



SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-102108- -00000-0000

Fecha: 2011-08-11 11:39:37

Dep. 2020 DIR.NUEVASCR

Tra 11 PATENTEIYII

Eve: 378 FASENACIONALI

Act. 411 PRESENTACION

Folios: 103

Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

DELEGATURA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL

División de Nuevas Creaciones

SOLICITUD PATENTE DE INVENCION

21. EXPEDIENTE No. _____

54. TÍTULO _____

COMPOSICIONES PLAGUICIDAS

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL _____

71. SOLICITANTE _____

DOW AGROSCIENCES LLC

DOMICILIO _____

INDIANAPOLIS, INDIANA, ESTADOS UNIDOS DE AMERICA

74. APODERADO _____

LUZ CLEMENCIA DE PAEZ
C.C. 35.456.344 de Usaquén

22. BOGOTÁ, D.C., _____



PETITORIO

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 11-102108- -00000-0000
Fecha: 2011-08-11 11:39:37 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 103

FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL

1 SOLICITUD DE:	
☒ Patente de Invención.	☐ Patente de Modelo de Utilidad.
☒ Capítulo I.	☐ Capítulo II.
2 SOLICITANTE (71)	Nombre: DOW AGROSCIENCES LLC Sociedad constituida y existente bajo las leyes del Estado de Delaware, Estados Unidos de América. Dirección: 9330 Zionsville Road, Indianapolis, Indiana 46268, Estados Unidos de América Domicilio: Indianapolis, Indiana, Estados Unidos de América IDENTIFICACIÓN C.C. ☐ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Cual _____ Número _____
3 REPRESENTANTE O APODERADO	Nombre: LUZ CLEMENCIA DE PAEZ Dirección: Carrera 4ª. No. 72-35 Teléfono: 347 36 11 Fax: 211 86 50 E-mail: clientes@cavelier.com Domicilio: Bogotá, Colombia. IDENTIFICACIÓN C.C. ☒ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Cual _____ Número 35.456.344 T.P 23.555
4 INVENTOR (ES) (72)	1. Gary CROUSE 5069 East 146th Street, Noblesville, Indiana 46062, Estados Unidos de América 3. CaSandra MCLEOD 6034 Haverford Avenue, Indianapolis, Indiana 46220, Estados Unidos de América 5. Thomas SIDDALL 1925 South 900 East, Zionsville, Indiana 46077, Estados Unidos de América 2. Thomas SPARKS 1322 Greenhills Road, Greenfield, Indiana 46140, Estados Unidos de América 4. Annette BROWN 8132 Shottery Terrace, Indianapolis, Indiana 46268, Estados Unidos de América
5 PCT (86) Solicitud Internacional No. <u>PCT/US2010/023852</u> Fecha: <u>11 de febrero de 2010</u> Publicación Internacional No. <u>WO 2010/093764 A1</u> Fecha: <u>19 de agosto de 2010</u>	
6 Título (54) <u>COMPOSICIONES PLAGUICIDAS</u>	
7 Clasificación Internacional (51) <u>C07H 015/002</u>	

8	Prioridad SI ☒ NO ☐	(33) País de Origen	(32) Fecha	(31) Número de Solicitud
		US	11 de febrero de 2009	61/151,549

9 Comprobante de pago No.: 11-0076253 Fecha: 08 de agosto de 2011

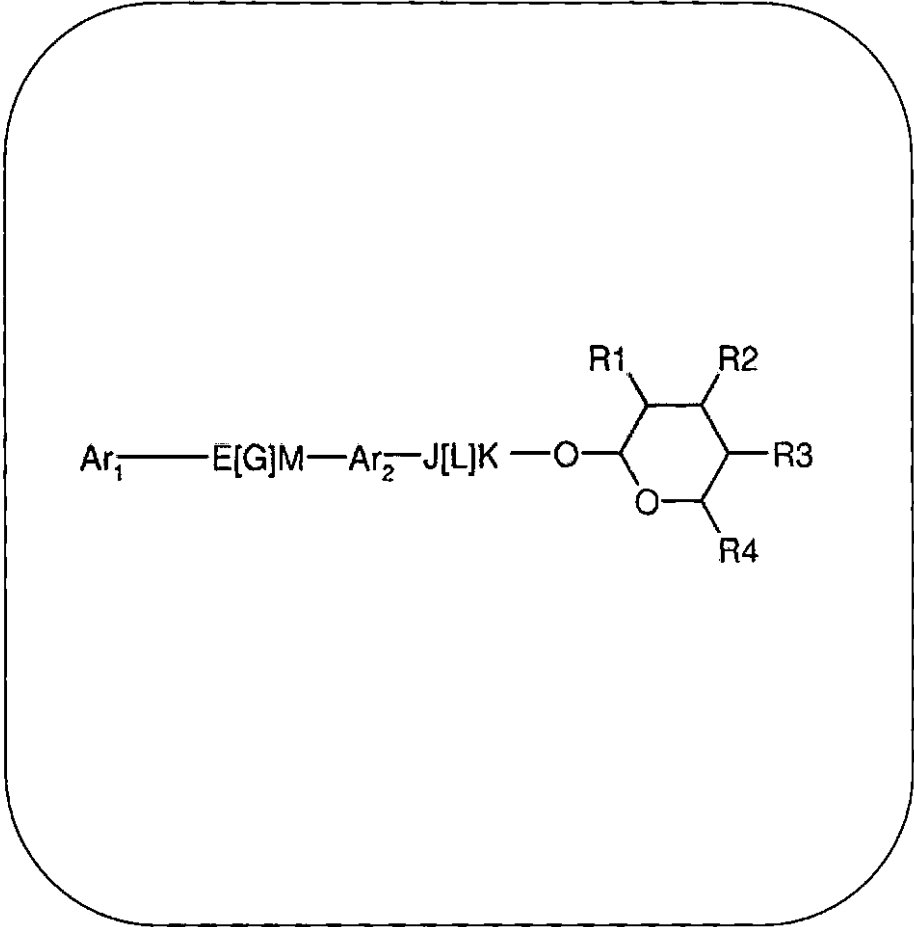
10 **Anexos:**

- ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por \$ 571.000.00.
- ☐ Comprobante de pago por reivindicaciones adicionales después de la décima reivindicación por.
- ☒ Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica.
- ☒ Poder de la sociedad **DOW AGROSCIENCES LLC.**
- ☐ Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante.
- ☐ Declaraciones.
- ☐ Copia de la solicitud internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☒ Copia de la carátula de la Publicación Internacional WO 2010/093764 A1.
- ☒ Traducción de la solicitud internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☐ Copia del examen preliminar efectuado por la IPEA.
- ☐ Traducción del examen preliminar efectuado por la IPEA.
- ☐ De ser el caso, copia del contrato de acceso.
- ☐ De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas.
- ☐ De ser el caso, certificado de depósito del material biológico.
- ☒ Arte final 12x12
- ☐ De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud.
- ☒ Otros: VER HOJA DE DOCUMENTOS ANEXOS

3

11

FIGURA CARACTERÍSTICA



12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE: LUZ CLEMENCIA DE PAEZ

FIRMA : *Luiz Clemencia De Paez*
C.C. 35.456.344 de Usaquén T.P. 23.555

SCT

4

DOCUMENTOS ANEXOS

1. ☒ Publicación Internacional WO 2010/093764 A1

Descripción:

Páginas 77 en español

Reivindicaciones: Número (s) 10

Figuras: Número (s)

2. ☒ Forma **PCT/ISA/210**. Informe de Búsqueda Internacional.

3. ☒ Extracto de publicación.

**NO SE REALIZARON MODIFICACIONES EN LA FASE
INTERNACIONAL**

CAVELIER

ABOGADOS

EDIFICIO SISKI

CARRERA 4ª N° 72-35

BOGOTÁ, 8 - COLOMBIA

REPRESENTACION, RATIFICACION Y PODER

For patents, utility models, industrial designs, trademarks, commercial names, trade emblems, slogans.

Para patentes, modelos de utilidad, diseños industriales, marcas de fábrica, nombres comerciales, enseñas, lemas comerciales.

REPRESENTATION, RATIFICATION AND POWER OF ATTORNEY

I (we), the undersigned /Yo (nosotros), abajo firmado (s)

Dow AgroSciences LLC

of/domiciliado (s) en 9330 Zionsville Road,

Indianapolis, Indiana 46268, United

States of America,

por el presente ratificamos la

presentada por

como agente oficioso ante

en

el

y por el presente nombramos a GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; EMILIO FERRERO, tpa. 31929; y LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555; domiciliados en la Carrera 4ª N° 72-35, Bogotá, Colombia, en obediencia a lo dispuesto en el parágrafo 1º del Artículo 543 del Código de Comercio, el primero como principal y los demás como suplentes, en su orden, como mis (nuestros) representantes en todos los asuntos de propiedad industrial con facultad para recibir notificaciones y nombrar apoderados judiciales o extrajudiciales. El primer representante suplente reemplazará al principal en caso de ausencia o impedimento temporal o definitivo de aquél. La misma regla se aplicará cuando el segundo representante suplente haya de reemplazar al primero, o el tercero al segundo. En tales casos, el representante principal, o el primero, o segundo suplente, en su caso, o ambos, declararán su intención de no ejercer la representación mediante declaración autenticada por Notario Público en Colombia, o por Notario u otro Funcionario Público, o Cónsul de Colombia, en el extranjero; y si se tratare de impedimento, con el certificado respectivo. Si alguno de los nombrados faltare definitivamente, el siguiente tomará su lugar. Cuando cesare la ausencia o impedimento del representante principal, o de su primero o segundo suplentes, en su caso, podrán ejercer la representación, en su orden, uno u otros según el caso, asumiéndola por el solo hecho de ejercerla, cesando en ese momento el ejercicio de la representación por el primero, segundo o tercer suplente en su caso.

Además, confiero (conferimos) poder a los abogados arriba nombrados, para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad industrial y contra la competencia desleal, a cuyo efecto autorizo (amos) a los dichos apoderados para que me (nos) representen ante cualesquiera entidades o personas, ejerzan o no jurisdicción, especialmente ante las del orden administrativo, contencioso-administrativo y judicial, así como los tribunales de arbitramento, en todo lo concerniente a los siguientes asuntos: a) Obtención de patentes de invención, modelos de utilidad y diseños industriales; el registro de marcas de fábrica, colectivas, defensivas, de servicio, lemas comerciales, nombres comerciales, enseñas, variedades vegetales y denominaciones de origen; su renovación, traspaso, cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria; y el registro de licencias de uso de esos derechos; b) Las acciones de competencia desleal, protección del consumidor, oposiciones u observaciones, cancelación administrativa o judicial, nulidad,

hereby ratify the

filed without a Power of Attorney by

before

in

on

and do hereby appoint GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; EMILIO FERRERO, tpa. 31929; and LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555; domiciled at Carrera 4ª N° 72-35, Bogotá, Colombia, in due compliance with the terms of Paragraph 1st. of Article 543 of the Commercial Code, the first as principal and the others as alternates, in the order of their appointment, as our representatives for all industrial property matters with faculty to receive notifications and to appoint attorneys in and out of Court. The first alternate shall replace the principal in case of his absence or of temporal or definitive impediment. The same rule will apply when the second alternate representative is to replace the first one, or when the third is to replace the first or second alternates in their turn, or both of them, second. In such cases, the principal representative, or the shall state their intention not to act as representatives through a declaration given before a Notary Public in Colombia, or before a Notary or another Public Official or a Colombian Consul abroad; and in case of impediment, the appropriate certificate shall suffice. If any of the appointees were to be definitely absent, the following alternate shall take his place. When the absence or impediment of the principal representative, or of the first or second alternate in their turn ceases, the representation can be taken again in their sequence, by the principal, the first or second alternate depending on case, and the mere fact or its exercise will suffice. The exercise of the representation by the first, second or third alternates in their turn shall end at such time.

In addition, we grant a Power of Attorney in favor of the above-named attorneys-at-law so that they may obtain the protection of my (our) industrial property and against the unfair competition, for which purpose we authorize the said attorneys to represent us before any authorities or persons, with or without jurisdiction, especially before administrative, administrative contencioso-administrative, as well as before Arbitration Courts, in all matters, concerning the following: a) Obtainment of patents, utility models and industrial designs; the registration of trademarks, collective, defensive and service marks, slogans, commercial names, trade emblems, vegetal varieties and denotations of origin; its renewal, assignment, change of name or domicile, voluntary cancellation; and the registration of licenses of use of the above rights; b) Actions of

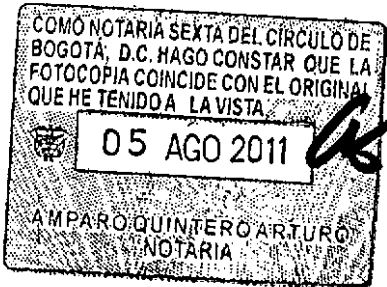
A la vuelta →

Over →

medidas cautelares, concesión de licencias, la tutela, la protección de secretos industriales, y en general los juicios civiles, penales, administrativos o contencioso-administrativos relacionados con estos derechos; acciones y procesos que promovamos o se nos promuevan. Y para que en todos los asuntos arriba determinados, puedan sustituir este mandato, transigir, conciliar, admitir los hechos del proceso, desistir, cancelar, recibir, renunciar, y ratificar los actos de agentes oficiosos.

unfair competition, protection to the consumer, oppositions or observations, administrative or Court cancellation, nullity, infringement, granting of licenses, the action for writ mandamus, the protection of trade secrets, and in general the civil, penal, and administrative suits relating to those rights; actions and suits instituted by me (us) or against me (us). And that in all the above matters they may substitute this Power of Attorney, compromise, conciliate, admit the facts of the case, desist, cancel, receive, resign, and ratify acts done by representatives without a power of attorney.

Given and signed this/Dado y firmado hoy February 6, 1978
in/en Indianapolis, Indiana 46268
United States of America
Kenneth L. Loertscher
Signature Firma
Kenneth L. Loertscher
Assistant Secretary
& General Patent Counsel



I, Sue Anne Gilroy, Secretary of State of Indiana, DO HEREBY CERTIFY: That, according to records on file in my office, Lydia S. Owens was duly elected or appointed to the office of Notary Public in and for Hendricks County, and that the term of said office included the date of February 6, 1998; that to all his/her official acts as said official, full faith and credit ought to be given in all Courts of Justice and elsewhere. In testimony whereof, I have hereunto set my hand and affixed the Great Seal of the State of Indiana, at Indianapolis, this Tenth day of February, 1998



Sue Anne Gilroy
Secretary of State
by: Mary Reever
Deputy



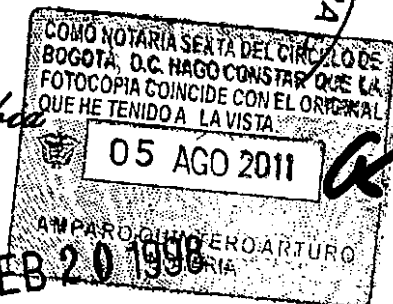
Consulado General de Colombia

500 NORTH MICHIGAN AVENUE, SUITE 2040
CHICAGO, ILLINOIS 60611

TEL (312)923-1196 FAX (312)923-1197

Chicago, FEB 20 1998

No. 254



El suscrito Cónsul General de Colombia, CERTIFICA, que el señor (a) MARY REEVER, quien como SECRETARIA DELEGADA ESTADO, IN., autenticó la firma del signatario del poder precedente, ejercía en la fecha las funciones indicadas y su firma corresponde a la registrada en este Consulado; que la compañía DOW AGROSCIENCES LLC es una sociedad constituida de acuerdo con las leyes de DELAWARE y cumple su objeto conforme a las mismas; que el (a) señor (a) KENNETH L. LOERTSCHER, quien en su carácter de REPRESENTANTE LEGAL de la citada compañía confiere el poder precedente, es su representante legal en este país.

El Cónsul General no asume responsabilidad alguna por el contenido del documento.

PAGADO IMPUESTO DE TIMBRE Y DERECHOS CONSULARES
US\$56.00 (Cincuenta y seis dólares)

Carlos Alfonso Negrete
Cónsul General



MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES

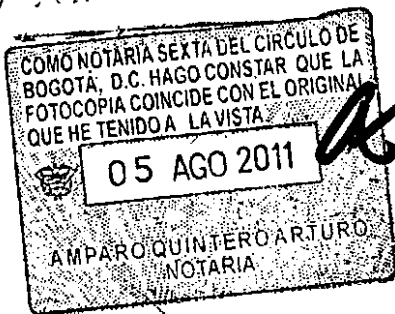
NO SE ASUME

RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

1998 MAR 11 11:55

JEFE DE LEGALIZACIONES
SANTAFE DE BOGOTA D.C.

Á FIRMAR APARECE EN EL
DOCUMENTO DESEMPENA
FUNCIONES INDICADAS



Bernarda R. de Martínez

Traductora e Interprete Oficial

Resolución 683 Minjusticia 1994

1. Que he visto l

CADO
CADO
ION J
MIEN

shos doc

Dow

ciudad

lo con las
nos Uni

el domicilio
Zionsvi
B. Estag

el objeto u
stán compi
ada Socleda

el(los) Sr.(Sra)
ARIO ASSI

utorizado(s) :

INDIANAPOI
INDIANA

6

FE

CERTIFICADO NOTARIAL (INDIVIDUO)

A los 6 días del mes de FEBRERO de 19 98
ante mí, Notario Público de ESTADO DE INDIANA
compareció(eron) personalmente KENNETH L. LOERTSCHER

a quien(es) doy fe de conocer y me consta que es(son) la(s)
persona(s) firmante(s) del documento que precede, y quien(es)
tiene(n) capacidad legal para otorgarlo.

Notario Público — Notary Public

CERTIFICADO NOTARIAL (SOCIEDAD)

Hoy, 6 de FEBRERO de 19 98
compareció(eron) ante mí
KENNETH L. LOERTSCHER

quien(es) conozco personalmente y que firma(n) este documen-
to en representación de la Sociedad/compañía
denominada Dow AgroSciences LLC

Certifico:

1. Que he visto los siguientes documentos:*

CERTIFICADO DE CONSTITUCION, FECHADO 1 JULIO 1997
CERTIFICADO DE MODIFICACION, FECHADO 1 OCT. 1997
RESOLUCION JUNTA DIRECTIVA, FECHADO 23 OCT, 1997
CONSENTIMIENTO ESCRITO DE LA JUNTA, 1 JULIO 1997

2. Que dichos documentos prueban lo siguiente:

2.1. Que Dow AgroSciences LLC
es una Sociedad/Compañía legalmente constituida y existente

de acuerdo con las leyes de 1 Estado de Delaware,
Estados Unidos de América

2.2. Que el domicilio de dicha Sociedad/Compañía es
9330 Zionsville Road, Indianapolis, Indiana
46268, Estados Unidos de America.

2.3. Que el objeto u objeto para los cuales se otorga el presente
poder están comprendidos dentro del objeto social de la
mencionada Sociedad/Compañía.

2.4. Que el(los) Sr.(Sres.) KENNETH L. LOERTSCHER
SECRETARIO ASISTENTE Y ASESOR LEGAL PATENTES

está(n) autorizado(s) para otorgar el presente Poder.

Ciudad INDIANAPOLIS
Estado INDIANA

Hoy 6 FEB. de 19 98

Notario Público — Notary Public

* Los documentos deben identificarse con fecha y origen.

NOTARIAL CERTIFICATE (INDIVIDUAL)

On this 6th day of February 19 98
before me, a Notary Public of State of Indiana.
personally appeared Kenneth L. Loertscher

to me known, and known to me to be the person(s) who
executed that foregoing document, and who has(have) legal
capacity to execute it.

NOTARIAL CERTIFICATE (CORPORATION)

On this 6th day of February 19 98
appeared before me
Kenneth L. Loertscher

who(m) I know personally and who(m) signed this document as
representative(s) of the Dow AgroSciences LLC Limited
named Dow AgroSciences LLC Company.

I Certify:

1. That I have seen the following documents:
Certificate of formation, dated July 1, 1997
Certificate of amendment, dated October 23, 1997
Board resolution, dated October 23, 1997
Board written consent, dated July 1, 1997
2. That the above documents duly prove the following:
2.1. That Dow AgroSciences LLC
Limited Liability
is a Company legally constituted and in existence
in accordance with the laws of the State of Delaware,
United States of America

2.2. That the domicile of said Company is
9330 Zionsville Road, Indianapolis, Indiana
46268, United States of America.

2.3. That the purpose of purposes for which the present Power
of Attorney is granted are comprised within the corporation
purposes set forth in the charter of the mentioned
corporation/company limited liability company.

2.4. That Mr.(Messrs.) Kenneth L. Loertscher
Assistant Secretary and General Patent Counsel
is(are) authorized to grant the present Power of Attorney.

City Indianapolis
State Indiana

This 6th day of Feb. 19 98

Lydia S. Owens

Lydia S. Owens
Notary Public, State of Indiana
Hendricks County
My Commission Expires 03/05/00

* Documents must be identified with date and origin.

Don T. G. Osorio 74 C. 1

9

**CERTIFICACION NOTARIAL
Y AUTENTICACION CONSULAR**

1. Es necesaria la legalización con certificado notarial. El Notario Público debe certificar:

- 1.1. Que la compañía está legalmente constituida y actualmente existente.
- 1.2. Su domicilio.
- 1.3. Que el propósito del poder está incluido en el objeto social de la compañía.
- 1.4. Que el poderdante está autorizado para dar el poder en nombre de la compañía.

2. Los documentos que hay que mostrarle al Notario Público para probar los puntos anteriores, deben estar expresados en el Certificado Notarial con fecha y origen:

- 2.1. Respecto a los puntos 1.1, 1.2 y 1.3 sugerimos referirse a los artículos de constitución con fecha y lugar de otorgamiento; y
- 2.2. Para el punto 1.4 sugerimos mencionar la resolución de la Junta Directiva o los estatutos, según los cuales la persona que otorga el poder está autorizada para ello.

3. Enseguida el Señor Cónsul de Colombia debe autenticar la firma del Notario Público.

**NOTARIAL CERTIFICATION AND
CONSULAR AUTENTIFICATION**

1. Notarial legalization is necessary. The Notary Public must certify:

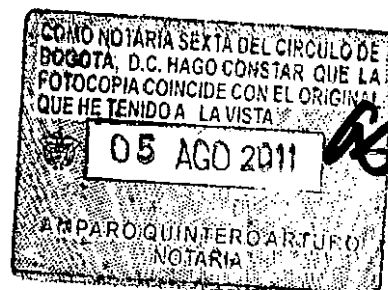
- 1.1. That the company is legally constituted and presently existent.
- 1.2. Its place of business.
- 1.3. That the purpose of the Power-of-Attorney is included in the activities of the company.
- 1.4. That the grantor is empowered to give the Power of Attorney in the name of the company he represents.

2. The documents which the Notary Public had before him to prove the above points must be listed by him in the Notarial Certificate with dated and origin:

- 2.1. In connection with points 1.1., 1.2. and 1.3 we suggest referring to the articles of incorporation with date and place of execution.
- 2.2. For point 1.4 we suggest to mention the resolution of the Board of Directors and/or the by-laws whereby the person who grants the Power of Attorney has been authorized to give it.

3. Then the Colombian Consul must legalize the signature of the Notary Public.

NOTA PARA EL SEÑOR CONSUL COLOMBIANO: Según el artículo 259 del C. de P.C. el Señor Cónsul debe autenticar la última precedente autenticación.

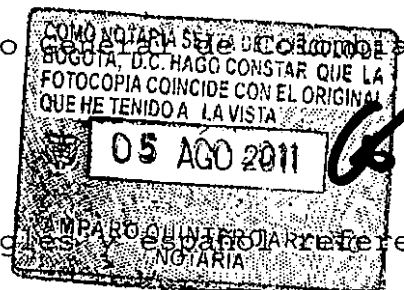


TRADUCCION OFICIAL No.03.075.98 de un documento escrito en inglés el cual para su identificación se sella con el sello del Traductor al mismo tiempo que la presente. Esta traducción ha sido preparada por Bernarda R. de Martínez, Traductora Oficial debidamente reconocida por el Ministerio de Relaciones Exteriores y aprobada por el Ministerio de Justicia de Colombia mediante Resolución No. 683 de 1991.

(Se traducen sellos y legalizaciones que aparecen a continuación de un documento escrito en inglés y español por medio del cual Dow AgroSciences LLC, otorga Poder a favor de GERMAN CAVELIER, GONZALO PERDOMO, EMILIO FERRERO y LUZ CLEMENCIA DE PAEZ.)

Dado y firmado hoy 6 de febrero de 1998, en Indianápolis, Indiana, E.E.U.U., por Kenneth L. Loertscher, Subsecretario y Asesor General de Patentes.

(Sellos parciales en tinta del Consulado de Colombia en Chicago.)



CERTIFICADO NOTARIAL (INDIVIDUO), en inglés y español referente a la capacidad legal que tenía KENNETH L. LOERTSCHER para otorgar el documento antes mencionado, expedido el 6 de febrero de 1998 en el Estado de Indiana.

CERTIFICADO NOTARIAL (SOCIEDAD), en inglés y español referente a la existencia legal de la sociedad Dow AgroSciences LLC, expedido en la Ciudad de Indianápolis, Indiana, E.E.U.U., el 6 de febrero de 1998.

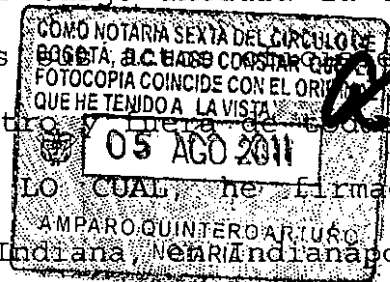
(Firmado), Lydia S. Owens, Notario Público
(Sello notarial en tinta), LYDIA S. OWENS Notario Público,
Estado de Indiana, Condado de Hendricks Mi comisión expira el
03/05/00
(Sello notarial seco), LYDIA S. OWENS NOTARIO PUBLICO INDIANA
(Sello parcial en tinta del Consulado General de Colombia en
Chicago.)

ESTADO UNIDOS DE AMERICA

CERTIFICADO DEL CARGO

ESTADO DE INDIANA

Yo, SUE ANN GILROY, Secretario de Estado de Indiana, POR EL
PRESENTE CERTIFICO: que, de acuerdo con los archivos que obran
en mi oficina, LYDIA S. OWENS fue debidamente elegido y
nombrado para el cargo de NOTARIO PUBLICO en y para el Condado
de Hendricks y que el término de dicho cargo incluía la fecha
del 6 de febrero de 1998: que a todos los que se presenten a
los debe dar completa fe y crédito dentro de los límites de las
Corte de Justicia. EN TESTIMONIO DE LO CUAL, he firmado y
estampado el Gran Sello del Estado de Indiana, en Indianapolis,
hoy 10 de febrero de 1998.



(Firma facsimilar), Sue Ann Gilroy

Secretario de Estado

(Firmado),

Por: Mary Reeve

Suplente

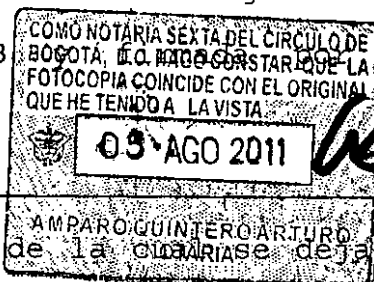
(Adherido se encuentra sello de oblea dorado con texto en
relieve), SELLO DEL ESTADO DE INDIANA 1816

(Sello parcial en tinta del Consulado General de Colombia en Chicago.)

(En español), Certificación de la firma y cargo de MARY REEVER, de la existencia legal de la compañía DOW AGROSCIENCES LLC y de la autoridad que tenía su representante Legal, KENNETH L. LOERTSCHER, para otorgar el poder mencionado arriba. Esta certificación fue expedida por el CONSULADO GENERAL DE COLOMBIA EN CHICAGO, ILLINOIS, bajo el N° 254, de fecha 20 de febrero de 1998 y firmada por Carlos Alfonso Negret Mosquera, Cónsul General. Pagados Impuesto de Timbre y Derechos Consulares por valor de veintiún dólares.

(Sello parcial en tinta del Consulado General de Colombia en Chicago.)

(al dorso), Legalización de la firma que antecede expedida el MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES bajo el No. 221220, de fecha 11 de marzo de 1998 el Jefe de Legalizaciones.



Es traducción fiel y completa de la original que se encuentra en los archivos de esta oficina para su confrontación y a la cual me remito.

Bogotá, 17 de marzo de 1998

COLO 6641-801-001-3

BRM.137

Bernarda R. de Martínez

Bernarda R. de Martínez
Traductora e Interprete Oficial
Resolución 683 Minjusticia 1991

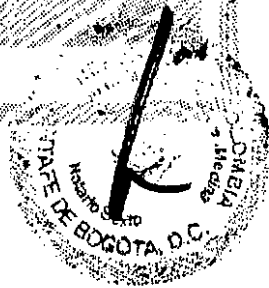
COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTAFE DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA(S) ANTERIOR(ES) FIRMA(S) PUESTA(S) POR

[Signature]

IDENTIFICADOS CON C.C. No.(s)

ES(SON) AUTENTICA(S)

SANTAFE DE BOGOTA, 17 MAR 1998



NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

98 MAR 18 AMU 156

DEFE DE LEGALIZACIONES
SANTAFE DE BOGOTA D.C.

COMO NOTARIA SEXTA DEL CIRCULO DE BOGOTA, D.C. HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA

05 AGO 2011

AMPARO QUINTERO ARTURO
NOTARIA

MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES

022686

CUYA FIRMA APARECE EN
DOCUMENTO DESEMPLEADO
LAS FUNCIONES INDICADAS

CAVELIER

ABOGADOS

WEB SITE: www.cavelier.com
E-MAIL: cavelier@cavelier.com

EDIFICIO SISKI
CARRERA 4 No. 72 - 35
BOGOTA 8, COLOMBIA

TELEFONO: (57) (1) 347-3611
TELEFAX: (57) (1) 217-9211 (57) (1) 310-4995

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

E. S. D.

Poderdante : DOW AGROSCIENCES LLC

Poder conferido el : 06/02/1998

Yo, EMILIO FERRERO, obrando como apoderado principal del poderdante arriba mencionado, mediante el presente escrito sustituyo el poder a mi otorgado a la doctora LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, identificada con cédula de ciudadanía No. 35.456.344 y Tarjeta Profesional N°23.555, con todas las facultades que me fueron conferidas.

Hago la anterior sustitución conforme al artículo 66 del Código de Procedimiento Civil.



EMILIO FERRERO

T.P.A. N° 31.929

C.C. N° 438.019 de Usaquén

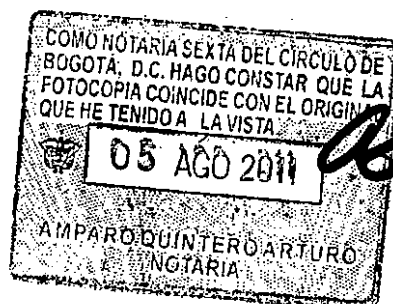
Acepto:



LUZ CLEMENCIA DE PAEZ

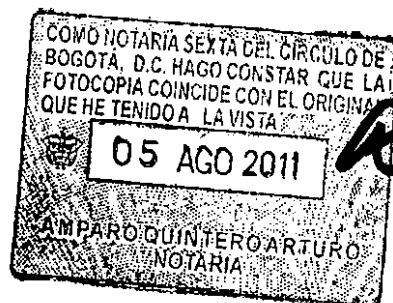
T.P.A. N° 23.555

C.C. No. 35.456.344 de Usaquén



NOTARIA SEXTA DE BOGOTA
RECONOCIMIENTO Y PRESENTACION PERSONAL
 Bogotá, D.C.
 Ante mí AMPARO QUINTERO ARTURO
 NOTARIA SEXTA DEL CÍRCULO DE
 BOGOTÁ, D.C.
 Comparado(aron) *Emilio Fomero*
Williamson y Luz Clemencia
Guarez de Paez
 Quien(es) exhibió(aron) la(s) C.C.
 CC 438019 TP 31929
 CC 35456341 TP 23535
 Y declaró(aron) que la(s) firma(s) que acompaña(n)
 en el presente documento es(son) la(s) suya(s) y
 que el contenido del mismo es cierto.
 En conciencia se firma esta diligencia.

Emilio Fomero
Luz Clemencia Guarez



dp

GEORGIA SUPERIOR COURT
CLERKS' COOPERATIVE AUTHORITY

Notary Division

1875 Century Boulevard, Suite 100

Atlanta, Georgia 30345

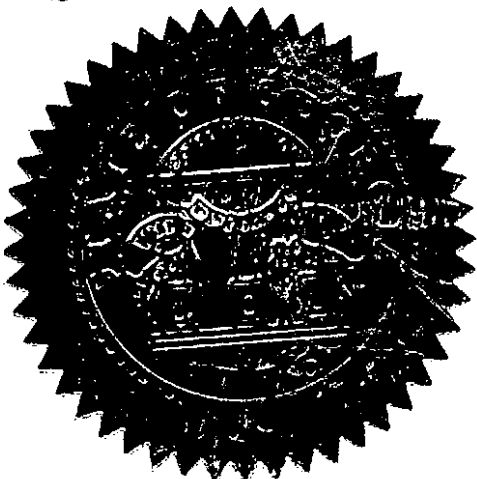
APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 Octobre 1961)

1. Country: United States of America
This public document
2. has been signed by LINDA H BRYANS
3. acting in the capacity of NOTARY PUBLIC, STATE OF GEORGIA
4. bears the seal/stamp of LINDA H BRYANS
NOTARY PUBLIC
GWINNETT COUNTY, GEORGIA

CERTIFIED

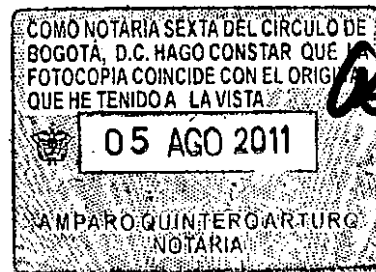
5. at ATLANTA, GEORGIA
6. the 2ND DAY OF NOVEMBER, 2001
7. by GEORGIA SUPERIOR COURT CLERKS' COOPERATIVE AUTHORITY
8. No. I-042917
9. Seal/Stamp:
10. Signature:



David R. Williams

DAVID R. WILLIAMS
EXECUTIVE DIRECTOR

NOTARY PUBLIC
(404) 327-6023



15

(12) INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
19 August 2010 (19.08.2010)

PCT

(10) International Publication Number
WO 2010/093764 A1

(51) International Patent Classification:
C07H 15/02 (2006.01) A01N 43/16 (2006.01)

(21) International Application Number:
PCT/US2010/023852

(22) International Filing Date:
11 February 2010 (11.02.2010)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
61/151,549 11 February 2009 (11.02.2009) US

(71) Applicant (for all designated States except US): **DOW AGROSCIENCES LLC** [US/US]; 9330 Zionsville Road, Indianapolis, IN 46268-1054 (US).

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (for US only): **CROUSE, Gary** [US/US]; 5069 East 146th Street, Noblesville, IN 46062 (US). **SPARKS, Thomas** [US/US]; 1322 Greenhills Road, Greenfield, IN 46140 (US). **MCLEOD, CaSandra** [US/US]; 6034 Haverford Avenue, Indianapolis, IN 46220 (US). **BROWN, Annette** [US/US]; 8132 Shottery Terrace, Indianapolis, IN 46268 (US). **SIDDALL, Thomas** [US/US]; 1925 South 900 East, Zionsville, IN 46077 (US).

(74) Agent: **CORVIN, Carl**; 9330 Zionsville Rd, Indianapolis, Indiana 46268 (US).

(81) Designated States (unless otherwise indicated, for every kind of national protection available): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) Designated States (unless otherwise indicated, for every kind of regional protection available): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), Eurasian (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

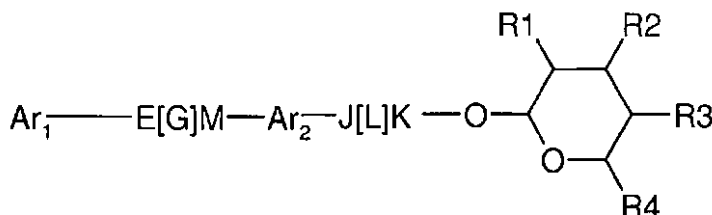
Declarations under Rule 4.17:

— as to applicant's entitlement to apply for and be granted a patent (Rule 4.17(ii))

Published:

— with international search report (Art. 21(3))

(54) Title: PESTICIDAL COMPOSITIONS



(57) Abstract: The invention disclosed in this document is related to the field of pesticides and their use in controlling pests. A compound having the following structure is disclosed.

WO 2010/093764 A1

COMPOSICIONES PLAGUICIDAS

CAMPO DE LA INVENCION

Esta solicitud reclama el beneficio de la Solicitud Provisional de los Estados Unidos Serial Número 61/151,549 presentada el 11 de febrero de 2009, cuya completa divulgación se incorpora por este medio por referencia. La invención divulgada en este documento se relaciona con el campo de los plaguicidas y su uso en controlar plagas.

ARTE PREVIO DE LA INVENCION

Las plagas causan millones de muertes humanas alrededor del mundo cada año. Adicionalmente, existen más de diez mil especies de plagas que ocasionan pérdidas en la agricultura. Estas pérdidas agrícolas ascienden a miles de millones de U.S. dólares cada año. Las termitas producen daños a varias estructuras tales como viviendas. Estas pérdidas por daños de termitas suman miles de millones de U.S. dólares cada año. Como nota final, muchas plagas de alimentos almacenados consumen y adulteran los alimentos almacenados. Estas pérdidas en alimentos almacenados equivalen a miles de millones de U.S. dólares cada año, pero, lo que es más importante, privan a las personas de alimentos necesarios.

Existe una aguda necesidad de nuevos plaguicidas. Los insectos están desarrollando resistencia a los plaguicidas en el uso actual. Centenares de especies de insectos son resistentes a uno o más plaguicidas. El desarrollo de resistencia a algunos de los plaguicidas más antiguos, tales como DDT, los carbamatos, y los organofosfatos, es bien conocido. Pero se ha desarrollado resistencia incluso a algunos de los plaguicidas más nuevos. Por consiguiente, existe una necesidad de nuevos plaguicidas y, particularmente, de plaguicidas que

17

tengan nuevos modos de acción.

RADICALES (LISTADO NO EXHAUSTIVO)

Los ejemplos dados para los radicales son (con la excepción de halo) no exhaustivos y no tienen que interpretarse como limitantes de la invención divulgada en este documento.

"Alquenilo" significa un radical acíclico, insaturado (por lo menos un enlace doble carbono-carbono), ramificado o no ramificado, que consta de carbono e hidrógeno, por ejemplo, vinilo, alilo, butenilo, pentenilo, hexenilo, heptenilo, octenilo, nonenilo, y decenilo.

"Alqueniloxi" significa un alquenilo que consta además de un enlace simple carbono-oxígeno, por ejemplo, aliloxi, buteniloxi, penteniloxi, hexeniloxi, hepteniloxi, octeniloxi, noneniloxi, y deceniloxi.

"Alcoxi" significa un alquilo que consta además de un enlace simple carbono-oxígeno, por ejemplo, metoxi, etoxi, propoxi, isopropoxi, 1-butoxi, 2-butoxi, isobutoxi, *terc*-butoxi, pentoxi, 2-metilbutoxi, 1,1-dimetilpropoxi, hexoxi, heptoxi, octoxi, nonoxi, y decoxi.

"Alquilo" significa un radical acíclico, saturado, ramificado o no ramificado, que consta de carbono e hidrógeno, por ejemplo, metilo, etilo, propilo, isopropilo, 1-butilo, 2-butilo, isobutilo, *terc*-butilo, pentilo, 2-metilbutilo, 1,1-dimetilpropilo, hexilo, heptilo, octilo, nonilo, y decilo.

"Alquinilo" significa un radical acíclico, insaturado (por lo menos un enlace triple carbono-carbono, y cualesquiera enlaces dobles), ramificado o no ramificado, que consta de carbono e hidrógeno, por ejemplo, etinilo, propargilo,

butinilo, pentinilo, hexinilo, heptinilo, octinilo, noninilo, y decinilo.

"Halo" significa fluoro, cloro, bromo, y yodo.

"Haloalcoxi" significa un haloalquilo que consta además de un enlace simple carbono-oxígeno, por ejemplo, fluorometoxi, difluorometoxi, y trifluorometoxi, 2-fluoroetoxi, 1,1,2,2,2-pentafluoroetoxi, 1,1,2,2-tetrafluoro-2-bromoetoxi y 1,1,2,2-tetrafluoroetoxi.

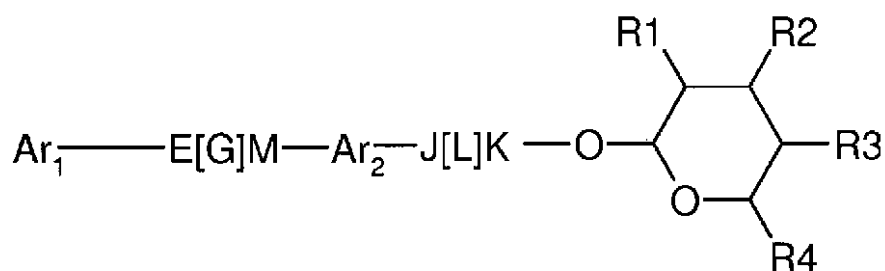
"Haloalquilo" significa un alquilo que consta además de, desde uno al número máximo posible de, halos idénticos o diferentes, por ejemplo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 2-fluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, clorometilo, triclorometilo, y 1,1,2,2-tetrafluoroetilo.

"Halofeniloxi" significa un feniloxi que tiene uno o más halos idénticos o diferentes.

"Hidroxialquilo" significa un alquilo que tiene uno o más grupos hidroxilo.

DESCRIPCIÓN DETALLADA DE LA INVENCION

Los compuestos de esta invención tienen la siguiente fórmula:



en donde:

(a) Ar_1 es

(1) furanilo, fenilo, piridazinilo, piridilo, pirimidinilo, tienilo, o

(2) furanilo sustituido, fenilo sustituido, piridazinilo sustituido, piridilo sustituido, pirimidinilo sustituido, o tienilo sustituido,

en donde el citado furanilo sustituido, fenilo sustituido, piridazinilo sustituido, piridilo sustituido, pirimidinilo sustituido, y tienilo sustituido, tienen uno o más radicales seleccionados independientemente de H, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ haloalquilo, C₁-C₆ hidroxialquilo, C₃-C₆ cicloalquilo, C₃-C₆ halocicloalquilo, C₃-C₆ hidroxicicloalquilo, C₃-C₆ cicloalcoxi, C₃-C₆ halocicloalcoxi, C₃-C₆ hidroxicicloalcoxi, C₁-C₆ alcoxi, C₁-C₆ haloalcoxi, C₂-C₆ alquenilo, C₂-C₆ alquinilo, S(=O)_n(C₁-C₆ alquilo), S(=O)_n(C₁-C₆ haloalquilo), OSO₂(C₁-C₆ alquilo), OSO₂(C₁-C₆ haloalquilo), C(=O)H, C(=O)NR_xR_y, (C₁-C₆ alquilo)NR_xR_y, C(=O)(C₁-C₆ alquilo), C(=O)O(C₁-C₆ alquilo), C(=O)(C₁-C₆ haloalquilo), C(=O)O(C₁-C₆ haloalquilo), C(=O)(C₃-C₆ cicloalquilo), C(=O)O(C₃-C₆ cicloalquilo), C(=O)(C₂-C₆ alquenilo), C(=O)O(C₂-C₆ alquenilo), (C₁-C₆ alquilo)O(C₁-C₆ alquilo), (C₁-C₆ alquilo)S(C₁-C₆ alquilo), (C₁-C₆ haloalquilo)O(C₁-C₆ haloalquilo)O, C₁-C₆ (hidroxi)haloalquilo, C(=O)(C₁-C₆ alquilo)C(=O)O(C₁-C₆ alquilo), fenilo, fenoxi, fenilo sustituido y fenoxi sustituido (en donde tal fenilo sustituido y fenoxi sustituido tienen uno o más radicales seleccionados independientemente de H, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ haloalquilo, C₁-C₆ hidroxialquilo, C₃-C₆ cicloalquilo, C₃-C₆ halocicloalquilo, C₃-C₆ hidroxicicloalquilo, C₃-C₆ cicloalcoxi, C₃-C₆ halocicloalcoxi, C₃-C₆ hidroxicicloalcoxi, C₁-C₆ alcoxi, C₁-C₆ haloalcoxi, C₂-C₆ alquenilo, C₂-C₆ alquinilo, S(=O)_n(C₁-C₆ alquilo), S(=O)_n(C₁-C₆ haloalquilo), OSO₂(C₁-C₆ alquilo), OSO₂(C₁-C₆ haloalquilo), C(=O)H, C(=O)NR_xR_y, (C₁-C₆ alquilo)NR_xR_y, C(=O)(C₁-C₆ alquilo), C(=O)O(C₁-C₆ alquilo), C(=O)(C₁-C₆ haloalquilo), C(=O)O(C₁-C₆ haloalquilo), C(=O)(C₃-C₆ cicloalquilo), C(=O)O(C₃-C₆ cicloalquilo), C(=O)(C₂-C₆ alquenilo), C(=O)O(C₂-C₆ alquenilo), (C₁-C₆ alquilo)O(C₁-C₆ alquilo), (C₁-C₆ alquilo)S(C₁-C₆ alquilo), C(=O)(C₁-C₆ alquilo)C(=O)O(C₁-C₆ alquilo) fenilo, y fenoxi);

(b) E es N, C, o CR5;
 (c) G es un enlace doble o triple;
 (d) M es N, C, o CR5, (con tal que cuando E es un átomo de nitrógeno "N", entonces M es un átomo de nitrógeno "N", y cuando E es un átomo de carbono "C", entonces M es un átomo de carbono "C", y cuando E es "CR5" entonces M es "CR5";

(c) Ar₂ es

(1) furanilo, fenilo, piridazinilo, piridilo, pirimidinilo, tienilo, o

(2) furanilo sustituido, fenilo sustituido, piridazinilo sustituido, piridilo sustituido, pirimidinilo sustituido, o tienilo sustituido,

en donde el citado furanilo sustituido, fenilo sustituido, piridazinilo sustituido, piridilo sustituido, pirimidinilo sustituido, y tienilo sustituido, tienen uno o más radicales seleccionados independientemente de H, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ haloalquilo, C₁-C₆ hidroxialquilo, C₃-C₆ cicloalquilo, C₃-C₆ halocicloalquilo, C₃-C₆ hidroxicicloalquilo, C₃-C₆ cicloalcoxi, C₃-C₆ halocicloalcoxi, C₃-C₆ hidroxicicloalcoxi, C₁-C₆ alcoxi, C₁-C₆ haloalcoxi, C₂-C₆ alquenilo, C₂-C₆ alquinilo, S(=O)_n(C₁-C₆ alquilo), S(=O)_n(C₁-C₆ haloalquilo), OSO₂(C₁-C₆ alquilo), OSO₂(C₁-C₆ haloalquilo), C(=O)H, C(=O)NR_xR_y, (C₁-C₆ alquilo)NR_xR_y, C(=O)(C₁-C₆ alquilo), C(=O)O(C₁-C₆ alquilo), C(=O)(C₁-C₆ haloalquilo), C(=O)O(C₁-C₆ haloalquilo), C(=O)(C₃-C₆ cicloalquilo), C(=O)O(C₃-C₆ cicloalquilo), C(=O)(C₂-C₆ alquenilo), C(=O)O(C₂-C₆ alquenilo), (C₁-C₆ alquilo)O(C₁-C₆ alquilo), (C₁-C₆ alquilo)S(C₁-C₆ alquilo), (C₁-C₆ haloalquilo)O(C₁-C₆ haloalquilo)O, C₁-C₆ (hidroxi)(halo)alquilo, C(=O)(C₁-C₆ alquilo)C(=O)O(C₁-C₆ alquilo), fenilo, fenoxi, fenilo sustituido y fenoxi sustituido (en donde tal fenilo sustituido y fenoxi sustituido tienen uno o más radicales seleccionados independientemente de H, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ haloalquilo, C₁-C₆ hidroxialquilo, C₃-C₆ cicloalquilo, C₃-C₆ halocicloalquilo, C₃-C₆ hidroxicicloalquilo, C₃-C₆ cicloalcoxi, C₃-C₆ halocicloalcoxi, C₃-C₆ hidroxicicloalcoxi, C₁-C₆ alcoxi, C₁-C₆ haloalcoxi, C₂-C₆ alquenilo, C₂-C₆ alquinilo, S(=O)_n(C₁-C₆ alquilo), S(=O)_n(C₁-C₆ haloalquilo), OSO₂(C₁-C₆ alquilo), OSO₂(C₁-C₆ haloalquilo), C(=O)H, C(=O)NR_xR_y, (C₁-C₆

alquilo)NR_xR_y, C(=O)(C₁-C₆ alquilo), C(=O)O(C₁-C₆ alquilo), C(=O)(C₁-C₆ haloalquilo), C(=O)O(C₁-C₆ haloalquilo), C(=O)(C₃-C₆ cicloalquilo), C(=O)O(C₃-C₆ cicloalquilo), C(=O)(C₂-C₆ alquenilo), C(=O)O(C₂-C₆ alquenilo), (C₁-C₆ alquilo)O(C₁-C₆ alquilo), (C₁-C₆ alquilo)S(C₁-C₆ alquilo), C(=O)(C₁-C₆ alquilo)C(=O)O(C₁-C₆ alquilo) fenilo, y fenoxi);

(d) J es O, N, NR₅, CR₅, o C=O;

(e) L es un enlace simple o doble;

(f) K es CR₅, C=O, N, NR₅, o C=S;

(g) R₁ es H, OH, F, Cl, Br, I, oxo, C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ haloalquilo, C₁-C₆ alcoxi, C₃-C₆ cicloalcoxi, C₁-C₆ haloalcoxi, C₂-C₆ alqueniloxi, (C₁-C₆ alquilo)O(C₁-C₆ alquilo), (C₁-C₆ alquilo)O(C₁-C₆ alcoxi), OC(=O)(C₁-C₆ alquilo), OC(=O)(C₃-C₆ cicloalquilo), OC(=O)(C₁-C₆ haloalquilo), OC(=O)(C₂-C₆ alquenilo), o NR_xR_y;

(h) R₂ es H, F, Cl, Br, I, oxo, C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ haloalquilo, C₁-C₆ alcoxi, C₃-C₆ cicloalcoxi, C₁-C₆ haloalcoxi, C₂-C₆ alqueniloxi, (C₁-C₆ alquilo)O(C₁-C₆ alquilo), (C₁-C₆ alquilo)O(C₁-C₆ alcoxi), OC(=O)(C₁-C₆ alquilo), OC(=O)(C₃-C₆ cicloalquilo), OC(=O)(C₁-C₆ haloalquilo), OC(=O)(C₂-C₆ alquenilo), o NR_xR_y;

(i) R₃ es H, OH, F, Cl, Br, I, oxo, C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ haloalquilo, C₁-C₆ alcoxi, C₃-C₆ cicloalcoxi, C₁-C₆ haloalcoxi, C₂-C₆ alqueniloxi, (C₁-C₆ alquilo)O(C₁-C₆ alquilo), (C₁-C₆ alquilo)O(C₁-C₆ alcoxi), OC(=O)(C₁-C₆ alquilo), OC(=O)(C₃-C₆ cicloalquilo), OC(=O)(C₁-C₆ haloalquilo), OC(=O)(C₂-C₆ alquenilo), o NR_xR_y;

(j) R₄ es H, C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ haloalquilo, C₁-C₆ alcoxi, C₁-C₆ haloalcoxi, C₂-C₆ alqueniloxi, (C₁-C₆ alquilo)O(C₁-C₆ alquilo);

(k) R₅ es (cada independientemente) H, C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ haloalquilo, C₃-C₆ cicloalquilo, o C₃-C₆ halocicloalquilo; y

(l) R_x y R_y se seleccionan independientemente de H, C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ haloalquilo, C₁-C₆ hidroxialquilo, C₃-C₆ cicloalquilo, C₃-C₆ halocicloalquilo, C₃-C₆ hidroxicicloalquilo, C₃-C₆ cicloalcoxi, C₃-C₆ halocicloalcoxi, C₃-C₆ hidroxicicloalcoxi, C₁-C₆ alcoxi, C₁-C₆ haloalcoxi, C₂-C₆ alquenilo, C₂-C₆ alquinilo, S(=O)_n(C₁-C₆ alquilo), S(=O)_n(C₁-C₆ haloalquilo), OSO₂(C₁-C₆ alquilo), OSO₂(C₁-C₆ haloalquilo), C(=O)H, C(=O)OH, C(=O)(C₁-C₆ alquilo), C(=O)O(C₁-C₆ alquilo), C(=O)(C₁-C₆

22

WO 2010/093764

PCT/US2010/023852

haloalquilo), C(=O)O(C₁-C₆ haloalquilo), C(=O)(C₃-C₆ cicloalquilo), C(=O)O(C₃-C₆ cicloalquilo), C(=O)(C₂-C₆ alqueno), C(=O)O(C₂-C₆ alqueno), (C₁-C₆ alquilo)O(C₁-C₆ alquilo), (C₁-C₆ alquilo)S(C₁-C₆ alquilo), C(=O)(C₁-C₆ alquilo)C(=O)O(C₁-C₆ alquilo), fenilo, y fenoxi.

En otra incorporación de esta invención:

Ar₁ es fenilo sustituido, en donde el citado fenilo sustituido tiene uno o más radicales seleccionados independientemente de C₁-C₆ haloalquilo, C₁-C₆ alcoxi, C₁-C₆ haloalcoxi, C(=O)(C₁-C₆ alquilo), (C₁-C₆ haloalquilo)O(C₁-C₆ haloalquilo)O, y C₁-C₆ (hidroxi)haloalquilo.

En otra incorporación de esta invención:

Ar₁ es fenilo sustituido, en donde el citado fenilo sustituido tiene uno o más radicales seleccionados independientemente de C₁-C₆ haloalquilo, C₁-C₆ alcoxi, C₁-C₆ haloalcoxi, y (C₁-C₆ haloalquilo)O(C₁-C₆ haloalquilo)O.

En otra incorporación de esta invención: Ar₂ es fenilo.

En otra incorporación de esta invención: J es N, NR₅, o CR₅.

En otra incorporación de esta invención: K es C=O, o N.

En otra incorporación de esta invención: R₁, R₂, y R₃, son (cada uno independientemente) un C₁-C₆ alcoxi.

En otra incorporación de esta invención: R₄ es un C₁-C₆ alquilo. En otra incorporación de esta invención: R₅ es H.

Aunque se han enunciado estas incorporaciones, son posibles otras incorporaciones y combinaciones de estas incorporaciones enunciadas.

PREPARACIÓN DE INTERMEDIOS DE PIRANOSA

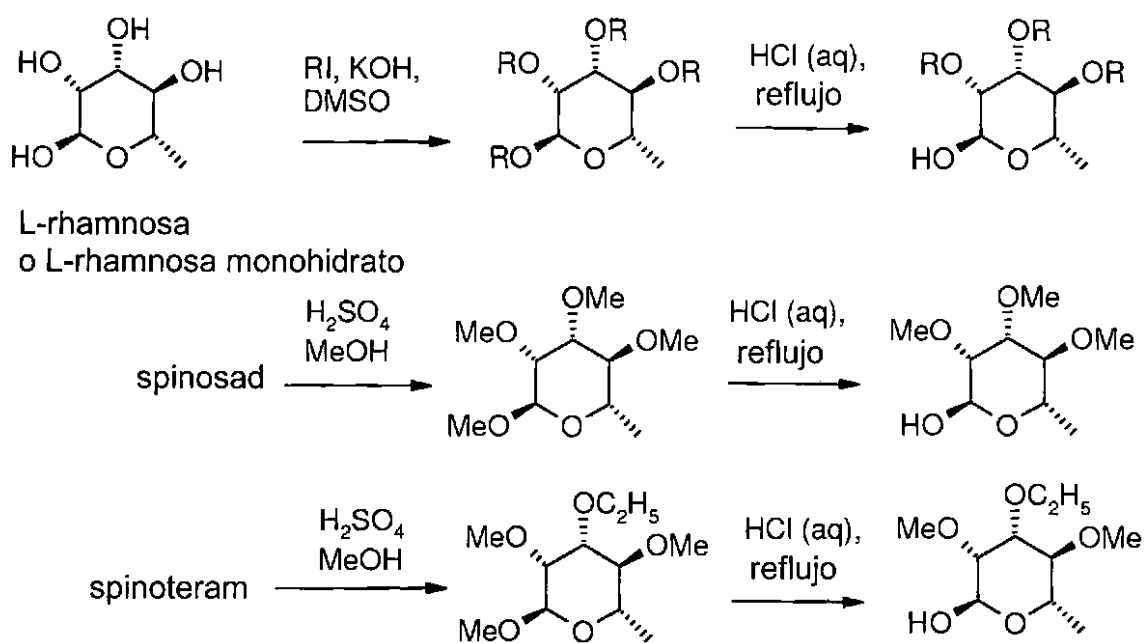
Una amplia variedad de piranosas (en diferentes formas estructurales, por ejemplo, D- y L-) puede usarse para elaborar los compuestos de esta invención. Por ejemplo, puede utilizarse el siguiente listado no exhaustivo de piranosas: ribosa, arabinosa, xilosa, lixosa, ribulosa, xilulosa, alosa, altrosa, glucosa, manosa, gulosa, idosa, galactosa, talosa, psicosa, fructosa, sorbosa, tagatosa, fucosa, micarosa, quinovosa, oleandrosa, rhamnosa, y paratosa. En la mayoría de los siguientes ejemplos, se empleó L-rhamnosa para elaborar intermedios de piranosa.

En general, los intermedios de piranosa pueden elaborarse en la siguiente forma (usando L-rhamnosa como un ejemplo). Derivados de rhamnosa O-alquilada pueden prepararse a partir de L-rhamnosa disponible en el comercio o hidrato de L-rhamnosa usando un yoduro alquílico y un hidróxido de potasio KOH en polvo en sulfóxido de dimetilo (DMSO) seco a una temperatura desde 5°C a 15 °C. El producto completamente alquilado se aísla entonces por extracción de la solución de DMSO con hexanos, seguida por la concentración de la capa de hexano bajo vacío. Este intermedio de alquil piranósido se trata entonces directamente con ácido clorhídrico (HCl) acuoso u otro ácido acuoso, que forma el azúcar hidroxil libre, usualmente como una mezcla de anómeros α y β .

Alternativamente, la L-rhamnosa per-alquilada puede aislarse por hidrólisis de spinosad u otro producto natural tri-(O-alquilo)rhamnosilado, usando condiciones similares a las descritas para aislamiento de metil oleandrósido de avermectina B₂ (Loewe et al. *J. Org. Chem.* **1994**, 59, 7870). Por consiguiente, el tratamiento de spinosad técnico con exceso de ácido sulfúrico concentrado en alcohol metílico (MeOH) seco resulta en hidrólisis del azúcar rhamnosa y conversión en el metil piranósido. El metil piranósido puro puede eliminarse

entonces del medio de reacción por extracción exhaustiva con hexanos u otro disolvente hidrocarburo. El rhamnopiranosido puro puede aislarse entonces con un rendimiento global de aprox. 65-75% por destilación del licor crudo bajo vacío.

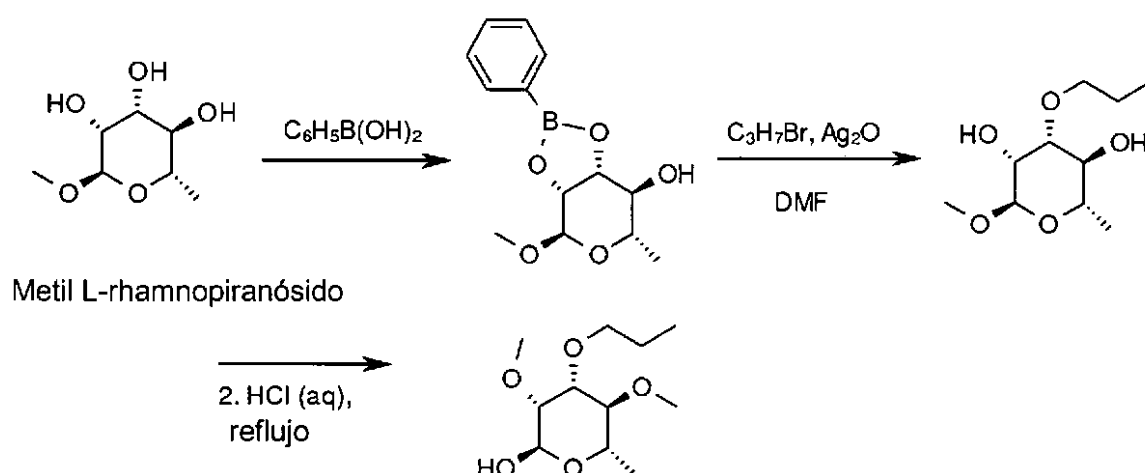
La 3-O-etil-2,4-di-O-metil rhamnosa puede prepararse en una manera similar, a partir de spinetoram. Análogamente pueden producirse otros derivados alquilados comenzando con los derivados de spinosoid apropiadamente funcionalizados, los cuales se elaboran de cualquier factor espinosina que tiene uno o más grupos hidroxilo libres, unidos a rhamnosa (por ejemplo, espinosina J) empleando las condiciones descritas en DeAmicis et al., patente de los Estados Unidos 6,001,981, 1999.



Se ha descrito un precursor rhamnosa que se alquila selectivamente con un radical mayor en C3 (véase, por ejemplo, Pozsgay et al. *Can. J. Chem.* **1987**, 65, 2764). Una ruta alterna, que evita el uso de reactivos de estaño, se describe más adelante. La reacción del metil piranosido de L-rhamnosa con un equivalente de ácido fenilbórico, bajo condiciones que permitan la eliminación de agua, resulta en

25

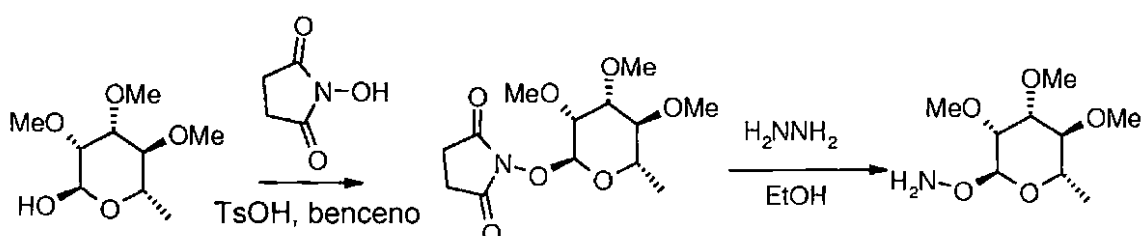
la formación de un acetal de boro. El tratamiento de este acetal con un yoduro alquílico y óxido de plata, en un disolvente aprótico polar, tal como *N,N*-dimetilformamida (DMF), a una temperatura desde 0 °C a 110 °C, resulta en una alquilación selectiva en C3-OH, produciendo el 3-O-alquil metil piranósido. Este material puede metilarse entonces posteriormente en las posiciones 2-OH y 4-OH con yoduro de metilo, empleando condiciones descritas previamente. La rhamnosa completamente alquilada puede hidrolizarse entonces como se describe más arriba para producir 2,4-di-O-metil-3-O-alquil L-rhamnosa.



Ilustraciones de preparar tales intermedios de piranosa se dan en los Ejemplos.

Puede prepararse igualmente intermedios de hidroxilamino piranosa. Por ejemplo, éstos pueden prepararse del correspondiente derivado de rhamnosa y *N*-hidroxisuccinimida (NHS) bajo condiciones en las cuales el agua formada se elimina azeotrópicamente, para formar un aducto *N*-succinimidoil hidroxilamina. En una incorporación, estas condiciones implican combinar rhamnosa y NHS en tolueno o benceno, agregar una cantidad catalítica de un ácido tal como ácido *p*-toluenosulfónico (TsOH), y calentar a reflujo en un aparato equipado con una trampa Dean-Stark. La conversión en el intermedio hidroxilamina libre se lleva a

cabo por tratamiento del aducto succinimidoilo con exceso de hidrato de hidracina o hidracina anhidra en un disolvente alcohólico tal como MeOH o alcohol etílico (EtOH). La reacción de la O-rhamnosil hidroxilamina con un aldehído o acetona usando EtOH u otro disolvente alcohol inferior a una temperatura desde temperatura ambiente a temperatura de reflujo produce entonces una O-rhamnosil oxima.



PREPARACIÓN DE INTERMEDIOS DE DIARILO

Los compuestos de esta invención se preparan enlazando las piranosas descritas más arriba a un intermediario diarilo, Ar₁-E[G]M-Ar₂, mediante un enlazador covalente J[L]KQ (definido anteriormente). Una amplia variedad de precursores diarilo puede usarse para preparar compuestos de esta invención, con tal que contengan un grupo funcional apropiado en Ar₂, al cual puede unirse el intermediario de piranosa, con el fin de formar el enlazador covalente. Grupos funcionales apropiados incluyen un grupo amino, oxoalquilo, formilo, o ácido carboxílico. Estos intermediarios pueden prepararse por métodos descritos previamente en la literatura química. A continuación siguen varios de estos métodos.

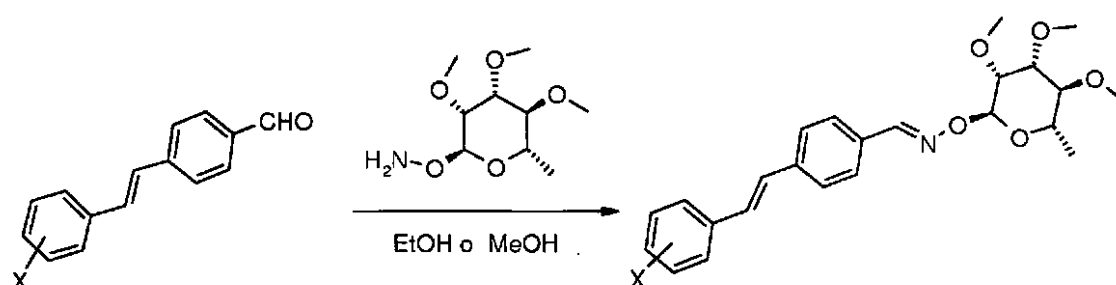
PREPARACIÓN DE COMPUESTOS ENLAZADOS A OXIMA

Los compuestos enlazados a oxima pueden prepararse de los correspondientes aril aldehídos o acetonas por reacción con el correspondiente azúcar 2-hidroxilamino, en un disolvente orgánico tal como MeOH o EtOH, a

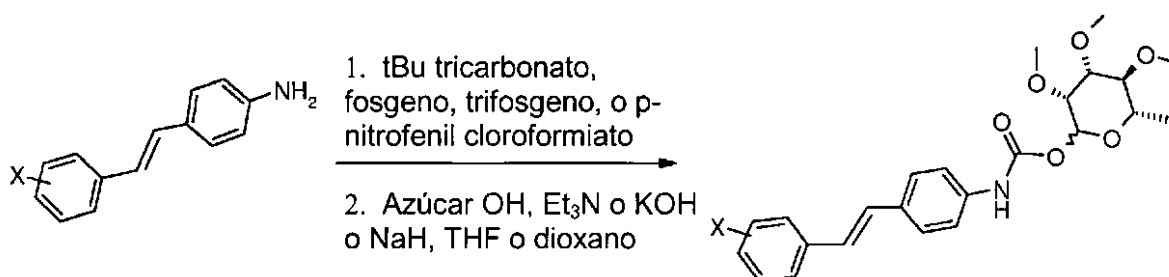
27

temperaturas entre 0 y 100 °C.

PREPARACIÓN DE COMPUESTOS ENLAZADOS A CARBAMATO



Compuestos enlazados a carbamato o tio-carbamato pueden prepararse de las correspondientes aril aminas por conversión en un isocianato, isotiocianato o *p*-nitrofenil carbamato, seguida por tratamiento con el -ROH apropiado y una base orgánica o inorgánica en un disolvente adecuado tal como tetrahidrofurano (THF), a temperaturas entre 0 y 100 °C:



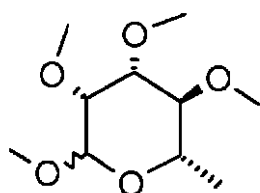
En estas reacciones, la configuración α en C1 de la fracción rhamnosa es usualmente el producto principal, aunque también se forma una cantidad menor del anómero β . Estos dos isómeros pueden separarse cromatográficamente, o pueden usarse como una mezcla.

La preparación de compuestos en el ámbito de esta invención puede hacerse por la síntesis de un intermedio apropiado que contiene un ácido, aldehído, acetona, o grupo funcional amino para enlace al intermedio de piranosa.

EJEMPLOS

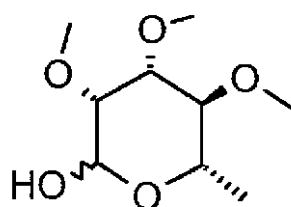
Estos ejemplos son para propósitos de ilustración y no tienen que interpretarse como si limitaran la invención divulgada en este documento a únicamente las incorporaciones divulgadas.

EJEMPLO 1: Preparación de (3R,4R,5S,6S)-2,3,4,5-tetrametoxi-6-metil-tetrahidropirano (Compuesto E-1)



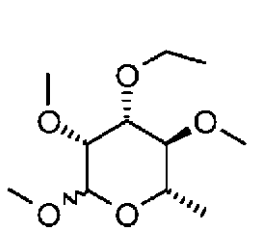
Una solución de hidrato de L-rhamnosa (40 gramos (g), 0.22 mol (mol)) sulfóxido de dimetilo seco (DMSO; 450 mililitros (mL)) se puso en un matraz de fondo redondo con 3 cuellos, de 2 litros (L), y se agitó mecánicamente mientras se agregaba hidróxido de potasio en polvo (KOH; 75 g, 1.34 mol) en una porción. Se agregó yodometano (187 g, 1.32 mol) a esta solución a una tasa tal que la temperatura de la solución se mantuviera por debajo de 30 °C. Se utilizó un baño de acetona helada intermitentemente para mantener esta temperatura. Una vez finalizada la adición (alrededor de 2 horas (h)), la solución se agitó 3 h más, luego se dejó reposar a temperatura ambiente de un día para otro. Esta solución clara se extrajo entonces con hexanos (4 x 500 mL), y la solución de hexanos combinados se lavó con salmuera antes del secamiento y evaporación del disolvente para producir una solución anaranjada clara (44 g, 92%). La destilación produjo 40 g de un aceite incoloro, punto de ebullición (bp) 150 °C (0.5 mm Hg).

EJEMPLO 2: Preparación de (3R,4R,5S,6S)-3,4,5-trimetoxi-6-metil-tetrahidropiran-2-ol (Compuesto E-2)

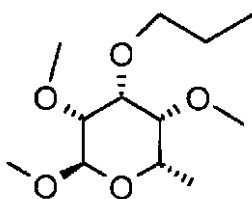


Una solución de E-1 (35.7 g, 0.162 mol) en 2 N ácido clorhídrico (HCl; 300 mL) se calentó a 98 °C durante 5 h, luego se enfrió a temperatura ambiente, y se extrajo con diclorometano (CH_2Cl_2 ; 4 x 170-mL). Los extractos combinados se secaron sobre sulfato de magnesio (MgSO_4) y se descolorizaron con carbón vegetal. La concentración produjo el compuesto del título (24.7 g, 74%) como un aceite viscoso. Una porción del producto crudo (960 miligramos (mg)) se destiló en vacío usando un aparato Kuhgelrohr, recolectando 890 mg a 145-155 °C (1-2 mm).

EJEMPLO 3: Preparación de (3R,4R,5S,6S)-4-etoxi-2,3,5-trimetoxi-6-metil - tetrahidropirano (Compuesto E-3)



Ácido sulfúrico (H_2SO_4 , 98%; 300 mL, 5.6 mol) se agregó lentamente a una solución agitada de alcohol metílico (2.5 litros (L)) en un matraz Erlenmeyer de 4-L. Cuando la solución se enfrió a temperatura ambiente, se agregó 3'-OEt espinosina J/L (350 g, 0.47 mol) (preparada como en DeAmicis et al., patente de los Estados Unidos 6,001,981, 1999) y la solución resultante se calentó a reflujo durante 6 h. La solución enfriada se transfirió a un embudo separador de 4-L y se extrajo con hexanos (3x1 L). La solución orgánica combinada se secó y se concentró *in vacuo*, luego se destiló usando un Kugelrohr para producir un aceite incoloro (65 g, 60%), bp 165 °C (10 mTorr).

EJEMPLO 4: Preparación de (2R,3R,4R,5R,6S)-2,3,5-trimetoxi-6-metil-4-propoxi-tetrahidropirano (Compuesto E-5)**Paso 1. (2R,3R,4R,5R,6S)-2-Metoxi-6-metil-4-propoxi-tetrahidropirano-3,5-diol.**

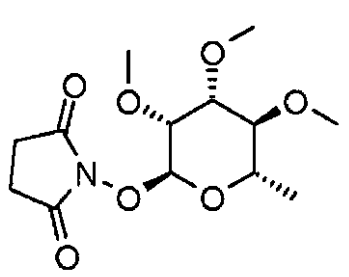
Siguiendo el procedimiento descrito por Oshima et al. (*Tetrahedron Lett.* **1997**, 38, 5001) para la preparación del éster 3,4-boronato de metil α -L-fucopiranosido, metil α -L-rhamnopiranosido se convirtió en el éster 2,3-boronato. El éster crudo (10.0 g, 37.7 milimoles (mmol)) se disolvió en tolueno (150 mL) y se trató con yodopropano (8.0 g, 47 mmol), óxido de plata (21.8 g, 94.3 mmol) y trietilamina (4.77 g, 47.1 mmol). La solución se calentó a 100 °C y se dejó agitar de un día para otro (16 h). Luego de enfriar y filtrar, la solución se concentró a un aceite gomoso y se purificó mediante cromatografía en gel de sílice eluyendo con un gradiente de acetato de etilo (EtOAc)-hexano para obtener 5.9 g de producto puro.

Paso 2. El material del Paso 1 se metiló usando MeI y KOH, bajo condiciones descritas en el Ejemplo 1 para proporcionar el compuesto E-5

Los intermedios de piranosa enumerados en la Tabla 1 se prepararon por las rutas descritas anteriormente e ilustradas en los Ejemplos 1-4.

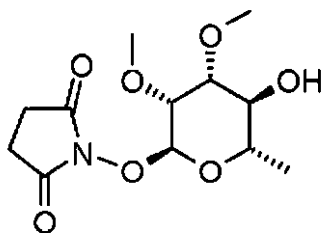
Un ejemplo de la preparación de intermedios de 2-O-succinimidoil piranosa se describe a continuación.

EJEMPLO 5: Preparación de 1-((2S,3R,4R,5S,6S)-3,4,5-trimetoxi-6-metil-tetrahidropiran-2-iloxi)- pirrolidin-2,5-diona (Compuesto E-23)



A una solución agitada de 2,3,4-tri-O-metil-L-rhamnosa (6.5 g, 31.5 mmol) y *N*-hidroxisuccinimida (5.4 g, 47 mmol) en benceno (50 mL) se agregó ácido p-toluenosulfónico (50 mg, cat.). La solución se calentó a reflujo y se recolectó agua (H₂O) usando una trampa Dean-Stark. Luego de 4 h, la solución se enfrió y la capa sobrenadante de tolueno se separó de una pequeña cantidad de goma insoluble. La capa orgánica se lavó con una solución saturada de bicarbonato de sodio (NaHCO₃; 20 mL), luego se secó sobre MgSO₄ y se concentró a un sólido. La recrystalización de éter (Et₂O)-hexanos produjo el compuesto del título (4.95 g, 52%) como un sólido blancuzco.

EJEMPLO 6: Preparación de 1-(2*S*,3*R*,4*R*,5*S*,6*S*)-5-hidroxi-3,4-dimetoxi-6-metil-tetrahidropiran-2-iloxi)-pirrolidin-2,5-diona (Compuesto E-24)



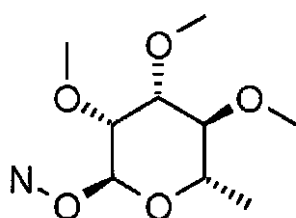
Una solución de (2*R*,3*R*,4*R*,5*S*,6*S*)-5-benciloxi-3,4-dimetoxi-6-metil-tetrahidropiran-2-ol (preparado de acuerdo con Wu et al., *Carbohydr. Res.* **1998**, 306, 493; 10.5 g, 26.6 mmol), *N*-hidroxisuccinimida (5.0 g, 50 mmol) y TsOH (250 mg, cat.) en benceno (100 mL) se calentó a reflujo durante 24 h con eliminación de H₂O usando una trampa de Dean-Stark. La solución marrón se enfrió, se filtró, se lavó con solución de NaHCO₃ saturada y se concentró. El aceite gomoso se purificó por cromatografía en gel de sílice, eluyendo con 70:30 hexanos-acetona.

La O-succinimida pura (7.5 g, 14.5 mmol) se transfirió entonces a un aparato de hidrogenación Parr de 500-mL y se desbenciló utilizando $\text{Pd}(\text{OH})_2/\text{C}$ (0.95 g) en EtOH (75 mL). La solución, que absorbió 19 libras por pulgada cuadrada (psi) de hidrógeno durante 24 h, se filtró y se concentró entonces, dejando un residuo sólido, el cual se recrystalizó de EtOH para producir un sólido blanco (3.25 g).

Los intermedios de O-succinimidil piranosa enumerados en la Tabla 2 se prepararon por las rutas descritas anteriormente e ilustradas en los Ejemplos 5 y 6.

Un ejemplo de la preparación de intermedios de 2-hidroxilamino piranosa de los correspondientes intermedios de O-succinimidoil piranosa se describe a continuación.

Ejemplo 7: Preparación de O-((2S,3R,4R,5S,6S)-3,4,5-trimetoxi-6-metil-tetrahidropiran-2-il)-hidroxilamina (Compuesto E-30)

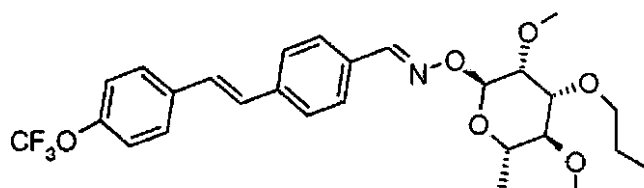


El derivado de 2,3,4-tri-O-metil-N-succinimidil rhamnosa E-23 (0.50 g, 1.65 mmol), preparado de acuerdo con Ejemplo 5, se disolvió en EtOH absoluto (5 mL) y se trató con un exceso de hidrato de hidracina (0.4 g, 8 mmol). La solución se dejó agitar a temperatura ambiente durante 60 minutos (min), con lo cual se formó un precipitado blanco. Se agregó más EtOH (5 mL), y la solución se agitó a temperatura ambiente de un día para otro. La solución se filtró y se concentró, luego se purificó por cromatografía (100% EtOAc) para proporcionar 265 mg (rendimiento 74%) de la hidroxilamina como un sólido cristalino.

33

Los intermedios de piranosa en la Tabla 3 se prepararon por las rutas descritas anteriormente e ilustradas en Ejemplo 7.

Ejemplo 8: Preparación de 4-[(E)-2-(4-trifluorometoxifenil)-vinil]-benzaldehído
O-((2S,3R,4R,5S,6S)-3,5-dimetoxi-6-metil-4-propoxi-tetrahidropiran-2-il)-oxima (Compuesto 1)



Paso 1. 4-[(E)-2-(4-Trifluorometoxifenil)-vinil]-benzonitrilo. A un matraz de fondo redondo purgado con nitrógeno se agregó fosfato de potasio, tribásico (617 mg, 2.9 mmol) en dimetil acetamida (DMA; 2 mL), 4-trifluorometoxi bromobenceno (500 mg, 2.1 mmol) y 4-cianovinilbenceno (322 mg, 2.5 mmol), seguidos por acetato de paladio (23 mg, 5 mol%). La solución se calentó a 140 °C agitando durante 12 h. La solución se dejó enfriar entonces a temperatura ambiente, se vertió en H₂O, se extrajo con EtOAc, y se lavó con salmuera. Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre MgSO₄, se filtraron y se concentraron. El material crudo se purificó por cromatografía de columna (EtOAc en hexanos, 0-75%) para proporcionar un sólido amarillo (543 mg, 90%), que se purificó por análisis de cromatografía de gases/espectrometría de masas (GC-MS). Este material se usó directamente en la siguiente reacción sin purificación posterior.

Paso 2. 4-[(E)-2-(4-Trifluorometoxifenil)-vinil]-benzaldehído. El ciano difenil estireno (543 mg, 1.88 mmol) se disolvió en CH₂Cl₂ seco (10 mL) y se enfrió a -78 °C en un baño de hielo seco/acetona. A esta solución se agregó gota a gota hidruro de diisobutilaluminio en hexanos (3.7 mL, 3.7 mmol). La reacción se dejó agitar 4 h calentando al mismo tiempo a temperatura ambiente. El aldehído deseado se formó exclusivamente por GC-MS. Se agregaron agua y metanol a la mezcla de reacción, lo cual causó burbujeo y formación de gel. La mezcla

heterogénea se diluyó con CH₂Cl₂ y se filtró a través de una frita separadora de fases Biotage. Se recogió la capa orgánica y se concentró para producir un sólido amarillo (450 mg, 81%) que se purificó por GC-MS. El producto se usó directamente en la siguiente reacción sin purificación posterior.

Paso 3. 4-[(E)-2-(4-Trifluorometoxifenil)-vinil]-benzaldehído O-((2S,3R,4R,5S,6S)-3,5-dimetoxi-6-metil-4-propoxi-tetrahidropiran-2-il)-oxima.

El aldehído preparado en el Paso 1 (0.1 g, 0.3 mmol) y el Compuesto E-32 (0.3 mmol) se disolvieron en EtOH absoluto (10 mL) y la solución se calentó a 40 °C agitando de un día para otro. Entonces se agregó agua (5 mL) a la solución enfriada, lo cual hizo que se formara un precipitado blanco. La solución se distribuyó entre H₂O (5 mL) y EtOAc (3x5 mL), y luego las capas orgánicas combinadas se secaron sobre MgSO₄, se filtraron y se concentraron para producir un sólido marrón oscuro. La purificación por cromatografía de columna de fase normal (gradiente EtOAc-hexanos) produjo el producto deseado (72 mg, 40%) como un sólido amarillo claro: punto de fusión (mp) 124-132 °C; ¹H NMR (300 MHz, CDC₁₃) δ 8.13 (s, 1H), 7.63 (d, *J* = 9.0 Hz, 2H), 7.54 (m, 4H), 7.21 (d, *J* = 9.0 Hz, 2H), 7.11 (d, *J* = 9.0 Hz, 2H), 5.63 (s, 1H), 3.71 (m 1H), 3.70-3.50 (m, 4H), 3.59 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.20 (t, *J* = 9.0 Hz, 1H), 1.68 (m, 2H), 1.31 (d, *J* = 6.0 Hz, 3H), 0.98 (t, *J* = 7.6 Hz, 3H); ESIMS *m/z* 524

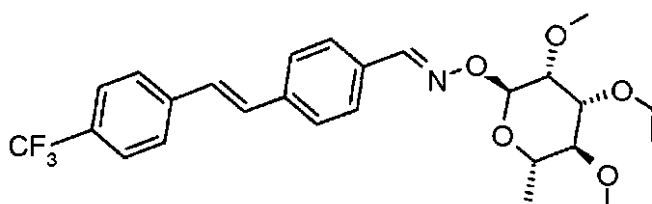
Los siguientes compuestos se prepararon empleando las condiciones descritas en Ejemplo 8.

4-[(E)-2-(4-Trifluorometilfenil)-vinil]-benzaldehído O-((2S,3R,4R,5S,6S)-4-etoxi-3,5-dimetoxi-6-metil-tetrahidropiran-2-il)-oxima (Compuesto 2)

35

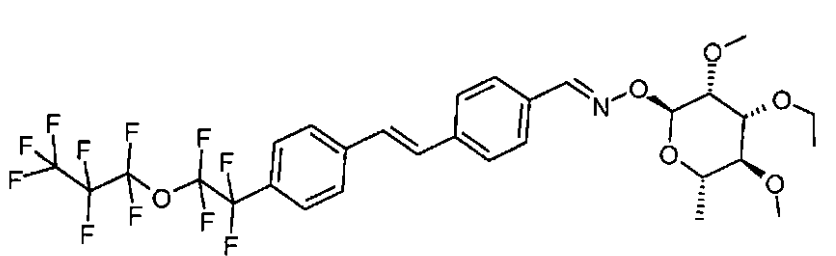
WO 2010/093764

PCT/US2010/023852



La formación de oxima produjo 60% de un sólido marrón amarillento: mp 150-153 °C; ^1H NMR (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 8.41 (s, 1H), 7.84 (d, $J = 8.1$ Hz, 2H), 7.75-7.67 (m, 6H), 7.46 (s, 2H), 5.49 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 3.73-3.66 (br s, 2H), 3.56-3.47 (m, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.43 (s, 3H), 3.04 (t, $J = 10.0$ Hz, 1H), 1.17 (m, 6H); ESIMS m/z 494 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

4-[(E)-2-[4-(1,1,2,2-Tetrafluoro-2-heptafluoropropiloxy-etil)-fenil]-vinil]-benzaldehído O-((2S,3R,4R,5S,6S)-4-etoxi-3,5-dimetoxi-6-metil-tetrahidropiran-2-il)-oxima (Compuesto 3)

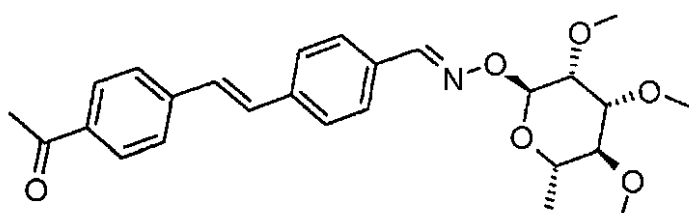


La formación de oxima produjo 84% de un aceite amarillo claro: ^1H NMR (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 8.40 (s, 1H), 7.68 (m, 4H), 7.50 (m, 3H), 7.40 (d, $J = 4.0$ Hz, 1H), 7.15 (d, $J = 8.0$ Hz, 1H), 5.48 (s, 1H), 3.74 (m, 1H), 3.67 (m, 1H), 3.55-3.46 (m, 4H), 3.45 (s, 3H), 3.43 (s, 3H), 3.04 (t, $J = 9.2$ Hz, 1H), 1.17 (m, 6H); ESIMS m/z 707 ($[\text{M}-\text{H}]^-$).

4-[(E)-2-(4-Acetil-fenil)-vinil]-benzaldehído O-((2S,3R,4R,5S,6S)-4-etoxi-3,5-dimetoxi-6-metil-tetrahidropiran-2-il)-oxima (Compuesto 4)

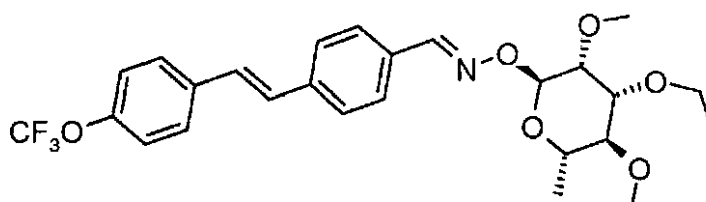
WO 2010/093764

PCT/US2010/023852



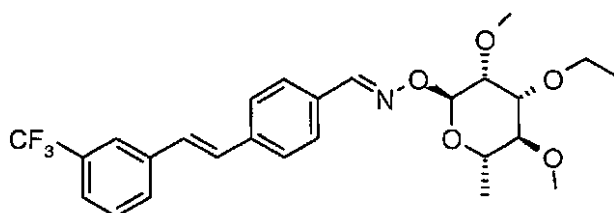
La formación de oxima produjo 56% de un sólido marrón amarillento: mp 164-167 °C; ^1H NMR (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 8.41 (s, 1H), 7.97 (d, $J = 8.0$ Hz, 2H), 7.77 (d, $J = 8.0$ Hz, 2H), 7.72 (d, $J = 8.0$ Hz, 2H), 7.68 (d, $J = 8.3$ Hz, 2H), 7.45 (s, 2H), 5.48 (s, 1H), 3.86 (s, 3H), 3.74 (br s, 1H), 3.73-3.66 (m, 1H), 3.54-3.46 (m, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.43 (s, 3H), 3.04 (t, $J = 8.0$ Hz, 1H), 1.17 (m, 6H); ESIMS m/z 485 ($[\text{M}+\text{H}_2\text{O}]^+$).

4-[(*E*)-2-(4-Trifluorometoxifenil)-vinil]-benzaldehído *O*-((2*S*,3*R*,4*R*,5*S*,6*S*)-4-etoxi-3,5-dimetoxi-6-metil-tetrahidropiran-2-il)-oxima (Compuesto 5)



La formación de oxima produjo 24% de un sólido amarillo claro: mp 91-101 °C; ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 8.13 (s, 1H), 7.63 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 7.55-7.51 (m, 3H), 7.23-7.17 (m, 3H), 7.11 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 5.64 (d, $J = 3.0$ Hz, 1H), 3.79-3.60 (m, 5H), 3.59 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.20 (t, $J = 9.0$ Hz, 1H), 1.32-1.24 (m, 6H); ESIMS m/z 532 ($[\text{M}+\text{Na}]^+$).

4-[(*E*)-2-(3-Trifluorometilfenil)-vinil]-benzaldehído *O*-((2*S*,3*R*,4*R*,5*S*,6*S*)-4-etoxi-3,5-dimetoxi-6-metil-tetrahidropiran-2-il)-oxima (Compuesto 6)



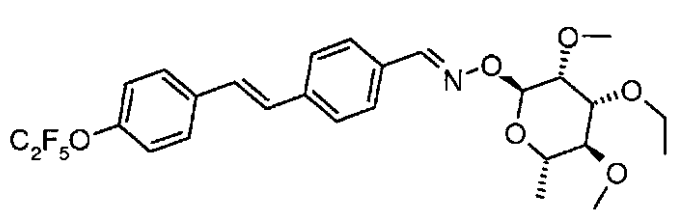
37

WO 2010/093764

PCT/US2010/023852

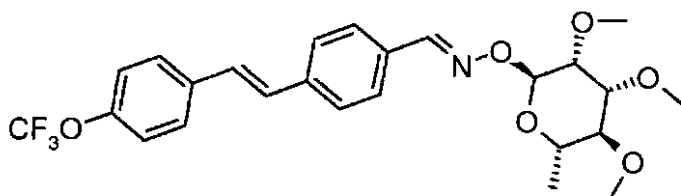
La formación de oxima produjo 62% de un aceite marrón: ^1H NMR (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 8.40 (s, 1H), 7.99 (s, 1H), 7.94 (br s, 1H), 7.72-7.63 (m, 6H), 7.47 (s, 2H), 5.48 (s, 1H), 3.74 (m, 1H), 3.73-3.68 (m, 1H), 3.54-3.47 (m, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.43 (s, 3H), 3.04 (t, $J = 8.0$ Hz, 1H), 1.17 (m, 6H); ESIMS m/z 494 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

4-[(*E*)-2-(4-Pentafluoroetiloxifenil)-vinil]-benzaldehído O-((2*S*,3*R*,4*R*,5*S*,6*S*)-4-etoxi-3,5-dimetoxi-6-metil-tetrahidropiran-2-il)-oxima (Compuesto 7)



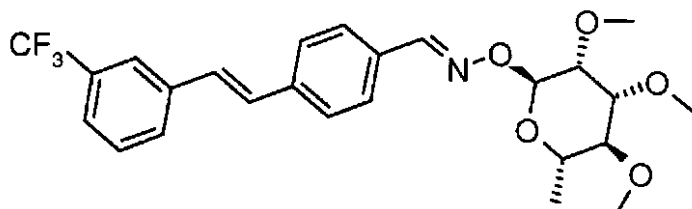
La formación de oxima produjo 7 mg (6%) de un cristalizado amarillo claro: ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 8.13 (s, 1H), 7.63 (d, $J = 8.1$ Hz, 2H), 7.56-7.51 (m, 5H), 7.24 (d, $J = 4.5$ Hz, 2H), 7.11 (d, $J = 8.1$ Hz, 2H), 5.63 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 3.79-3.60 (m, 5H), 3.59 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 1.32-1.25 (m, 6H); ESIMS m/z 582 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

4-[(*E*)-2-(4-Trifluorometiloxifenil)-vinil]-benzaldehído O-((2*S*,3*R*,4*R*,5*S*,6*S*)-3,4,5-trimetoxi-6-metil-tetrahidropiran-2-il)-oxima (Compuesto 8)

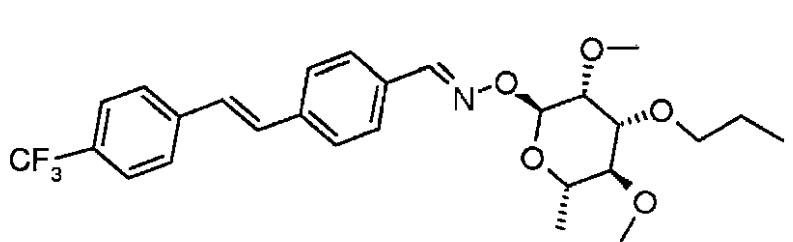


La formación de oxima produjo 37 mg (30%) de un sólido blanco: mp 120-128 °C; ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.40 (s, 1H), 7.75 (d, $J = 8.0$ Hz, 2H), 7.68-7.65 (m, 4H), 7.42-7.30 (m, 4H), 5.50 (s, 1H), 3.80-3.79 (m, 1H), 3.56-3.52 (m, 1H), 3.43 (s, 3H), 3.42 (s, 3H), 3.40-3.37 (m, 1H), 3.38 (s, 3H), 3.05 (t, $J = 8.0$ Hz, 1H), 1.17 (d, $J = 4.0$ Hz, 3H); ESIMS m/z 496 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

4-[(*E*)-2-(3-Trifluorometilfenil)-vinil]-benzaldehído O-((2*S*,3*R*,4*R*,5*S*,6*S*)-

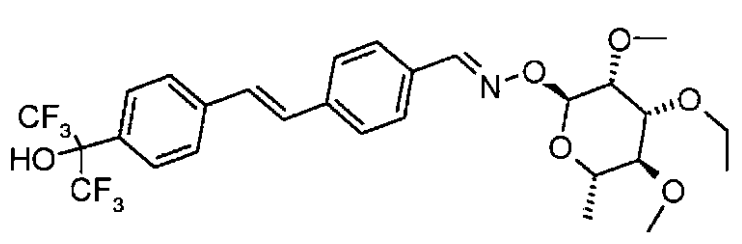
trimetoxi-6-metil-tetrahidropiran-2-il)-oxima (Compuesto 9)

El material (65 mg, 50%) se aisló como un cristalizado claro: ^1H NMR (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 8.40 (s, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.72 (br s, 1H), 7.70 (dd, $J = 12.0, 8.0$ Hz, 4H), 7.64 (br s, 2H), 7.48 (s, 2H), 5.51 (br s, 1H), 3.56-3.43 (m, 3H), 3.43 (s, 3H), 3.42 (s, 3H), 3.38 (s, 3H), 3.05 (t, $J = 8.0$ Hz, 1H), 1.17 (d, $J = 4.0$ Hz, 3H); ESIMS m/z 480 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

4-[(E)-2-(4-Trifluorometilfenil)-vinil]-benzaldehído O-((2S,3R,4R,5S,6S)-4-propoxi-3,5-dimetoxi-6-metil-tetrahidropiran-2-il)-oxima (Compuesto 10)

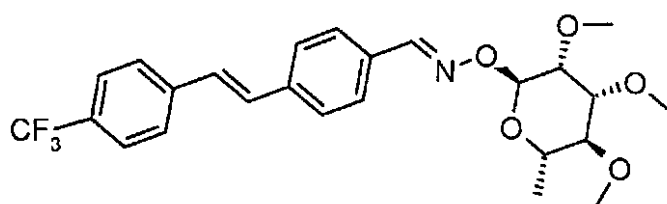
El material (210 mg, 77%) se aisló como un sólido incoloro: mp 163-166; ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 8.16 (s, 1H), 7.66 (d, $J = 8$ Hz, 2H), 7.63 (s, 4H), 7.56 (d, $J = 8$ Hz, 2H), 7.2 (s, 2H), 5.66 (s, 1H), 3.73-3.57 (m, 10H), 3.23 (t, $J = 9$ Hz, 1H), 1.71 (m, 2H), 1.33 (d, $J = 6$ Hz, 2H), 1.0 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H).

4-[(E)-2-[4-(2,2,2-Trifluoro-1-hidroxi-1-trifluorometil-etil)-fenil]-vinil]-benzaldehído O-((2S,3R,4R,5S,6S)-4-etoxi-3,5-dimetoxi-6-metil-tetrahidropiran-2-il)-oxima (Compuesto 11)



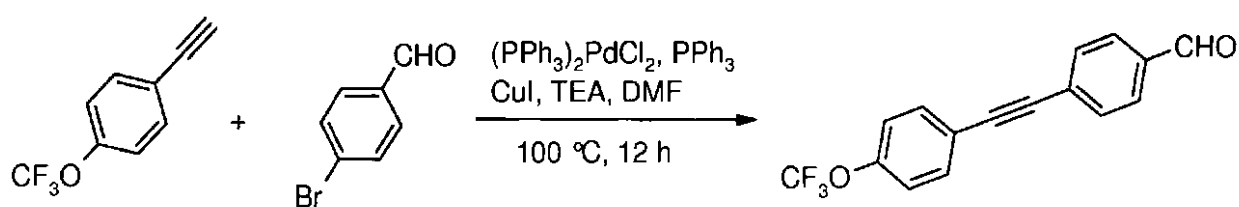
El material (250 mg, 86%) se aisló como una goma amarilla: ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 8.16 (s, 1H), 7.74 (d, J = 8 Hz, 2H), 7.65-7.45 (m, 6H), 7.15 (s, 2H), 5.62 (d, J = 1.4 Hz, 1H), 4.67 (s, 1H), 4.8-4.5 (m, 11H), 3.22 (t, J = 8 Hz, 1H), 1.35-1.2 (m, 6H); ESIMS m/z 614 ($[\text{M}+\text{Na}]^+$).

4-[(E)-2-(4-Trifluorometilfenil)-vinil]-benzaldehído O-((2S,3R,4R,5S,6S)-3,4,5-trimetoxi-6-metil-tetrahidropiran-2-il)-oxima (Compuesto 12)



El material (95 mg, 56 %) se aisló como un sólido blanco: mp 147-151 °C; ^1H NMR (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 8.42 (s, 1H), 7.85 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 7.76-7.67 (m, 6H), 7.47 (s, 2H), 5.52 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 3.80 (t, J = 4.0 Hz, 1H), 3.56-3.51 (m, 1H), 3.43 (s, 3H), 3.42 (s, 3H), 3.41-3.39 (m, 1H), 3.38 (s, 3H), 3.04 (t, J = 8.0 Hz, 1H), 1.17 (d, J = 4.0 Hz, 3H).

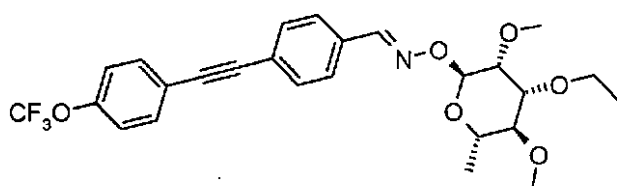
Ejemplo 9: Procedimiento general para el acoplamiento de alquino a bromobenceno



El alquino (0.5 g, 2.7 mmol), bromobenzaldehído (0.45 g, 2.4 mmol), catalizador Pd (0.04 g, 0.06 mmol), CuI (0.02 g, 0.12 mmol), trifenil fosfina (0.03 g, 0.12 mmol)

y trietilamina (3.5 mL) se combinaron en 1.5 mL de DMF anhidro. La solución se calentó a 100 °C agitando bajo una atmósfera de nitrógeno durante un total de 12 h. La solución se enfrió entonces a temperatura ambiente, se filtró a través de Celita, y se concentró a un sólido marrón, el cual se purificó por cromatografía de columna de fase normal (EtOAc en hexanos) para producir el acetileno diarilado (512 mg, 65%), el cual se usó directamente sin caracterización posterior.

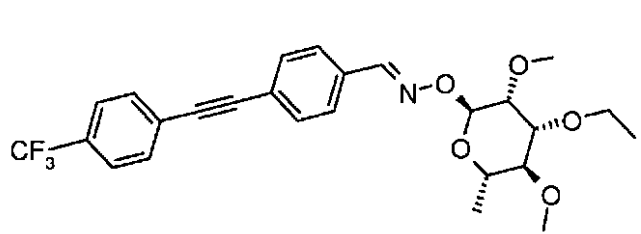
Ejemplo 10: Preparación de 4-(4-trifluorometoxifeniletinil)-benzaldehído O-((2S,3R,4R,5S,6S)-4-etoxi-3,5-dimetoxi-6-metil-tetrahidropiran-2-il)-oxima (Compuesto 13)



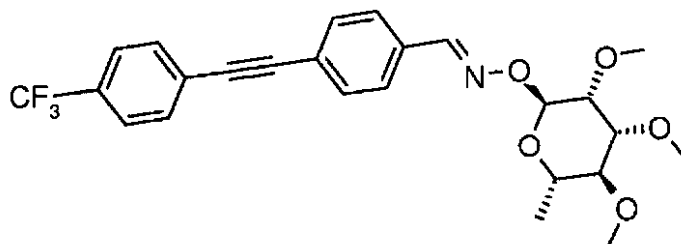
El aldehído (0.12 g, 0.42 mmol) en EtOH (10 mL) se trató con el intermedio de hidroxilamina E-31 (0.10 g, 0.42 mmol) y la solución se calentó a 50 °C agitando simultáneamente. Cuando finalizó la reacción (por análisis LC-MS), la solución se enfrió a temperatura ambiente, se diluyó con H₂O y se extrajo con EtOAc (3 x 10 mL). Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre MgSO₄, se filtraron y se concentraron para producir un sólido amarillo que se purificó por cromatografía de columna de fase normal (EtOAc en hexanos). El producto deseado (120 mg, 56%) se aisló como un sólido amarillo pegajoso: mp 82-87 °C; ¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) δ 8.13 (s, 1H), 7.63 (d, *J* = 9.0 Hz, 2H), 7.55 (m, 4H), 7.21 (d, *J* = 9.0 Hz, 2H), 5.63 (s, 1H), 3.75-3.60 (m, 5H), 3.59 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.19 (t, *J* = 9.0 Hz, 1H), 1.32-1.27 (m, 6H); ESIMS *m/z* 509 ([M+H]⁺).

Los siguientes compuestos se prepararon usando las condiciones descritas en los Ejemplos 9 y 10.

4-(4-Trifluorometilfeniletinil)-benzaldehído O-((2S,3R,4R,5S,6S)-4-etoxi-3,5-

dimetoxi-6-metil-tetrahidropiran-2-il)-oxima (Compuesto 14)

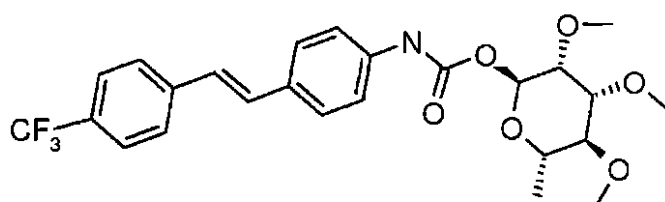
El producto se aisló como un sólido blancuzco (137 mg, 76%): mp 130-132 °C; ^1H NMR (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 8.46 (s, 1H), 7.81 (s, 4H), 7.73 (d, $J = 8$ Hz, 2H), 7.70 (d, $J = 8$ Hz, 2H), 5.49 (s, 1H), 3.75 (br s, 1H), 3.52 (m, 1H), 3.51-3.46 (m, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.43 (s, 3H), 3.04 (t, $J = 8.0$ Hz, 1H), 1.19-1.15 (m, 6H); ESIMS m/z 492 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

4-(4-Trifluorometilfeniletinil)-benzaldehído O-((3R,4R,5S,6S)-3,4,5-trimetoxi-6-metil-tetrahidropiran-2-il)-oxima (Compuesto 15)

El producto (78 mg, 84%) se aisló como un sólido blanco: mp 128-136 °C; ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.14 (s, 1H), 7.65-7.63 (m, 6H), 7.56 (d, $J = 8.0$ Hz, 2H), 5.65 (s, 1H), 3.76-3.75 (m, 1H), 3.68-3.64 (m, 1H), 3.58 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 3.51-3.49 (m, 1H), 3.20 (t, $J = 8.0$ Hz, 1H), 1.32 (d, $J = 4.0$ Hz, 3H); ESIMS m/z 500 ($[\text{M}+\text{Na}]^+$).

Ejemplo 11: Preparación de (2S,3R,4R,5S,6S)-4-etoxi-3,5-dimetoxi-6-metil-tetrahidropiran-2-il éster de ácido {4-[(E)-2-(4-trifluorometilfenil)-vinil]-fenil} – carbámico (Compuesto 16)

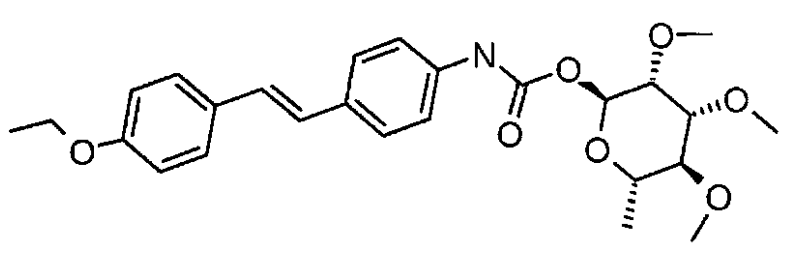
42



A una solución de 4-(4-trifluorometilfenilvinil)fenil amina (25 mg, 0.095 mmol) en THF seco (4 mL) se agregó 4-nitrofenil cloroformiato (19 mg, 0.095 mmol). La solución se dejó agitar bajo nitrógeno durante 1 h, y luego se agregó la rhamnopiranososa (Compuesto E-8; 20 mg, 0.95 mmol), seguida por KOH en polvo (25 mg, 0.4 mmol). La solución se dejó agitar a temperatura ambiente durante 4 h, y luego se diluyó con Et₂O (25 mL), se lavó con H₂O, se secó con MgSO₄ y se concentró. El aceite rojo crudo se purificó por cromatografía en gel de sílice para producir el Compuesto 16: ¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) δ 7.61 (s, 4H), 7.52 (d, *J* = 8 Hz, 2H), 7.47 (d, *J* = 8 Hz, 2H), 7.2 (d, *J* = 15 Hz, 1H), 7.05 (d, *J* = 15 Hz, 1H), 6.74 (s, 1H), 6.2 (d, *J* = 1.5 Hz, 1H), 3.8-3.5 (m, 11H), 3.23 (t, *J* = 8.0 Hz, 1H), 1.33-1.25 (m, 6H); ESIMS *m/z* 531 ([M+Na]⁺).

Los siguientes compuestos se prepararon usando las condiciones descritas en el Ejemplo 11.

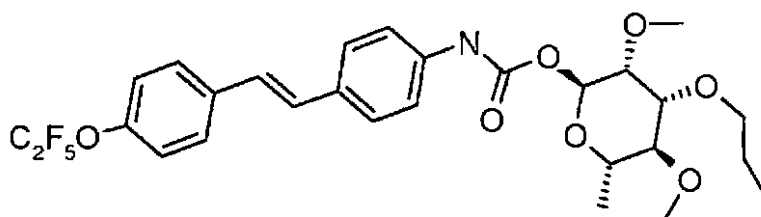
(2S,3R,4R,5S,6S)-3,4,5-Tri-metoxi-6-metil-tetrahidropiran-2-il éster de ácido {4-[(*E*)-2-(4-etoxifenil)-vinil]-fenil}-carbámico (Compuesto 17)



El material (68 mg, 40%) se aisló como una espuma amarilla: ¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) δ 7.38-7.22 (m, 8H), 6.84 (d, *J* = 8.24 Hz, 2H), 6.64 (s, 1H), 5.65 (s, 1H), 4.06 (q, *J* = 7.24 Hz, 2H), 3.76-3.75 (m, 1H), 3.68-3.64 (m, 1H), 3.58 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 3.51-3.49 (m, 1H), 3.20 (t, *J* = 8.0 Hz, 1H), 1.38-1.28 (m, 6H); ESI

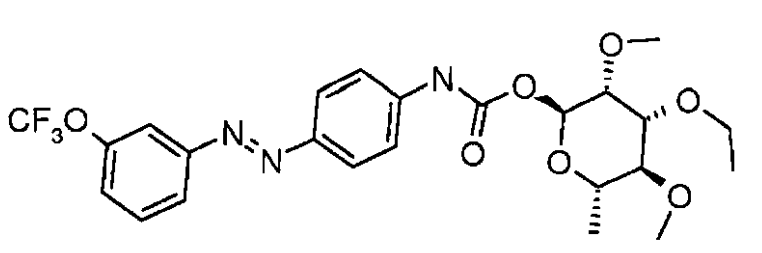
m/z 485 ($[M]^+$).

(2S,3R,4R,5S,6S)-4-Propoxi-3,5-dimetoxi-6-metil-tetrahidropiran-2-il éster de ácido {4-[(E)-2-(4-pentafluoroetiloxifenil)-vinil]-fenil}-carbámico (Compuesto 18)



El material (18 mg, 12%) se aisló como un sólido gomoso: ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 7.5-7.45 (m, 6H), 7.21 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H), 7.05 (s, 2H), 6.91 (s, 1H), 5.27 (br s, 1H), 3.8 (m, 1H), 3.69-3.50 (m, 10H), 3.23 (t, $J = 8$ Hz, 1H), 1.69 (m, 2H), 1.3 (d, $J = 6$ Hz, 3H), 0.98 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H); ESIMS m/z 591 ($[M+H]^+$).

Ejemplo 12: Preparación de (2S,3R,4R,5S,6S)-3,5-dimetoxi-4-etoxi-6-metil-tetrahidropiran-2-il éster de ácido [4-(3-trifluorometoxifenilazo)-fenil]-carbámico (Compuesto 19)



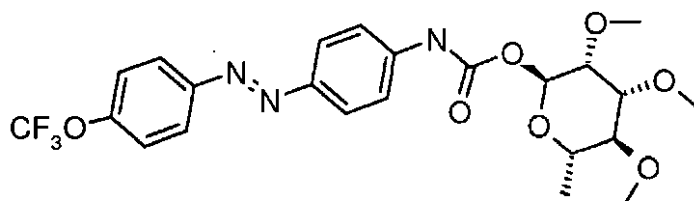
Paso 1. 4-(3-Trifluorometoxifenilazo)anilina. 3-Trifluorometoxianilina (2.0 g, 11 mmol) se disolvió en CH_2Cl_2 (20 mL), y se trató con una mezcla de Oxone[™] (11 g, 18 mmol) en H_2O (20 mL), y la solución se agitó durante 20 h a 25 °C. La fase orgánica se separó y la fase acuosa se extrajo con CH_2Cl_2 (2 x 20 mL), las fases orgánicas combinada se secaron (Na_2SO_4) y se evaporaron. El compuesto nitroso crudo se disolvió en ácido acético (40 mL), se trató con p-fenilendiamina (2.0 g, 19

mmol), y se dejó agitar durante 60 h. Se eliminaron los volátiles bajo vacío y el residuo se purificó por cromatografía en gel de sílice con 0 a 20% EtOAc/hexano para producir la azo anilina (900 mg, 27%) como un aceite anaranjado: ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 7.77-7.84 (m, 3H), 7.71 (s, 1H), 7.46-7.52 (m, 1H), 7.22-7.26 (m, 1H), 6.71-6.75 (m, 2H), 4.12 (br s, 2H); ESIMS m/z 282 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

Paso 2. Compuesto 19. 4-(3-Trifluorometoxifenilazo)anilina (200 mg, 0.71 mmol) se disolvió en THF anhidro (5 mL), se trató con 4-nitrofenil cloroformiato (170 mg, 0.82 mmol) y se agitó durante 1 h a 25 °C. Se agregaron 3*R*,4*R*,5*S*,6*S*-4-etoxi-3,5-dimetoxi-6-metil-tetrahidropiran-2-ol (175 mg, 0.78 mmol) y 95% de hidruro de sodio (NaH; 35 mg, 2.1 mmol), y la mezcla se agitó durante 2 h. Se agregó H_2O (20 μL , 1 mmol) y se continuó la agitación durante 1 h. La mezcla se diluyó con H_2O (10 mL) y EtOAc (15 mL). La fase orgánica separada se lavó con H_2O (5 mL) y salmuera (5 mL), se secó (Na_2SO_4) y se concentró. El residuo se purificó por cromatografía en gel de sílice con 0 a 30% EtOAc/hexano para producir el compuesto del título (220 mg, 59%) como un aceite: ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.87-7.97 (m, 3H), 7.77 (s, 1H), 7.54-7.57 (m, 4H), 6.94 (s, 1H), 6.22 (s, 1H), 3.56-3.78 (m, 11H), 3.24 (t, $J = 9.2$ Hz, 1H), 1.28-1.36 (m, 6H); ESIMS m/z 528 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

Los siguientes compuestos se prepararon usando las condiciones descritas en el Ejemplo 12.

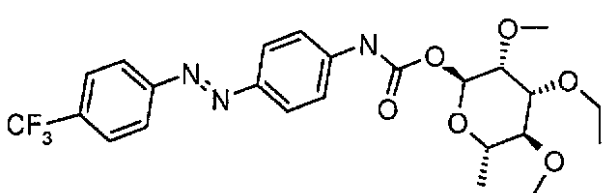
(2*S*,3*R*,4*R*,5*S*,6*S*)-4-Etoxi-3,5-dimetoxi-6-metil-tetrahidropiran-2-il éster de ácido [4-(4-trifluorometoxi-fenilazo)-fenil]-carbámico (Compuesto 20)



Paso 1. 4-(4-Trifluorometiloxifenilazo)anilina. ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 7.79-7.83 (m, 4H), 7.25-7.33 (m, 2H), 6.72-6.75 (m, 2H), 4.09 (br s, 2H); ESIMS m/z 282 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

Paso 2. Compuesto 20. mp 158-159 °C; ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.95-7.92 (m, 4H), 7.59-7.57 (d, $J = 8.6\text{ Hz}$, 2H), 7.34 (d, $J = 8.1\text{ Hz}$, 2H), 6.86 (s, 1H), 6.21 (s, 1H), 3.8-3.5 (m, 11H), 3.22 (t, $J = 9.4\text{ Hz}$, 1H), 1.35-1.25 (m, 6H); ESIMS m/z 528 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

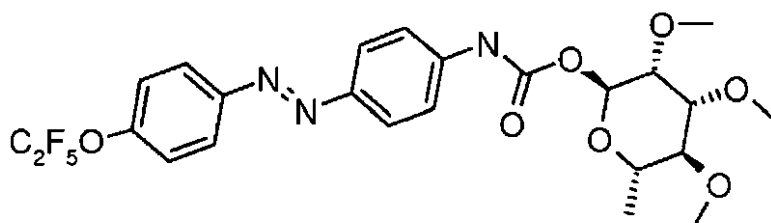
(2S,3R,4R,5S,6S)-4-Etoxi-3,5-dimetoxi-6-metil-tetrahidropiran-2-il éster de ácido [4-(4-trifluorometilfenilazo)-fenil]-carbámico (Compuesto 21)



Paso 1. 4-(4-Trifluorometilfenilazo)anilina. ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 7.81-7.91 (m, 4H), 7.72 (d, $J = 8.2\text{ Hz}$, 2H), 6.71-6.75 (m, 2H), 4.12 (br s, 2H); ESIMS m/z 266 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

Paso 2. Compuesto 21. mp 186-188 °C; ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.89-8.2 (m, 4H), 7.77 (d, $J = 8.3\text{ Hz}$, 2H), 7.60 (d, $J = 8.6\text{ Hz}$, 2H), 6.91 (s, 1H), 6.21 (s, 1H), 3.77-3.57 (m, 11H), 3.22 (t, $J = 9.4\text{ Hz}$, 1H), 1.34-1.28 (m, 6H); ESIMS m/z 512 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

(2S,3R,4R,5S,6S)-4-Etoxi-3,5-dimetoxi-6-metil-tetrahidropiran-2-il éster de ácido [4-(4-pentafluoroetiloxifenilazo)-fenil]-carbámico (Compuesto 22)



Paso 1. 4-(4-Pentafluoroetoxifenilazo)anilina. ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) 87.89-7.79 (m, 4H), 7.32 (d, $J = 8.5$ Hz, 2H), 6.73-6.76 (m, 2H), 4.09 (br s, 2H); ESIMS m/z 332 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

Paso 2. Compuesto 22. ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 7.96-7.92 (m, 4H), 7.60-7.57 (m, 2H), 7.38-7.35 (m, 2H), 6.86 (s, 1H), 6.26 (s, 1H), 3.75-3.45 (m, 11H), 3.22 (t, $J = 9.3$ Hz, 1H), 1.33-1.26 (m, 6H); ESIMS m/z 578 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

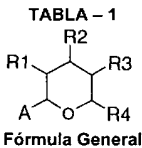
EXPERIMENTACIÓN DE LOS COMPUESTOS

Se condujeron bioensayos con el gusano soldado (BAW - *beet armyworm*; *Spodoptera exigua*: Lepidoptera) usando un bioanálisis con detección sistemática de alto rendimiento (HTS - *high throughput screening*) basado en una placa de microtitulación de 96 pocillos, o un análisis con una cubeta de dieta de 128 pocillos. El análisis HTS se basa en una modificación de Lewer et al. *J. Nat. Prod.* **2006**, 69, 1506. Huevos de BAW se pusieron encima de una dieta artificial (100 μL) en cada pocillo de una placa de microtitulación de 96 pocillos. La dieta se trató previamente con compuestos de prueba (12 μg disueltos en 30 μL de una mezcla de DMSO-acetona- H_2O) esparcidos encima de la dieta usando un sistema de manejo de líquido, y luego se dejaron secar durante varias horas. Las placas infestadas se cubrieron entonces con una capa de guata de algodón estéril y la tapa de la placa, y se mantuvieron luego en la oscuridad a 29 °C. Se registró la mortalidad a los 6 días pos-tratamiento. Cada placa tenía seis réplicas. Se calculó la mortalidad porcentual del promedio de las seis réplicas. En el caso del análisis de la dieta de 128 pocillos, tres a cinco larvas BAW de segunda crisálida se

pusieron en cada pocillo (3 mL) de la cubeta de dieta que se habían llenado previamente con 1 mL de dieta artificial, a la cual se habían aplicado (a cada uno de los ocho pocillos) 50 ug/cm² del compuesto de prueba (disuelto en 50 µL de una mezcla 90:10 de acetona-agua) y luego se dejaron secar. Las cubetas se taparon con una cubierta auto-adhesiva transparente, y se mantuvieron a 25 °C, 14:10 ciclo de luz-oscuridad durante seis días. Se registró la mortalidad porcentual para las larvas en cada pocillo; seguidamente se promedió la actividad en los ocho pocillos. Los resultados se indican en la Tabla 4. En Tabla 4, bajo los dos encabezados BAW HTS y BAW 50, una "A" significa que el compuesto se ensayó y que se observó una mortalidad de por lo menos 50 %, mientras que "B" significa que (1) el compuesto se ensayó y se observó una mortalidad menor que el 50 % o (2) que el compuesto no se ensayó.

TABLA – 1 R1 R2 R3 R4 A O Fórmula General									
#	A	R1	R2	R3	R4	Azúcar	M.S	bp	¹ H NMR (CDCl ₃ , δ)
E-1	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	L-rhamnosa		150 °C (0.5 mm Hg)	5.28 (m, 1H), 3.85 (m, 1H), 3.66 (m, 1H), 3.60-3.50 (m, 1H), 3.58 (s, 3H), 3.53 (s, 6H), 3.37 (s, 3H), 3.16 (t, 1H), 1.31 (d, 7 = 6.2 Hz, 3H)
E-2	OH	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	L-rhamnosa		145-155 °C (1 mm Hg)	28 (s, 1H), 3.83 (m, 1H), 3.7-3.45 (m, 1 1H), 3.16 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.0 (s, 1H), 1.31 (d, J = 6 Hz, 3H).
E-3	OCH ₃	OCH ₃	OC ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₃	L-rhamnosa	202.9 (M-MeOH)	165°C (10 m Torr)	4.71 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 3.77-3.50 (m, 11H), 3.37 (s, 3H), 3.13 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 1.32 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 1.27 (t, J = 7.0 Hz, 3H)
E-4	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	CH ₃	L-rhamnosa	299.1 (M+Na)	180°C (10m Torr)	4.72 (d, J = 1.8 Hz) and 4.30 (s, total 1H), 4.0-3.35 (series de m, 10H), 3.2 (m, 2H), 1.3-1.1 (m, 15H)
E-5	OCH ₃	OCH ₃	OC ₃ H ₇	OCH ₃	CH ₃	L-rhamnosa		175 °C (10m Torr)	4.70 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 3.77-3.50 (m, 11H), 3.37 (s, 3H), 3.13(t, J = 9.4Hz, 1H), 1.62 (m, 2H), 1.32 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.98 (t, J = 7.5 Hz, 3H)

JP



A	R1	R2	R3	R4	Azúcar	M.S	bp	¹ H NMR (CDCl ₃ , δ)
OCH ₃	OCH ₃	O-alil	OCH ₃	CH ₃	L-rhamnosa		175 °C (10 mTorr)	5.98 (m, 1H), 5.32 (d, 1H), 5.20 (d, 1H), 4.50 (s, 1H), 4.18 (d, 2H), 3.62-3.50 (m, 9H), 3.28 (s, 3H), 3.17 (t, J = 6.3 Hz, 1H), 1.33 (d, J = 6.3 Hz, 3H)
OCH ₃	OCH ₃	OC ₄ H ₉	OCH ₃	CH ₃	L-rhamnosa		165 °C (5 mTorr)	4.71 (s, 1H), 3.62-3.50 (m, 11H), 3.35 (s, 3H), 3.17 (t, 1H), 1.6 (m, 2H), 1.4 (m, 2H), 1.33 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.98 (t, J = 7.5 Hz, 3H)
OH	OCH ₃	OC ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₃	L-rhamnosa	202.9 (M-H ₂ O)	165°C (9 mTorr)	5.35 (m, J = 3.2, 2.0 Hz, 1H), 3.84-3.62 (in, 5H), 3.59 (s, 3H), 3.53 (s, 3H), 3.16 (t, J = 9.5 Hz, 1H), 2.73 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 1.33-1.26 (m, 6H)
OH	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	CH ₃	L-rhamnosa	248.2 (M ⁺)	203 °C (5 mTorr)	5.2 (s) and 4.65 (dd, J = 1.2, 9 Hz, señales de protón anomérico, total 1H, relación 64:36 α:β); 4.10-3.45 (m, 8H), 3.36-3.20 (m, 2H), 1.37-1.13 (m, 12H)
OH	OCH ₃	OC ₃ H ₇	OCH ₃	CH ₃	L-rhamnosa	220.2 (M ⁺)	185 °C (5 mTorr)	5.25 (dd, J = 3.2, 2.0 Hz) and 4.61 (m, total 1H), 3.80 (m, 1H), 3.70-3.50 (m, 9H), 3.36-3.05 (m, 1H), 1.60 (m, 2H), 1.30 (m, 5H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H)

49

50

WO 2010/093764

PCT/US2010/023852

	#	E-6	E-7	E-8	E-9	E-10
--	---	-----	-----	-----	-----	------

TABLA – 1 R1 R2 R3 R4 A O Fórmula General									
#	A	R1	R2	R3	R4	Azúcar	M.S	bp	¹ H NMR (CDCl ₃ , δ)
E-11	OH	OCH ₃	O-alil	OCH ₃	CH ₃	L-rhamnosa	254.9 (M-Na)	175 °C (10 mTorr)	5.95 (m, 1H), 5.3 (m, 1H), 5.19 (m, 1H), 5.21 y 4.61 (los dos m, anómeros α y β, total 1H), 4.20 (m, 2H), 3.80 (m, 1H), 3.70-3.50 (m, 7H), 3.40-3.10 (m, 3H), 1.3 (m, 3H)
E-12	OH	OCH ₃	OC ₄ H ₉	OCH ₃	CH3	L-rhamnosa	248.2 (M ⁺)	189 °C (5 mTorr)	5.35 (dd, J = 3.2, 2.0 Hz) and 4.45 (m, total 1H), 3.80 (m, 1H), 3.70-3.50 (m, 10H), 3.36-3.05 (m, 1H), 2.73 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 1.60 (m, 2H), 1.40 (m, 2H), 1.33 (d, J = 6 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H)
E-13	-OH	-OCH ₃	-OCH ₃	-OCH ₃	CH ₂ O-CH ₃	L-rhamnosa			5.32 (s, 1H), 3.9 (m, 1H), 3.66-3.53 (series de m, 4H), 3.52 (s, 3H), 3.51 (s, 3H), 3.49 (s, 3H), 3.40 (s, 3H), 3.35 (m, 1H), 3.18 (d, J =3 Hz, 1H)
E-14	-OH	-OCH ₃	-OCH ₃	OCH ₃	CH ₂ O-CH ₃	D-glucosa			5.33 (d, J = 3.6 Hz) y 4.60 (d, J = 4 Hz, anómeros α y β, total 1H), 3.9 (m, 1H), 3.6-3.3 (series de s y m, 14H), 3.28 (m, 3H), 1.7 (s, 1H)

51

TABLA – 1 R1 R2 R3 R4 A O Fórmula General									
#	A	R1	R2	R3	R4	Azúcar	M.S	bp	¹ H NMR (CDCl ₃ , δ)
E-15	-OCH ₃	-OCH ₃	-OCH ₃	-OCH ₃	-H ₂	L-xilosa	207 (M+H)		4.77 (d, J = 3.5 Hz) y 4.15 (d, J = 7.4 Hz, total 1H en una relación 0.27:1 α:β), 4.00 (dd, J = 11.6, 5.0 Hz, 1H), 4.03-2.93 (series de s y m, 16H)
E-16	-OH	-OCH ₃	-OCH ₃	-OCH ₃	-H ₂	L-xilosa	175 (M-H ₂ O)		5.23 (t, J = 3.4 Hz) and 4.60 (t, J = 6.3 Hz, total 1H en una relación 1.5:1 α:β), 4.01 -2.97 (series de s y m, 15H)
E-17	-OCH ₃	-OCH ₃	-OCH ₃	-OCH ₃	-H ₂	L-lixosa	207 (M+H)		4.69 (d, J = 3.0 Hz, 1H, anómero α), 3.77 (dd, J = 10.8, 4.7 Hz, 1H), 3.62-3.32 (series de s y m, 16H)
E-18	-OH	-OCH ₃	-OCH ₃	-OCH ₃	-H ₂	L-lixosa	175 (M-H ₂ O)		5.18-5.11 (m, 1H, mezcla de anómeros α y β), 4.84 (d, J = 10.1 Hz, 0.4H), 3.98-3.37 (series de s y m, 14H), 3.11 (d, J = 4.2 Hz, 0.6H)
E-19	-OCH ₃	-OCH ₃	-OCH ₃	OCH ₃	CH ₂ O-CH ₃	L-glucosa	205 (M-CH ₂ OCH ₃)		(600 MHz, CDCl ₃) 4.83 (d, J = 4.1 Hz) y 4.14 (d, J = 7.8 Hz, total 1H en una relación 0.2:1 α:β), 3.66-3.36 (series de s y m, 18H), 3.29-3.26 (m, 1H), 3.17-3.13 (m, 1H), 3.01 - 2.94 (m, 1H)

52

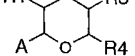
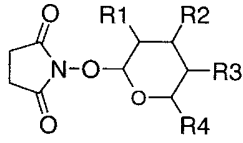
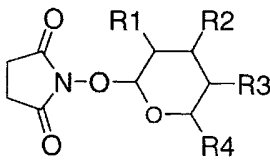
TABLA – 1  Fórmula General									
#	A	R1	R2	R3	R4	Azúcar	M.S	bp	¹ H NMR (CDCl ₃ , δ)
E-20	-OH	-OCH ₃	-OCH ₃	-OCH ₃	CH ₂ O-CH ₃	L-glucosa	191 (M-CH ₂ OCH ₃)	Mp °C 63-67	5.33 (d, J = 3.7 Hz) y 4.58 (d, J = 7.9 Hz, total 1H en una relación 2.5:1 α:β), 3.92 - 3.86 (m, 0.8H), 3.65-3.08 (series de s y m, 18H), 2.96 (dd, J = 8.8, 7.8 Hz, 0.2H)
E-21	-OCH ₃	-H ₂	-OCH ₃	-OCH ₃	CH ₂ O-CH ₃	2-deoxi-D-glucosa	220 (M ⁺)		4.81 (dd, 7=3.6, 1.1 Hz) y 4.34 (dd, J = 9.5, 1.9 Hz, total 1H en una relación 0.29:1 α:β), 3.71-3.23 (m, 16H), 3.18-3.05 (m, 1H), 2.33-2.16 (m, 1H), 1.60-1.41 (m, 1H)
E-22	-OCH ₃	-H ₂	-OCH ₃	OH	CH ₃	L-oleandrosa			4.78 (d, 7 = 3.3 Hz, 1H), 3.52 (m, 1H), 3.47 (m, 1H), 3.45 (s, 3H), 3.30 (s, 3H), 3.19 (m, 1H), 2.67 (brs, 1H), 2.29 (dd, J = 4.8, 12.9 Hz, 1H), 1.51 (m, 1H), 1.32 (d, J = 6.3 Hz, 3H)

TABLA - 2								
								
#	R1	R2	R3	R4	Azúcar	M.S	mp	¹ H NMR (CDCl ₃ , δ)
E-23	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	L-rhamnosa	326.1 [M+Na] ⁺	135 °C	5.35 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 4.29 (m, 1 H), 3.89 (dd, J = 3.3, 2.1 Hz, 1H), 3.55 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 3.52 (s, 3H), 3.51 (m, 1H), 3.18 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 2.74 (s, 4H), 1.27 (d, J = 6.1 Hz, 3H)
E-24	OCH ₃	OCH ₃	OH	CH ₃	L-rhamnosa	288 [M-H]	163-166 °C	5.42 (s, 1H), 4.40 (m, 1H), 4.0 (m, 1H), 3.63 (d, 7=8 Hz, 1H), 3.55-3.45 (m, 7H), 2.78 (s, 4H), 2.2 (br s, 1H), 1.30 (d, J = 6.3 Hz, 3H)
E-25	OCH ₃	OC ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₃	L-rhamnosa			5.35 (m, 1H), 4.29 (m, 1H), 3.85 (m, 1H), 3.78-3.50 (m, 9H), 3.19 (t, J= 9.5 Hz, 1H), 2.75 (s, 4H), 1.33-1.26 (m, 6H)
E-26	OCH ₃	OC ₃ H ₇	OCH ₃	CH ₃	L-rhamnosa	354 [M+Na] ⁺	69-71 °C	5.35 (s, 1H), 4.29 (m, 1H), 3.84 (m, 1H), 3.78-3.50 (m, 9H), 3.19 (t, J = 9.5 Hz, 1H), 2.75 (s, 4H), 1.64 (m, 2H), 1.25 (d, J = 6.1 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H)
E-27	OCH ₃	OC ₄ H ₉	OCH ₃	CH ₃	L-rhamnosa			5.32 (d, J= 1.8 Hz, 1H), 4.29 (m, 1H), 3.84 (m, 1H), 3.6-3.45 (m, 9H), 3.17 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 2.73 (s, 4H), 1.6 (m, 2H), 1.4 (m, 2H), 1.26 (d, J = 5.7 Hz, 3H), 0.93 (t, J = 7.5 Hz, 3H)

54

TABLA - 2								
								
#	R1	R2	R3	R4	Azúcar	M.S	mp	¹ H NMR (CDCl ₃ , δ)
E-28	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH ₂ OCH ₃	L-glucosa			5.52 (d, J = 4 Hz, 1H), 4.45 (d, J = 10 Hz, 1H), 3.68-3.47 (m, 12H), 3.4-3.27, (series de m, 5H), 2.72 (s, 4H)
E-29	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH ₂ OCH ₃	L-manosa			5.44 (s, 1H), 4.29 (m, 1H), 3.90 (m, 1H), 3.7-3.55 (m, 3H), 3.54 (s, 3H), 3.53 (s, 3H), 3.52 (s, 3H), 3.53 (m, 1H), 3.38 (s, 3H), 2.73 (s,4H)

S

TABLA – 3

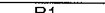
#	R1	R2	R3	R4	Azúcar	M.S	mp	¹ H NMR (CDCl ₃ , δ)
E-30	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	L-rhamnosa	221.7 (M+H ⁺)	55 °C	5.51 (s, 2H), 4.98 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 3.60 (m, 2H), 3.55 (s, 3H), 3.50 (s, 3H), 3.48 (s, 3H), 3.35 (dd, J = 9.2, 3.3 Hz, 1H), 3.13 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 1.34 (d, J = 6.2 Hz, 3H)
E-31	OCH ₃	OC ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₃	L-rhamnosa	258.1 (M+Na ⁺)	88 °C	5.51 (s, 2H), 4.98 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 3.60 (m, 4H), 3.55 (s, 3H), 3.48 (s, 3H), 3.35 (dd, J = 9.2, 3.3 Hz, 1H), 3.13 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 1.34-1.26 (m, 6H)
E-32	OCH ₃	OC ₃ H ₇	OCH ₃	CH ₃	L-rhamnosa	249.1 (M+H ⁺)	49 °C	5.6 (s, 2H), 4.95 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 3.6-3.3 (m, 11H), 3.13 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 1.65 (m, 2H), 1.34 (d, J = 6.2 Hz, 3H), 0.97 (t, J = 7.5 Hz, 3H)
E-33	OCH ₃	OC ₄ H ₉	OCH ₃	CH ₃	L-rhamnosa		40-42 °C	5.6 (s, 2H), 4.97 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 3.6-3.3 (m, 11H), 3.13 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 1.62 (m, 2H), 1.40 (m, 2H), 1.34 (d, J = 6.2 Hz, 3H), 0.94 (t, J = 7.5 Hz, 3H)
E-34	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	CH ₃	L-rhamnosa	264.1 (M+Na ⁺)	Oil	5.5 (s, 2H), 4.90 (s, 1H), 3.9 (m, 1H), 3.80-3.50 (m, 7H), 3.4 (m, 1H), 3.25 (t, J = 9 Hz, 1H), 1.35 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 1.27 (m, 9H)

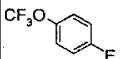
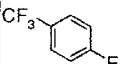
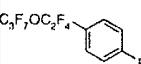
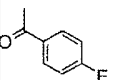
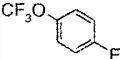
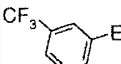
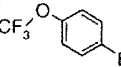


N[C@@H]1C(R1)C(R2)C(R3)C(R4)O1

R1	R2	R3	R4	Azúcar	M.S	mp	¹ H NMR (CDCl ₃ , δ)
OCH ₃	OCH ₃	OH	CH ₃	L-rhamnosa	268 (M+AcOH)	Aceite	5.6 (br s, 2H), 4.96 (s, 1H), 3.7-3.5 (m, 3H), 3.48 (s, 3H), 3.42 (s, 3H), 3.25 (dd, J =10, 3 Hz, 1H), 2.75 (br s, 1H), 1.7 (d, J = 7 Hz, 3H)
OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH ₂ OCH ₃	L-manosa	251.1 (M+H ⁺)	58 °C	5.5 (br s, 2H), 5.04 (d, J = 2 Hz, 1H), 3.65-3.58 (m, 4H), 3.52 (s, 3H), 3.48 (two s, 6H), 3.42 (s, 3H), 3.45-3.39 (m, 2H)
OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	L-fucosa		91 °C	5.58 (s,2H), 5.1 (d, J = 4Hz, 1H), 3.60 (q, J = 6.8 Hz, 1H), 3.66 (m, 1H), 3.60 (s, 3H), 3.53 (s, 3H), 3.51 (s, 3H), 3.5-3.4 (m, 2H), 1.34 (d, J = 6.4 Hz, 3H)
OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH ₂ OCH ₃	L-glucosa	251.8 (M+H) ⁺	82 °C	5.6 (br. s, 2H), 5.1 (d, J = 4 Hz, 1H), 3.7 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.53 (s, 3H), 3.41 (s, 3H), 3.65-3.35 (series de m, 3H), 3.4 (m, 1H), 3.2 (m, 2H)

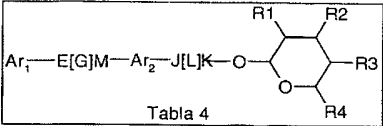
27

Ar₁—E[G]M—Ar₂—J[L]K—O—

Compuesto	Ar1	E	G	M	Ar2	J	L	K	R1	R2	R3	R4	Anó-mero	Azúcar
1		CH	doble	CH		CH	doble	N	CH ₃	OC ₃ H ₇	OCH ₃	CH ₃	α	L-rhamnosa
2		CH	doble	CH		CH	doble	N	CH ₃	OC ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₃	α	L-rhamnosa
3		CH	doble	CH		CH	doble	N	CH ₃	OC ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₃	α	L-rhamnosa
4		CH	doble	CH		CH	doble	N	CH ₃	OC ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₃	α	L-rhamnosa
5		CH	doble	CH		CH	doble	N	CH ₃	OC ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₃	α	L-rhamnosa
6		CH	doble	CH		CH	doble	N	CH ₃	OC ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₃	α	L-rhamnosa
8		CH	doble	CH		CH	doble	N	CH ₃	OC ₃ H ₇	OCH ₃	CH ₃	α	L-rhamnosa

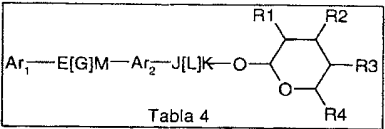
	#	E-35	E-36	E-37	E-38
--	---	------	------	------	------





Compuesto	Ar1	E	G	M	Ar2	J	L	K	R1	R2	R3	R4	Anó-mero	Azúcar	DAW 50 BAW HTS	
9		CH	doble	CH		CH	doble	N	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	α	L-rhamnosa	A	A
10		CH	doble	CH		CH	doble	N	OCH ₃	OC ₃ H ₇	OCH ₃	CH ₃	α	L-rhamnosa	A	A
11		CH	doble	CH		CH	doble	N	OCH ₃	OC ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₃	α	L-rhamnosa	B	B
12		CH	doble	CH		CH	doble	N	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	α	L-rhamnosa	B	B
13		C	triple	C		CH	doble	N	OCH ₃	OC ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₃	α	L-rhamnosa	A	B
14		C	triple	C		CH	doble	N	OCH ₃	OC ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₃	α	L-rhamnosa	A	A
15		C	Triple	C		CH	doble	N	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	α	L-rhamnosa	A	A

59



Compuesto	Ar1	E	G	M	Ar2	J	L	K	R1	R2	R3	R4	Anó-mero	Azúcar	DAW 50	BAW HTS
16		CH	doble	CH		NH	sencillo	CO	OCH3	OC2H5	OCH3	CH3	α	L-rhamnosa	A	B
17		CH	doble	CH		NH	sencillo	CO	OCH3	OCH3	OCH3	CH3	α	L-rhamnosa	A	A
18		CH	doble	CH		NH	sencillo	CO	OCH3	OC2H7	OCH3	CH3	α	L-rhamnosa	B	A
19		N	doble	N		N	sencillo	CO	OCH3	OC2H5	OCH3	CH3	α	L-rhamnosa	A	A
20		N	doble	N		N	sencillo	CO	OCH3	OC2H5	OCH3	CH3	α	L-rhamnosa	A	A
21		N	doble	N		N	sencillo	CO	OCH3	OC2H5	OCH3	CH3	α	L-rhamnosa	A	A
22		N	doble	N		N	sencillo	CO	OCH3	OC2H5	OCH3	CH3	α	L-rhamnosa	A	A

60

WO 2010/093764

PCT/US2010/023852

DAW 50	A	A	A	A	A	B	A
BAW HTS	A	B	B	A	A	A	A

DERIVADOS DE ÁCIDO & SAL, Y SOLVATOS

Los compuestos divulgados en esta invención pueden estar en la forma de sales de adición de ácido plaguicidamente aceptables.

A modo de ejemplo no limitante, una función amina puede formar sales con ácidos clorhídrico, bromhídrico, sulfúrico, fosfórico, acético, benzoico, cítrico, malónico, salicílico, málico, fumárico, oxálico, succínico, tartárico, láctico, glucónico, ascórbico, maleico, aspártico, bencenosulfónico, metanosulfónico, etanosulfónico, hidroximetanosulfónico, e hidroxietanosulfónico.

Adicionalmente, a modo de ejemplo no limitante, una función ácido puede formar sales incluyendo las derivadas de metales alcalinos y alcalinotérreos y las derivadas de amoníaco y aminas. Ejemplos de cationes preferidos incluyen cationes de sodio, potasio, magnesio, y aminio.

Las sales se preparan contactando la forma de base libre con una cantidad suficiente del ácido deseado para producir una sal. Las formas de base libre pueden regenerarse tratando la sal con una solución de base acuosa diluida, tal como hidróxido de sodio (NaOH) acuoso diluido, carbonato de potasio, amoníaco, y bicarbonato de sodio. Como un ejemplo, en muchos casos, un plaguicida se modifica a una forma más soluble en agua, v.g. la sal dimetil amina de ácido (2,4-diclorofenoxi)acético es una forma más soluble en agua de ácido (2,4-diclorofenoxi)acético, un herbicida bien conocido.

Los compuestos divulgados en esta invención pueden formar asimismo complejos estables con moléculas de disolvente que permanecen intactas una vez se eliminan las moléculas de disolvente no acomplexadas de los compuestos. Estos complejos se denominan a menudo como "solvatos."

ESTEREOISÓMEROS

Ciertos compuestos divulgados en esta invención pueden existir como uno o más estereoisómeros. Las diferentes estereoisómeros incluyen isómeros geométricos, diastereómeros, y enantiómeros. Por consiguiente, los compuestos divulgados en esta invención incluyen mezclas racémicas, estereoisómeros individuales, y mezclas ópticamente activas. Se observará por las personas expertas en el arte que un estereoisómero puede ser más activo que otros. Estereoisómeros individuales y mezclas ópticamente activas pueden obtenerse mediante procesos sintéticos selectivos, mediante procedimientos sintéticos convencionales usando materiales de partida resueltos, o mediante procedimientos de resolución convencionales.

PLAGAS

En otra incorporación, la invención divulgada en este documento puede usarse para controlar plagas.

En otra incorporación, la invención divulgada en este documento puede usarse para controlar plagas del filo nemátodos.

En otra incorporación, la invención divulgada en este documento puede usarse para controlar plagas del filo artrópodos.

En otra incorporación, la invención divulgada en este documento puede usarse para controlar plagas del subfilo quelicerados.

En otra incorporación, la invención divulgada en este documento puede usarse para controlar plagas de la clase arácnidos.

En otra incorporación, la invención divulgada en este documento puede usarse para controlar plagas del subfilo miriápodos.

En otra incorporación, la invención divulgada en este documento puede usarse para controlar plagas de la clase sínfilos.

En otra incorporación, la invención divulgada en este documento puede usarse para controlar plagas del subfilo hexápodos.

En otra incorporación, la invención divulgada en este documento puede usarse para controlar plagas de la clase insectos.

En otra incorporación, la invención divulgada en este documento puede usarse para controlar **coleópteros (escarabajos)**. Un listado no exhaustivo de estas plagas incluye, pero no se limita a, *Acanthoscelides* spp. (weevils), *Acanthoscelides obtectus* (common bean weevil), *Agrilus planipennis* (emerald ash borer), *Agriotes* spp. (wireworms), *Anoplophora glabripennis* (Asian longhorned beetle), *Anthonomus* spp. (weevils), *Anthonomus grandis* (boll weevil), *Aphidius* spp., *Apion* spp. (weevils), *Apogonia* spp. (grubs), *Ataenius spretulus* (Black Turfgrass Ataenius), *Atomaria linearis* (pygmy mangold beetle), *Aulacophore* spp., *Bothynoderes punctiventris* (beet root weevil), *Bruchus* spp. (weevils), *Bruchus pisorum* (pea weevil), *Cacoesia* spp., *Callosobruchus maculatus* (southern cow pea weevil), *Carpophilus hemipteras* (dried fruit beetle), *Cassida vittata*, *Cerosterna* spp., *Cerotoma* spp. (chrysomelids), *Cerotoma trifurcata* (bean leaf beetle), *Ceutorhynchus* spp. (weevils), *Ceutorhynchus assimilis* (cabbage seedpod weevil), *Ceutorhynchus napi* (cabbage curculio), *Chaetocnema* spp. (chrysomelids), *Colaspis* spp. (soil beetles), *Conoderus scalaris*, *Conoderus stigmosus*, *Conotrachelus nenuphar* (plum curculio), *Cotinus nitidis* (Green June beetle), *Crioceris asparagi* (asparagus beetle), *Cryptolestes ferrugineus* (rusty grain beetle), *Cryptolestes pusillus* (flat grain beetle), *Cryptolestes turcicus* (Turkish

grain beetle), *Ctenicera* spp. (wireworms), *Curculio* spp. (weevils), *Ciclocephala* spp. (grubs), *Cylindropturus adspersus* (sunflower stem weevil), *Deporaus marginatus* (mango leaf-cutting weevil), *Dermestes lardarius* (larder beetle), *Dermestes maculatus* (hide beetle), *Diabrotica* spp. (chrysomelids), *Epilachna varivestis* (Mexican bean beetle), *Faustinus cubae*, *Hylobius pales* (pales weevil), *Hypera* spp. (weevils), *Hypera postica* (alfalfa weevil), *Hyperdoes* spp. (Hyperodes weevil), *Hypothenemus hampei* (coffee berry beetle), *Ips* spp. (engravers), *Lasioderma serricorne* (cigarette beetle), *Leptinotarsa decemlineata* (Colorado potato beetle), *Liogenys fuscus*, *Liogenys suturalis*, *Lissorhoptrus oryzophilus* (rice water weevil), *Lyctus* spp. (wood beetles/powder post beetles), *Maecolaspis jolivetii*, *Megascelis* spp., *Melanotus communis*, *Meligethes* spp., *Meligethes aeneus* (blossom beetle), *Melolontha melolontha* (common European cockchafer), *Oberea brevis*, *Oberea linearis*, *Oryctes rhinoceros* (date palm beetle), *Oryzaephilus mercator* (merchant grain beetle), *Oryzaephilus surinamensis* (sawtoothed grain beetle), *Otiorhynchus* spp. (weevils), *Oulema melanopus* (cereal leaf beetle), *Oulema oryzae*, *Pantomorus* spp. (weevils), *Phyllophaga* spp. (May/June beetle), *Phyllophaga cuyabana*, *Phyllotreta* spp. (chrysomelids), *Phynchites* spp., *Popillia japonica* (Japanese beetle), *Prostephanus truncatus* (larger grain borer), *Rhizopertha dominica* (lesser grain borer), *Rhizotrogus* spp. (European chafer), *Rhynchophorus* spp. (weevils), *Scolytus* spp. (wood beetles), *Shenophorus* spp. (Billbug), *Sitona lineatus* (pea leaf weevil), *Sitophilus* spp. (grain weevils), *Sitophilus granaries* (granary weevil), *Sitophilus oryzae* (rice weevil), *Stegobium paniceum* (drugstore beetle), *Tribolium* spp. (flour beetles), *Tribolium castaneum* (red flour beetle), *Tribolium confusum* (confused flour beetle), *Trogoderma variabile* (warehouse beetle), y *Zabrus tenebrioides*.

En otra incorporación, la invención divulgada en este documento puede usarse para controlar **dermápteros (tijeretas)**.

En otra incorporación, la invención divulgada en este documento puede

usarse para controlar **dictiópteros (cucarachas)**. Un listado no exhaustivo de estas plagas incluye, pero no se limita a, *Blattella germanica* (German cockroach), *Blatta orientalis* (oriental cockroach), *Parcoblatta pennsylvanica*, *Periplaneta americana* (American cockroach), *Periplaneta australoasiae* (Australian cockroach), *Periplaneta brunnea* (brown cockroach), *Periplaneta fuliginosa* (smokybrown cockroach), *Pycnoscelus surinamensis* (Surinam cockroach), y *Supella longipalpa* (brownbanded cockroach).

En otra incorporación, la invención divulgada en este documento puede usarse para controlar **dípteros (true flies)**. Un listado no exhaustivo de estas plagas incluye, pero no se limita a, *Aedes* spp. (mosquitoes), *Agromyza frontella* (alfalfa blotch leafminer), *Agromyza* spp. (leaf miner flies), *Anastrepha* spp. (fruit flies), *Anastrepha suspensa* (Caribbean fruit fly), *Anopheles* spp. (mosquitoes), *Bactrocera* spp. (fruit flies), *Bactrocera cucurbitae* (melon fly), *Bactrocera dorsalis* (oriental fruit fly), *Ceratitis* spp. (fruit flies), *Ceratitis capitata* (Mediterranean fruit fly), *Chrysops* spp. (deer flies), *Cochliomyia* spp. (screwworms), *Contarinia* spp. (Gall midges), *Culex* spp. (mosquitoes), *Dasineura* spp. (gall midges), *Dasineura brassicae* (cabbage gall midge), *Delia* spp., *Delia platura* (seedcorn maggot), *Drosophila* spp. (vinegar flies), *Fannia* spp. (filth flies), *Fannia canicularis* (little house fly), *Fannia scalaris* (latrine fly), *Gasterophilus intestinalis* (horse bot fly), *Gracillia perseae*, *Haematobia irritans* (horn fly), *Hylemyia* spp. (root maggots), *Hypoderma lineatum* (common cattle grub), *Liriomyza* spp. (leafminer flies), *Liriomyza brassica* (serpentine leafminer), *Melophagus ovinus* (sheep ked), *Musca* spp. (muscid flies), *Musca autumnalis* (face fly), *Musca domestica* (house fly), *Oestrus ovis* (sheep bot fly), *Oscinella frit* (frit fly), *Pegomyia betae* (beet leafminer), *Phorbia* spp., *Psila rosae* (carrot rust fly), *Rhagoletis cerasi* (cherry fruit fly), *Rhagoletis pomonella* (apple maggot), *Sitodiplosis mosellana* (orange wheat blossom midge), *Stomoxys calcitrans* (stable fly), *Tabanus* spp. (horse flies), y *Tipula* spp. (crane flies).

En otra incorporación, la invención divulgada en este documento puede usarse para controlar **hemípteros (true bugs)**. Un listado no exhaustivo de estas plagas incluye, pero no se limita a, *Acrosternum hilare* (green stink bug), *Blissus leucopterus* (chinch bug), *Calocoris norvegicus* (potato mirid), *Cimex hemipterus* (tropical bed bug), *Cimex lectularius* (bed bug), *Dagbertus fasciatus*, *Dichelops furcatus*, *Dysdercus suturellus* (cotton stainer), *Edessa meditabunda*, *Eurygaster maura* (cereal bug), *Euschistus heros*, *Euschistus servus* (brown stink bug), *Helopeltis antonii*, *Helopeltis theivora* (tea blight plantbug), *Lagynotomus* spp. (stink bugs), *Leptocorisa oratorius*, *Leptocorisa varicornis*, *Lygus* spp. (plant bugs), *Lygus hesperus* (western tarnished plant bug), *Maconellicoccus hirsutus*, *Neurocolpus longirostris*, *Nezara viridula* (southern green stink bug), *Phytocoris* spp. (plant bugs), *Phytocoris californicus*, *Phytocoris relativus*, *Piezodorus guildingi*, *Poecilopsus lineatus* (fourlined plant bug), *Psallus vaccinicola*, *Pseudacysta perseae*, *Scaptocoris castanea*, y *Triatoma* spp. (bloodsucking conenose bugs/kissing bugs).

En otra incorporación, la invención divulgada en este documento puede usarse para controlar **homópteros (áfidos, insectos con escamas, moscas blancas, saltamontes)**. Un listado no exhaustivo de estas plagas incluye, pero no se limita a, *Acrythosiphon pisum* (pea aphid), *Adelges* spp. (adelgids), *Aleurodes proletella* (cabbage whitefly), *Aleurodicus disperses*, *Aleurothrixus floccosus* (woolly whitefly), *Aluacaspis* spp., *Amrasca bigutella bigutella*, *Aphrophora* spp. (leafhoppers), *Aonidiella aurantii* (California red scale), *Aphis* spp. (aphids), *Aphis gossypii* (cotton aphid), *Aphis pomi* (apple aphid), *Aulacorthum solani* (foxglove aphid), *Bemisia* spp. (whiteflies), *Bemisia argentifolii*, *Bemisia tabaci* (sweetpotato whitefly), *Brachycolus noxius* (Russian aphid), *Brachycorynella asparagi* (asparagus aphid), *Brevennia rehi*, *Brevicoryne brassicae* (cabbage aphid), *Ceroplastes* spp. (scales), *Ceroplastes rubens* (red wax scale), *Chionaspis* spp. (scales), *Chrysomphalus* spp. (scales), *Coccus* spp. (scales), *Dysaphis plantaginea* (rosy apple aphid), *Empoasca* spp. (leafhoppers), *Eriosoma lanigerum*

(woolly apple aphid), *Icerya purchasi* (cottony cushion scale), *Idioscopus nitidulus* (mango leafhopper), *Laodelphax striatellus* (smaller brown planthopper), *Lepidosaphes* spp., *Macrosiphum* spp., *Macrosiphum euphorbiae* (potato aphid), *Macrosiphum granarium* (English grain aphid), *Macrosiphum rosae* (rose aphid), *Macrosteles quadrilineatus* (aster leafhopper), *Mahanarva frimbiolata*, *Metopolophium dirhodum* (rose grain aphid), *Mictis longicornis*, *Myzus persicae* (green peach aphid), *Nephotettix* spp. (leafhoppers), *Nephotettix cinctipes* (green leafhopper), *Nilaparvata lugens* (brown planthopper), *Parlatoria pergandii* (chaff scale), *Parlatoria ziziphi* (ebony scale), *Peregrinus maidis* (corn delphacid), *Philaenus* spp. (spittlebugs), *Phylloxera vitifoliae* (grape phylloxera), *Physokermes piceae* (spruce bud scale), *Planococcus* spp. (mealybugs), *Pseudococcus* spp. (mealybugs), *Pseudococcus brevipes* (pine apple mealybug), *Quadraspidotus perniciosus* (San Jose scale), *Rhapalosiphum* spp. (aphids), *Rhapalosiphum maida* (corn leaf aphid), *Rhapalosiphum padi* (oat bird-cherry aphid), *Saissetia* spp. (scales), *Saissetia oleae* (black scale), *Schizaphis graminum* (greenbug), *Sitobion avenae* (English grain aphid), *Sogatella furcifera* (white-backed planthopper), *Therioaphis* spp. (aphids), *Toumeyella* spp. (scales), *Toxoptera* spp. (aphids), *Trialeurodes* spp. (whiteflies), *Trialeurodes vaporariorum* (greenhouse whitefly), *Trialeurodes abutiloneus* (bandedwing whitefly), *Unaspis* spp. (scales), *Unaspis yanonensis* (arrowhead scale), y *Zulia entreriana*.

En otra incorporación, la invención divulgada en este documento puede usarse para controlar **himenópteros (hormigas, avispas y abejas)**. Un listado no exhaustivo de estas plagas incluye, pero no se limita a, *Acromyrmex* spp., *Athalia rosae*, *Atta* spp. (leafcutting ants), *Camponotus* spp. (carpenter ants), *Diprion* spp. (sawflies), *Formica* spp. (ants), *Iridomyrmex humilis* (Argentine ant), *Monomorium* spp., *Monomorium minimum* (little black ant), *Monomorium pharaonis* (Pharaoh ant), *Neodiprion* spp. (sawflies), *Pogonomyrmex* spp. (harvester ants), *Polistes* spp. (paper wasps), *Solenopsis* spp. (fire ants), *Tapinoma sessile* (odorous house ant), *Tetranomorium* spp. (pavement ants), *Vespula* spp. (yellow jackets), y

Xilocopa spp. (carpenter bees).

En otra incorporación, la invención divulgada en este documento puede usarse para controlar **isópteros (termitas)**. Un listado no exhaustivo de estas plagas incluye, pero no se limita a, *Coptotermes* spp., *Coptotermes curvignathus*, *Coptotermes frenchii*, *Coptotermes formosanus* (Formosan subterranean termite), *Cornitermes* spp. (nasute termites), *Cryptotermes* spp. (drywood termites), *Heterotermes* spp. (desert subterranean termites), *Heterotermes aureus*, *Kalotermes* spp. (drywood termites), *Incistitermes* spp. (drywood termites), *Macrotermes* spp. (fungus growing termites), *Marginitermes* spp. (drywood termites), *Microcerotermes* spp. (harvester termites), *Microtermes obesi*, *Procornitermes* spp., *Reticulitermes* spp. (subterranean termites), *Reticulitermes banyulensis*, *Reticulitermes grassei*, *Reticulitermes flavipes* (eastern subterranean termite), *Reticulitermes hageni*, *Reticulitermes hesperus* (western subterranean termite), *Reticulitermes santonensis*, *Reticulitermes speratus*, *Reticulitermes tibialis*, *Reticulitermes virginicus*, *Schedorhinotermes* spp., y *Zootermopsis* spp. (rotten-wood termites).

En otra incorporación, la invención divulgada en este documento puede usarse para controlar **lepidópteros (polillas y mariposas)**. Un listado no exhaustivo de estas plagas incluye, pero no se limita a, *Achoea Janata*, *Adoxophyes* spp., *Adoxophyes orana*, *Agrotis* spp. (cutworms), *Agrotis ipsilon* (black cutworm), *Alabama argillacea* (cotton leafworm), *Amorbia cuneana*, *Amyelosis transitella* (navel orangeworm), *Anacamptodes defectaria*, *Anarsia lineatella* (peach twig borer), *Anomis sabulifera* (jute looper), *Anticarsia gemmatilis* (velvetbean caterpillar), *Archips argyrospila* (fruittree leafroller), *Archips rosana* (rose leaf roller), *Argyrotaenia* spp. (tortricid moths), *Argyrotaenia citrana* (orange tortrix), *Autographa gamma*, *Bonagota cranaodes*, *Borbo cinnara* (rice leaf folder), *Bucculatrix thurberiella* (cotton leafperforator), *Caloptilia* spp. (leaf miners), *Capua reticulana*, *Carposina niponensis* (peach fruit moth), *Chilo* spp.,

Chlumetia transversa (mango shoot borer), *Choristoneura rosaceana* (obliquebanded leafroller), *Chrysodeixis* spp., *Cnaphalocerus medinalis* (grass leafroller), *Colias* spp., *Conpomorpha cramerella*, *Cossus cossus* (carpenter moth), *Crambus* spp. (Sod web worms), *Cydia funebrana* (plum fruit moth), *Cydia molesta* (oriental fruit moth), *Cydia nigricana* (pea moth), *Cydia pomonella* (codling moth), *Darna diducta*, *Diaphania* spp. (stem borers), *Diatraea* spp. (stalk borers), *Diatraea saccharalis* (sugarcane borer), *Diatraea grandiosella* (southwestern corn borer), *Earias* spp. (bollworms), *Earias insulata* (Egyptian bollworm), *Earias vitella* (rough northern bollworm), *Ecdytopopha aurantianum*, *Elasmopalpus lignosellus* (lesser cornstalk borer), *Epiphysias postruttana* (light brown apple moth), *Ephestia* spp. (flour moths), *Ephestia cautella* (almond moth), *Ephestia elutella* (tobacco moth), *Ephestia kuehniella* (Mediterranean flour moth), *Epimeces* spp., *Epinotia aporema*, *Erionota thrax* (banana skipper), *Eupoecilia ambiguella* (grape berry moth), *Euxoa auxiliaris* (army cutworm), *Feltia* spp. (cutworms), *Gortyna* spp. (stemborers), *Grapholita molesta* (oriental fruit moth), *Hedylepta indicata* (bean leaf webber), *Helicoverpa* spp. (noctuid moths), *Helicoverpa armigera* (cotton bollworm), *Helicoverpa zea* (bollworm/corn earworm), *Heliothis* spp. (noctuid moths), *Heliothis virescens* (tobacco budworm), *Hellula undalis* (cabbage web worm), *Indarbela* spp. (root borers), *Keiferia lycopersicella* (tomato pinworm), *Leucinodes orbonalis* (eggplant fruit borer), *Leucoptera malifoliella*, *Lithocolletis* spp., *Lobesia botrana* (grape fruit moth), *Loxagrotis* spp. (noctuid moths), *Loxagrotis albicosta* (western bean cutworm), *Lymantria dispar* (gypsy moth), *Lyonetia clerkella* (apple leaf miner), *Mahasena corbetti* (oil palm bagworm), *Malacosoma* spp. (tent caterpillars), *Mamestra brassicae* (cabbage armyworm), *Maruca testulalis* (bean pod borer), *Metisa plana* (bagworm), *Mythimna unipuncta* (true armyworm), *Neoleucinodes elegantalis* (small tomato borer), *Nymphula depunctalis* (rice caseworm), *Operophtera brumata* (winter moth), *Ostrinia nubilalis* (European corn borer), *Oxidia vesulia*, *Pandemis cerasana* (common currant tortrix), *Pandemis heparana* (brown apple tortrix), *Papilio demodocus*, *Pectinophora gossypiella* (pink bollworm), *Peridroma*

21

spp. (cutworms), *Peridroma saucia* (variegated cutworm), *Perileucoptera coffeella* (white coffee leafminer), *Phthorimaea operculella* (potato tuber moth), *Phyllocnistis citrella*, *Phyllonorycter* spp. (leafminers), *Pieris rapae* (imported cabbageworm), *Plathypena scabra*, *Plodia interpunctella* (Indian meal moth), *Plutella xilostella* (diamondback moth), *Polychrosis viteana* (grape berry moth), *Prays endocarpa*, *Prays oleae* (olive moth), *Pseudaletia* spp. (noctuid moths), *Pseudaletia unipunctata* (armyworm), *Pseudoplusia includens* (soybean looper), *Rachiplusia nu*, *Scirpophaga incertulas*, *Sesamia* spp. (stemborers), *Sesamia inferens* (pink rice stem borer), *Sesamia nonagrioides*, *Setora nitens*, *Sitotroga cerealella* (Angoumois grain moth), *Sparganothis pilleriana*, *Spodoptera* spp. (armyworms), *Spodoptera exigua* (beet armyworm), *Spodoptera frugiperda* (fall armyworm), *Spodoptera oridania* (southern armyworm), *Synanthedon* spp. (root borers), *Thecla basilides*, *Thermisia gemmatalis*, *Tineola bisselliella* (webbing clothes moth), *Trichoplusia ni* (cabbage looper), *Tuta absoluta*, *Yponomeuta* spp., *Zeuzera coffeae* (red branch borer), *Zeuzera pirina* (leopard moth).

En otra incorporación, la invención divulgada en este documento puede usarse para controlar **malófagos (piojos masticadores)**. Un listado no exhaustivo de estas plagas incluye, pero no se limita a, *Bovicola ovis* (sheep biting louse), *Menacanthus stramineus* (chicken body louse), y *Menopon gallinae* (common hen louse).

En otra incorporación, la invención divulgada en este documento puede usarse para controlar **ortópteros (saltamontes, langostas, y grillos)**. Un listado no exhaustivo de estas plagas incluye, pero no se limita a, *Anabrus simplex* (Mormon cricket), Gryllotalpidae (mole crickets), *Locusta migratoria*, *Melanoplus* spp. (grasshoppers), *Microcentrum retinerve* (angularwinged katydid), *Pterophylla* spp. (katydids), *Schistocerca gregaria*, *Scudderia furcata* (forktailed bush katydid), y *Valanga nigricornis*.

72

En otra incorporación, la invención divulgada en este documento puede usarse para controlar **ftirápteros (piojos chupadores)**. Un listado no exhaustivo de estas plagas incluye, pero no se limita a, *Haematopinus* spp. (cattle and hog lice), *Linognathus ovillus* (sheep louse), *Pediculus humanus capitis* (human body louse), *Pediculus humanus humanus* (human body lice), y *Pthirus pubis* (crab louse).

En otra incorporación, la invención divulgada en este documento puede usarse para controlar **sifonápteros (pulgas)**. Un listado no exhaustivo de estas plagas incluye, pero no se limita a, *Ctenocephalides canis* (dog flea), *Ctenocephalides felis* (cat flea), y *Pulex irritans* (human flea).

En otra incorporación, la invención divulgada en este documento puede usarse para controlar **tisanópteros (arañuelas)**. Un listado no exhaustivo de estas plagas incluye, pero no se limita a, *Frankliniella fusca* (tobacco thrips), *Frankliniella occidentalis* (western flower thrips), *Frankliniella schultzei*, *Frankliniella williamsi* (corn thrips), *Heliothrips haemorrhaidalis* (greenhouse thrips), *Rhipiphorothrips cruentatus*, *Scirtothrips* spp., *Scirtothrips citri* (citrus thrips), *Scirtothrips dorsalis* (yellow tea thrips), *Taeniothrips rhopalantennalis*, y *Thrips* spp.

En otra incorporación, la invención divulgada en este documento puede usarse para controlar **tisanuros (lepismas)**. Un listado no exhaustivo de estas plagas incluye, pero no se limita a, *Lepisma* spp. (silverfish) y *Thermobia* spp. (firebrats).

En otra incorporación, la invención divulgada en este documento puede usarse para controlar **ácaros (garrapatas)**. Un listado no exhaustivo de estas plagas incluye, pero no se limita a, *Acarapsis woodi* (tracheal mite of honeybees), *Acarus* spp. (food mites), *Acarus siro* (grain mite), *Aceria mangiferae* (mango bud

mite), *Aculops* spp., *Aculops lycopersici* (tomato russet mite), *Aculops pelekasi*, *Aculus pelekassi*, *Aculus schlechtendali* (apple rust mite), *Amblyomma americanum* (lone star tick), *Boophilus* spp. (ticks), *Brevipalpus obovatus* (privet mite), *Brevipalpus phoenicis* (red and black flat mite), *Demodex* spp. (mange mites), *Dermacentor* spp. (hard ticks), *Dermacentor variabilis* (american dog tick), *Dermatophagoides pteronyssinus* (house dust mite), *Eotetranychus* spp., *Eotetranychus carpini* (yellow spider mite), *Epitimerus* spp., *Eriophyes* spp., *Ixodes* spp. (ticks), *Metatetranychus* spp., *Notoedres cati*, *Oligonychus* spp., *Oligonychus coffee*, *Oligonychus ilicus* (southern red mite), *Panonychus* spp., *Panonychus citri* (citrus red mite), *Panonychus ulmi* (European red mite), *Phyllocoptruta oleivora* (citrus rust mite), *Polyphagotarsonemus latus* (broad mite), *Rhipicephalus sanguineus* (brown dog tick), *Rhizoglyphus* spp. (bulb mites), *Sarcoptes scabiei* (itch mite), *Tegolophus perseae*, *Tetranychus* spp., *Tetranychus urticae* (twospotted spider mite), y *Varroa destructor* (honey bee mite).

En otra incorporación, la invención divulgada en este documento puede usarse para controlar **nemátodos (nemátodos)**. Un listado no exhaustivo de estas plagas incluye, pero no se limita a, *Aphelenchoides* spp. (bud and leaf & pine wood nematodes), *Belonolaimus* spp. (sting nematodes), *Crictonemella* spp. (ring nematodes), *Dirofilaria immitis* (dog heartworm), *Ditylenchus* spp. (stem and bulb nematodes), *Heterodera* spp. (cyst nematodes), *Heterodera zeae* (corn cyst nematode), *Hirschmanniella* spp. (root nematodes), *Hoplolaimus* spp. (lance nematodes), *Meloidogyne* spp. (root knot nematodes), *Meloidogyne incognita* (root knot nematode), *Onchocerca volvulus* (hook-tail worm), *Pratylenchus* spp. (lesion nematodes), *Radopholus* spp. (burrowing nematodes), y *Rotylenchus reniformis* (kidney-shaped nematode).

En otra incorporación, la invención divulgada en este documento puede usarse para controlar **sínfilos (sínfilos)**. Un listado no exhaustivo de estas plagas incluye, pero no se limita a, *Scutigerella immaculata*.

Para una información más detallada, consúltese el "Handbook of Pest Control - The Behavior, Life History, and Control of Household Pests" por Arnold Mallis, 9th Edition, copyright 2004 by GIE Media Inc.

MEZCLAS

Algunos de los plaguicidas que pueden emplearse benéficamente en combinación con la invención divulgada en este documento incluyen, pero no se limitan a, los siguientes:

1,2-dicloropropano, 1,3-dicloropropeno,

abamectina, acefato, acequinocil, acetamiprid, acetión, acetoprol, acrinatrina, acrilonitrilo, alanicarb, aldicarb, aldoxicarb, aldrina, aletrina, alosamidina, alixicarb, alfa-cipermetrina, alfa-ecdisona, alfa-endosulfán, AKD-1022, amiditió, amidoflumet, aminocarb, amiton, amitraz, anabasina, óxido de arsenio, atidatió, azadiractina, azametifós, azinfós-etil, azinfós-metil, azobenceno, azociclotina, azotoato,

Bacillus thuringiensis, hexafluorosilicato de bario, barthrin, benclothiaz, bendiocarb, benfuracarb, benomil, benoxafós, bensultap, benzoximato, benzoato de bencilo, beta-ciflutrina, beta-cipermetrina, bifenazato, bifentrina, binapacril, bioaletrina, bioetanometrina, biopermetrina, bistriflurón, bórax, ácido bórico, bromfenvinfós, bromo DDT, bromocicleno, bromofós, bromofós-etil, bromopropilato, bufencarb, buprofezina, butacarb, butatíofós, butocarboxim, butonato, butoxicarboxim,

cadusafós, arseniato de calcio, polisulfuro de calcio, canfecloro, carbanolato, carbaril, carbofurán, disulfuro de carbono, tetracloruro de carbono,

75

carbofenotión, carbosulfán, cartap, quinometionato, clorantraniliprol, clorobensida, cloribiciclano, clordano, clordecona, clordimeform, cloretoxifós, clorfenapir, clorfenetol, clorfenson, clorfensulfuro, clorfenvinfós, clorfluazurón, clormefós, clorobenzilato, 3-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-4-hidroxi-8-oxa-1-azaspiro[4,5]dec-3-en-2-ona, 3-(4'-cloro-2,4-dimetil[1,1'-bifenil]-3-il)-4-hidroxi-8-oxa-1-azaspiro[4,5]dec-3-en-2-ona, 4-[[[(6-cloro-3-piridinil)metil]metilamino]-2(5*H*)-furanona, 4-[[[(6-cloro-3-piridinil) metil]ciclopropilamino]-2(5*H*)-furanona, 3-cloro-*N*2-[(1*S*)-1-metil-2-(metilsulfonilo) etil]-*N*1-[2-metil-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil]-1,2-bencenodicarboxamida, cloroformo, cloromebuform, clorometiurón, cloropicrina, cloropropilato, clorfoxim, clorprazofós, clorpirifós, clorpirifos-metil, clortiofós, cromafenozida, cinerina I, cinerina II, cismetrina, cloetocarb, clofentezina, closantel, clotianidina, acetoarsenita de cobre, arseniato de cobre, naftenato de cobre, oleato de cobre, coumafós, coumitoato, crotamitón, crotoxifós, cruentaren A & B, crufomato, criolita, cianofenfós, cianofós, ciantoato, ciantraniliprol, cicletrina, cicloprotrina, cienopirafén, ciflumetofén, ciflutrina, cihalotrina, cihexatina, cipermetrina, cifenotrina, ciromazina, citioato, 2-ciano-*N*-etil-4-fluoro-3-metoxi-bencenosulfonamida, 2-ciano-*N*-etil-3- metoxi-bencenosulfonamida, 2-ciano-3-difluorometoxi-*N*-etil-4-fluoro- bencenosulfonamida, 2-ciano-3- fluorometoxi-*N*-etil-bencenosulfonamida, 2-ciano-6-fluoro-3-metoxi-*N,N*-dimetil- bencenosulfonamida, 2-ciano-*N*-etil-6-fluoro-3-metoxi-*N*-metil- bencenosulfonamida, 2-ciano-3-difluorometoxi-*N,N*- dimetilbencenosulfonamida,

d-limoneno, dazomet, DBCP, DCIP, DDT, decarbofurán, deltametrina, demefión, demefión-O, demefión-S, demetón, demetón-metil, demetón-O, demetón-O-metil, demetón-S, demetón-S-metil, demetón-S-metilsulfona, diafentiurón, dialifós, diamidafós, diazinona, dicaptón, diclofentió, diclofluanida, diclorvós, dicofol, dicresil, dicrotofós, diciclanil, dieldrina, dienoclor, diflovidazin, diflubenzurona, 3-(difluorometil)-*N*-[2-(3,3-dimetilbutil)fenil]-1-metil-1*H*-pirazol-4-carboxamida, dilor, dimeflutrina, dimefox, dimetan, dimetoato, dimetrina, dimetilvinfós, dimetilan, dinex, dinobuton, dinocap, dinocap-4, dinocap-6, dinoceton,

76

WO 2010/093764

PCT/US2010/023852

dinopenton, dinoprop, dinosam, dinosulfon, dinotefuran, dinoterbon, diofenolan, dioxabenzofós, dioxacarb, dioxatión, difenil sulfona, disulfiram, disulfoton, diticrofós, DNOC, dofenapin, doramectina, ecdisterona, emamectina, benzoato de emamectina, EMPC, empentrina, endosulfán, endotión, endrina, EPN, epofenonane, eprinomectina, esfenvalerato, etafós, ethiofencarb, etión, etiprol, etoato metil, etoprofós, etil DDD, formiato de etilo, dibromuro de etileno, dicloruro de etileno, óxido de etileno, etofenprox, etoxazol, etrimfós, EXD,

F1050, famphur, fenamifós, fenazaflor, fenazaquina, óxido de fenbutatina, fenclorfós, fenethacarb, fenflutrina, fenitrotión, fenobucarb, fenotiocarb, fenoxacrim, fenoxicarb, fenpiritrina, fenpropatarina, fenpiroximato, fenson, fensulfotión, fentiión, fentiión-etil, fentrifanil, fenvalerato, fipronil, FKI-1033, flonicamid, fluacripirim, fluazurón, flubendiamida, flubenzimina, flucofurón, fluciclofurón, flucitrinato, fluenetil, flufenerim, flufenoxurón, flufenprox, flumetrina, fluorbensida, fluvalinato, fonofós, formetanato, formotión, formparanato, fosmetilán, fospirato, fostiazato, fostietan, fostietan, furatiocarb, furetrina, furfural,

gamma-cihalotrina, gamma-HCH,

halfenprox, halofenozida, HCH, HEOD, heptaclor, heptenofós, heterofós, hexaflumuron, hexitiazox, HHDN, hidrametilnon, cianuro de hidrógeno, hidropreno, hiquincarb,

imiciafós, imidacloprida, imidaclopriz, imiprotrina, indoxacarb, yodometano, IPSP, isamidofós, isazofós, isobenzan, isocarbofós, isodrina, isofenfós, isoprocarb, isoprotilano, isotioato, isoxatión, ivermectina

jasmolina I, jasmolina II, jodfenfós, hormona juvenil I, hormona juvenil II, hormona juvenil IE, JS118,

77

WO 2010/093764

PCT/US2010/023852

kelevan, kinoprene,

lambda cihalotrina, arseniato de plomo, lepimectina, leptofós, lindano, lirimfós, lufenuron, litiidati3n,

malati3n, malonoben, mazidox, mecarbam, mecarfon, menazon, mefosfolan, cloruro mercurioso, mesulfen, mesulfenf3s, metaflumizona, metam, metacrif3s, metamidof3s, metidati3n, metiocarb, metocrotof3s, metomil, metopreno, metoxiclor, metoxifenoza, bromuro de metilo, isotiocianato de metilo, metilcloroformo, cloruro de metileno, metoflutrina, metolcarb, metoxadiazona, mevinf3s, mexacarbato, milbemectina, oxima de milbemicina, mipafox, mirex, MNAF, monocrotof3s, morphoti3n, moxidectina,

naftalof3s, naled, naftaleno, nereistoxina, *N*-etil-2,2- dimetilpropionamida-2-(2,6-dicloro- α,α,α -trifluoro-*p*-tolil)hidrazona, *N*-etil-2,2-dicloro -1-metilciclopropano-carboxamida-2-(2,6-dicloro- α,α,α - trifluoro-*p*-tolil)hidrazona nicotina, nifluridide, nikkomicinas, nitenpiram, nitiazina, nitrilcarb, novaluron, noviflumuron,

ometoato, oxamil, oxidemet3n-metil, oxideprof3s, oxidisulfoton,

paradiclorobenceno, parati3n, parati3n-metil, penfluron, pentaclorofenol, pentmetrina, permetrina, fenkapton, fenotrina, fentoato, forato, fosadona, fosfol3n, fosmet, fosniclor, fosfamidon, fosfina, fosfophocarb, foxim, foxim-metil, piperonil but3xido, pirimetaf3s, pirimicarb, pirimif3s-etil, pirimif3s-metil, arsenita de potasio, tiocianato de potasio, pp'-DDT, praletrina, precoceno I, precoceno II, precoceno III, primidof3s, proclonol, profenof3s, proflutrina, promacil, promecarb, propaf3s, propargita, propetamf3s, propoxur, protidati3n, protiof3s, protoato, protrifenbute, piraclof3s, pirafluprol, pirazof3s, piresmetrina, piretrina I, piretrina II, piridabeno, piridalil, piridafenti3n, pirifluquinazon, pirimidifen, pirimitato, piriprol, piriproxif3n,

78

WO 2010/093764

PCT/US2010/023852

Qcide, quassia, quinalfós, quinalfós-metil, quinotión, quantiofós, rafoxanide, resmetrina, rotenone, ryania,

sabadilla, schradan, selamectina, silafluofen, arsenita de sodio, fluoruro de sodio, hexafluorosilicato de sodio, tiocianato de sodio, sophamide, spinetoram, spinosad, spiroadiclofen, spiromesifen, spirotetramat, sulcofuron, sulfiram, sulfluramid, sulfotep, sulfoxaflor, sulfur, fluoruro de sulfurilo, sulprofós,

tau-fluvalinato, tazimcarb, TDE, tebufenozide, tebufenpirad, tebupirimfós, teflubenzurón, teflutrina, temefós, TEPP, teraletrina, terbufós, tetracloroetano, tetraclorvinfós, tetradifon, tetrametrina, tetrametilflutrina, tetranactina, tetrasul, theta-cipermetrina, tiacloprid, tiametoxam, ticrofós, tiocarboxima, tiociclam, tiodicarb, tiofanox, tiometon, tionazina, tioquinox, tiosultap, turingiensina, tolfenpirad, tralometrina, transflutrina, transpermetrina, triaratenó, triazamato, triazofós, triclorfón, triclorometafós-3, tricloronat, trifenofós, triflumuron, trimethacarb, triprene,

vamidotión, vaniliprol, verticillide

XMC, xililcarb,

zeta-cipermetrina y zolaprofós.

Adicionalmente, puede usarse cualquier combinación de los plaguicidas anteriores.

La invención divulgada en este documento puede utilizarse asimismo con herbicidas y fungicidas, tanto por razones de economía como de sinergia.

29

WO 2010/093764

PCT/US2010/023852

La invención divulgada en este documento puede emplearse con antimicrobianos, bactericidas, defoliantes, antidotos, sinergistas, alguicidas, atrayentes, desecantes, feromonas, repelentes, mezclas de ingredientes para animales ("**animal dips**"), avicidas, desinfectantes, semioquímicos, y moluscicidas (estas categorías no necesariamente mutuamente excluyentes) por razones de economía y sinergia.

Adicionalmente, los siguientes compuestos conocidos comúnmente puede usarse con esta invención, luensulfona, fufenozida, pimetrozina, IKA-2002, IKI-2002, ZJ0967, IPP-10, JT-L001, N-etil-2,2-dicloro-1-metilciclopropanocarboxamida-2-(2,6-dicloro- α , α , α -trifluoro-p-tolil) hidrazona.

Para mayor información consultar "Compendium of Pesticide Common Names" localizado en <http://www.alanwood.net/pesticides/index.html> a la fecha de presentación de este documento. Consúltase también "The Pesticide Manual" 14th Edition, editado por C D S Tomlin, copyright 2006 por British Crop Production Council.

MEZCLAS SINERGÉTICAS

La invención divulgada en este documento puede usarse con otros compuestos tales como los mencionados bajo el encabezamiento "Mezclas" para formar mezclas sinérgicas en las que el modo de acción de los compuestos en las mezclas son las mismas, similares, o diferentes.

Ejemplos de modos de acción incluyen, pero no se limitan a: inhibidor de la acetilcolinaesterasa; modulador de canales de calcio; inhibidor de la síntesis de la quitina; antagonista de canal de cloruro regulado por GABA; agonista de canal de cloruro regulado por GABA y glutamato; agonista de receptor de acetilcolina;

80

WO 2010/093764

PCT/US2010/023852

inhibidor de MET I; inhibidor de ATPasa estimulado por Mg; receptor de acetilcolina nicotínica; disruptor de la membrana del intestino medio; y disruptor de la fosforilación oxidativa.

Adicionalmente, los siguientes compuestos son conocidos como sinergistas y pueden emplearse con la invención divulgada en este documento: butóxido de piperonilo, piprotal, propilisoma, sesamex, sesamolina, y sulfóxido.

FORMULACIONES

Un plaguicida es raramente apropiado para aplicación en su forma pura. Usualmente es necesario agregar otras sustancias de manera que el plaguicida pueda utilizarse en la concentración requerida y en una forma apropiada, permitiendo la facilidad de la aplicación, manipulación, transporte, almacenamiento, y actividad plaguicida máxima. Por consiguiente, los plaguicidas se formulan, por ejemplo, en cebos, emulsiones concentradas, polvos, concentrados emulsionables, fumigantes, geles, gránulos, microencapsulaciones, tratamientos de semillas, concentrados de suspensión, suspoemulsiones, tabletas, líquidos solubles en agua, gránulos dispersables en agua o autosuspensibles secos, polvos humectables, y soluciones de volumen ultrabajo.

Para mayor información sobre los tipos de formulación véase "Catalogue of Pesticide Formulation Types and International Coding System" Technical Monograph n°2, 5th Edition por CropLife International (2002).

Los plaguicidas se aplican muy comúnmente como suspensiones acuosas o emulsiones preparadas de formulaciones concentradas de tales plaguicidas. Tales formulaciones solubles en agua, suspendibles en agua, o emulsionables, son sólidos, usualmente conocidos como polvos humectables, o gránulos dispersables en agua, o líquidos conocidos comúnmente como concentrados

emulsionables, o suspensiones acuosas. Polvos humectables, los cuales pueden compactarse para formar gránulos dispersables en agua, contienen una mezcla íntima del plaguicida, un excipiente, y surfactantes. La concentración del plaguicida es usualmente desde alrededor de 10% a alrededor de 90% en peso. El excipiente se selecciona habitualmente entre arcillas attapulgita, las arcillas montmorillonita, las tierras de diatomeas, o los silicatos purificados. Surfactantes efectivos, que contienen desde alrededor de 0.5% a alrededor de 10% del polvo humectable, se encuentran entre ligninas sulfonadas, naftalenosulfonatos condensados, naftalenosulfonatos, alquilbencenosulfonatos, alquil sulfatos, y surfactantes no iónicos tales como aductos de óxido de etileno y alquil fenoles.

Concentrados emulsionables de plaguicidas contienen una concentración conveniente de un plaguicida, tal como desde alrededor de 50 a alrededor de 500 gramos por litro de líquido disuelto en un excipiente que es un disolvente miscible en agua o una mezcla de disolvente orgánico no miscible en agua y emulsionantes. Disolventes orgánicos útiles incluyen aromáticos, especialmente xilenos y fracciones de petróleo, especialmente las porciones naftalénicas y olefinicas de petróleo, con alto punto de ebullición, tales como nafta aromática pesada. Pueden usarse asimismo otros disolventes orgánicos, tales como los disolventes terpénicos incluyendo derivados de colofonia, acetonas alifáticas tales como ciclohexanona, y alcoholes complejos tales como 2-etoxietanol. Emulsionantes apropiados para concentrados emulsionables se seleccionan de surfactantes aniónicos y no iónicos convencionales.

Las suspensiones acuosas incluyen suspensiones de plaguicidas insolubles en agua, dispersadas en un excipiente acuoso en una concentración en el rango desde alrededor de 5% a alrededor de 50% en peso. Las suspensiones se preparan moliendo finamente el plaguicida y mezclándolo vigorosamente en un excipiente compuesto de agua y surfactantes. De igual manera pueden agregarse ingredientes, tales como sales inorgánicas y gomas naturales o sintéticas, para

aumentar la densidad y viscosidad del excipiente acuoso. Con frecuencia es muy efectivo moler y mezclar el plaguicida al mismo tiempo preparando la mezcla acuosa y homogenizándola en un utensilio tales como un molino de arena, molino de bolas, u homogenizador tipo pistón.

Los plaguicidas pueden aplicarse también como composiciones granulares que son particularmente útiles para aplicaciones al suelo. Las composiciones granulares contienen usualmente desde alrededor de 0.5% a alrededor de 10% en peso del plaguicida, dispersado en un excipiente que contiene arcilla o una sustancia similar. Tales composiciones se preparan por lo común disolviendo el plaguicida en un disolvente apropiado y aplicándolo a un excipiente granular, que se ha pre-formado al tamaño adecuado de partículas, en el rango de desde alrededor de 0.5 a 3 mm. Tales composiciones pueden formularse además elaborando una masa o pasta del excipiente y el compuesto, y triturando y secando para obtener el tamaño de partícula granular deseado.

Polvos que contienen un plaguicida se preparan mezclando íntimamente el plaguicida en forma de polvo con un excipiente agrícola pulverulento apropiado, tal como una arcilla caolín, roca volcánica molida, y similares. Los polvos pueden contener convenientemente desde alrededor de 1% a alrededor de 10% del plaguicida. Éstos pueden aplicarse como un tratamiento de semillas, o como una aplicación de follaje con una pulverizadora.

Es igualmente práctico aplicar un plaguicida en la forma de una solución en un disolvente orgánico apropiado, usualmente aceite de petróleo, tal como los aceites atomizables, los cuales se usan ampliamente en la química agrícola.

Los plaguicidas pueden aplicarse asimismo en la forma de una composición en aerosol. En tales composiciones el plaguicida se disuelve en un excipiente, el cual es un propelente que genera presión. La composición en aerosol se envasa

en un envase, del cual se dispensa la mezcla a través de una válvula atomizadora.

Los cebos de plaguicida se forman cuando el plaguicida se mezcla con un alimento o un atrayente, o ambos. Cuando las plagas ingieren el cebo, consumen también el plaguicida. Los cebos pueden adoptar la forma de gránulos, geles, polvos autosuspensibles, líquidos, o sólidos. Éstos se usan en refugios de plagas.

Los fumigantes son plaguicidas que tienen una presión de vapor relativamente alta y, por lo tanto, pueden existir como un gas en concentraciones suficientes para eliminar plagas en el suelo o espacios cerrados. La toxicidad del fumigante es proporcional a su concentración en el tiempo de exposición. Se caracterizan por una buena capacidad de difusión y actúan penetrando el sistema respiratorio de la plaga o absorbiéndose a través de la cutícula de la plaga. Los fumigantes se aplican para controlar plagas de productos almacenados bajo cubiertas a prueba de gas, en cuartos sellados a prueba de gas o edificaciones, o en cámaras especiales.

Los plaguicidas pueden microencapsularse suspendiendo las partículas de plaguicida o gotículas en polímeros plásticos de varios tipos. Alterando la química del polímero o modificando factores en el procesamiento, pueden formarse microcápsulas en diferentes tamaños, solubilidad, espesores de pared, y grados de penetrabilidad. Estos factores rigen la velocidad a la cual se libera el ingrediente activo contenido en ellas, lo cual, a su vez, afecta el desempeño residual, velocidad de acción, y olor del producto.

Los concentrados en solución de aceite se elaboran disolviendo el plaguicida en un disolvente que mantendrá el plaguicida en solución. Las soluciones de aceite de un plaguicida proporcionan usualmente un efecto de volteo ("**knockdown**") y una eliminación más rápida de las plagas que otras formulaciones, debido a que los disolventes mismos tienen una acción plaguicida y

la disolución de la cubierta cerosa del tegumento aumenta la velocidad de absorción del plaguicida. Otras ventajas de las soluciones de aceite incluyen una mejor estabilidad al almacenamiento, una mejor penetración de las hendiduras, y una mejor adhesión a superficies grasosas.

Otra incorporación es una emulsión de aceite en agua, en donde la emulsión contiene glóbulos aceitosos, los cuales se proveen cada uno con una cubierta de cristal líquido laminar y se dispersan en una fase acuosa, en donde cada glóbulo aceitoso contiene por lo menos un compuesto que es agrícolamente activo, y se recubre individualmente con una capa monolaminar u oligolaminar compuesta de: (1) por lo menos un agente tensioactivo lipófilo no iónico, (2) por lo menos un agente tensioactivo hidrófilo no iónico y (3) por lo menos un agente tensioactivo iónico, en donde los glóbulos tienen un diámetro medio de partícula de menos de 800 nanómetros. Mayor información sobre la incorporación se divulga en publicación de patente de los Estados Unidos 20070027034 publicada el 1 de febrero de 2007, con el número de serial de Solicitud de Patente 11/495,228. Para facilidad de uso de esta incorporación se designará "OIWE."

Para mayor información consúltese "Insect Pest Management" 2nd Edition por D. Dent, copyright CAB International (2000). Adicionalmente, para información más detallada, consúltese "Handbook of Pest Control - The Behavior, Life History, and Control of Household Pests" por Arnold Mallis, 9th Edition, copyright 2004 por GIE Media Inc.

OTROS COMPONENTES DE LA FORMULACIÓN

Generalmente, cuando la invención divulgada en este documento se emplea en una formulación, tal formulación puede contener además otros componentes. Estos componentes incluyen, pero no se limitan a, (éste es un listado no exhaustivo y no mutuamente excluyente) mojadores, propagadores,

adhesivos, penetrantes, amortiguadores, agentes secuestrantes, agentes reductores de deriva, agentes de compatibilidad, agentes antiespumantes, agentes limpiadores, y emulsionantes. A continuación se describen unos cuantos componentes.

Un agente humectante es una sustancia que cuando se agrega a un líquido aumenta la dispersión o el poder de penetración del líquido, reduciendo la tensión interfacial entre el líquido y la superficie sobre la cual se está esparciendo. Los agentes humectantes se emplean para dos funciones principales en formulaciones agroquímicas: durante el procesamiento y fabricación, para aumentar la tasa de humectación de polvos en agua, para elaborar concentrados para líquidos solubles o concentrados de suspensión; y durante el mezclado de un producto con agua en un tanque de aspersión para disminuir el tiempo de los polvos mojables y mejorar la penetración del agua en los gránulos dispersables en agua. Ejemplos de agentes humectantes utilizados en formulaciones de polvos mojables, concentrados de suspensión, y gránulos dispersables en agua son: laurilsulfato sódico; dioctil sulfosuccinato sódico; alquil fenol etoxilatos; y etoxilatos de alcohol alifático.

Un agente dispersante es una sustancia que se adsorbe sobre la superficie de partículas y contribuye a preservar el estado de dispersión de las partículas e impide que se vuelvan a agregar. Los agentes dispersantes se adicionan a las formulaciones agroquímicas para facilitar la dispersión y suspensión durante la fabricación, y para garantizar que las partículas se re-dispersen en agua en un tanque de aspersión. Se emplean ampliamente en polvos mojables, concentrados de suspensión y gránulos dispersables en agua. Los surfactantes que se usan como agentes dispersantes tienen la capacidad de adsorberse fuertemente sobre la superficie de una partícula o proporcionar una barrera cargada o espacial a la re-agregación de las partículas. Los surfactantes más comúnmente utilizados son aniónicos, no iónicos, o mezclas de los dos tipos. Para formulaciones de polvos

mojables, los agentes dispersantes más comunes son lignosulfonatos sódicos. Para concentrados de suspensión, se obtienen una excelente adsorción y estabilización usando polielectrólitos, tales como condensados de formaldehído y naftalensulfonato sódico. Se usan igualmente ésteres fosfato y tristirilfenol etoxilato. No iónicos tales como condensados de óxido de alquilariletileno y copolímeros de bloques EO-PO se combinan a veces con aniónicos como agentes dispersantes para concentrados de suspensión. En años recientes, se han desarrollado como agentes dispersantes nuevos tipos de surfactantes poliméricos de peso molecular muy elevado. Éstos tienen 'cadenas principales' hidrófobas muy largas y un gran número de cadenas de óxido de etileno, que forman los 'dientes' de un surfactante 'peine'. Estos polímeros de alto peso molecular pueden impartir una estabilidad muy buena a largo plazo a concentrados de suspensión, porque las cadenas principales hidrófobas tienen muchos puntos de anclaje sobre las superficies de las partículas. Ejemplos de agentes dispersantes empleados en formulaciones agroquímicas son: lignosulfonatos sódicos; condensados de formaldehído y naftalensulfonato sódico; ésteres fosfato y tristirilfenol etoxilato; etoxilatos de alcohol alifático; alquil etoxilatos; copolímeros de bloques EO-PO; y copolímeros injertados.

Un agente emulsionante es una sustancia que estabiliza una suspensión de gotículas de una fase líquida en otra fase líquida. Sin el agente emulsionante, los dos líquidos se separarían en dos fases líquidas no miscibles. Las mezclas de emulsionante utilizadas más comúnmente contienen alquilfenol o alcohol alifático con 12 o más unidades de óxido de etileno y la sal de calcio soluble en aceite de ácido dodecylbencenosulfónico. Un rango de valores de equilibrio hidrófilo-lipófilo ("HLB - *hydrophile-lipophile balance* ") desde 8 a 18 proporcionará normalmente excelentes emulsiones estables. La estabilidad de la emulsión puede mejorarse a veces mediante la adición de una pequeña cantidad de un surfactante de copolímero de bloques EO-PO.

Un agente solubilizante es un surfactante que formará micelas en agua en concentraciones por encima de la concentración crítica de las micelas. Las micelas son entonces capaces de disolver o solubilizar materiales no solubles en agua dentro de la parte hidrófoba de la micela. El tipo de surfactantes usados habitualmente para solubilización son no iónicos: monooleatos de sorbitán; etoxilatos de monooleato de sorbitán; y ésteres metil oleato.

A veces se usan surfactantes, solos o con otros aditivos tales como aceites vegetales o minerales como coadyuvantes a mezclas de tanques de aspersión para mejorar el desempeño biológico del plaguicida sobre el objetivo o plaga. Los tipos de surfactantes usados para biopotenciación dependen generalmente de la naturaleza y el modo de acción del plaguicida. No obstante, a menudo son no iónicos tales como: alquil etoxilatos; etoxilatos de alcohol alifático lineal; etoxilatos de amina alifática.

Un excipiente o diluyente en una formulación agrícola es un material agregado al plaguicida para proporcionar un producto de la potencia requerida. Usualmente los excipientes son materiales con altas capacidades de absorción, mientras que los diluyentes son generalmente materiales con bajas capacidades de absorción. Los excipientes y diluyentes se utilizan en la formulación de polvos, polvos mojables, gránulos y gránulos dispersables en agua.

Los disolventes orgánicos se usan principalmente en la formulación de concentrados emulsionables, formulaciones de volumen ultra bajo (ULV – *ultra low volume*) y, en una menor medida, formulaciones granulares. A veces se emplean mezclas de disolventes. El primer grupo principal de disolventes son aceites parafínicos alifáticos tales como queroseno o parafinas refinadas. El segundo grupo principal, y el más común, incluye los disolventes aromáticos tales como xileno y fracciones de peso molecular más elevado de disolventes aromáticos C₉ y C₁₀. Los hidrocarburos clorados son útiles como co-disolventes para evitar la

cristalización de plaguicidas cuando la formulación se emulsiona en agua. De vez en cuando se utilizan alcoholes como co-disolventes para aumentar el poder disolvente.

Espesantes o agentes de gelificación se usan principalmente en la formulación de concentrados de suspensión, emulsiones y suspoemulsiones para modificar la reología o las propiedades de flujo del líquido y para evitar la separación o sedimentación de las partículas dispersadas o gotículas. Los agentes espesantes, gelificantes, y anti-sedimentantes caen generalmente en dos categorías, a saber, particulados no solubles en agua y polímeros solubles en agua. Es posible producir formulaciones de concentrados de suspensión empleando arcillas y sílices. Ejemplos de estos tipos de materiales, incluyen, pero no se limitan a, montmorillonita, v.g. bentonita; silicato de aluminio y magnesio; y attapulgita. Polisacáridos solubles en agua se han usado como agentes espesantes-gelificantes durante muchos años. Los tipos de polisacáridos más comúnmente utilizados son extractos naturales de semillas y algas marinas, o son derivados sintéticos de celulosa. Ejemplos de estos tipos de materiales incluyen, pero no se limitan a, goma de guar; goma de algarrobo; carragenina; alginatos; metil celulosa; carboximetilcelulosa sódica (SCMC - *sodium carboxymethyl cellulose*); hidroxietilcelulosa (HEC - *hydroxyethyl cellulose*). Otros tipos de agentes anti-sedimentantes se basan en almidones modificados, poliacrilatos, alcohol polivinílico y óxido de polietileno. Otro excelente agente anti-sedimentante es la goma xantana.

Microorganismos causan el deterioro y descomposición de los productos formulados. Por consiguiente, se utilizan agentes preservantes para eliminar o disminuir su efecto. Ejemplos de tales agentes incluyen, pero no se limitan a: ácido propiónico y su sal de sodio; ácido sórbico y sus sales de sodio o potasio; ácido benzoico y su sal de sodio; sal de sodio de ácido p-hidroxibenzoico; metil p-hidroxi benzoato; y 1,2-benzisotiazolin-3-ona (BIT).

La presencia de surfactantes, con menor tensión interfacial, a menudo hace que formulaciones a base de agua produzcan espuma durante las operaciones de mezclado en la producción y en la aplicación a través del tanque de aspersión. Con el fin de reducir la tendencia a hacer espuma, se añaden con frecuencia agentes antiespumantes durante la fase de producción o antes del envasado en botellas. Generalmente, existen dos tipos de agentes antiespumantes, a saber, siliconas y no siliconas. Las siliconas son por lo general emulsiones acuosas de polisiloxano de dimetilo, mientras que los agentes antiespumantes no siliconas son aceites no solubles en agua, tales como octanol y nonanol, o sílices. En ambos casos, la función del agente antiespumante es desplazar el surfactante de la interfase aire-agua.

Para mayor información véase "Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations" edited by D.A. Knowles, copyright 1998 por Kluwer Academic Publishers. Véase también "Insecticides in Agriculture and Environment - Retrospects and Prospects" por A.S. Perry, I. Yamamoto, I. Ishaaya, and R. Perry, copyright 1998 por Springer-Verlag.

APLICACIONES

La cantidad efectiva de plaguicida a aplicarse a entornos de plagas no es crítica y puede determinarse fácilmente por las personas expertas en el arte. En general, se espera que concentraciones desde alrededor de 0.01 gramos de plaguicida por hectárea a alrededor de 5000 gramos de pesticida por hectárea proporcionen un buen control.

El entorno al cual se aplica un plaguicida puede ser cualquier lugar habitado por una plaga, por ejemplo, cultivos vegetales, frutales y nogales, viñedos, plantas ornamentales, animales domésticos, las áreas interiores y

exteriores de edificios, y el terreno aledaño a las edificaciones.

Generalmente, con cebos, éstos se ponen en el suelo donde las termitas pueden entrar en contacto, por ejemplo, con el cebo. Los cebos pueden aplicarse también a un área de un edificio, (superficie horizontal, vertical, o inclinada) donde, por ejemplo, hormigas, termitas, cucarachas, y moscas, pueden entrar en contacto con el cebo.

Debido a la capacidad única de los huevos de algunas plagas de resistir a los plaguicidas pueden ser deseables aplicaciones repetidas para controlar larvas recién salidas.

El movimiento sistémico de los plaguicidas en las plantas puede utilizarse para controlar plagas en una parte de la planta, aplicando los plaguicidas a una parte de diferente de la planta. Por ejemplo, los insectos que se alimentan de follaje pueden controlarse por irrigación de goteo o aplicación en el surco, o tratando la semilla antes de la siembra. El tratamiento de semillas puede aplicarse a todos los tipos de semillas, incluyendo aquellas de las cuales germinarán plantas genéticamente transformadas para expresar rasgos especializados. Ejemplos representativos incluyen semillas o plantas que expresan proteínas y/o ARN bicatenario tóxico a plagas invertebradas, tales como *Bacillus thuringiensis*, toxinas Bt Cry, toxinas Bt Vip, ARNi, u otras toxinas insecticidas, las que expresan resistencia a los herbicidas, tales como la semilla "Roundup Ready", o aquellas con genes extraños "apilados", que expresan toxinas insecticidas, resistencias a los herbicidas, mejoramiento de la nutrición o cualesquiera otras características benéficas. Además, tales tratamientos de semillas con la invención divulgada en este documento pueden mejorar igualmente la capacidad de una planta para resistir mejor condiciones estresantes de crecimiento. Esto se traduce en una planta más sana, más vigorosa, lo cual puede llevar a rendimientos más altos en tiempo de cosecha.

Debe ser fácilmente evidente que la invención puede usarse con plantas transformadas genéticamente para expresar rasgos especializados, tales como *Bacillus thuringiensis*, ARNi, u otras toxinas insecticidas, o las que expresan resistencia a los herbicidas, o aquellas con genes extraños "apilados" que expresan toxinas insecticidas, resistencia a los herbicidas, mejoramiento de la nutrición o cualesquiera otras características benéficas.

La invención divulgada en este documento es apropiada para controlar endoparásitos y ectoparásitos en el sector de la medicina veterinaria o en el campo del cuidado de animales (lo cual, para evitar dudas, incluye mascotas, por ejemplo, gatos, perros, y pájaros). Los compuestos de acuerdo con la invención se aplican aquí en una manera conocida, tal como mediante administración oral en la forma, por ejemplo, de tabletas, cápsulas, bebidas, gránulos, mediante aplicación dérmica en la forma, por ejemplo, de remojo ("**dipping**"), aspersión, aplicación epicutánea, aplicación específica, y espolvoreo, y mediante administración parenteral en la forma, por ejemplo, de una inyección.

La invención divulgada en este documento puede emplearse asimismo ventajosamente en el cuidado de ganado, por ejemplo, vacunos, ovejas, cerdos, pollos, y gansos. Formulaciones apropiadas se administran oralmente a los animales con el agua de beber o el forraje. Las dosis y formulaciones que son apropiadas dependen de la especie.

Antes que pueda usarse o venderse comercialmente un plaguicida, tal plaguicida se somete a prolongados procesos de evaluación por varias autoridades gubernamentales (locales, regionales, estatales, nacionales, e internacionales). Requerimientos voluminosos de datos se especifican por las autoridades reguladoras y tienen que enviarse mediante generación y entrega de datos por la persona que registra el producto, o por otra persona a nombre de

92

WO 2010/093764

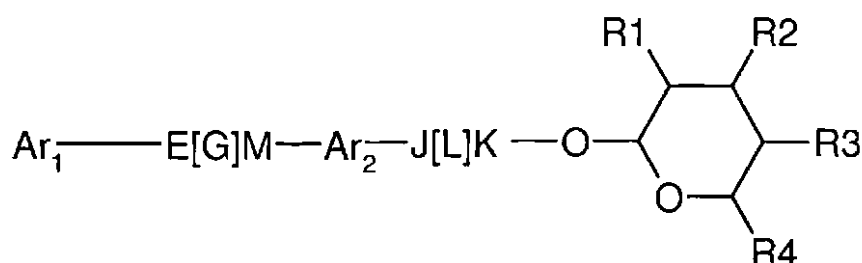
PCT/US2010/023852

quien registra. Estas autoridades gubernamentales revisan entonces tales datos y, si se concluye una determinación de seguridad, otorgan al usuario o vendedor potencial una aprobación del registro del producto. Posteriormente, en aquella localidad donde se otorga y sustenta el registro del producto, tal usuario o vendedor puede usar o vender tal plaguicida.

Los encabezamientos en este documento son para conveniencia únicamente y no tienen que usarse para interpretar alguna parte del mismo.

LO QUE SE REIVINDICA ES:

1. Un compuesto que tiene la siguiente fórmula:



en donde:

(a) Ar₁ es

- (1) furanilo, fenilo, piridazinilo, piridilo, pirimidinilo, tienilo, o
- (2) furanilo sustituido, fenilo sustituido, piridazinilo sustituido, piridilo sustituido, pirimidinilo sustituido, o tienilo sustituido,

en donde el citado furanilo sustituido, fenilo sustituido, piridazinilo sustituido, piridilo sustituido, pirimidinilo sustituido, y tienilo sustituido, tienen uno o más radicales seleccionados independientemente de H, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ haloalquilo, C₁-C₆ hidroxialquilo, C₃-C₆ cicloalquilo, C₃-C₆ halocicloalquilo, C₃-C₆ hidroxicicloalquilo, C₃-C₆ cicloalcoxi, C₃-C₆ halocicloalcoxi, C₃-C₆ hidroxicicloalcoxi, C₁-C₆ alcoxi, C₁-C₆ haloalcoxi, C₂-C₆ alquenilo, C₂-C₆ alquinilo, S(=O)_n(C₁-C₆ alquilo), S(=O)_n(C₁-C₆ haloalquilo), OSO₂(C₁-C₆ alquilo), OSO₂(C₁-C₆ haloalquilo), C(=O)H, C(=O)NR_xR_y, (C₁-C₆ alquilo)NR_xR_y, C(=O)(C₁-C₆ alquilo), C(=O)O(C₁-C₆ alquilo), C(=O)(C₁-C₆ haloalquilo), C(=O)O(C₁-C₆ haloalquilo), C(=O)(C₃-C₆ cicloalquilo), C(=O)O(C₃-C₆ cicloalquilo), C(=O)(C₂-C₆ alquenilo), C(=O)O(C₂-C₆ alquenilo), (C₁-C₆ alquilo)O(C₁-C₆ alquilo), (C₁-C₆ alquilo)S(C₁-C₆ alquilo), (C₁-C₆ haloalquilo)O(C₁-C₆ haloalquilo)O, C₁-C₆ (hidroxi)haloalquilo, C(=O)(C₁-C₆ alquilo)C(=O)O(C₁-C₆ alquilo), fenilo, fenoxi, fenilo sustituido y fenoxi sustituido (en donde tal fenilo sustituido y fenoxi sustituido

tienen uno o más radicales seleccionados independientemente de H, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ haloalquilo, C₁-C₆ hidroxialquilo, C₃-C₆ cicloalquilo, C₃-C₆ halocicloalquilo, C₃-C₆ hidroxicicloalquilo, C₃-C₆ cicloalcoxi, C₃-C₆ halocicloalcoxi, C₃-C₆ hidroxicicloalcoxi, C₁-C₆ alcoxi, C₁-C₆ haloalcoxi, C₂-C₆ alquenilo, C₂-C₆ alquinilo, S(=O)_n(C₁-C₆ alquilo), S(=O)_n(C₁-C₆ haloalquilo), OSO₂(C₁-C₆ alquilo), OSO₂(C₁-C₆ haloalquilo), C(=O)H, C(=O)NR_xR_y, (C₁-C₆ alquilo)NR_xR_y, C(=O)(C₁-C₆ alquilo), C(=O)O(C₁-C₆ alquilo), C(=O)(C₁-C₆ haloalquilo), C(=O)O(C₁-C₆ haloalquilo), C(=O)(C₃-C₆ cicloalquilo), C(=O)O(C₃-C₆ cicloalquilo), C(=O)(C₂-C₆ alquenilo), C(=O)O(C₂-C₆ alquenilo), (C₁-C₆ alquilo)O(C₁-C₆ alquilo), (C₁-C₆ alquilo)S(C₁-C₆ alquilo), C(=O)(C₁-C₆ alquilo)C(=O)O(C₁-C₆ alquilo) fenilo, y fenoxi);

(b) E es N, C, o CR₅;

(c) G es un enlace doble o triple;

(d) M es N, C, o CR₅, (con tal que cuando E es un átomo de nitrógeno "N", entonces M es un átomo de nitrógeno "N", y cuando E es un átomo de carbono "C", entonces M es un átomo de carbono "C", y cuando E es "CR₅" entonces M es "CR₅";

(c) Ar₂ es

(1) furanilo, fenilo, piridazinilo, piridilo, pirimidinilo, tienilo, o

(2) furanilo sustituido, fenilo sustituido, piridazinilo sustituido, piridilo sustituido, pirimidinilo sustituido, o tienilo sustituido,

en donde el citado furanilo sustituido, fenilo sustituido, piridazinilo sustituido, piridilo sustituido, pirimidinilo sustituido, y tienilo sustituido, tienen uno o más radicales seleccionados independientemente de H, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ haloalquilo, C₁-C₆ hidroxialquilo, C₃-C₆ cicloalquilo, C₃-C₆ halocicloalquilo, C₃-C₆ hidroxicicloalquilo, C₃-C₆ cicloalcoxi, C₃-C₆ halocicloalcoxi, C₃-C₆ hidroxicicloalcoxi, C₁-C₆ alcoxi, C₁-C₆ haloalcoxi, C₂-C₆ alquenilo, C₂-C₆

95

alquinilo, $S(=O)_n(C_1-C_6 \text{ alquilo})$, $S(=O)_n(C_1-C_6 \text{ haloalquilo})$, $OSO_2(C_1-C_6 \text{ alquilo})$, $OSO_2(C_1-C_6 \text{ haloalquilo})$, $C(=O)H$, $C(=O)NR_xR_y$, $(C_1-C_6 \text{ alquilo})NR_xR_y$, $C(=O)(C_1-C_6 \text{ alquilo})$, $C(=O)O(C_1-C_6 \text{ alquilo})$, $C(=O)(C_1-C_6 \text{ haloalquilo})$, $C(=O)O(C_1-C_6 \text{ haloalquilo})$, $C(=O)(C_3-C_6 \text{ cicloalquilo})$, $C(=O)O(C_3-C_6 \text{ cicloalquilo})$, $C(=O)(C_2-C_6 \text{ alquenilo})$, $C(=O)O(C_2-C_6 \text{ alquenilo})$, $(C_1-C_6 \text{ alquilo})O(C_1-C_6 \text{ alquilo})$, $(C_1-C_6 \text{ alquilo})S(C_1-C_6 \text{ alquilo})$, $(C_1-C_6 \text{ haloalquilo})O(C_1-C_6 \text{ haloalquilo})O$, C_1-C_6 (hidroxi)(halo)alquilo, $C(=O)(C_1-C_6 \text{ alquilo})C(=O)O(C_1-C_6 \text{ alquilo})$, fenilo, fenoxi, fenilo sustituido y fenoxi sustituido (en donde tal fenilo sustituido y fenoxi sustituido tienen uno o más radicales seleccionados independientemente de H, F, Cl, Br, I, CN, NO_2 , C_1-C_6 alquilo, C_1-C_6 haloalquilo, C_1-C_6 hidroxialquilo, C_3-C_6 cicloalquilo, C_3-C_6 halocicloalquilo, C_3-C_6 hidroxicicloalquilo, C_3-C_6 cicloalcoxi, C_3-C_6 halocicloalcoxi, C_3-C_6 hidroxicicloalcoxi, C_1-C_6 alcoxi, C_1-C_6 haloalcoxi, C_2-C_6 alquenilo, C_2-C_6 alquinilo, $S(=O)_n(C_1-C_6 \text{ alquilo})$, $S(=O)_n(C_1-C_6 \text{ haloalquilo})$, $OSO_2(C_1-C_6 \text{ alquilo})$, $OSO_2(C_1-C_6 \text{ haloalquilo})$, $C(=O)H$, $C(=O)NR_xR_y$, $(C_1-C_6 \text{ alquilo})NR_xR_y$, $C(=O)(C_1-C_6 \text{ alquilo})$, $C(=O)O(C_1-C_6 \text{ alquilo})$, $C(=O)(C_1-C_6 \text{ haloalquilo})$, $C(=O)O(C_1-C_6 \text{ haloalquilo})$, $C(=O)(C_3-C_6 \text{ cicloalquilo})$, $C(=O)O(C_3-C_6 \text{ cicloalquilo})$, $C(=O)(C_2-C_6 \text{ alquenilo})$, $C(=O)O(C_2-C_6 \text{ alquenilo})$, $(C_1-C_6 \text{ alquilo})O(C_1-C_6 \text{ alquilo})$, $(C_1-C_6 \text{ alquilo})S(C_1-C_6 \text{ alquilo})$, $C(=O)(C_1-C_6 \text{ alquilo})C(=O)O(C_1-C_6 \text{ alquilo})$ fenilo, y fenoxi);

(d) J es O, N, NR_5 , CR_5 , o $C=O$;

(e) L es un enlace simple o doble;

(f) K es CR_5 , $C=O$, N, NR_5 , o $C=S$;

(g) R1 es H, OH, F, Cl, Br, I, oxo, C_1-C_6 alquilo, C_1-C_6 haloalquilo, C_1-C_6 alcoxi, C_3-C_6 cicloalcoxi, C_1-C_6 haloalcoxi, C_2-C_6 alquenilo, $(C_1-C_6 \text{ alquilo})O(C_1-C_6 \text{ alquilo})$, $(C_1-C_6 \text{ alquilo})O(C_1-C_6 \text{ alcoxi})$, $OC(=O)(C_1-C_6 \text{ alquilo})$, $OC(=O)(C_3-C_6 \text{ cicloalquilo})$, $OC(=O)(C_1-C_6 \text{ haloalquilo})$, $OC(=O)(C_2-C_6 \text{ alquenilo})$, o NR_xR_y ;

(h) R2 es H, F, Cl, Br, I, oxo, C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ haloalquilo, C₁-C₆ alcoxi, C₃-C₆ cicloalcoxi, C₁-C₆ haloalcoxi, C₂-C₆ alquenilo, (C₁-C₆ alquilo)O(C₁-C₆ alquilo), (C₁-C₆ alquilo)O(C₁-C₆ alcoxi), OC(=O)(C₁-C₆ alquilo), OC(=O)(C₃-C₆ cicloalquilo), OC(=O)(C₁-C₆ haloalquilo), OC(=O)(C₂-C₆ alqueno), o NR_xR_y;

(i) R3 es H, OH, F, Cl, Br, I, oxo, C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ haloalquilo, C₁-C₆ alcoxi, C₃-C₆ cicloalcoxi, C₁-C₆ haloalcoxi, C₂-C₆ alquenilo, (C₁-C₆ alquilo)O(C₁-C₆ alquilo), (C₁-C₆ alquilo)O(C₁-C₆ alcoxi), OC(=O)(C₁-C₆ alquilo), OC(=O)(C₃-C₆ cicloalquilo), OC(=O)(C₁-C₆ haloalquilo), OC(=O)(C₂-C₆ alqueno), o NR_xR_y;

(j) R4 es H, C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ haloalquilo, C₁-C₆ alcoxi, C₁-C₆ haloalcoxi, C₂-C₆ alquenilo, (C₁-C₆ alquilo)O(C₁-C₆ alquilo);

(k) R5 es (cada uno independientemente) H, C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ haloalquilo, C₃-C₆ cicloalquilo, o C₃-C₆ halocicloalquilo; y

(l) R_x y R_y se seleccionan independientemente de H, C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ haloalquilo, C₁-C₆ hidroxialquilo, C₃-C₆ cicloalquilo, C₃-C₆ halocicloalquilo, C₃-C₆ hidroxicicloalquilo, C₃-C₆ cicloalcoxi, C₃-C₆ halocicloalcoxi, C₃-C₆ hidroxicicloalcoxi, C₁-C₆ alcoxi, C₁-C₆ haloalcoxi, C₂-C₆ alqueno, C₂-C₆ alquino, S(=O)_n(C₁-C₆ alquilo), S(=O)_n(C₁-C₆ haloalquilo), OSO₂(C₁-C₆ alquilo), OSO₂(C₁-C₆ haloalquilo), C(=O)H, C(=O)OH, C(=O)(C₁-C₆ alquilo), C(=O)O(C₁-C₆ alquilo), C(=O)(C₁-C₆ haloalquilo), C(=O)O(C₁-C₆ haloalquilo), C(=O)(C₃-C₆ cicloalquilo), C(=O)O(C₃-C₆ cicloalquilo), C(=O)(C₂-C₆ alqueno), C(=O)O(C₂-C₆ alqueno), (C₁-C₆ alquilo)O(C₁-C₆ alquilo), (C₁-C₆ alquilo)S(C₁-C₆ alquilo), C(=O)(C₁-C₆ alquilo)C(=O)O(C₁-C₆ alquilo), fenilo, y fenoxi.

2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 que tiene una estructura de acuerdo con los Compuestos 1 a 22.

97

WO 2010/093764

PCT/US2010/023852

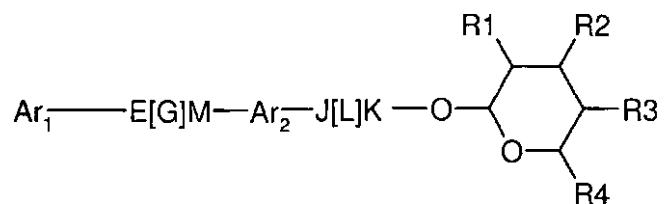
3. Un compuesto que es una sal de adición de ácido plaguicidamente aceptable de un compuesto de acuerdo con la reivindicación 2.
4. Un proceso que incluye aplicar un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 a un lugar para controlar plagas.
5. Una composición que contiene una mezcla de un compuesto de acuerdo con la reivindicación 2 con por lo menos otro plaguicida.
6. Un proceso de aplicar un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 a una semilla.
7. Un proceso de aplicar un compuesto de la reivindicación 1 a una semilla, que se ha transformado genéticamente para expresar uno o más rasgos especializados.
8. Un proceso de aplicar un compuesto de la reivindicación 1 a una planta transformada genéticamente, que se ha transformado genéticamente para expresar uno o más rasgos especializados.
9. Un proceso de administrar oralmente o aplicar un compuesto de la reivindicación 1 a un animal.
10. Un proceso que incluye entregar datos relacionados con un compuesto de la reivindicación 1 a una autoridad gubernamental, con el fin de obtener la aprobación de registro de un producto para un producto que contiene un compuesto de la reivindicación 1.

98

WO 2010/093764

PCT/US2010/023852

RESUMEN



La invención divulgada en este documento se relaciona con el campo de los plaguicidas y su uso en controlar plagas. Se divulga un compuesto que tiene la siguiente estructura.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/US2010/023852

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
INV. C07H15/02 A01N43/16
ADD.

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
C07H A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data, WPI Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 98/47894 A1 (DOW AGROSCIENCES LLC [US]) 29 October 1998 (1998-10-29) the whole document -----	1-10

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☒ See patent family annex.

* Special categories of cited documents :

A document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

E earlier document but published on or after the international filing date

L document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

O document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

P document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

T later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

X document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

Y document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

G document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

15 April 2010

Date of mailing of the international search report

03/05/2010

Name and mailing address of the ISA/

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Nikolai, Joachim

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

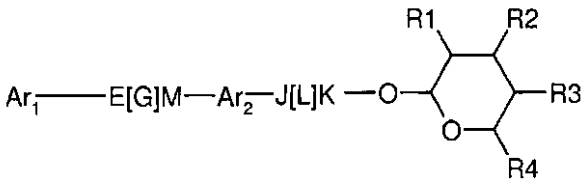
International application No

PCT/US2010/023852

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9847894	A1	29-10-1998	
		AU 730027 B2	22-02-2001
		AU 6865898 A	13-11-1998
		BR 9804865 A	24-08-1999
		CA 2259246 A1	29-10-1998
		CN 1228089 A	08-09-1999
		CO 5200831 A1	27-09-2002
		EP 0922043 A1	16-06-1999
		ES 2167882 T3	16-05-2002
		JP 4306806 B2	05-08-2009
		JP 2000516260 T	05-12-2000
		KR 20000022164 A	25-04-2000
		MX 9810849 A	20-08-2002
		TR 9802691 T1	21-07-1999

Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO DIVISION DE NUEVAS CREACIONES EXTRACTO PARA PUBLICACIÓN SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION PCT	
(21) N° de solicitud: (22) Fecha de solicitud: (30) Prioridad (31) Prioridad 61/151,549 (32) Fecha 11/02/2009 (33) País US	(51) Int Cl: C07H 015/002 (71) Solicitante(s) DOW AGROSCIENCES LLC (72) Inventor(es) GARY CROUSE Y OTROS (74) Apoderado: LUZ CLEMENCIA DE PAEZ
(85) Fecha límite inicio fase nacional: 11/09/2011 (86) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT Fecha de presentación de la solicitud: 11/02/2010 No. de solicitud PCT/us2010/023852	(87) Publicación internacional Fecha: 19/08/2010 N° publicación: WO 2010/093764 A1
(54) Título: COMPOSICIONES PLAGUICIDAS	

Resumen:



La invención divulgada en este documento se relaciona con el campo de los plaguicidas y su uso en controlar plagas. Se divulga un compuesto que tiene la siguiente estructura.

SOBRE DE ARTÉ

103



RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0076253

Bogotá D.C., Agosto 08 de 2011 - 16:50:34

RECIBIDO DE : CAVELIER ABOGADOS

NI 860.041.367

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	411764135	08/08/2011	48.753.000.00

*** Conceptos Pagados ***

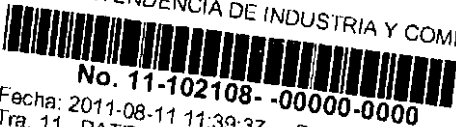
CANT	RENTISTICO	CONCEPTO	VR LUNDITARIO	VR CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE INVENCIÓN	571.000.00	571.000.00
				\$571.000.00

SON: **QUINIENTOS SETENTA Y UN MIL PESOS MONEDA CORRIENTE**

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-102108-00000-0000

Fecha: 2011-08-11 11:39:37
Tra. 11 PATENTE IYII
Act. 411 PRESENTACION

Dep. 2020 DIR. NUEVAS CR
Eve: 378 FASE NACIONAL I
Folios: 103

COLO: 10975-841-060-8

Sede Centro: Carrera 13 No. 27 - 00 Pisos 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C. - Colombia

Web: www.sic.gov.co e-mail: Info@sic.gov.co Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870284 Línea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240

, Agosto 8 de 2011 - 16:50:45

PATENTE DE INVENCION ☐

MODELO DE UTILIDAD ☐

Art 33 Decisión 486/00

☐ Indicación que se solicita una patente.

☐ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud

☐ Descripción de la invención

☐ Dibujos de ser estos pertinentes

☐ Comprobante de pago de las tasas establecidas (De ser el caso formato de descuento)

Completa ☐ Incompleta ☐

PATENTE DE INVENCION PCT ☒

MODELO DE UTILIDAD PCT ☐

Art.33 Decisión 486/00, Circular Única

☒ Indicación que se solicita una PCT

☒ Copia de la solicitud en español, tal como fue presentada inicialmente (capítulo descriptivo, reivindicatorio, resumen)

☒ Dibujos de ser estos pertinentes

☒ Comprobante de pago de las tasas establecidas (de ser el caso formato de descuento)

Completa ☒ Incompleta ☐

DISEÑO INDUSTRIAL ☐

(Art. 119 Decisión 486/00)

☐ Indicación que se solicita 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 ☐

(Art. 92 Decisión 486/00)

☐ Indicación que se solicita un esquema de trazado

☐ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud

☐ Representación gráfica de un esquema de trazado

☐ Comprobante de pago de las tasas establecidas

Completa ☐ Incompleta ☐