomates, guisantes y otras especies de legumbres.

En el caso de la aplicación a cultivos transgénicos, particularmente con resistencias a los insectos, junto con los efectos contra organismos dañinos, que se pueden observar en otros tipos de cultivos, aparecen con frecuencia efectos, que son específicos para la aplicación al respectivo cultivo transgénico, por ejemplo un espectro modificado o especialmente ampliado de plagas, que se pueden combatir, o cantidades a consumir modificadas, que se pueden emplear para la aplicación.

Es objeto del invento por lo tanto también la utilización de compuestos de la fórmula (I) para combatir organismos dañinos en plantas cultivadas transgénicas.

La aplicación del compuesto conforme al invento implica, junto con la aplicación directa a las plagas, cualquier otro tipo de aplicación, con la que los compuestos de la fórmula (I) actúan sobre las plagas. Tales aplicaciones indirectas pueden encontrarse por ejemplo en la aplicación de compuestos, que se descomponen o degradan en el suelo, las plantas o la plaga, para dar compuestos de la fórmula (I).

Junto con un efecto letal sobre plagas, los compuestos de la fórmula (I) se distinguen también por un pronunciado efecto repelente.

Es repelente en el sentido del invento una sustancia, o mezcla de sustancias, que actúa defendiendo o ahuyentando sobre otros seres vivos, particularmente parásitos y molestos. El concepto abarca en tal caso también efectos tales como el efecto anti-alimentación, siendo perturbada o impedida la ingestión de alimentos (efecto rechazador de la comida), represión del desove o un influjo sobre el desarrollo de poblaciones.

Es objeto del invento, por lo tanto, también la utilización de compuestos de la fórmula (I) para conseguir los mencionados efectos, particularmente en el caso de las plagas mencionadas en los ejemplos biológicos.

Es objeto del invento también un procedimiento para la defensa o expulsión de organismos dañinos, en el que se esparcen uno o varios compuestos de la fórmula (I) en el sitio, del que deben ser mantenidos apartados o expulsados los organismos dañinos.

El esparcimiento puede significar en el caso de una planta por ejemplo un tratamiento de la planta, pero también de las semillas.

Tiene interés en lo que se refiere al influjo sobre poblaciones el hecho de que los efectos son observados también unos tras de otros en el caso del desarrollo de una población, pudiéndose sumar éstos. En este caso, el efecto individual propiamente dicho de una sustancia activa puede tener un rendimiento o grado de acción situado claramente por debajo del 100 % y en total al final se puede alcanzar sin embargo un efecto de 100 %.

Además, los compuestos de la fórmula (I) se distinguen por el hecho de que - si se quisiesen aprovechar los efectos antes señalados - se aplica usualmente el agente en un momento más temprano como en el caso de una represión directa. El efecto persiste con frecuencia durante largo tiempo, por lo que se alcanza una duración del efecto de más de 2 meses.

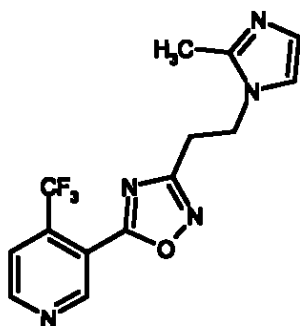
Los efectos aparecen no solamente en el caso de insectos sino también en el caso de ácaros y moluscos.

Al contenido de la solicitud de patente alemana 19962901.3, cuya prioridad reivindica la presente solicitud, así como a la recopilación adjunta, se hace referencia expresamente por la presente; éste sirve por cita como constituyente de la presente memoria descriptiva.

Los siguientes Ejemplos sirven para explicar el invento, sin que éste sea limitado por ellos.

A. Ejemplos de síntesis:

Ejemplo 1:

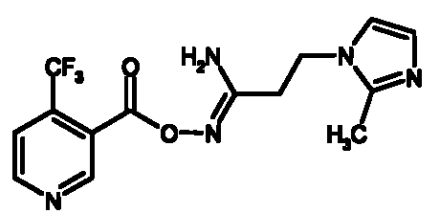


2,90 g (8,5 mmol) de la 3-(2-metil-imidazol-1-il)-O-(4-trifluorometil-nicotinil)-propionamidoxima y 0,95 g (8,5 mmol) de terc.-butanolato de potasio se agitaron a 50 - 60°C durante 4 h en 100 ml de tetrahidrofurano. Después de haber concentrado, el residuo se recogió con una mezcla de acetato de etilo y agua y la fase orgánica se seco y concentró. Para la purificación se cromatografió en gel de sílice (con una mezcla de acetato de etilo y metanol 7:3). Se obtuvieron 1,1 g (40,0 % del rendimiento teórico) de un producto en forma de aceite incoloro.

¹H-NMR (CDCl₃): 9,30 (s, 1H), 9,05 (d, 1H), 7,80 (d, 1H, H de piridina); 6,88, 6,92 (2s, 2H, H de imidazol); 4,39 (tr, 2H, CH₂), 3,30 (tr, 2H, CH₂), 2,40 (s, 3H, CH₃).

Preparación del producto de partida 3-(2-metil-imidazol-1-il)-O-(4-trifluorometil-nicotinil)-propionamidoxima

15

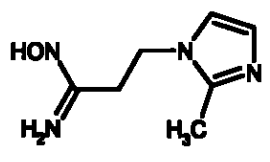


3,82 g (20 mmol) de ácido 4-trifluorometil-nicotínico y 3,24 g (20 mmol) de carbonil-diimidazol se agitaron en 100 ml de tetrahidrofurano seco a 50°C hasta el final del desprendimiento de CO₂. Se dejó enfriar y se añadió una solución de 4,21 g (25 mmol) de 3-(2-metil-imidazol-1-il)-propionamidoxima en 50 ml de tetrahidrofurano. Se agitó durante 6 h más a 50°C. Se concentró y se recogió con una mezcla de agua y diclorometano. Para la purificación, se cromatografió con acetato de etilo en presencia de gel de sílice.

Se obtuvieron 3,5 g (51,3 % del rendimiento teórico) de un producto en forma de material sólido incoloro. P.f. 137-138°C.

25

Preparación de 3-(2-metil-imidazol-1-il)-propionamidoxima



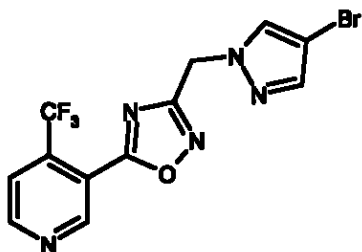
20 g (0,148 mol) de 3-(2-metil-imidazol-1-il)-propionitrilo y 12,4 g (0,178 mol) de cloruro de hidroxil-amonio se mezclaron con 31,97 g de una solución metanólica al 30 % de metilato de sodio y se agitaron durante 8 h a 50°C.

5 Después de haber enfriado se separó por filtración del cloruro de sodio y se concentró.

Se obtuvieron 18,3 g (73,5 % del rendimiento teórico) de un producto en forma de aceite incoloro, que se empleó en la siguiente etapa sin ninguna purificación adicional.

10

Ejemplo 2:



15

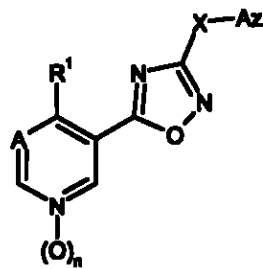
A una suspensión de 40 mg (1,4 mmol) de hidruro de sodio (como dispersión al 80 % en aceite) en 10 ml de dimetil-formamida se le añadieron 670 mg (4,6 mmol) de 4-bromo-pirazol y se agitó durante 30 min a 40°C. Se añadieron 300 mg (1,1 mmol) de 3-clorometil-5-(4-trifluorometil-3-piridil)-1,2,4-oxadiazol (Ejemplo 373 del documento WO-A-98/57969) en un poco de dimetil-formamida y se agitó durante 6 horas más a la temperatura ambiente. Para el tratamiento se diluyó con tolueno, se lavó con agua y la fase orgánica se secó y concentró. Para la purificación se cromatografió en gel de sílice con una mezcla de heptano y acetato de etilo 2:1.

20

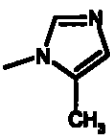
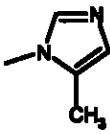
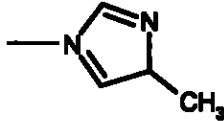
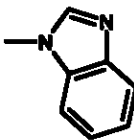
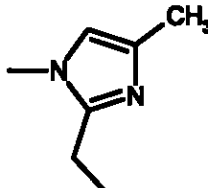
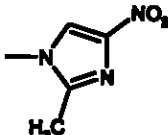
25 Se obtuvieron 210 mg de un producto (49 % del rendimiento teórico) en forma de aceite incoloro.

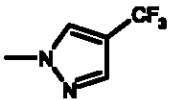
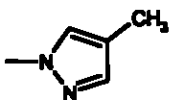
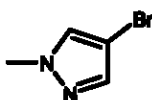
De manera análoga se preparan los compuestos señalados en las siguientes Tablas.

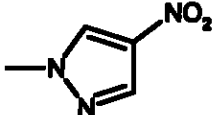
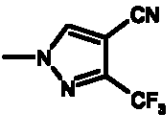
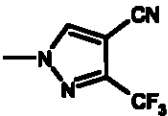
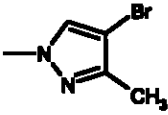
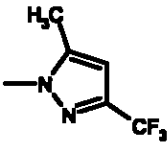
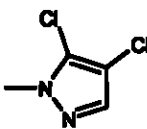
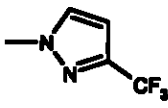
TABLA I

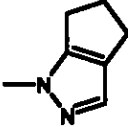
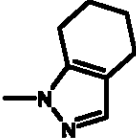
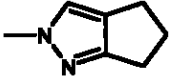
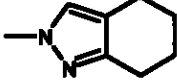
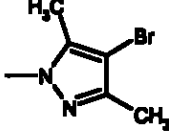


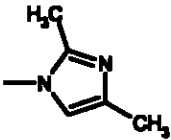
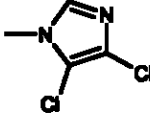
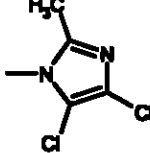
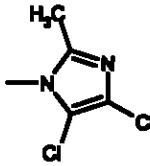
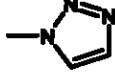
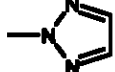
EJ.Nº.	A	N	R ¹	X	Az	P.f. [°C]
1	CH	0	CF ₃	-CH ₂		90-92
2	N	0	CF ₃	•	•	Aceite
3	CH	1	CF ₃	•	•	
4	CH	0	CF ₂ Cl	•	•	
5	CH	0	CF ₃	CH ₂ CH ₂	•	
6	N	0	CF ₃	CH ₂ CH ₂	•	
7	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	•	
8	CH	0	CF ₃	CH ₂ CH(CH ₃)	•	
9	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₄	•	
10	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₅	•	
11	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₆	•	
12	CH	0	CF ₃	CH ₂		Aceite
13	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	•	

EJ.Nº.	A	N	R ¹	X	Az	P.f. [°C]
14	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	▪	72-73
15	CH	0	CF ₃	CH ₂		
16	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	▪	64-65
17	CH	0				
18	CH	0	CF ₃	CH ₂		138-139
19	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	▪	
20	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	▪	
21	CH	0	CF ₃	CH ₂		
22	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	▪	72-74
23	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	▪	
24	CH	0	CF ₃	CH ₂		114-117
25	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	▪	
26	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	▪	
27	CH	0	CF ₃	CH ₂		

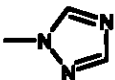
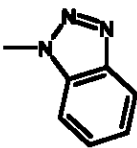
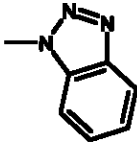
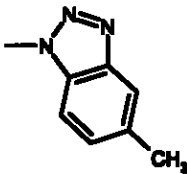
EJ.Nº.	A	N	R¹	X	Az	P.f. [°C]
28	CH	0	CF₃	(CH₂)₂	▪	Acelite
29	CH	0	CF₃	(CH₂)₃	▪	
30	CH	0	CF₃	CH₂	Pirazol	
31	N	0	CF₃	CH₂	▪	
32	CH	1	CF₃	CH₂	▪	
33	CH	0	CF₂Cl	CH₂	▪	Acelite
34	CH	0	CF₃	CH₂CH₂	Pirazol	
35	CH	0	CF₃	(CH₂)₃	▪	
36	CH	0	CF₃	(CH₂)₄	▪	
37	CH	0	CF₃	(CH₂)₅	▪	
38	CH	0	CF₃	(CH₂)₆	▪	
39	CH	1	CF₃	(CH₂)₂	▪	
40	CH	0	CF₃	CH₂CH(CH₃)	▪	
41	CH	0	CF₃	CH₂		
42	CH	0	CF₃	(CH₂)₂	▪	Acelite
43	CH	0	CF₃	(CH₂)₃	▪	
44	CH	0	CF₃	CH₂		
45	CH	0	CF₃	(CH₂)₂	▪	Acelite
46	CH	0	CF₃	(CH₂)₃	▪	Acelite
47	CH	0	CF₃	CH₂		
48	CH	0	CF₃	(CH₂)₂	▪	
49	CH	0	CF₃	(CH₂)₃	▪	

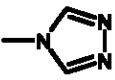
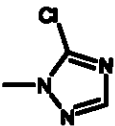
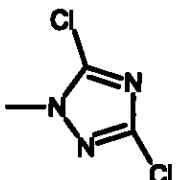
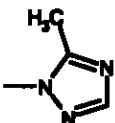
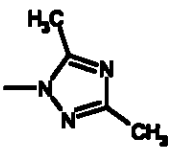
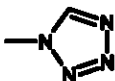
EJ.Nº.	A	N	R ¹	X	Az	P.f. [°C]
50	CH	0	CF ₃	CH ₂		129-130
51	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	•	69-70
52	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	•	
53	CH	0	CF ₃	CH ₂		
54	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	•	
55	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃		Acelite
56	CH	0	CF ₃	CH ₂		
57	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	•	
58	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	•	
59	CH	0	CF ₃	CH ₂		82-85
60	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	•	Acelite
61	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	•	
62	CH	0	CF ₃	(CH ₂)		
63	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	•	
64	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	•	78-79
65	CH	0	CF ₃	CH ₂		

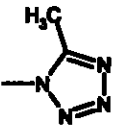
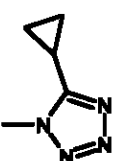
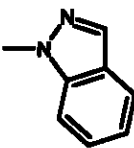
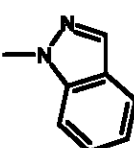
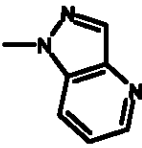
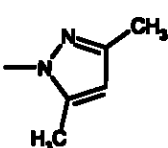
EJ.Nº.	A	N	R ¹	X	Az	P.f. [°C]
66	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	▪	
67	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	▪	
68	CH	0	CF ₃	CH ₂		
69	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	▪	
70	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	▪	
71	CH	0	CF ₃	CH ₂		
72	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	▪	Aceite
73	CH	9	CF ₃	(CH ₂) ₃	▪	
74	CH	0	CF ₃	CH ₂		
75	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	▪	
76	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	▪	
77	CH	0	CF ₃	CH ₂		
78	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	▪	
79	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	▪	
80	CH	0	CF ₃	CH ₂		
81	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	▪	107-109
82	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	▪	

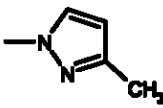
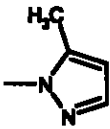
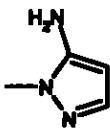
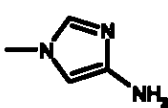
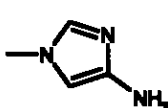
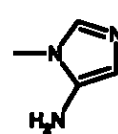
Ej.Nº.	A	N	R ¹	X	Az	P.f. [°C]
83	CH	0	CF ₃	CH ₂		
84	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	•	
85	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	•	
86	CH	0	CF ₃	CH ₂		
87	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	•	
88	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	•	
89	CH	0	CF ₃	CH ₂		117-120
90	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	•	
91	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃		
92	CH	0	CF ₃	CH ₂		Aceite
93	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	•	
94	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	•	
95	CH	0	CF ₃	CH ₂		Aceite
96	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	•	
97	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	•	

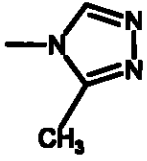
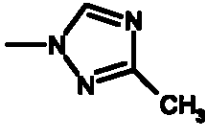
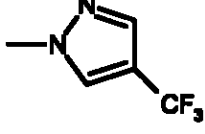
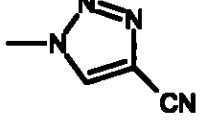
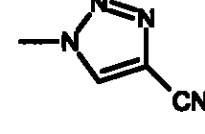
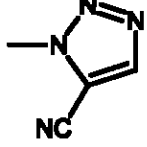
4/5
40

Ej.Nº.	A	N	R ¹	X	Az	P.f. [°C]
98	CH	0	CF ₃	CH ₂		Acetate
99	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	▪	42-43
100	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	▪	
101	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₄	▪	
102	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₅	▪	
103	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₆	▪	
104	CH	0	CF ₃	CH ₂ CH(CH ₃)	▪	Acetate
105	N	0	CF ₃	(CH ₂)	▪	
106	N	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	▪	
107	CH	1	CF ₃	(CH ₂) ₂	▪	
108	CH	0	CF ₂ Cl	(CH ₂) ₂	▪	
109	CH	0	CF ₃	CH ₂		102-103
110	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	▪	
111	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃		
112	CH	0	CF ₃	CH ₂		105-106
113	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	▪	
114	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	▪	

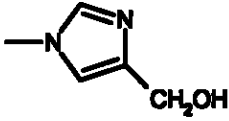
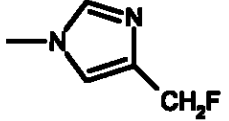
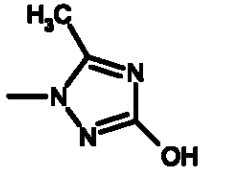
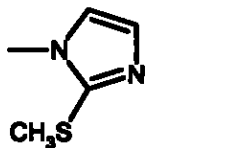
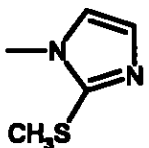
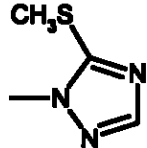
EJ.Nº.	A	N	R ¹	X	Az	P.f. [°C]
115	CH	0	CF ₃	CH ₂		
116	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
117	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
118	CH	0	CF ₃	CH ₂		
119	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
120	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
121	CH	0	CF ₃	CH ₂		
122	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
123	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
124	CH	0	CF ₃	CH ₂		
125	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
126	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
127	CH	0	CF ₃	CH ₂		
128	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
129	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
130	CH	0	CF ₃	CH ₂		
131	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	

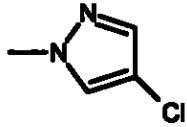
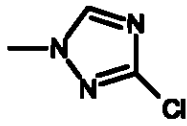
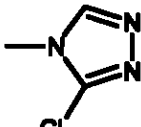
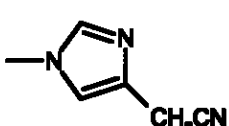
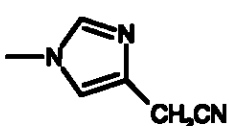
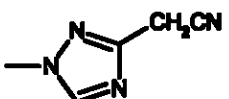
EJ.Nº.	A	N	R ¹	X	Az	P.f. [°C]
132	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	▪	Acetate
133	CH	0	CF ₃	CH ₂		
134	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	▪	
135	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	▪	
136	CH	0	CF ₃	(CH ₂)		
137	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	▪	
138	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	▪	
139	CH	0	CF ₃	CH ₂		
140	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	▪	
141	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃		
142	CH	0	CF ₃	CH ₂		
143	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	▪	
144	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	▪	
145	CH	0	CF ₃	CH ₂		

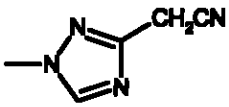
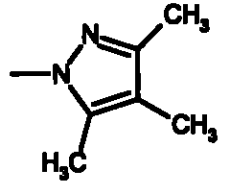
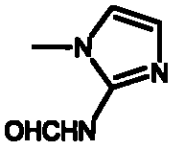
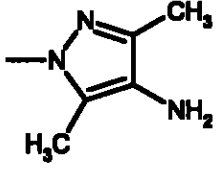
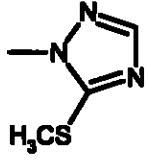
EJ.N°.	A	N	R ¹	X	Az	P.f. [°C]
146	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	▪	80-81
147	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	▪	
148	CH	0	CF ₃	CH ₂		
149	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	▪	
150	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	▪	
151	CH	0	CF ₃	CH ₂		
152	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	▪	
153	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	▪	
154	CH	0	CF ₃	CH ₂		
155	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	▪	
156	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	▪	
157	CH	0	CF ₃	CH ₂		
158	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	▪	
159	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃		
160	CH	0	CF ₃	CH ₂		
161	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	▪	
162	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	▪	

EJ.Nº.	A	N	R ¹	X	Az	P.f. [°C]
163	CH	0	CF ₃	CH ₂		
164	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
165	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
166	CH	0	CF ₃	CH ₂		
167	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
168	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
169	CH	0	CF ₃	CH ₂		
170	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
171	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
172	CH	0	CF ₃	CH ₂		
173	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂		
174	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
175	CH	0	CF ₃	CH ₂		
176	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
177	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	

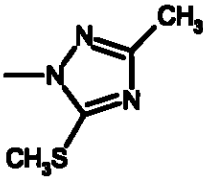
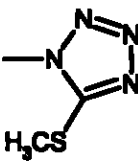
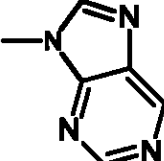
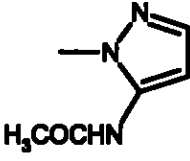
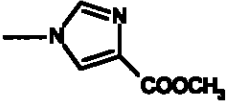
45

EJ.Nº.	A	N	R ¹	X	Az	P.f. [°C]
178	CH	0	CF ₃	CH ₂		
179	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
180	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
181	CH	0	CF ₃	CH ₂		
182	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
183	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
184	CH	0	CF ₃	CH ₂		
185	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
186	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
187	CH	0	CF ₃	CH ₂		
188	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂		
189	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
190	CH	0	CF ₃	CH ₂		

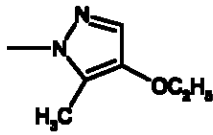
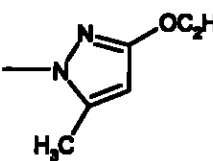
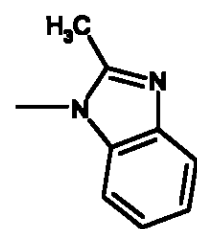
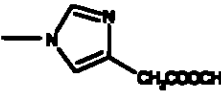
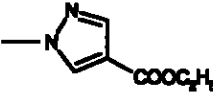
Ej.Nº.	A	N	R ¹	X	Az	P.f. [°C]
191	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
192	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
193	CH	0	CF ₃	CH ₂		
194	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
195	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
196	CH	0	CF ₃	CH ₂		
197	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
198	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
199	CH	0	CF ₃	CH ₂		
200	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
201	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
202	CH	0	CF ₃	CH ₂		
203	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
204	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃		
205	CH	0	CF ₃	CH ₂		

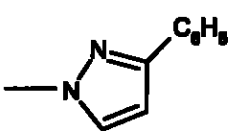
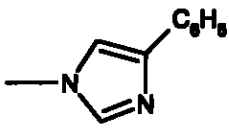
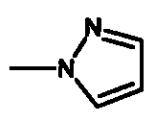
Ej.Nº.	A	N	R ¹	X	Az	P.f. [°C]
206	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂		
207	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
208	CH	0	CF ₃	CH ₂		
209	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
210	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
211	CH	0	CF ₃	CH ₂		
212	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
213	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
214	CH	0	CF ₃	CH ₂		
215	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
216	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
217	CH	0	CF ₃	CH ₂		
218	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
219	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	

478
48

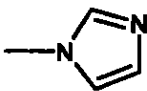
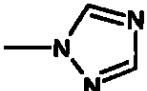
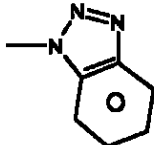
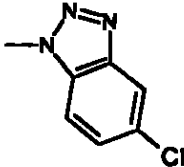
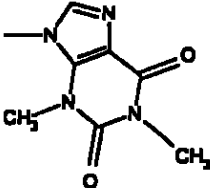
EJ.Nº	A	N	R ¹	X	Az	P.f. [°C]
220	CH	0	CF ₃	CH ₂		
221	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
222	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
223	CH	0	CF ₃	CH ₂		
224	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
225	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
226	CH	0	CF ₃	CH ₂		
227	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
228	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
229	CH	0	CF ₃	CH ₂		
230	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
231	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
232	CH	0	CF ₃	CH ₂		
233	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	

47
49

EJ.Nº.	A	N	R ¹	X	Az	P.f. [°C]
234	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	93-95
235	CH	0	CF ₃	CH ₂		
236	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
237	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
238	CH	0	CF ₃	CH ₂		
239	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
240	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
241	CH	0	CF ₃	CH ₂		
242	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
243	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
244	CH	0	CF ₃	CH ₂		
245	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
246	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
247	CH	0	CF ₃	CH ₂		

EJ.Nº.	A	N	R ¹	X	Az	P.f. [°C]
248	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
249	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
250	CH	0	CF ₃	CH ₂		
251	CH	0	CF ₃	CH ₂	.	
252	CH	0	CF ₃	CH ₂	.	
253	CH	0	CF ₃	CH ₂		
254	CH	0	CF ₃	CH ₂	.	
255	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
256	CH	0	CF ₃	CH(CH ₃)		Acelto
257	CH	0	CF ₃	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂	.	
258	CH	0	CF ₃	CH(CH ₃)CH ₂	.	

51

Ej.Nº.	A	N	R ¹	X	Az	P.f. [°C]
259	CH	0	CF ₃	CH(CH ₃)		
260	CH	0	CF ₃	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂	.	
261	CH	0	CF ₃	CH(CH ₃)CH ₂	.	
262	CH	0	CF ₃	CH(CH ₃)		
263	CH	0	CF ₃	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂	.	
264	CH	0	CF ₃	CH(CH ₃)CH ₂	.	74-75
265	CH	0	CF ₃	CH ₂ C(CH ₃) ₂	.	71-73
266	CH	0	CF ₃	CH ₂		
267	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	128-129
268	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
269	CH	0	CF ₃	CH ₂		
270	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	122-123
271	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
272	CH	0	CF ₃	CH ₂		

52

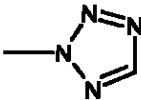
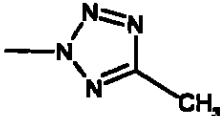
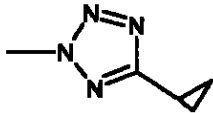
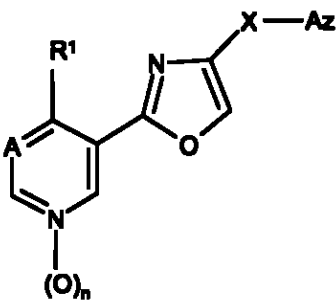
EJ.Nº.	A	N	R ¹	X	Az	P.f. [°C]
273	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	161-162
274	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
275	CH	0	CF ₃	CH ₂		
276	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
277	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
278	CH	0	CF ₃	CH ₂		
279	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
280	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
281	CH	0	CF ₃	CH ₂		
282	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
283	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	

TABLA 2



5

EJ.Nº	A	N	R ¹	X	Az	P.f. [°C]
300	CH	0	CF ₃	CH ₂		Acetate
301	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
302	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
303	CH	0	CF ₃	CH ₂		
304	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂		
305	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
306	CH	0	CF ₃	CH ₂		
307	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
308	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
309	CH	0	CF ₃	CH ₂		

54

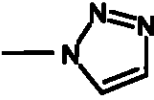
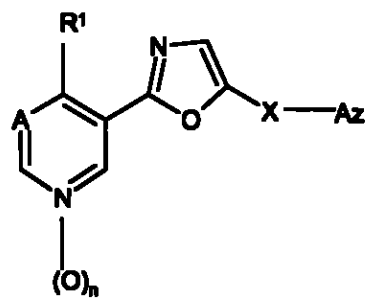
Ej.Nº	A	N	R ¹	X	Az	P.f. [°C]
310	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	▪	
311	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	▪	
312	CH	0	CF ₃	CH ₂		
313	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	▪	
314	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	▪	

TABLA 3

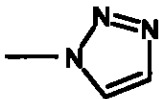


Ej.Nº	A	N	R ¹	X	Az	P.f. [°C]
400	CH	0	CF ₃	CH ₂		
401	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
402	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
403	CH	0	CF ₃	CH ₂		
404	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
405	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
406	CH	0	CF ₃	CH ₂		
407	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
408	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	
409	CH	0	CF ₃	CH ₂		
410	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	.	
411	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	.	

56

56

54

Ej.Nº	A	N	R ^I	X	Az	P.f. [°C]
412	CH	0	CF ₃	CH ₂		
413	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₂	"	
414	CH	0	CF ₃	(CH ₂) ₃	"	

5

B. Ejemplos de formulaciones

- 5 a) Se obtiene un agente para espolvorear mezclando 10 partes en peso de una sustancia activa y 90 partes en peso de talco como material inerte, y desmenuzándolas en un molino de impactos.
- 10 b) Se obtiene un polvo humectable, fácilmente dispersable en agua, mezclando 25 partes en peso de una sustancia activa, 65 partes en peso de cuarzo que contiene caolín como material inerte, 10 partes en peso de una sal de potasio de ácido lignina-sulfónico y 1 parte en peso de una sal de sodio de ácido oleoil-metil-táurico como agentes humectantes y dispersantes, y moliéndolas en un molino de púas.
- 15 c) Se produce un concentrado para dispersión fácilmente dispersable en agua, mezclando 40 partes en peso de una sustancia activa con 7 partes en peso de un semiéster de ácido sulfo-succínico, 2 partes en peso de una sal de sodio de ácido lignina-sulfónico y 51 partes en peso de agua y moliéndolas en un molino de bolas con fricción a una finura de por debajo de 5 micrómetros.
- 20 d) Se puede producir un concentrado emulsionable a partir de 15 partes en peso de una sustancia activa, 75 partes en peso de ciclohexano como disolvente y 10 partes en peso de nonil-fenol oxietilado (10 OE = óxido de etileno) como emulsionante.
- 25 e) Se puede producir un granulado a partir de 2 a 15 partes en peso de una sustancia activa y un material inerte de soporte de granulados tal como attapulgita, granulado de piedra pómez y/o arena cuarzosa. Convenientemente se utiliza una suspensión del polvo para proyectar del
- 30 Ejemplo b) con una proporción de material sólido de 30 % y se proyecta ésta sobre la superficie de un granulado de attapulgita, se seca y se mezcla íntimamente. En tal caso la proporción en peso del polvo para proyectar es de aproximadamente 5 % y la del material de soporte inerte es de aproximadamente 95 % del granulado acabado.

C. Ejemplos biológicos

Ejemplo 1

5 Semillas germinadas de haba común (*Vicia faba*) con radículas se transfirieron a frasquitos de vidrio pardo llenos de agua corriente y a continuación se cubrieron con aproximadamente 100 pulgones negros de haba (*Aphis fabae*). Las plantas y los pulgones se sumergieron luego durante 5 segundos en una solución acuosa del preparado que se había de probar y ya
10 formulado. Después de haber escurrido, las plantas y los animales se almacenaron en una cámara climatizada (16 horas de luz por día, a 25°C, con una humedad relativa de 40-60 %). Después de haber almacenado durante 3 y 6 días se comprobó el efecto del preparado sobre los pulgones. Con una concentración de 300 ppm (referida al contenido de sustancia activa) los
15 preparados según los Ejemplos 1, 13, 15, 18, 27, 30, 41, 44, 47, 50, 53, 56, 59, 62, 65, 80, 89, 92, 98, 99, 113, 242, 273 y 303 produjeron una mortalidad de 90-100 % de los pulgones.

Ejemplo 2

20 Las hojas de 12 plantas de arroz con una longitud de 8 cm de los tallos, se sumergieron durante 5 segundos en una solución acuosa del preparado que se había de probar y ya formulado. Después de haber escurrido, las plantas de arroz tratadas de este modo se colocaron en una cápsula de Petri y se cubrieron
25 con aproximadamente 20 larvas (estadio L3) de la especie de cigarra del arroz *Nilaparvata lugens*. Después de haber cerrado la cápsula de Petri, ésta se almacenó en una cámara climatizada (16 horas de luz por día, a 25°C, con una humedad relativa de 40-60 %). Después de haber almacenado durante 6 días se determinó la mortalidad de las larvas de cigarras. Con una concentración de
30 300 ppm (referida al contenido de sustancia activa) los preparados según los Ejemplos 27, 50, 53, 56, 59, 62, 80, 98, 99, 113, 242 y 273 produjeron una mortalidad de 90-100 %.

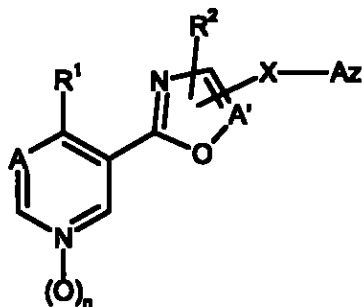
Ejemplo 3

35

Semillas germinadas de haba común (*Vicia faba*) con radículas se transfirieron a frasquitos de vidrio pardo llenos de agua corriente. Se introdujeron con pipeta en un frasquito de vidrio pardo cuatro mililitros de una solución acuosa del preparado que se había de probar y ya formulado. A
5 continuación el haba común se cubrió en gran manera con aproximadamente 100 pulgones negros de haba (*Aphis fabae*). Las plantas y los animales se almacenaron luego dentro de una cámara climatizada (16 horas de luz por día, a 25°C, con una humedad relativa de 40-60 %). Después de haber almacenado durante 3 y 6 días se comprobó el efecto sistémico por las raíces del preparado
10 sobre los pulgones. Con una concentración de 300 ppm (referida al contenido de sustancia activa) los preparados según los Ejemplos 1, 13, 15, 18, 27, 30, 41, 44, 47, 50, 53, 56, 59, 65, 80, 89, 92, 95, 98, 99 y 303 produjeron una mortalidad de 90-100 % de los pulgones mediante actividad sistémica por las raíces.

REIVINDICACIONES

- 1.- Derivados de azolilalquil-oxazoles y -oxadiazoles de la fórmula general (I)



5

en que los símbolos e índices tienen los siguientes significados:

- R¹** es halógeno-alquilo (C₁-C₄);
- R²** es hidrógeno, halógeno, alquilo (C₁-C₄), cicloalquilo (C₃-C₆) o
 10 halógeno-alquilo (C₁-C₄);
- A y A'** son iguales o diferentes y en cada caso CH ó N;
- n** es 0 ó 1;
- X** es una unidad de alquileo (C₁-C₈) ramificada o sin ramificar, en la que
 15 eventualmente un enlace simple de C-C puede estar reemplazado por un
 enlace doble o triple y en la que además uno o varios grupos CH₂ pueden
 estar reemplazados por un grupo carbonilo o una unidad con
 heteroátomo(s), y en la que, además, de 3 a 8 átomos de este radical
 hidrocarbilo, eventualmente modificado como antes se menciona, pueden
 formar un ciclo;
- 20 **Az** es un grupo de la fórmula general (II),



en la que los símbolos tienen los siguientes significados;

E, D, G y L son iguales o diferentes y significan en cada caso CH ó N, siendo CH en cada caso por lo menos uno de los sitios E, D, G y L y siendo N por lo menos uno de ellos;

y estando los átomos de carbono eventualmente sustituidos y pudiendo formar un anillo los sustituyentes de átomos de carbono contiguos, eventualmente junto con los carbonos del grupo Az.

2.- Compuesto de la fórmula (I) según la reivindicación 1, en que

R¹ significa fluoro-alquilo (C₁-C₄),

R² significa hidrógeno o metilo,

10 n significa O y

A significa CH.

3.- Compuesto de la fórmula (I) según la reivindicación 2, en que

R¹ significa trifluorometilo,

R² significa hidrógeno,

15 n significa O y

A significa CH.

4.- Compuestos de la fórmula (I) según la reivindicación 3, en que

R¹ significa trifluorometilo,

n significa O,

20 A significa CH y

A' significa nitrógeno.

5.- Compuestos de la fórmula (I) según una o varias de las reivindicaciones 1 a 4, en que

Az significa un radical imidazolilo, pirazolilo o 1,2,4-triazol-1-ilo y

25 eventualmente está sustituido con uno o varios radicales R⁴, y

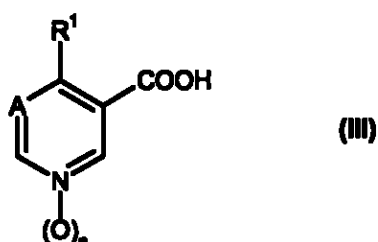
R⁴ significa alquilo (C₁-C₄), trifluorometilo, fluoro, cloro, bromo, ciano o nitro o dos radicales R⁴ están unidos para la condensación con benzo.

6.- Compuestos de la fórmula (I) según la reivindicación 5, en que

Az significa un radical pirazolilo o 1,2,4-triazol-1-ilo y eventualmente

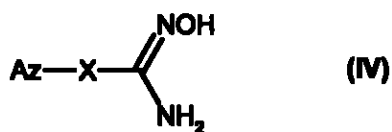
30 R⁴ significa metilo, cloro, bromo, ciano, nitro o trifluorometilo.

7.- Procedimiento para la preparación de compuestos de la fórmula general (I), en que A, R¹, X, n y Az tienen los significados indicados en la reivindicación 1 para la fórmula (I) y A' significa nitrógeno, caracterizado porque un compuesto de la fórmula (III),



en que A, R¹ y n tienen los significados indicados en la reivindicación 1 para la fórmula (I), eventualmente en forma de un derivado activado de este ácido, se hace reaccionar en presencia de una base con un compuesto de la fórmula (IV),

5

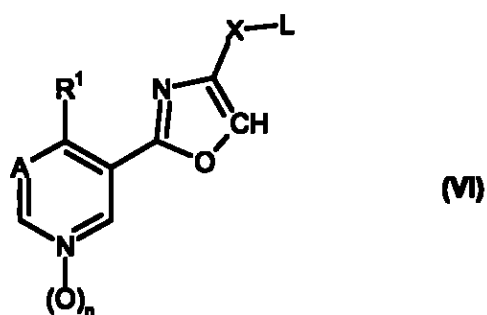


10

en la que X y Az tienen los significados indicados en la reivindicación 1 para la fórmula (I).

8.- Procedimiento para la preparación de compuestos de la fórmula general (I), en la que A, R¹, X, n y Az tienen los significados indicados en la reivindicación 1 para la fórmula (I) y A' significa CH, caracterizado porque un compuesto de la fórmula (VI),

15



20

en la que A, R¹, n y X tienen los significados indicados en la reivindicación 1 para la fórmula (I) y L significa un grupo lábil, se hace reaccionar con un azol eventualmente sustituido de la fórmula general (VII),

25



en la que B, C, D, E y m tienen los significados en la reivindicación 1 para la fórmula (II).

5 9.- Agente con efecto insecticida y acaricida, caracterizado por un cierto contenido de por lo menos un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 6.

10.- Agente con efecto insecticida y acaricida según la reivindicación 9, en mezcla con materiales de vehículo y/o tensioactivos.

10 11.- Agente según la reivindicación 9 ó 10, caracterizado porque contiene una sustancia activa adicional tomada entre el grupo de los acaricidas, fungicidas, herbicidas, insecticidas, nematocidas o sustancias reguladoras del crecimiento.

12.- Utilización de un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 6, o de un agente según la reivindicación 9 ó 10, para la preparación de un medicamento veterinario.

15 13.- Procedimiento para la represión de insectos dañinos y/o ácaros, caracterizado porque una cantidad eficaz de un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 6, o de un agente según una de las reivindicaciones 9 a 11, se aplica sobre el lugar donde se desea el efecto.

20 14.- Procedimiento para la protección de plantas útiles con respecto de la acción indeseada por insectos dañinos y/o ácaros, caracterizado porque por lo menos uno de los compuestos según una de las reivindicaciones 1 a 6, o un agente según una o varias de las reivindicaciones 9 a 11, se utiliza para el tratamiento de las semillas de plantas útiles.

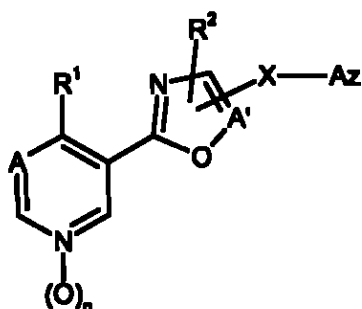
25 15.- Utilización de compuestos según una de las reivindicaciones 1 a 6, o de un agente según una de las reivindicaciones 9 a 11, para la represión de insectos dañinos y/o ácaros.

RESUMEN

Derivados de azolilalquil-azoles, procedimiento para su preparación y su utilización como agentes para la represión de plagas

5

Derivados de azolilalquil-oxazoles y -oxadiazoles de la fórmula general (I)



- 10 en la que los símbolos e índices están definidos como en la memoria descriptiva, además de tener una buena compatibilidad con las plantas y una favorable toxicidad para animales de sangre caliente, se adecuan muy bien para la represión de plagas de animales, tales como insectos, ácaros, nematodos, helmintos y moluscos así como para la represión de endo- y ecto-parásitos en el
- 15 sector médico veterinario.

Retirado folio 65 → extracto
2002-08-08. 202043

Folios 66 y 67
por ~~jet~~
Ez

REQUISITOS MINIMOS PARA ADMISION A TRAMITE

PATENTE DE INVENCION ☒ [x]

MODELO DE UTILIDAD []

- Indicación de que se solicita la concesión de una patente [x] Folio 1
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud [x] Folio 1
- Descripción de la invención [x] Folios 3 a 64
- Dibujos de ser estos pertinentes []
- Comprobante de Pago de las tasas establecidas [x] Folio 2

COMPLETA ☒ [x]

INCOMPLETA []

DISEÑO INDUSTRIAL []

- Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial []
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud. []
- Representación gráfica y fotográfica del Diseño Industrial o muestra del material que incorpora el diseño. []
- Comprobante de pago de las tasas establecidas. []

COMPLETA []

INCOMPLETA []

ESQUEMA DE TRAZADO []

- Indicación de que se solicita el registro de un Esquema de trazado. []
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud. []
- Representación gráfica del esquema de trazado []
- Comprobante de pago de las tasas establecidas. []

COMPLETA []

INCOMPLETA []


Firma Responsable

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicación : 0005672 00000000 Folios: 67

Fecha (RD): 2000-12-21 10:45:35

Trámite : 002 PATENTES D 1 REGISTRADO/ 411 PRESENTAC

Dependencia: 2000 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Carrera 13 No. 27-00 Piso 5 y 10
Conmutador: 334 12 21-2-3-4
Fax: 281 31 25 e-mail: info@sic.gov.co
Santa Fe de Bogotá D.C. - Colombia

2020
Bogotá, DC

Doctor
GUSTAVO HOLLMANN RESTREPO

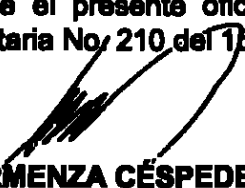
REFERENCIA:	Radicación No.	00-96872
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Oficio No.	0818
	Folios	001

Como resultado del examen de forma, realizado con fundamento en el artículo 38 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le comunica que:

- Debe allegar el poder otorgado al abogado que aparece en la solicitud como apoderado, con el lleno de los requisitos exigidos en el Código de Procedimiento Civil. Adicionalmente, deberá presentar el certificado de existencia y representación legal de la sociedad solicitante.
- Debe allegar copia del documento en que consta la cesión del derecho a la patente otorgado por el inventor al solicitante o a su causante (art. 26-k, Dec 486/2000).
- Debe indicarse el lugar de constitución de la sociedad solicitante (Art. 27-c, D 486/00).
- El interesado debe informar la dirección del solicitante, debido a que en la solicitud no aparece la misma. (Art. 27-b, D 486/00).

En cumplimiento del artículo 39 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le requiere para que dentro del término de dos (2) meses siguientes a la fecha de notificación del presente oficio, complete los requisitos anteriormente enunciados. En caso de no dar cumplimiento al presente requerimiento, la solicitud se considerará abandonada y perderá su prelación.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el artículo 8 de la Resolución Reglamentaria No. 210 del 15 de enero del 2001.


ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de la División de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de fecha 15 Feb. 2001.

Se recuerda al interesado que debe presentar, dentro de los dieciséis meses siguientes contados a partir de la fecha de presentación de la solicitud cuya prioridad se invoca, copia de la misma certificada por la autoridad que la explotó y, en los casos en que haya lugar, la traducción simple del capítulo reivindicatorio. El incumplimiento de éste plazo, acarreará la pérdida de la prioridad invocada.

202027/202022

Carrera 13 No. 27-00 Pisos 5, 7 y 10
Conmutador: 382 0840
Fax: 382 2695
E-mail: Info@sic.gov.co
Bogotá, D.C., Colombia