

Derivados heterocíclicos condensados sustituidos por 2-(het)arilo como pesticidas

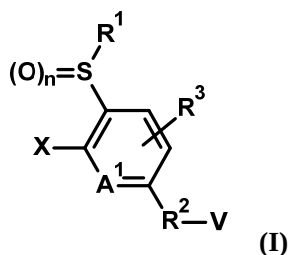
La presente invención se refiere a nuevos derivados heterocíclicos condensados sustituidos por 2-(het)arilo de la fórmula (I), su uso como acaricidas y/o insecticidas para el control de plagas animales, particularmente artrópodos y en especial de insectos y arácnidos y procedimientos y compuestos intermedios para su preparación.

Los derivados heterocíclicos condensados con propiedades insecticidas ya están descriptos por ejemplo en los documentos WO 2010/125985, WO 2012/074135, WO 2012/086848, WO 2013/018928, WO 2013/191113, WO 2014/142292, WO 2014/148451, WO 2015/000715, EP 15153943.4, EP 15153948.3, WO 2015/121136, WO 2015/133603, WO 2015/198859, WO 2015/002211, WO 2015/071180, WO 2015/091945, WO 2016/005263, WO 2015/198817, WO 2016/041819, WO 2016/039441, WO 2016/026848, WO 2016/023954, WO 2016/020286 y WO 2016/046071.

Los agentes ya conocidos de acuerdo a los documentos anteriores sin embargo muestran inconvenientes en su aplicación. Ya sea porque tienen una amplitud de aplicación reducida, ya sea porque no muestran un efecto insecticida o acaricida satisfactorio.

Se encontraron ahora nuevos derivados heterocíclicos condensados sustituidos por 2-(het)arilo que muestran ventajas frente a los compuestos ya conocidos, por ejemplo se mencionan mejores propiedades biológicas o ecológicas, procedimientos de aplicación más amplios, mejores efectos insecticidas, acaricidas así como una buena compatibilidad con plantas útiles. Los derivados heterocíclicos condensados sustituidos por 2-(het)arilo se pueden utilizar en combinación con otros agentes para mejorar la eficacia especialmente contra insectos difíciles de ser controlados.

Objeto de la presente invención son nuevos compuestos de la fórmula (I)



en la que (definición 1)

A¹ representa nitrógeno, =N⁺(O⁻)- o =C(R⁴)-,

R¹ representa (C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)haloalquilo, (C₁-C₆)cianoalquilo, (C₁-C₆)hidroxialquilo, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)haloalcoxi-(C₁-C₆)alquilo, (C₂-C₆)alquenilo, (C₂-C₆)alquenilo-(C₁-C₆)alquilo, (C₂-C₆)haloalquenilo-(C₁-C₆)alquilo, (C₂-C₆)haloalquenilo, (C₂-

- 5 (C₆)cianoalquenilo, (C₂-C₆)alquinilo, (C₂-C₆)alquinioloxi-(C₁-C₆)alquilo, (C₂-C₆)haloalquinioloxi-(C₁-C₆)alquilo, (C₂-C₆)haloalquinilo, (C₂-C₆)cianoalquinilo, (C₃-C₈)cicloalquilo, (C₃-C₈)cicloalquilo-(C₃-C₈)cicloalquilo, (C₁-C₆)alquilo-(C₃-C₈)cicloalquilo, halógeno(C₃-C₈)cicloalquilo, amino, (C₁-C₆)alquilamino, di-(C₁-C₆)alquil-amino, (C₃-C₈)cicloalquilamino, (C₁-C₆)alquilcarbonilo-amino, (C₁-C₆)alquiltio-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)haloalquiltio-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquilsulfinilo-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)haloalquilsulfinil-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquilsulfonilo-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)haloalquilsulfonilo-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alquiltio-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alquilsulfinilo-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alquilsulfonilo-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquilcarbonilo-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)haloalquilcarbonil-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alcoxycarbonil-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)haloalcoxycarbonil-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquilsulfonilamino, aminosulfonil-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquilaminosulfonil-(C₁-C₆)alquilo, di-(C₁-C₆)alquil-aminosulfonil-(C₁-C₆)alquilo,
- 10 o representa (C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alcoxi, (C₂-C₆)alquenilo, (C₂-C₆)alquinilo, (C₃-C₈)cicloalquilo sustituido en cada caso opcionalmente en forma simple o múltiple, idéntico o distinto, por arilo, hetarilo o heterociclilo, donde arilo, hetarilo o heterociclilo en cada caso opcionalmente en forma simple o múltiple, idéntico o distinto pueden estar sustituidos por halógeno, ciano, nitro, hidroxil,
- 15 amino, carboxil, carbamoil, aminosulfonil, (C₁-C₆)alquilo, (C₃-C₆)cicloalquilo, (C₁-C₆)alcoxi, (C₁-C₆)haloalquilo, (C₁-C₆)haloalcoxi, (C₁-C₆)alquiltio, (C₁-C₆)alquilsulfinilo, (C₁-C₆)alquilsulfonilo, (C₁-C₆)alquilsulfimino, (C₁-C₆)alquilsulfimino-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquilsulfimino-(C₂-C₆)alquilcarbonilo, (C₁-C₆)alquilsulfoximino, (C₁-C₆)alquilsulfoximino-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquilsulfoximino-(C₂-C₆)alquilcarbonilo, (C₁-C₆)alcoxycarbonilo, (C₁-C₆)alquilcarbonilo, (C₃-C₆)trialquilsililo o bencilo, o
- 20
- R¹ representa arilo, hetarilo o heterociclilo sustituidos en cada caso opcionalmente en forma simple o múltiple, idéntico o distinto por halógeno, ciano, nitro, hidroxil, amino, carboxil, carbamoil, (C₁-C₆)alquilo, (C₃-C₈)cicloalquilo, (C₁-C₆)alcoxi, (C₁-C₆)haloalquilo, (C₁-C₆)haloalcoxi, (C₁-C₆)alquiltio, (C₁-C₆)alquilsulfinilo, (C₁-C₆)alquilsulfonilo, (C₁-C₆)alquilsulfimino, (C₁-C₆)alquilsulfimino-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquilsulfimino-(C₂-C₆)alquilcarbonilo, (C₁-C₆)alquilsulfoximino, (C₁-C₆)alquilsulfoximino-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquilsulfoximino-(C₂-C₆)alquilcarbonilo, (C₁-C₆)alcoxycarbonilo, (C₁-C₆)alquilcarbonilo, (C₃-C₆)trialquilsililo, (=O) (sólo en el caso de heterociclilo) o (=O)₂ (sólo en el caso de heterociclilo),
- 25
- 30
- R² representa un anillo opcionalmente sustituido en forma simple o múltiple, idéntico o distinto, saturado, parcialmente saturado o heteroaromático, en el que al menos un átomo C está sustituido por un heteroátomo, donde al menos puede estar contenido un grupo carbonilo y/o donde se consideran como sustituyentes: ciano, carboxil, halógeno, nitro, acetil, hidroxil, amino, SCN, tri-(C₁-C₆)alquilsilil, (C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)haloalquilo, (C₁-C₆)cianoalquilo, (C₁-C₆)hidroxialquilo, hidroxycarbonil-(C₁-C₆)alcoxi, (C₁-C₆)alcoxycarbonil-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)
- 35

- 5 C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alquilo, (C₂-C₆)alquenilo, (C₂-C₆)haloalquenilo, (C₂-C₆)cianoalquenilo, (C₂-C₆)alquinilo, (C₂-C₆)haloalquinilo, (C₂-C₆)cianoalquinilo, (C₃-C₆)cicloalquilo, (C₃-C₆)cicloalquilo-(C₃-C₆)cicloalquilo, (C₁-C₄)alquilo-(C₃-C₆)cicloalquilo (C₁-C₆)alcoxi, (C₁-C₆)haloalcoxi, (C₁-C₆)cianoalcoxi, (C₁-C₆)alcoxycarbonil-(C₁-C₆)alcoxi, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alcoxi, (C₁-C₆)alcoxiimino, -N=C(H)-O(C₁-C₆)alquilo, -C(H)=N-O(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)haloalquilo-(C₁-C₆)alcoxiimino, (C₁-C₆)alquiltio, (C₁-C₆)haloalquiltio, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alquiltio, (C₁-C₆)alquiltio-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquilsulfinilo, (C₁-C₆)haloalquilsulfinilo, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alquilsulfinilo, (C₁-C₆)alquilsulfinilo-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquilsulfonilo, (C₁-C₆)haloalquilsulfonilo, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alquilsulfonilo, (C₁-C₆)alquilsulfonilo-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquilsulfoniloxi, (C₁-C₆)alquilcarbonilo, (C₁-C₆)haloalquilcarbonilo, (C₁-C₆)alquilcarboniloxi, (C₁-C₆)alcoxycarbonilo, (C₁-C₆)haloalcoxycarbonilo, aminocarbonilo, (C₁-C₆)alquilaminocarbonilo, di-(C₁-C₆)alquilaminocarbonilo, (C₂-C₆)alquenilaminocarbonilo, di-(C₂-C₆)-alquenilaminocarbonilo, (C₃-C₈)cicloalquilaminocarbonilo, (C₁-C₆)alquilsulfonilamino, (C₁-C₆)alquilamino, di-(C₁-C₆)alquilamino, aminosulfonilo, (C₁-C₆)alquilaminosulfonilo, di-(C₁-C₆)alquilaminosulfonilo, (C₁-C₆)alquilsulfoximino, aminotiocarbonilo, (C₁-C₆)alquilaminotiocarbonilo, di-(C₁-C₆)alquilaminotiocarbonilo, (C₃-C₈)cicloalquilamino, (C₁-C₆)alquilcarbonilamino,
- 10
- 15
- V representa un anillo opcionalmente sustituido en forma simple o múltiple, idéntico o distinto, saturado, parcialmente saturado o heteroaromático, en el que al menos un átomo C está sustituido por un heteroátomo o representa un anillo aromático sustituido en forma simple o múltiple, idéntico o distinto, donde al menos puede estar contenido un grupo carbonilo y/o donde se consideran como sustituyentes: ciano, carboxilo, halógeno, nitro, acetilo, hidroxilo, amino, SCN, tri-(C₁-C₆)alquilsilil, (C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)haloalquilo, (C₁-C₆)cianoalquilo, (C₁-C₆)hidroxialquilo, hidroxycarbonilo-(C₁-C₆)-alcoxi, (C₁-C₆)alcoxycarbonil-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alquilo, (C₂-C₆)alquenilo, (C₂-C₆)haloalquenilo, (C₂-C₆)cianoalquenilo, (C₂-C₆)alquinilo, (C₂-C₆)haloalquinilo, (C₂-C₆)cianoalquinilo, (C₃-C₆)cicloalquilo, (C₃-C₆)cicloalquilo-(C₃-C₆)cicloalquilo, (C₁-C₄)alquilo-(C₃-C₆)cicloalquilo (C₁-C₆)alcoxi, (C₁-C₆)haloalcoxi, (C₁-C₆)cianoalcoxi, (C₁-C₆)alcoxycarbonil-(C₁-C₆)alcoxi, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alcoxi, (C₁-C₆)alcoxiimino, -N=C(H)-O(C₁-C₆)alquilo, -C(H)=N-O(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)haloalquilo-(C₁-C₆)alcoxiimino, (C₁-C₆)alquiltio, (C₁-C₆)haloalquiltio, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alquiltio, (C₁-C₆)alquiltio-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquilsulfinilo, (C₁-C₆)haloalquilsulfinilo, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alquilsulfinilo, (C₁-C₆)alquilsulfinilo-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquilsulfonilo, (C₁-C₆)haloalquilsulfonilo, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alquilsulfonilo, (C₁-C₆)alquilsulfonilo-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquilsulfoniloxi, (C₁-C₆)alquilcarbonilo, (C₁-C₆)haloalquilcarbonilo, (C₁-C₆)alquilcarboniloxi, (C₁-C₆)alcoxycarbonilo, (C₁-C₆)haloalcoxycarbonilo, aminocarbonilo, (C₁-C₆)alquilaminocarbonilo, di-(C₁-C₆)alquilaminocarbonilo, (C₂-C₆)alquenilaminocarbonilo, di-(C₂-C₆)-alquenilaminocarbonilo, (C₃-C₈)cicloalquilaminocarbonilo, (C₁-C₆)alquilsulfonilamino, (C₁-C₆)alquilamino, di-(C₁-C₆)
- 20
- 25
- 30
- 35

C₆alquilamino, aminosulfonilo, (C₁-C₆)alquilaminosulfonilo, di-(C₁-C₆)alquilaminosulfonilo, (C₁-C₆)alquilsulfoximino, aminotiocarbonilo, (C₁-C₆)alquilaminotiocarbonilo, di-(C₁-C₆)alquilaminotiocarbonilo, (C₃-C₈)cicloalquilamino, (C₁-C₆)alquilcarbonilamino,

R³ representa hidrógeno, ciano, halógeno, nitro, acetilo, hidroxí, amino, SCN, tri-(C₁-C₆)alquilsilil, (C₃-C₈)cicloalquilo, (C₃-C₈)cicloalquilo-(C₃-C₈)cicloalquilo, (C₁-C₆)alquilo-(C₃-C₈)cicloalquilo, halógeno(C₃-C₈)cicloalquilo, (C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)haloalquilo, (C₁-C₆)cianoalquilo, (C₁-C₆)hidroxialquilo, hidroxicarbonilo-(C₁-C₆)-alcoxi, (C₁-C₆)alcoxicarbonil-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alquilo, (C₂-C₆)alquenilo, (C₂-C₆)haloalquenilo, (C₂-C₆)cianoalquenilo, (C₂-C₆)alquinilo, (C₂-C₆)haloalquinilo, (C₂-C₆)cianoalquinilo, (C₁-C₆)alcoxi, (C₁-C₆)haloalcoxi, (C₁-C₆)cianoalcoxi, (C₁-C₆)alcoxicarbonil-(C₁-C₆)alcoxi, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alcoxi, (C₁-C₆)alquilhidroxiimino, (C₁-C₆)alcoxiimino, (C₁-C₆)alquilo-(C₁-C₆)alcoxiimino, (C₁-C₆)haloalquilo-(C₁-C₆)alcoxiimino, (C₁-C₆)alquiltio, (C₁-C₆)haloalquiltio, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alquiltio, (C₁-C₆)alquiltio-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquilsulfinilo, (C₁-C₆)haloalquilsulfinilo, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alquilsulfinilo, (C₁-C₆)alquilsulfinilo-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquilsulfonilo, (C₁-C₆)haloalquilsulfonilo, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alquilsulfonilo, (C₁-C₆)alquilsulfonilo-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquilsulfoniloxi, (C₁-C₆)alquilcarbonilo, (C₁-C₆)alquiltiocarbonilo, (C₁-C₆)haloalquilcarbonilo, (C₁-C₆)alquilcarboniloxi, (C₁-C₆)alcoxicarbonilo, (C₁-C₆)haloalcoxicarbonilo, aminocarbonilo, (C₁-C₆)alquilaminocarbonilo, (C₁-C₆)alquilaminotiocarbonilo, di-(C₁-C₆)alquil-aminocarbonilo, di-(C₁-C₆)alquil-aminotiocarbonilo, (C₂-C₆)alquenilaminocarbonilo, di-(C₂-C₆)-alquenilaminocarbonilo, (C₃-C₈)cicloalquilaminocarbonilo, (C₁-C₆)alquilsulfonilamino, (C₁-C₆)alquilamino, di-(C₁-C₆)alquilamino, aminosulfonilo, (C₁-C₆)alquilaminosulfonilo, di-(C₁-C₆)alquil-aminosulfonilo, (C₁-C₆)alquilsulfoximino, aminotiocarbonilo, (C₁-C₆)alquilaminotiocarbonilo, di-(C₁-C₆)alquil-aminotiocarbonilo, (C₃-C₈)cicloalquilamino, NHCO-(C₁-C₆)alquilo ((C₁-C₆)alquilcarbonilamino),

representa en cada caso opcionalmente en forma simple o múltiple, idéntico o distinto, en forma independiente arilo o hetarilo sustituido, donde (en el caso de hetarilo) opcionalmente puede contener al menos un grupo carbonilo y/o donde se consideran como sustituyentes: ciano, carboxilo, halógeno, nitro, acetilo, hidroxil, amino, SCN, tri-(C₁-C₆)alquilsilil, (C₃-C₈)cicloalquilo, (C₃-C₈)cicloalquilo-(C₃-C₈)cicloalquilo, (C₁-C₆)alquilo-(C₃-C₈)cicloalquilo, halógeno(C₃-C₈)cicloalquilo, (C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)haloalquilo, (C₁-C₆)cianoalquilo, (C₁-C₆)hidroxialquilo, hidroxicarbonilo-(C₁-C₆)-alcóxido, (C₁-C₆)alcóxicarbonil-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alcóxido-(C₁-C₆)alquilo, (C₂-C₆)alquenilo, (C₂-C₆)haloalquenilo, (C₂-C₆)cianoalquenilo, (C₂-C₆)alquinilo, (C₂-C₆)haloalquinilo, (C₂-C₆)cianoalquinilo, (C₁-C₆)alcóxido, (C₁-C₆)haloalcóxido, (C₁-C₆)cianoalcóxido, (C₁-C₆)alcóxicarbonil-(C₁-C₆)alcóxido, (C₁-C₆)alcóxido-(C₁-C₆)alcóxido, (C₁-C₆)alquilhidroxiiimino, (C₁-C₆)alcóxiimino, (C₁-C₆)alquilo-(C₁-C₆)alcóxiimino, (C₁-C₆)haloalquilo-(C₁-C₆)alcóxiimino, (C₁-C₆)alquitio, (C₁-C₆)haloalquitio, (C₁-C₆)alcóxido-(C₁-C₆)alquitio.

- C₆)alquiltio, (C₁-C₆)alquiltio-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquilsulfinilo, (C₁-C₆)haloalquilsulfinilo,
 (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alquilsulfinilo, (C₁-C₆)alquilsulfinilo-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-
 C₆)alquilsulfonilo, (C₁-C₆)haloalquilsulfonilo, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alquilsulfonilo, (C₁-
 C₆)alquilsulfonilo-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquilsulfoniloxi, (C₁-C₆)alquilcarbonilo, (C₁-
 5 C₆)haloalquilcarbonilo, (C₁-C₆)alquilcarboniloxi, (C₁-C₆)alcoxycarbonilo, (C₁-
 C₆)haloalcoxycarbonilo, aminocarbonilo, (C₁-C₆)alquilaminocarbonilo, di-(C₁-C₆)alquil-
 aminocarbonilo, (C₂-C₆)alquenilaminocarbonilo, di-(C₂-C₆)-alquenilaminocarbonilo, (C₃-
 C₈)cicloalquilaminocarbonilo, (C₁-C₆)alquilsulfonilamino, (C₁-C₆)alquilamino, di-(C₁-
 C₆)alquilamino, aminosulfonilo, (C₁-C₆)alquilaminosulfonilo, di-(C₁-C₆)alquilaminosulfonilo,
 10 (C₁-C₆)alquilsulfoximino, aminotiocarbonilo, (C₁-C₆)alquilaminotiocarbonilo, di-(C₁-
 C₆)alquilaminotiocarbonilo, (C₃-C₈)cicloalquilamino, (C₁-C₆)alquilcarbonilamino,
- R⁴ representa hidrógeno, ciano, halógeno, nitro, acetilo, hidroxilo, amino, SCN, tri-(C₁-C₆)alquilsilil,
 (C₃-C₈)cicloalquilo, (C₃-C₈)cicloalquilo-(C₃-C₈)cicloalquilo, (C₁-C₆)alquilo-(C₃-C₈)cicloalquilo,
 halógeno(C₃-C₈)cicloalquilo, (C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)haloalquilo, (C₁-C₆)cianoalquilo, (C₁-
 15 C₆)hidroxialquilo, hidroxycarbonilo-(C₁-C₆)-alcoxi, (C₁-C₆)alcoxycarbonil-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-
 C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alquilo, (C₂-C₆)alquenilo, (C₂-C₆)haloalquenilo, (C₂-C₆)cianoalquenilo, (C₂-
 C₆)alquinilo, (C₂-C₆)haloalquinilo, (C₂-C₆)cianoalquinilo, (C₁-C₆)alcoxi, (C₁-C₆)haloalcoxi, (C₁-
 C₆)cianoalcoxi, (C₁-C₆)alcoxycarbonil-(C₁-C₆)alcoxi, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alcoxi, (C₁-
 C₆)alquilhidroxiimino, (C₁-C₆)alcoxiimino, (C₁-C₆)alquilo-(C₁-C₆)alcoxiimino, (C₁-
 20 C₆)haloalquilo-(C₁-C₆)alcoxiimino, (C₁-C₆)alquiltio, (C₁-C₆)haloalquiltio, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-
 C₆)alquiltio, (C₁-C₆)alquiltio-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquilsulfinilo, (C₁-C₆)haloalquilsulfinilo,
 (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alquilsulfinilo, (C₁-C₆)alquilsulfinilo-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-
 C₆)alquilsulfonilo, (C₁-C₆)haloalquilsulfonilo, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alquilsulfonilo, (C₁-
 C₆)alquilsulfonilo-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquilsulfoniloxi, (C₁-C₆)alquilcarbonilo, (C₁-
 25 C₆)alquiltiocarbonilo, (C₁-C₆)haloalquilcarbonilo, (C₁-C₆)alquilcarboniloxi, (C₁-
 C₆)alcoxycarbonilo, (C₁-C₆)haloalcoxycarbonilo, aminocarbonilo, (C₁-C₆)alquilaminocarbonilo,
 (C₁-C₆)alquilaminotiocarbonilo, di-(C₁-C₆)alquil-aminocarbonilo, di-(C₁-C₆)alquil-
 aminotiocarbonilo, (C₂-C₆)alquenilaminocarbonilo, di-(C₂-C₆)-alquenilaminocarbonilo, (C₃-
 C₈)cicloalquilaminocarbonilo, (C₁-C₆)alquilsulfonilamino, (C₁-C₆)alquilamino, di-(C₁-
 30 C₆)alquilamino, aminosulfonilo, (C₁-C₆)alquilaminosulfonilo, di-(C₁-C₆)alquil-aminosulfonilo,
 (C₁-C₆)alquilsulfoximino, aminotiocarbonilo, (C₁-C₆)alquilaminotiocarbonilo, di-(C₁-C₆)alquil-
 aminotiocarbonilo, (C₃-C₈)cicloalquilamino o -NHCO-(C₁-C₆)alquilo ((C₁-
 C₆)alquilcarbonilamino),
- X representa un sistema de anillos condensados, bi- o tricíclico, parcialmente saturado o saturado,
 35 heterocíclico o heteroaromático de 8, 9 10, 11 o 12 miembros, que puede contener al menos un
 grupo carbonilo y/o donde el sistema de anillos opcionalmente pueden estar sustituidos en forma
 simple o múltiple, idéntico o distinto y donde los sustituyentes pueden ser seleccionados

- independientemente de hidrógeno, ciano, halógeno, nitro, acetilo, hidroxilo, amino, SCN, tri-(C₁-C₆)alquilsilil, (C₃-C₈)cicloalquilo, (C₃-C₈)cicloalquilo-(C₃-C₈)cicloalquilo, (C₁-C₆)alquilo-(C₃-C₈)cicloalquilo, halógeno(C₃-C₈)cicloalquilo, (C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)haloalquilo, (C₁-C₆)cianoalquilo, (C₁-C₆)hidroxialquilo, hidroxicarbonilo-(C₁-C₆)-alcoxi, (C₁-C₆)alcoxycarbonil-
- 5 (C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alquilo, (C₂-C₆)alqueno, (C₂-C₆)haloalqueno, (C₂-C₆)cianoalqueno, (C₂-C₆)alquino, (C₂-C₆)alquinoxil-(C₁-C₄)alquilo, (C₂-C₆)haloalquino, (C₂-C₆)cianoalquino, (C₁-C₆)alcoxi, (C₁-C₆)haloalcoxi, (C₁-C₆)haloalcoxi-(C₁-C₆)alquilo, (C₂-C₆)alquinoxil-(C₁-C₆)alquilo, (C₂-C₆)haloalquinoxil-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)cianoalcoxi, (C₁-C₆)alcoxycarbonil-(C₁-C₆)alcoxi, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alcoxi, (C₁-C₆)alquilhidroxilimino, (C₁-
- 10 C₆)alcoxilimino, (C₁-C₆)alquilo-(C₁-C₆)alcoxilimino, (C₁-C₆)haloalquilo-(C₁-C₆)alcoxilimino, (C₁-C₆)alquiltio, (C₁-C₆)haloalquiltio, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alquiltio, (C₁-C₆)alquiltio-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquilsulfino, (C₁-C₆)haloalquilsulfino, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alquilsulfino, (C₁-C₆)alquilsulfino-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquilsulfono, (C₁-C₆)haloalquilsulfono, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alquilsulfono, (C₁-C₆)alquilsulfono-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquilsulfinoxil,
- 15 (C₁-C₆)alquilcarbonilo, (C₁-C₆)alquilcarbonilo-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquiltiocarbonilo, (C₁-C₆)haloalquilcarbonilo, (C₁-C₆)alquilcarboniloxil, (C₁-C₆)alcoxycarbonilo, (C₁-C₆)haloalcoxycarbonilo, aminocarbonilo, (C₁-C₆)alquilaminocarbonilo, (C₁-C₆)alquilaminotiocarbonilo, di-(C₁-C₆)alquil-aminocarbonilo, di-(C₁-C₆)alquil-aminotiocarbonilo, (C₂-C₆)alquenalaminocarbonilo, di-(C₂-C₆)-alquenalaminocarbonilo, (C₃-C₈)cicloalquilaminocarbonilo, (C₁-C₆)alquilsulfonilamino, (C₁-C₆)alquilamino, di-(C₁-C₆)alquilamino, aminosulfono, (C₁-C₆)alquilaminosulfono, di-(C₁-C₆)alquil-aminosulfono, (C₁-C₆)alquilsulfoximino, aminotiocarbonilo, (C₁-C₆)alquilaminotiocarbonilo, di-(C₁-C₆)alquil-aminotiocarbonilo, (C₃-C₈)cicloalquilamino, NHCO-(C₁-C₆)alquilo ((C₁-C₆)alquilcarbonilamino),
- 20 o donde los sustituyentes pueden ser seleccionados independientemente de fenilo o de un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, en el que el fenilo o el anillo opcionalmente pueden estar sustituidos en forma simple o múltiple, idéntico o distinto por C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₂-C₆-haloalqueno, C₂-C₆-haloalquino, C₃-C₆-halocicloalquilo, halógeno, CN, NO₂, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi,
- 25 n representa 0, 1 o 2.

Además se ha encontrado que los compuestos de la fórmula (I) tienen una muy buena eficacia como pesticidas, preferentemente como insecticidas y/o acaricidas. Por otra parte, por regla general son muy bien tolerados por las plantas de cultivo.

- Los compuestos de la invención se definen en forma general por la fórmula (I). Los sustituyentes o
- 35 intervalos preferidos de los radicales que aparecen en las fórmulas arriba mencionadas o mencionadas a continuación, se explican a continuación:

Descripción 2

- A¹ representa preferentemente nitrógeno, =N⁺(O⁻)- o =C(R⁴)-,
- R¹ representa preferentemente (C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄)hidroxialquilo, (C₁-C₄)haloalquilo, (C₁-C₄)cianoalquilo, (C₁-C₄)alcoxi-(C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄)haloalcoxi-(C₁-C₄)alquilo, (C₂-C₄)alquenilo, (C₂-C₄)alqueniloxi-(C₁-C₄)alquilo, (C₂-C₄)haloalqueniloxi-(C₁-C₄)alquilo, (C₂-C₄)haloalquenilo, (C₂-C₄)cianoalquenilo, (C₂-C₄)alquinilo, (C₂-C₄)alquiniloxi-(C₁-C₄)alquilo, (C₂-C₄)haloalquiniloxi-(C₁-C₄)alquilo, (C₂-C₄)haloalquinilo, (C₂-C₄)cianoalquinilo, (C₃-C₆)cicloalquilo, (C₃-C₆)cicloalquilo(C₃-C₆)cicloalquilo, (C₁-C₄)alquilo-(C₃-C₆)cicloalquilo, halógeno(C₃-C₆)cicloalquilo, (C₁-C₄)alquilamino, di-(C₁-C₄)alquil-amino, (C₃-C₆)cicloalquilamino, (C₁-C₄)alquilcarbonilo-amino, (C₁-C₄)alquiltio-(C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄)haloalquiltio-(C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄)alquilsulfinilo-(C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄)haloalquilsulfinil-(C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄)alquilsulfonilo-(C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄)alquilcarbonilo-(C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄)haloalquilcarbonil-(C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄)alquilsulfonilamino,
- o representa (C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄)alcoxi, (C₂-C₄)alquenilo, (C₂-C₄)alquinilo, (C₃-C₆)cicloalquilo sustituido en cada caso opcionalmente en forma simple o doble, idéntico o distinto por arilo, hetarilo o heterociclilo, donde arilo, hetarilo o heterociclilo pueden estar sustituidos opcionalmente en cada caso en forma simple o doble, idéntico o distinto por halógeno, ciano, carbamoil, aminosulfinilo, (C₁-C₄)alquilo, (C₃-C₄)cicloalquilo, (C₁-C₄)alcoxi, (C₁-C₄)haloalquilo, (C₁-C₄)haloalcoxi, (C₁-C₄)alquiltio, (C₁-C₄)alquilsulfinilo, (C₁-C₄)alquilsulfonilo, (C₁-C₄)alquilsulfimino, o
- R¹ representa preferentemente arilo, hetarilo o heterociclilo sustituido en cada caso opcionalmente en forma simple o doble, idéntico o distinto por halógeno, ciano, carbamoil, (C₁-C₄)alquilo, (C₃-C₆)cicloalquilo, (C₁-C₄)alcoxi, (C₁-C₄)haloalquilo, (C₁-C₄)haloalcoxi, (C₁-C₄)alquiltio, (C₁-C₄)alquilsulfinilo, (C₁-C₄)alquilsulfonilo, (C₁-C₄)alquilsulfimino, (C₁-C₄)alquilsulfoximino, (C₁-C₄)alquilcarbonilo, (C₃-C₄)trialquilsililo, (=O) (sólo en el caso de heterociclilo) o (=O)₂ (sólo en el caso de heterociclilo),
- R² representa preferentemente un anillo saturado, parcialmente saturado o heteroaromático opcionalmente sustituido en cada caso en forma simple o doble, idéntico o distinto, en el que al menos un átomo C está sustituido por un heteroátomo del grupo N, O o S, donde al menos puede estar contenido un grupo carbonilo y/o donde como sustituyentes se consideran: ciano, halógeno, nitro, acetilo, amino, (C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄)haloalquilo, (C₁-C₄)cianoalquilo, (C₁-C₄)hidroxialquilo, (C₁-C₄)alcoxi-(C₁-C₄)alquilo, (C₂-C₄)alquenilo, (C₂-C₄)haloalquenilo, (C₂-C₄)cianoalquenilo, (C₂-C₄)alquinilo, (C₂-C₄)haloalquinilo, (C₂-C₄)cianoalquinilo, (C₃-C₆)cicloalquilo, (C₃-C₆)cicloalquilo-(C₃-C₆)cicloalquilo, (C₁-C₄)alquilo-(C₃-C₆)cicloalquilo, (C₁-C₄)alcoxi, (C₁-C₄)haloalcoxi, (C₁-C₄)cianoalcoxi, (C₁-C₄)alcoxi-(C₁-C₄)alcoxi, (C₁-

- aminocarbonilo, aminotiocarbonilo, (C₁-C₄)alquilaminocarbonilo, di-(C₁-C₄)alquilaminocarbonilo, (C₁-C₄)alquilsulfonilamino, (C₁-C₄)alquilamino, di-(C₁-C₄)alquilamino, aminosulfonilo, (C₁-C₄)alquilaminosulfonilo, di-(C₁-C₄)alquil-aminosulfonilo, aminotiocarbonilo, NHCO-(C₁-C₄)alquilo ((C₁-C₄)alquilcarbonilamino),
- 5 representa además preferentemente en cada caso opcionalmente en forma simple o doble, idéntico o distinto, en forma independiente fenilo o hetarilo, donde (en el caso de hetarilo) opcionalmente puede contener al menos un grupo carbonilo y/o donde se consideran como sustituyentes: ciano, halógeno, nitro, acetilo, amino, (C₃-C₆)cicloalquilo, (C₃-C₆)cicloalquilo-(C₃-C₆)cicloalquilo, (C₁-C₄)alquilo-(C₃-C₆)cicloalquilo, halógeno(C₃-C₆)cicloalquilo, (C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄)haloalquilo,
- 10 (C₁-C₄)cianoalquilo, (C₁-C₄)hidroxialquilo, (C₁-C₄)alcoxi-(C₁-C₄)alquilo, (C₂-C₄)alquenilo, (C₂-C₄)haloalquenilo, (C₂-C₄)cianoalquenilo, (C₂-C₄)alquinilo, (C₂-C₄)haloalquinilo, (C₂-C₄)cianoalquinilo, (C₁-C₄)alcoxi, (C₁-C₄)haloalcoxi, (C₁-C₄)cianoalcoxi, (C₁-C₄)alcoxi-(C₁-C₄)alcoxi, (C₁-C₄)alquilhidroxiimino, (C₁-C₄)alcoxiimino, (C₁-C₄)alquilo-(C₁-C₄)alcoxiimino, (C₁-C₄)haloalquilo-(C₁-C₄)alcoxiimino, (C₁-C₄)alquiltio, (C₁-C₄)haloalquiltio, (C₁-C₄)alquiltio-
- 15 (C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄)alquilsulfinilo, (C₁-C₄)haloalquilsulfinilo, (C₁-C₄)alquilsulfinilo-(C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄)alquilsulfonilo, (C₁-C₄)haloalquilsulfonilo, (C₁-C₄)alquilsulfonilo-(C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄)alquilsulfoniloxi, (C₁-C₄)alquilcarbonilo, (C₁-C₄)haloalquilcarbonilo, aminocarbonilo, (C₁-C₄)alquilaminocarbonilo, di-(C₁-C₄)alquil-aminocarbonilo, (C₁-C₄)alquilsulfonilamino, (C₁-C₄)alquilamino, di-(C₁-C₄)alquilamino, aminosulfonilo, (C₁-C₄)alquilaminosulfonilo, di-(C₁-C₄)alquilaminosulfonilo, NHCO-(C₁-C₄)alquilo ((C₁-C₄)alquilcarbonilamino),
- 20
- R⁴ representa preferentemente hidrógeno, ciano, halógeno, nitro, acetilo, hidroxilo, amino, SCN, tri-
- 25 (C₁-C₄)alquilsilil, (C₃-C₆)cicloalquilo, (C₃-C₆)cicloalquilo-(C₃-C₆)cicloalquilo, (C₁-C₄)alquilo-(C₃-C₆)cicloalquilo, halógeno(C₃-C₆)cicloalquilo, (C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄)haloalquilo, (C₁-C₄)cianoalquilo, (C₁-C₄)hidroxialquilo, (C₁-C₄)alcoxi-(C₁-C₄)alquilo, (C₂-C₄)alquenilo, (C₂-C₄)haloalquenilo, (C₂-C₄)cianoalquenilo, (C₂-C₄)alquinilo, (C₂-C₄)haloalquinilo, (C₂-C₄)cianoalquinilo, (C₁-C₄)alcoxi, (C₁-C₄)haloalcoxi, (C₁-C₄)cianoalcoxi, (C₁-C₄)alcoxi-(C₁-C₄)alcoxi, (C₁-C₄)alquilhidroxiimino, (C₁-C₄)alcoxiimino, (C₁-C₄)alquilo-(C₁-C₄)alcoxiimino, (C₁-C₄)haloalquilo-(C₁-C₄)alcoxiimino, (C₁-C₄)alquiltio, (C₁-C₄)haloalquiltio, (C₁-C₄)alquiltio-
- 30 (C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄)alquilsulfinilo, (C₁-C₄)haloalquilsulfinilo, (C₁-C₄)alquilsulfinilo-(C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄)alquilsulfonilo, (C₁-C₄)haloalquilsulfonilo, (C₁-C₄)alquilsulfonilo-(C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄)alquilsulfoniloxi, (C₁-C₄)alquilcarbonilo, (C₁-C₄)haloalquilcarbonilo, aminocarbonilo, aminotiocarbonilo, (C₁-C₄)alquilaminocarbonilo, di-(C₁-C₄)alquilaminocarbonilo, (C₁-C₄)alquilsulfonilamino, (C₁-C₄)alquilamino, di-(C₁-C₄)alquilamino, aminosulfonilo, (C₁-C₄)alquilaminosulfonilo, di-(C₁-C₄)alquil-aminosulfonilo, aminotiocarbonilo o NHCO-(C₁-C₄)alquilo ((C₁-C₄)alquilcarbonilamino),
- 35

- X representa preferentemente un sistema de anillos condensados heteroaromático, bi- o tricíclico de 8, 9, 10, 11 o 12 miembros, en el que el sistema de anillos opcionalmente está sustituido en forma simple o múltiple, idéntico o distinto, y donde los sustituyentes pueden ser seleccionados independientemente de hidrógeno, ciano, halógeno, nitro, acetilo, hidroxilo, amino, SCN, tri-(C₁-C₆)alquilsilil, (C₃-C₈)cicloalquilo, (C₃-C₈)cicloalquilo-(C₃-C₈)cicloalquilo, (C₁-C₆)alquilo-(C₃-C₈)cicloalquilo, halógeno(C₃-C₈)cicloalquilo, (C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)haloalquilo, (C₁-C₆)cianoalquilo, (C₁-C₆)hidroxialquilo, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alquilo, (C₂-C₆)alquenilo, (C₂-C₆)haloalquenilo, (C₂-C₆)cianoalquenilo, (C₂-C₆)alquinilo, (C₂-C₆)alquiniloxi-(C₁-C₄)alquilo, (C₂-C₆)haloalquinilo, (C₁-C₆)alcoxi, (C₁-C₆)haloalcoxi, (C₁-C₆)haloalcoxi-(C₁-C₆)alquilo, (C₂-C₆)alqueniloxi-(C₁-C₆)alquilo, (C₂-C₆)haloalqueniloxi-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)cianoalcoxi, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alcoxi, (C₁-C₆)alquilhidroxiiimino, (C₁-C₆)alcoxiimino, (C₁-C₆)alquilo-(C₁-C₆)alcoxiimino, (C₁-C₆)alquiltio, (C₁-C₆)haloalquiltio, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alquiltio, (C₁-C₆)alquiltio-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquilsulfinilo, (C₁-C₆)haloalquilsulfinilo, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alquilsulfinilo, (C₁-C₆)alquilsulfinilo-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquilsulfonilo, (C₁-C₆)haloalquilsulfonilo, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alquilsulfonilo, (C₁-C₆)alquilsulfonilo-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquilsulfoniloxi, (C₁-C₆)alquilcarbonilo, (C₁-C₆)alquilcarbonilo-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquiltiocarbonilo, (C₁-C₆)haloalquilcarbonilo, (C₁-C₆)alquilcarboniloxi, (C₁-C₆)alcoxycarbonilo, (C₁-C₆)haloalcoxycarbonilo, aminocarbonilo, (C₁-C₆)alquilaminocarbonilo, (C₁-C₆)alquilaminotiocarbonilo, di-(C₁-C₆)alquil-aminocarbonilo, di-(C₁-C₆)alquilaminotiocarbonilo, (C₃-C₈)cicloalquilaminocarbonilo, (C₁-C₆)alquilsulfonilamino, (C₁-C₆)alquilamino, di-(C₁-C₆)alquilamino, aminosulfonilo, (C₁-C₆)alquilaminosulfonilo, di-(C₁-C₆)alquil-aminosulfonilo, (C₁-C₆)alquilsulfoximino, aminotiocarbonilo, (C₁-C₆)alquilaminotiocarbonilo, di-(C₁-C₆)alquil-aminotiocarbonilo, (C₃-C₈)cicloalquilamino, NHCO-(C₁-C₆)alquilo ((C₁-C₆)alquilcarbonilamino),

o donde los sustituyentes pueden ser seleccionados independientemente de fenilo o de un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, en el que el fenilo o el anillo opcionalmente pueden estar sustituidos en forma simple o múltiple, idéntico o distinto por C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-haloalquinilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, halógeno, CN, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi,

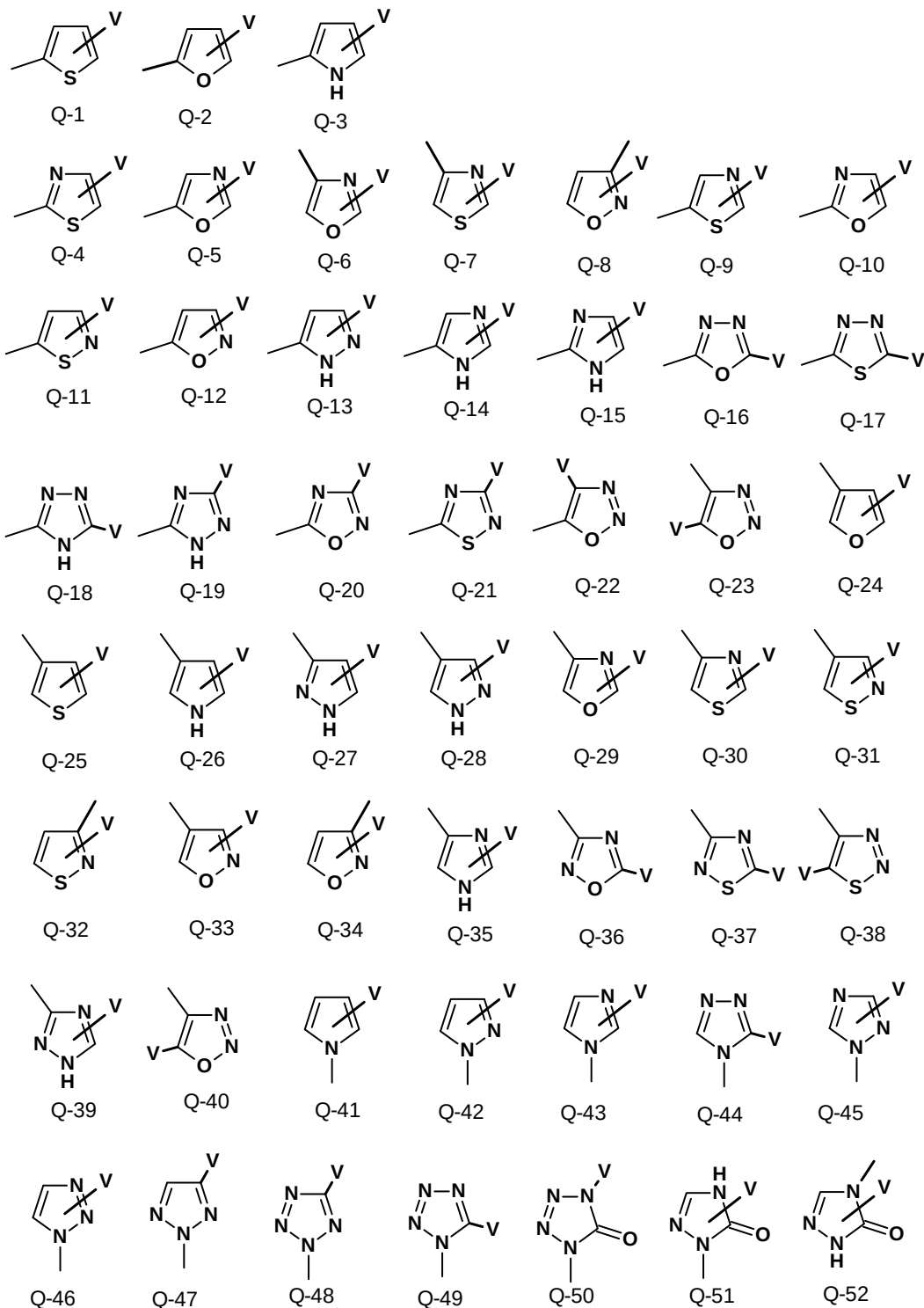
n representa preferentemente 0, 1 o 2.

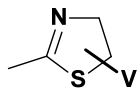
Descripción 3-1

- A¹ representa en forma especialmente preferente nitrógeno o =C(R⁴)-,
- R¹ representa en forma especialmente preferente (C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄)hidroxialquilo, (C₁-C₄)haloalquilo, (C₂-C₄)alqueno, (C₂-C₄)haloalqueno, (C₂-C₄)alquino, (C₂-C₄)haloalquino, (C₃-C₆)cicloalquilo, (C₁-C₄)alquiltio-(C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄)alquilsulfino-(C₁-C₄)alquilo o (C₁-

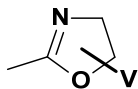
C_4)alquilsulfonilo-(C_1 - C_4)alquilo,

R^2 -V representa en forma especialmente preferente un anillo de 5 o 6 miembros, opcionalmente sustituido en forma simple o doble, idéntico o distinto, de la serie Q-1 a Q-80, donde como sustituyentes se consideran: ciano, halógeno, (C_1 - C_4)alquilo, (C_1 - C_4)alcoxi o (C_1 - C_4)haloalcoxi,

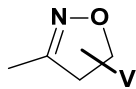




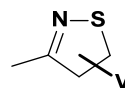
Q-53



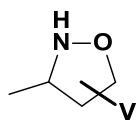
Q-54



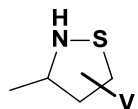
Q-55



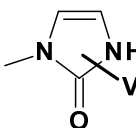
Q-56



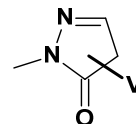
Q-57



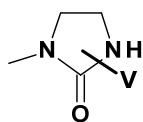
Q-58



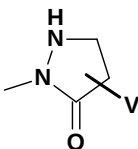
Q-59



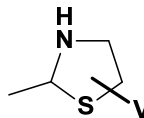
Q-60



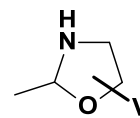
Q-61



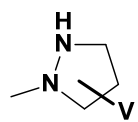
Q-62



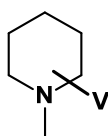
Q-63



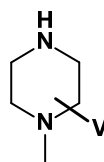
Q-64



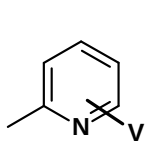
Q-65



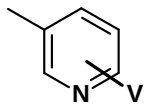
Q-66



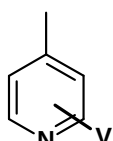
Q-67



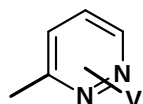
Q-68



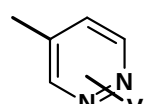
Q-69



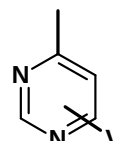
Q-70



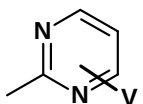
Q-71



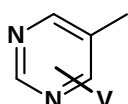
Q-72



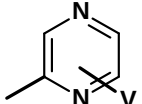
Q-73



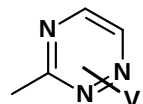
Q-74



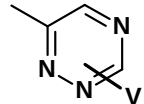
Q-75



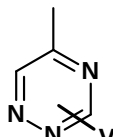
Q-76



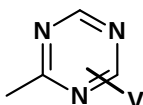
Q-77



Q-78



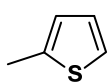
Q-79



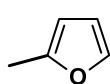
Q-80

donde

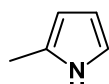
- V representa en forma especialmente preferente un anillo de 5 o 6 miembros, opcionalmente sustituido en forma simple o doble, idéntico o distinto, de la serie V-1 a V-101, donde como
- 5 sustituyentes se consideran: ciano, halógeno, (C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄)alcoxi o (C₁-C₄)haloalcoxi,



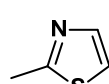
V-1



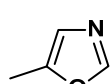
V-2



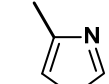
V-3



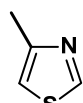
V-4



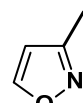
V-5



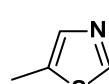
V-6



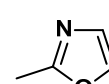
V-7



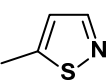
V-8



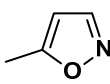
V-9



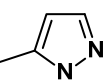
V-10



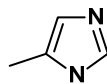
V-11



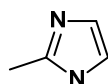
V-12



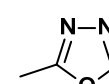
V-13



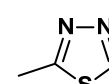
V-14



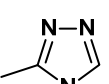
V-15



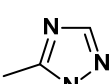
V-16



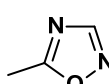
V-17



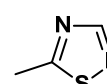
V-18



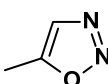
V-19



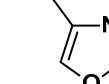
V-20



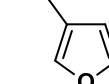
V-21



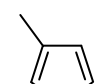
V-22



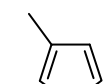
V-23



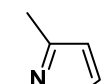
V-24



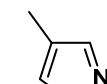
V-25



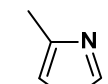
V-26



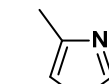
V-27



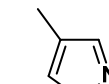
V-28



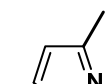
V-29



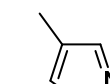
V-30



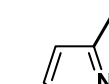
V-31



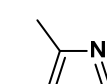
V-32



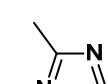
V-33



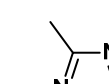
V-34



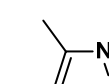
V-35



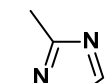
V-36



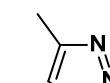
V-37



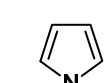
V-38



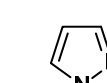
V-39



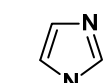
V-40



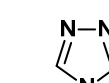
V-41



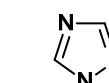
V-42



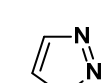
V-43



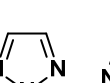
V-44



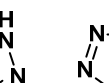
V-45



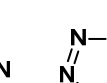
V-46



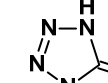
V-47



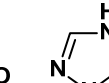
V-48



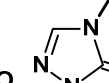
V-49



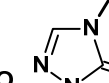
V-50



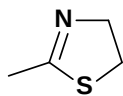
V-51



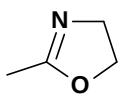
V-52



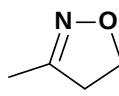
V-53



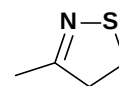
V-54



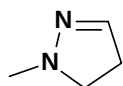
V-55



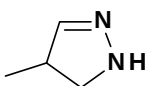
V-56



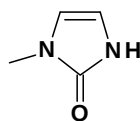
V-57



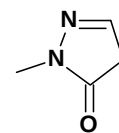
V-58



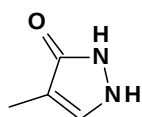
V-59



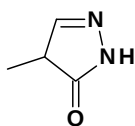
V-60



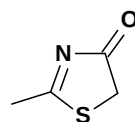
V-61



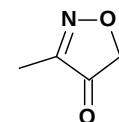
V-62



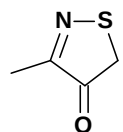
V-63



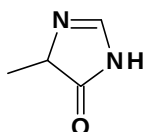
V-64



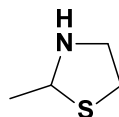
V-65



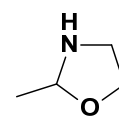
V-66



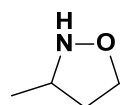
V-67



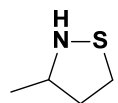
V-68



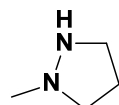
V-69



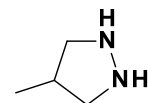
V-70



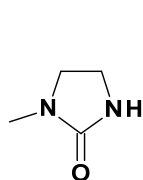
V-71



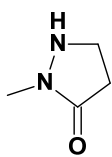
V-72



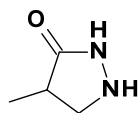
V-73



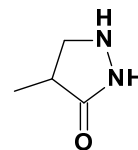
V-74



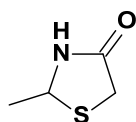
V-75



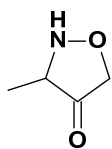
V-76



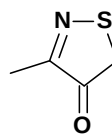
V-77



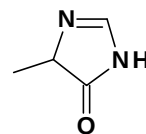
V-78



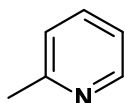
V-79



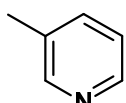
V-80



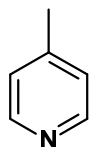
V-81



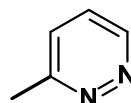
V-82



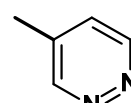
V-83



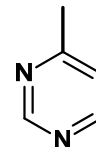
V-84



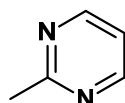
V-85



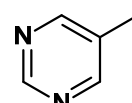
V-86



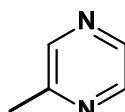
V-87



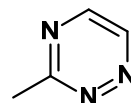
V-88



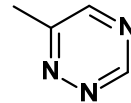
V-89



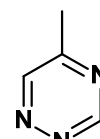
V-90



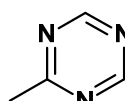
V-91



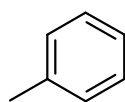
V-92



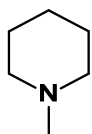
V-93



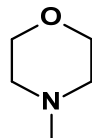
V-94



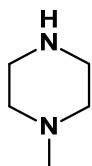
V-95



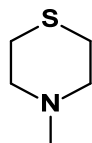
V-96



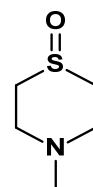
V-97



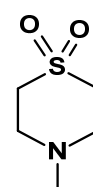
V-98



V-99

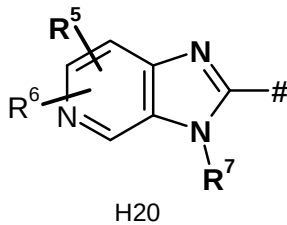
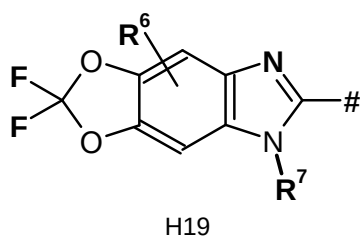
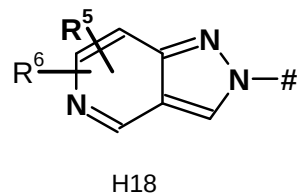
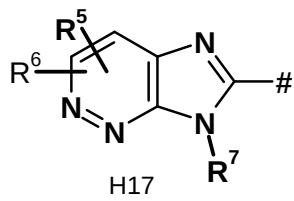
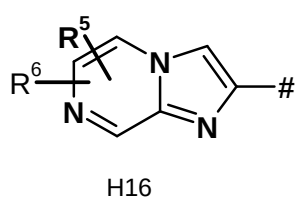
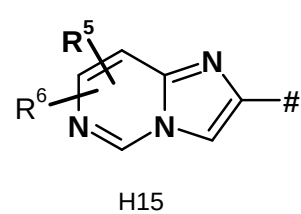
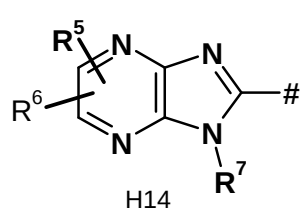
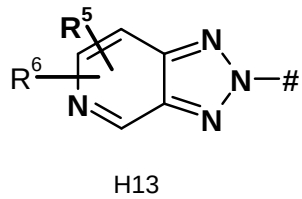
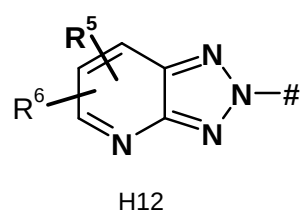
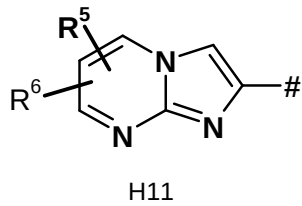
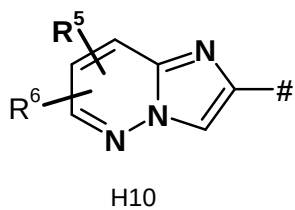
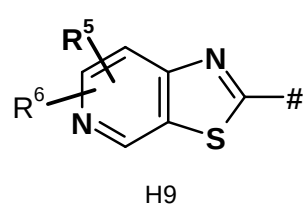
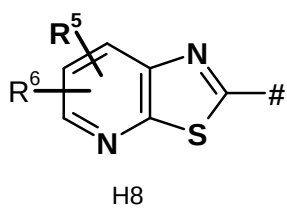
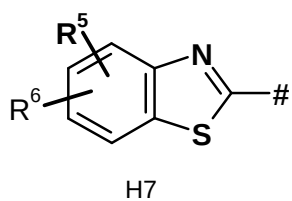
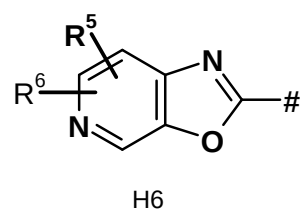
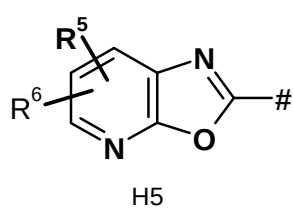
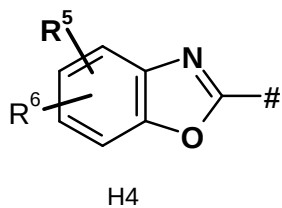
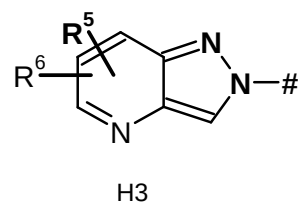
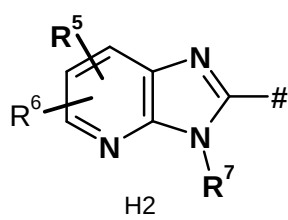
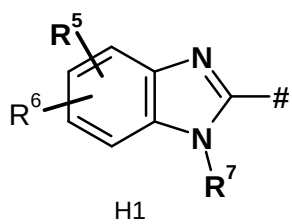


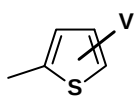
V-100



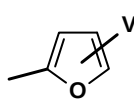
V-101

R³ representa en forma especialmente preferente hidrógeno, ciano, halógeno, nitro, hidroxilo, amino,

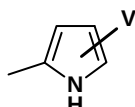




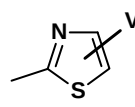
Q-1



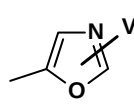
Q-2



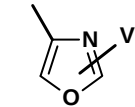
Q-3



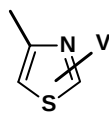
Q-4



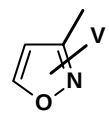
Q-5



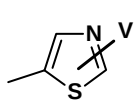
Q-6



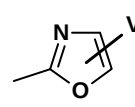
Q-7



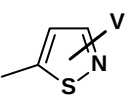
Q-8



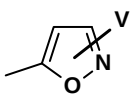
Q-9



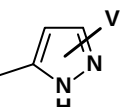
Q-10



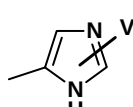
Q-11



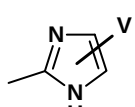
Q-12



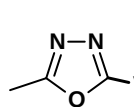
Q-13



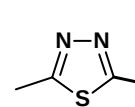
Q-14



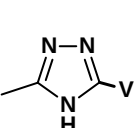
Q-15



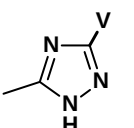
Q-16



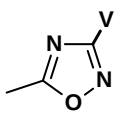
Q-17



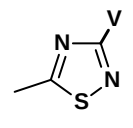
Q-18



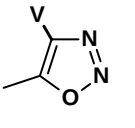
Q-19



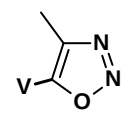
Q-20



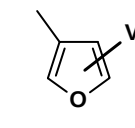
Q-21



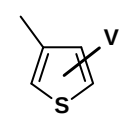
Q-22



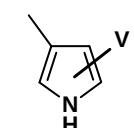
Q-23



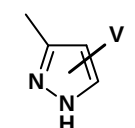
Q-24



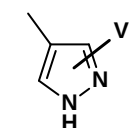
Q-25



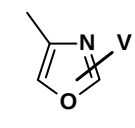
Q-26



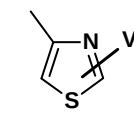
Q-27



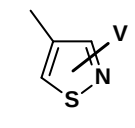
Q-28



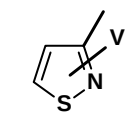
Q-29



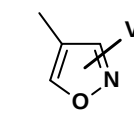
Q-30



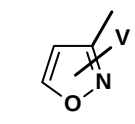
Q-31



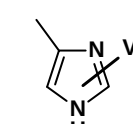
Q-32



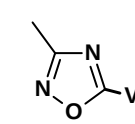
Q-33



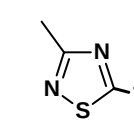
Q-34



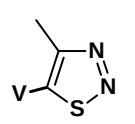
Q-35



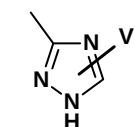
Q-36



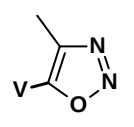
Q-37



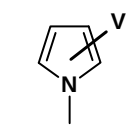
Q-38



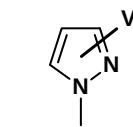
Q-39



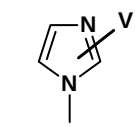
Q-40



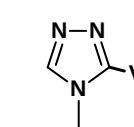
Q-41



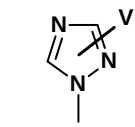
Q-42



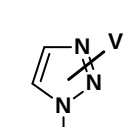
Q-43



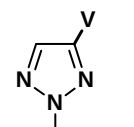
Q-44



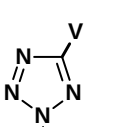
Q-45



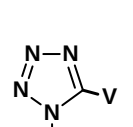
Q-46



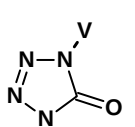
Q-47



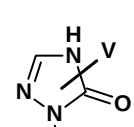
Q-48



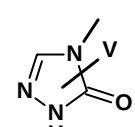
Q-49



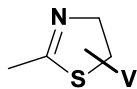
Q-50



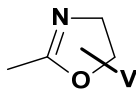
Q-51



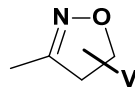
Q-52



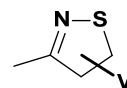
Q-53



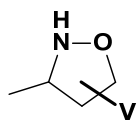
Q-54



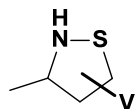
Q-55



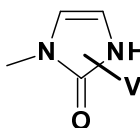
Q-56



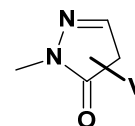
Q-57



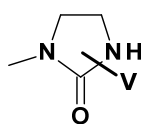
Q-58



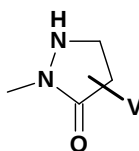
Q-59



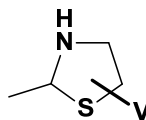
Q-60



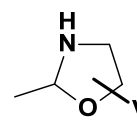
Q-61



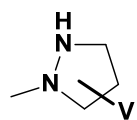
Q-62



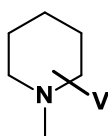
Q-63



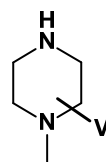
Q-64



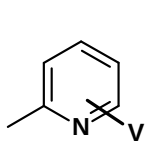
Q-65



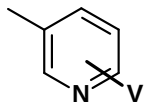
Q-66



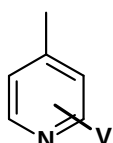
Q-67



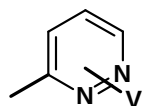
Q-68



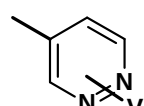
Q-69



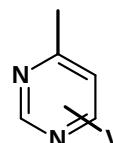
Q-70



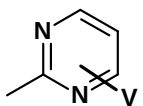
Q-71



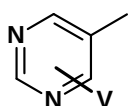
Q-72



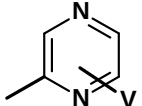
Q-73



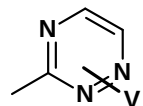
Q-74



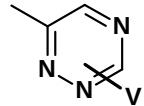
Q-75



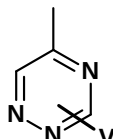
Q-76



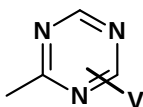
Q-77



Q-78



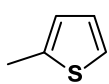
Q-79



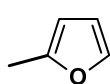
Q-80

donde

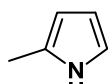
- V representa en forma especialmente preferente un anillo de 5 o 6 miembros, opcionalmente sustituido en forma simple o doble, idéntico o distinto, de la serie V-1 a V-101, donde como sustituyentes se consideran: ciano, halógeno, (C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄)haloalquilo, (C₁-C₄)alcoxi o (C₁-C₄)haloalcoxi,



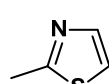
V-1



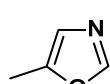
V-2



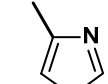
V-3



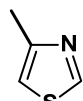
V-4



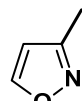
V-5



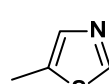
V-6



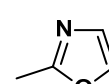
V-7



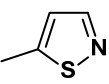
V-8



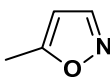
V-9



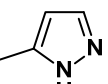
V-10



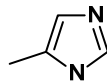
V-11



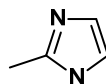
V-12



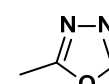
V-13



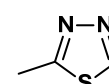
V-14



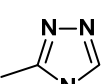
V-15



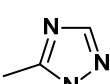
V-16



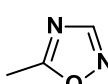
V-17



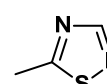
V-18



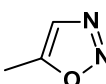
V-19



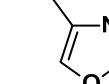
V-20



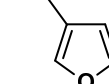
V-21



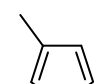
V-22



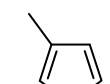
V-23



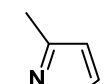
V-24



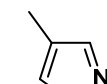
V-25



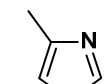
V-26



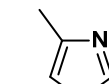
V-27



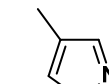
V-28



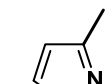
V-29



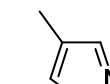
V-30



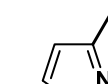
V-31



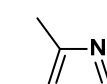
V-32



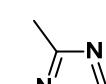
V-33



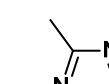
V-34



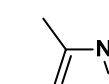
V-35



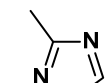
V-36



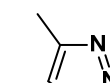
V-37



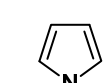
V-38



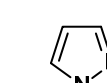
V-39



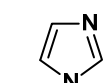
V-40



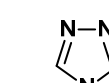
V-41



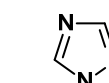
V-42



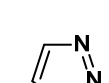
V-43



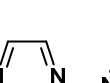
V-44



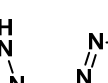
V-45



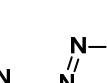
V-46



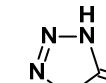
V-47



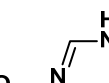
V-48



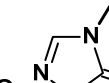
V-49



V-50



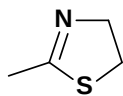
V-51



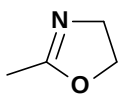
V-52



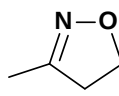
V-53



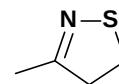
V-54



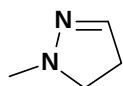
V-55



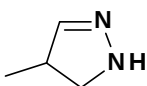
V-56



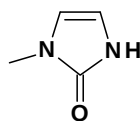
V-57



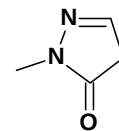
V-58



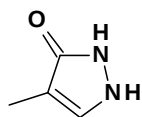
V-59



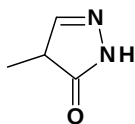
V-60



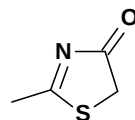
V-61



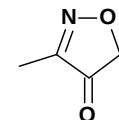
V-62



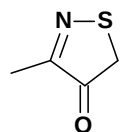
V-63



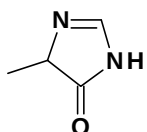
V-64



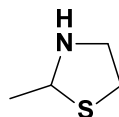
V-65



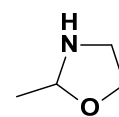
V-66



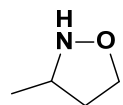
V-67



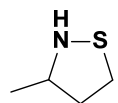
V-68



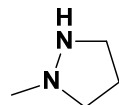
V-69



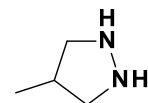
V-70



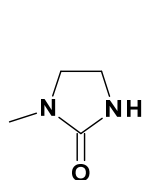
V-71



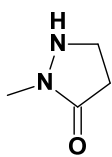
V-72



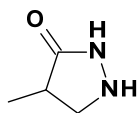
V-73



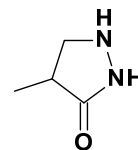
V-74



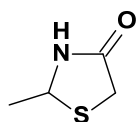
V-75



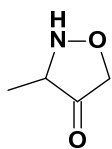
V-76



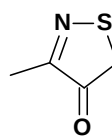
V-77



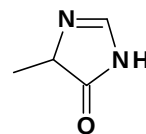
V-78



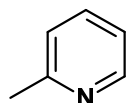
V-79



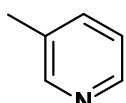
V-80



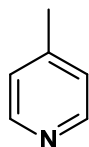
V-81



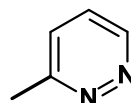
V-82



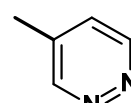
V-83



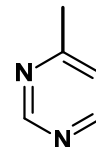
V-84



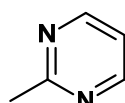
V-85



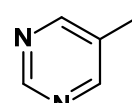
V-86



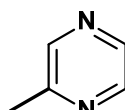
V-87



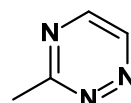
V-88



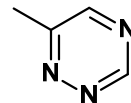
V-89



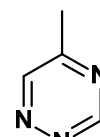
V-90



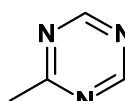
V-91



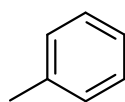
V-92



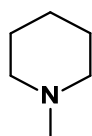
V-93



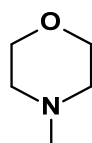
V-94



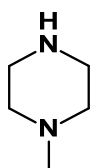
V-95



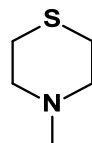
V-96



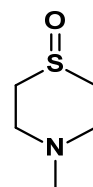
V-97



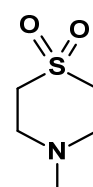
V-98



V-99



V-100



V-101

En la forma de realización especialmente preferente, R^2 puede además de V estar sustituido opcionalmente en forma simple o doble, idéntico o distinto, por ciano, halógeno, (C_1-C_4) alquilo, (C_1-C_4) haloalquilo, (C_1-C_4) alcoxi o (C_1-C_4) haloalcoxi.

Descripción 4-1

- 5 A^1 representa muy especialmente preferente nitrógeno o $=C(R^4)-$,
- R^1 representa muy especialmente preferente metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, ciclo-propilo, n-butilo, i-butilo, terc-butilo, ciclo-butilo, flúorometilo, diflúorometilo, triflúorometilo, flúoroetilo, diflúoroetilo, triflúoroetilo, tetraflúoroetilo o pentaflúoroetilo,
- 10 R^2-V representa muy especialmente preferente un anillo de 5 o 6 miembros, opcionalmente sustituido en forma simple, de la serie Q-1, Q-2, Q-3, Q-4, Q-5, Q-6, Q-7, Q-8, Q-9, Q-10, Q-12, Q-13, Q-14, Q-15, Q-16, Q-17, Q-24, Q-25, Q-26, Q-27, Q-28, Q-29, Q-30, Q-34, Q-35, Q-41, Q-42, Q-43, Q-44, Q-45, Q-46, Q-47, Q-48, Q-49, Q-50, Q-51, Q-52, Q-55, Q-59, Q-61, Q-66, Q-67, Q-68, Q-69, Q-70, Q-71, Q-72, Q-73, Q-74 o Q-75, donde como sustituyentes se consideran: ciano, flúor, cloro, metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, i-butilo, terc-butilo, metoxi o
- 15 triflúormetoxi,
- donde
- V representa en forma especialmente preferente un anillo opcionalmente sustituido en forma simple o doble, idéntico o distinto, por ciano, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, i-butilo, terc-butilo, metoxi o triflúormetoxi, seleccionado de V-1, V-2, V-3, V-4, V-5, V-
- 20 6, V-7, V-9, V-10, V-16, V-17, V-18, V-19, V-20, V-21, V-24, V-25, V-27, V-28, V-29, V-30, V-35, V-36, V-39, V-42, V-43, V-44, V-45, V-46, V-47, V-48, V-49, V-50, V-51, V-52, V-53, V-60, V-82, V-83, V-84, V-85, V-86, V-87, V-88, V-89, V-90, V-91, V-92, V-93, V-94, V-95, V-96, V-97, V-98, V-99, V-100 o V-101,
- 25 R^3 representa muy especialmente preferente hidrógeno, ciano, halógeno, (C_1-C_4) alquilo, (C_1-C_4) haloalquilo, (C_1-C_4) haloalcoxi, (C_1-C_4) alquiltio, (C_1-C_4) alquilsulfinilo, (C_1-C_4) alquilsulfonilo, (C_1-C_4) haloalquiltio, (C_1-C_4) haloalquilsulfinilo, (C_1-C_4) haloalquilsulfonilo o $NHCO-(C_1-C_4)$ alquilo ((C_1-C_4) alquilcarbonilamino),
- 30 X representa muy especialmente preferente un sistema de anillos condensados heteroaromático, bi- o tricíclico, de 9 o 12 miembros, de la serie H1, H2, H3, H4, H5, H6, H7, H8, H9, H10, H11, H12, H13, H14, H15, H16, H17, H18, H19 o H20,
- R^4 representa muy especialmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo o ciano,

R⁵ representa muy especialmente preferente flúor, cloro, flúorometilo, diflúorometilo, triflúorometilo, flúoroetilo, diflúoroetilo, triflúoroetilo, tetraflúoroetilo, pentaflúoroetilo, triflúormetoxi, diflúoro clorometoxi, dicloro flúormetoxi, triflúorometiltio, triflúorometilsulfonilo o triflúorometilsulfinilo,

5 R⁶ representa muy especialmente preferente hidrógeno,

R⁷ representa muy especialmente preferente metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, i-butilo, terc-butilo, metoximetilo o metoxietilo,

n representa muy especialmente preferente 0, 1 o 2.

En la forma de realización especialmente preferente, R² puede además de V estar sustituido opcionalmente
10 en forma simple por ciano, flúor, cloro, metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, i-butilo, terc-butilo, metoxi o triflúormetoxi.

Descripción 4-2

A¹, R¹, R³, R⁴, X, R⁵, R⁶, R⁷ y n tienen los significados indicados en la Descripción 4-1 y

15 R²-V representa muy especialmente preferente un anillo de 5 o 6 miembros, opcionalmente sustituido en forma simple, de la serie Q-1, Q-2, Q-3, Q-4, Q-5, Q-6, Q-7, Q-8, Q-9, Q-10, Q-12, Q-13, Q-14, Q-15, Q-16, Q-17, Q-24, Q-25, Q-26, Q-27, Q-28, Q-29, Q-30, Q-34, Q-35, Q-41, Q-42, Q-43, Q-44, Q-45, Q-46, Q-47, Q-48, Q-49, Q-50, Q-51, Q-52, Q-55, Q-59, Q-61, Q-66, Q-67, Q-68, Q-69, Q-70, Q-71, Q-72, Q-73, Q-74 o Q-75, donde como sustituyentes se consideran: ciano, flúor, cloro, metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, i-butilo, terc-butilo, triflúorometilo,
20 metoxi o triflúormetoxi,

donde

V representa de manera muy especialmente preferida un anillo opcionalmente sustituido en forma simple o doble, idéntico o distinto, por ciano, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, i-butilo, terc-butilo, triflúorometilo, metoxi o triflúormetoxi, seleccionado de V-
25 1, V-2, V-3, V-4, V-5, V-6, V-7, V-9, V-10, V-16, V-17, V-18, V-19, V-20, V-21, V-24, V-25, V-27, V-28, V-29, V-30, V-35, V-36, V-39, V-42, V-43, V-44, V-45, V-46, V-47, V-48, V-49, V-50, V-51, V-52, V-53, V-60, V-82, V-83, V-84, V-85, V-86, V-87, V-88, V-89, V-90, V-91, V-92, V-93, V-94, V-95, V-96, V-97, V-98, V-99, V-100 o V-101,

En la forma de realización muy especialmente preferida, R² puede además de V estar sustituido
30 opcionalmente en forma simple por ciano, flúor, cloro, metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, i-butilo, terc-butilo, triflúorometilo, metoxi o triflúormetoxi.

Descripción 5-1

- A¹ representa con destacada preferencia nitrógeno,
- R¹ representa con destacada preferencia etilo,
- R²-V representa con destacada preferencia un anillo de la serie Q-42, Q-50, Q-51, Q-52, Q-59 o Q-61,
- 5 donde
- V representa destacadamente un anillo opcionalmente sustituido en forma simple o doble, idéntico por flúor, cloro o bromo de la serie V-82 o V-95,
- R³ representa con destacada preferencia hidrógeno,
- X representa con destacada preferencia un sistema heteroaromático de anillos de la serie H20,
- 10 R⁵ representa con destacada preferencia trifluorometilo,
- R⁶ representa con destacada preferencia hidrógeno,
- R⁷ representa con destacada preferencia metilo,
- n representa con destacada preferencia 2.

Descripción 5-2

- 15 A¹ representa con destacada preferencia nitrógeno,
- R¹ representa con destacada preferencia etilo,
- R²-V representa con destacada preferencia un anillo opcionalmente sustituido en forma simple por cloro o trifluorometilo de la serie Q-12, Q-27, Q-28, Q-42, Q-45, Q-50, Q-51, Q-52, Q-59 o Q-61,
- donde
- 20 V representa en forma destacada un anillo opcionalmente sustituido en forma simple o doble, idéntico o distinto, por flúor, cloro o bromo de la serie V-2, V-82, V-83 o V-95,
- R³ representa con destacada preferencia hidrógeno,
- X representa con destacada preferencia un sistema heteroaromático de anillos de la serie H1, H2, H15 o H20,
- 25 R⁵ representa con destacada preferencia trifluorometilo,

R⁶ representa con destacada preferencia hidrógeno,

R⁷ representa con destacada preferencia metilo,

n representa con destacada preferencia 2.

5 En la forma de realización destacada, R² puede además de V estar sustituido opcionalmente en forma simple por cloro o trifluorometilo.

La sustitución en los anillos Q-1 a Q-80 así como V-1 a V-101 puede efectuarse por sustitución de hidrógeno en el átomo de carbono y/o en el átomo de nitrógeno.

10 En una forma de realización preferida, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I), donde X representa H1 y R¹, R², R³, R⁵, R⁶, R⁷, A¹, V, X y n tienen los significados indicados en Descripción (3-1) o Descripción (3-2) o Descripción (4-1) o Descripción (4-2) o Descripción (5-1) o Descripción (5-2).

En una forma de realización preferida, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I), donde X representa H2 y R¹, R², R³, R⁵, R⁶, R⁷, A¹, V, X y n tienen los significados indicados en Descripción (3-1) o Descripción (3-2) o Descripción (4-1) o Descripción (4-2) o Descripción (5-1) o Descripción (5-2).

15 En una forma de realización preferida, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I), donde X representa H3 y R¹, R², R³, R⁵, R⁶, A¹, V, X y n tienen los significados indicados en Descripción (3-1) o Descripción (3-2) o Descripción (4-1) o Descripción (4-2) o Descripción (5-1) o Descripción (5-2).

En una forma de realización preferida, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I), donde X representa H4 y R¹, R², R³, R⁵, R⁶, A¹, V, X y n tienen los significados indicados en Descripción (3-1) o Descripción (3-2) o Descripción (4-1) o Descripción (4-2) o Descripción (5-1) o Descripción (5-2).

20 En una forma de realización preferida, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I), donde X representa H5 y R¹, R², R³, R⁵, R⁶, A¹, V, X y n tienen los significados indicados en Descripción (3-1) o Descripción (3-2) o Descripción (4-1) o Descripción (4-2) o Descripción (5-1) o Descripción (5-2).

25 En una forma de realización preferida, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I), donde X representa H6 y R¹, R², R³, R⁵, R⁶, A¹, V, X y n tienen los significados indicados en Descripción (3-1) o Descripción (3-2) o Descripción (4-1) o Descripción (4-2) o Descripción (5-1) o Descripción (5-2).

En una forma de realización preferida, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I), donde X representa H7 y R¹, R², R³, R⁵, R⁶, A¹, V, X y n tienen los significados indicados en Descripción (3-1) o Descripción (3-2) o Descripción (4-1) o Descripción (4-2) o Descripción (5-1) o Descripción (5-2).

30 En una forma de realización preferida, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I), donde X representa H8 y R¹, R², R³, R⁵, R⁶, A¹, V, X y n tienen los significados indicados en Descripción (3-1) o Descripción (3-2) o Descripción (4-1) o Descripción (4-2) o Descripción (5-1) o Descripción (5-2).

En una forma de realización preferida, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I), donde X representa H9 y R¹, R², R³, R⁵, R⁶, A¹, V, X y n tienen los significados indicados en Descripción (3-1) o Descripción (3-2) o Descripción (4-1) o Descripción (4-2) o Descripción (5-1) o Descripción (5-2).

En una forma de realización preferida, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I), donde X
5 representa H10 y R¹, R², R³, R⁵, R⁶, A¹, V, X y n tienen los significados indicados en Descripción (3-1) o Descripción (3-2) o Descripción (4-1) o Descripción (4-2) o Descripción (5-1) o Descripción (5-2).

En una forma de realización preferida, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I), donde X representa H11 y R¹, R², R³, R⁵, R⁶, A¹, V, X y n tienen los significados indicados en Descripción (3-1) o Descripción (3-2) o Descripción (4-1) o Descripción (4-2) o Descripción (5-1) o Descripción (5-2).

10 En una forma de realización preferida, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I), donde X representa H12 y R¹, R², R³, R⁵, R⁶, R⁷, A¹, V, X y n tienen los significados indicados en Descripción (3-1) o Descripción (3-2) o Descripción (4-1) o Descripción (4-2) o Descripción (5-1) o Descripción (5-2).

En una forma de realización preferida, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I), donde X representa H13 y R¹, R², R³, R⁵, R⁶, A¹, V, X y n tienen los significados indicados en Descripción (3-1) o Descripción (3-2) o Descripción (4-1) o Descripción (4-2) o Descripción (5-1) o Descripción (5-2).

En una forma de realización preferida, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I), donde X representa H14 y R¹, R², R³, R⁵, R⁶, R⁷, A¹, V, X y n tienen los significados indicados en Descripción (3-1) o Descripción (3-2) o Descripción (4-1) o Descripción (4-2) o Descripción (5-1) o Descripción (5-2).

En una forma de realización preferida, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I), donde X
20 representa H15 y R¹, R², R³, R⁵, R⁶, A¹, V, X y n tienen los significados indicados en Descripción (3-1) o Descripción (3-2) o Descripción (4-1) o Descripción (4-2) o Descripción (5-1) o Descripción (5-2).

En una forma de realización preferida, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I), donde X representa H16 y R¹, R², R³, R⁵, R⁶, A¹, V, X y n tienen los significados indicados en Descripción (3-1) o Descripción (3-2) o Descripción (4-1) o Descripción (4-2) o Descripción (5-1) o Descripción (5-2).

25 En una forma de realización preferida, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I), donde X representa H17 y R¹, R², R³, R⁵, R⁶, R⁷, A¹, V, X y n tienen los significados indicados en Descripción (3-1) o Descripción (3-2) o Descripción (4-1) o Descripción (4-2) o Descripción (5-1) o Descripción (5-2).

En una forma de realización preferida, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I), donde X representa H18 y R¹, R², R³, R⁵, R⁶, A¹, V, X y n tienen los significados indicados en Descripción (3-1) o Descripción (3-2) o Descripción (4-1) o Descripción (4-2) o Descripción (5-1) o Descripción (5-2).

En una forma de realización preferida, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I), donde X representa H19 y R¹, R², R³, R⁵, R⁶, R⁷, A¹, V, X y n tienen los significados indicados en Descripción (3-

1) o Descripción (3-2) o Descripción (4-1) o Descripción (4-2) o Descripción (5-1) o Descripción (5-2).

En una forma de realización preferida, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I), donde X representa H₂O y R¹, R², R³, R⁵, R⁶, R⁷, A¹, V, X y n tienen los significados indicados en Descripción (3-1) o Descripción (3-2) o Descripción (4-1) o Descripción (4-2) o Descripción (5-1) o Descripción (5-2).

5 En las definiciones preferidas, a menos que se indique lo contrario,

halógeno es seleccionado de la serie flúor, cloro, bromo y yodo, a su vez preferido de la serie flúor, cloro y bromo,

En las definiciones especialmente preferidas, a menos que se indique lo contrario,

10 halógeno es seleccionado de la serie flúor, cloro, bromo y yodo, a su vez preferido de la serie flúor, cloro y bromo,

A menos que se defina lo contrario en otra parte, en el contexto de la presente invención se entiende por „alquilo“, ya sea en forma aislada o en combinación con otros términos como por ejemplo haloalquilo, un radical de un grupo de hidrocarburos alifáticos saturados con 1 a 12 átomos de carbono, que puede estar ramificado o no ramificado. Ejemplos para radicales de C₁-C₁₂-alquilo son metilo, etilo, n-propilo, iso-
15 propilo, n-butilo, iso-butilo, sek.-butilo, terc-butilo, n-pentilo, iso-pentilo, neopentilo, terc-pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 1-etilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, hexilo n-heptilo, n-octilo, n-nonilo, n-decilo, n-undecilo y n-dodecilo. De estos radicales alquilo se prefieren particularmente radicales C₁-C₆-alquilo. Particularmente preferidos son los radicales C₁-C₄-alquilo.

A menos que se defina lo contrario en otra parte, según la invención se entiende por „alquenilo“, ya sea
20 en forma aislada o en combinación con otros términos, un radical C₂-C₁₂-alquenilo lineal o ramificado, el cual muestra al menos un doble enlace, por ejemplo vinilo, alilo, 1-propenilo, isopropenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1,3-butadienilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1,3-pentadienilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo y 1,4-hexadienilo. Los preferidos entre estos son radicales C₂-C₆-alquenilo y particularmente preferidos son radicales C₂-C₄-alquenilo.

25 A menos que se defina lo contrario en otra parte, según la invención se entiende por „alquinilo“, ya sea en forma aislada o en combinación con otros términos, un radical C₂-C₁₂-alquinilo lineal o ramificado, el cual muestra al menos un triple enlace, por ejemplo etinilo, 1-propinilo y propargilo. Los preferidos entre estos son radicales C₃-C₆-alquinilo y particularmente preferidos son radicales C₃-C₄-alquinilo. El radical alquinilo puede tener también al menos un doble enlace.

30 A menos que se defina lo contrario en otra parte, según la invención se entiende por „cicloalquilo“, ya sea en forma aislada o en combinación con otros términos, un radical C₃-C₈-cicloalquilo, por ejemplo ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo y ciclooctilo. Los preferidos entre estos son radicales C₃-C₆-cicloalquilo.

Por „alcoxi“, ya sea en forma aislada o en combinación con otros términos, como por ejemplo halógenoalcoxi, se entiende un radical O-alquilo, en donde el término "alquilo" se define como mencionado arriba.

5 Los radicales sustituidos con halógeno, p. ej. haloalquilo (= haloalquilo) son mono- o polihalogenados hasta el número máximo posible de sustituyentes. En caso de polihalogenación, los átomos de halógeno pueden ser idénticos o diferentes. Halógeno representa flúor cloro, bromo y yodo, en particular, flúor, cloro y bromo.

10 Los radicales opcionalmente sustituidos pueden, a menos que se indique lo contrario, estar sustituidos en forma simple o múltiple, por lo que en caso de sustitución múltiple los sustituyentes pueden ser idénticos o diferentes.

Las definiciones generales de radicales o las explicaciones en rangos de preferencia respectivamente arriba mencionadas aplican a los productos finales y correspondientemente a los de partida y productos intermedios. Estas definiciones de los radicales pueden combinarse arbitrariamente entre sí, es decir incluso entre los respectivos rangos de preferencia.

15 De acuerdo a la invención se usan preferentemente compuestos de la fórmula (I) que presentan una combinación de los significados indicados anteriormente como preferentes.

De acuerdo a la invención se usan especialmente preferente compuestos de la fórmula (I) que presentan una combinación de los significados indicados anteriormente como especialmente preferentes.

20 De acuerdo a la invención se usan muy especialmente preferente compuestos de la fórmula (I) que presentan una combinación de los significados indicados anteriormente como muy especialmente preferentes.

De acuerdo a la invención se usan con destacada preferencia compuestos de la fórmula (I) que presentan una combinación de los significados indicados anteriormente como de destacada preferencia.

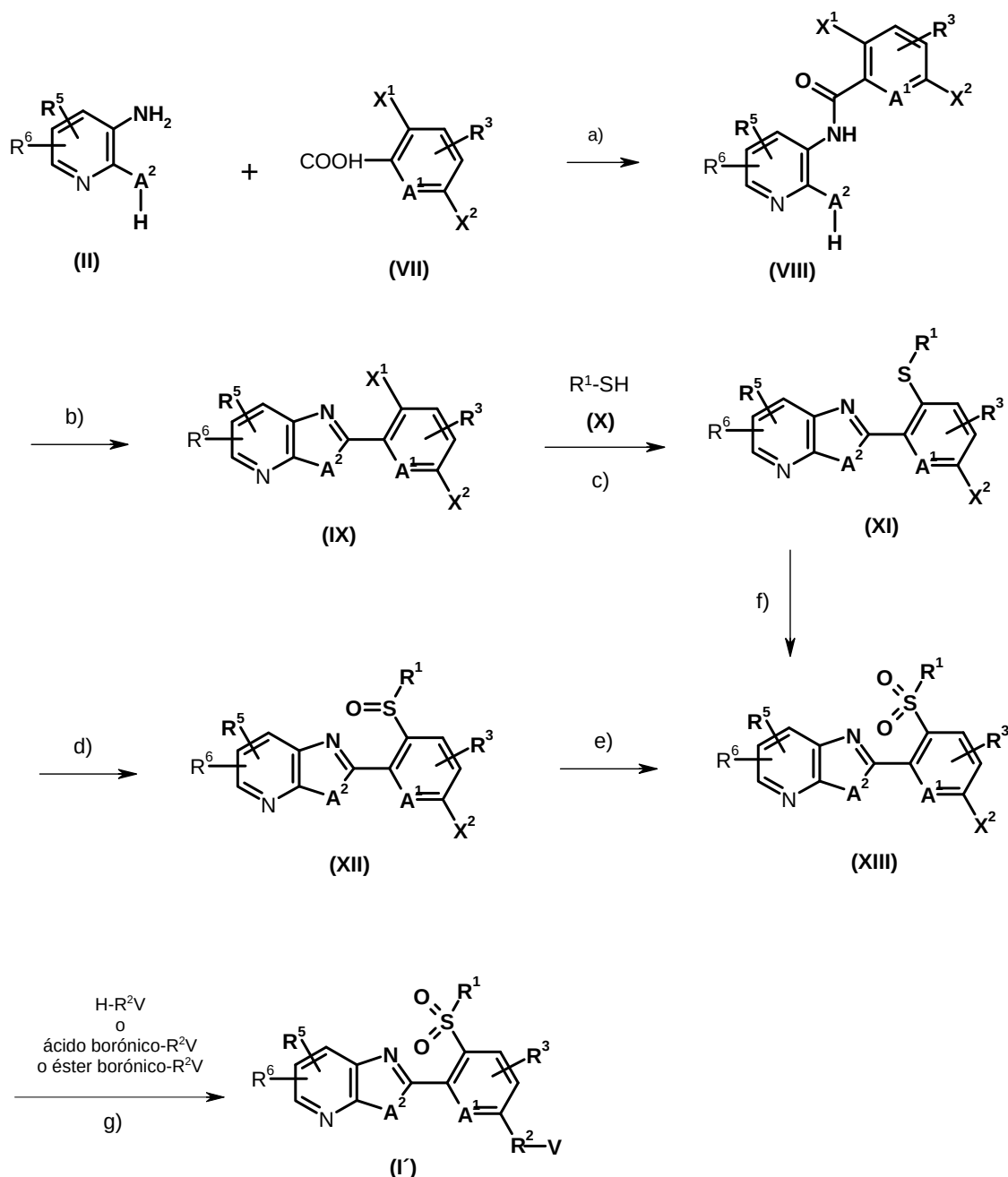
25 Los compuestos de la fórmula (I), dependiendo de la naturaleza de los sustituyentes, pueden estar presentes como isómeros geométricos y/o como isómeros ópticamente activos o como mezclas de isómeros correspondientes de composición variable. Por ejemplo son estereoisómeros enantiómeros, diastereómeros, atropoisómeros o isómeros geométricos. Por lo tanto, la invención incluye estereoisómeros puros así como cualquier mezcla de estos isómeros.

30 Los compuestos de la fórmula (I) según la invención pueden obtenerse por los procedimientos descriptos en los siguientes esquemas:

Procedimiento A

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

- 5 El procedimiento general para la preparación de compuestos de fórmula (I), en los que X representa H1, H2, H4, H5, H6, H7, H8, H9, H14, H19 o H20, se describe a continuación en base a los ejemplos H2, H5 o H8.



- 10 Los radicales R^1 , R^2 , R^3 , R^5 , R^6 , A^1 y V tienen los significados arriba mencionados, A^2 representa $-N-R^7$,

O o S, donde R^7 tiene el significado arriba mencionado y X^1 o X^2 representan halógeno.

Paso a)

Los compuestos de la fórmula (VIII) se pueden producir de forma análoga al procedimiento descrito en el documento US5576335, por la reacción de los compuestos de la fórmula (II) con un ácido carboxílico de la fórmula (VII) en presencia de un agente de condensación o una base.

Los compuestos de la fórmula (II) o bien están disponibles comercialmente o se pueden producir según métodos conocidos, por ejemplo análogamente a los métodos descritos en el documento US2003/69257 o WO2006/65703.

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

La reacción de los compuestos de la fórmula (II) con ácidos carboxílicos de la fórmula (VII) se puede llevar a cabo en sustancia o en un disolvente. La reacción preferentemente se lleva a cabo en un disolvente seleccionado entre los disolventes inertes habituales en las condiciones de reacción que prevalecen. Se prefieren éteres como por ejemplo diisopropiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano; hidrocarburos halogenados como por ejemplo diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; nitrilos, como por ejemplo acetonitrilo o propionitrilo; hidrocarburos aromáticos como por ejemplo tolueno, o xileno; disolventes polares apróticos como por ejemplo N,N-dimetilformamida o N-metilpirrolidona o compuestos nitrogenados como por ejemplo piridina.

Son agentes de condensación adecuados por ejemplo carbodiimidas como ser 1-(3-dimetilaminopropilo)-3-hidrocloruro de etilcarbodiimida (EDCI) o 1,3-diciclohexilcarbodiimida.

Las bases inorgánicas son bases adecuadas, que se utilizan por lo general en tales reacciones. Preferentemente se usan bases elegidas por ejemplo del grupo de los acetatos, fosfatos, carbonatos e bicarbonatos de metales alcalinos o alcalinotérreos. Se prefieren especialmente el acetato de sodio, fosfato de sodio, fosfato de potasio, carbonato de cesio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio.

La reacción se puede realizar al vacío, a presión normal o sobrepresión y a temperaturas de 0 °C a 180 °C, preferentemente la reacción se lleva a cabo a presión normal y a temperaturas de 20 a 140 °C.

Paso b)

Los compuestos de la fórmula (IX) se pueden preparar por condensación de los compuestos de la fórmula (VIII) análogamente por ejemplo al método descrito en WO2012/86848.

La reacción de los compuestos de la fórmula (IX) se puede llevar a cabo en sustancia o en un disolvente.

- 5 La reacción preferentemente se lleva a cabo en un disolvente seleccionado entre los disolventes inertes habituales en las condiciones de reacción que prevalecen. Se prefieren éteres como por ejemplo diisopropiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, terc-butilmetiléter; hidrocarburos halogenados como por ejemplo diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; nitrilos, como por ejemplo acetonitrilo o propionitrilo; hidrocarburos aromáticos como por ejemplo tolueno o xileno; disolventes polares apróticos como por ejemplo N,N-dimetilformamida o N-
- 10 metilpirrolidona o compuestos nitrogenados como por ejemplo piridina.

La reacción se puede realizar en presencia de un agente de condensación, de un ácido, de una base o de un agente de cloración.

- Ejemplos de agentes de condensación adecuados son carbodiimidas como 1-(3-dimetilaminopropilo)-3-
- 15 hidrocloreuro de etilcarbodiimida (EDCI) o 1,3-diciclohexilcarbodiimida; anhídridos como anhídrido acético, anhídrido trifluoroacético; una mezcla de trifenilfosfina, base y tetracloruro de carbono o una mezcla de trifenilfosfina y un azodiéster como por ejemplo azodicarboxilato de dietilo.

Ejemplos de ácidos adecuados que se pueden utilizar en la reacción descrita son ácidos sulfónicos como ácido para-toluenosulfónico; ácidos carboxílicos como ácido acético o ácido polifosfórico.

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

Un ejemplo de un agente de cloración adecuado es el oxicloruro de fósforo.

La reacción se puede realizar al vacío, a presión normal o sobrepresión y a temperaturas de 0 °C a 200 °C.

25 **Paso c)**

Los compuestos de la fórmula (XI), se pueden preparar por reacción de los compuestos de la fórmula (IX) con los compuestos de la fórmula (X) en presencia de una base.

- Los derivados de mercaptano de la fórmula (X) como por ejemplo metilmercaptano, etilmercaptano o isopropil mercaptano, o bien están disponibles comercialmente o se pueden producir según métodos
- 30 conocidos, análogamente por ejemplo al método descrito en los documentos US2006/25633, US2006/111591, US2820062, en Chemical Communications, **13** (2000), 1163-1164 o en Journal of the

American Chemical Society, **44** (1922), p. 1329.

La reacción a compuestos de la fórmula (XI) se puede llevar a cabo en sustancia o en un disolvente. La reacción preferentemente se lleva a cabo en un disolvente seleccionado entre los disolventes inertes habituales en las condiciones de reacción que prevalecen. Se prefieren éteres como por ejemplo diisopropiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, terc-butilmetiléter; nitrilos, como por ejemplo acetonitrilo o propionitrilo; hidrocarburos aromáticos como por ejemplo tolueno o xileno; disolventes polares apróticos como por ejemplo N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona o sulfóxido de dimetilo.

Ejemplos de bases adecuadas son bases inorgánicas del grupo de los acetatos, fosfatos y carbonatos de metales alcalinos o alcalinotérreos. Se prefieren el carbonato de cesio, carbonato de sodio y carbonato de potasio. Otras bases adecuadas son hidruros de metales alcalinos como por ejemplo hidruro de sodio.

La reacción se puede realizar al vacío, a presión normal o sobrepresión y a temperaturas de 0 °C a 200 °C.

Paso d)

Los compuestos de la fórmula (XII) se pueden producir por oxidación de los compuestos de la fórmula (XI). La oxidación generalmente se realiza en un disolvente seleccionado entre los disolventes inertes habituales en las condiciones de reacción que prevalecen. Se prefieren hidrocarburos halogenados como por ejemplo diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; alcoholes como metanol o etanol; ácido fórmico, ácido acético, ácido propanoico o agua.

Son ejemplos de oxidantes adecuados peróxido de hidrógeno, ácido metacloroperbenzoico o peryodato de sodio.

La reacción se puede realizar al vacío, a presión normal o sobrepresión y a temperaturas de -20°C a 120 °C.

Paso e)

Los compuestos de la fórmula (XIII) se pueden producir por oxidación de los compuestos de la fórmula (XII). La oxidación generalmente se realiza en un disolvente. Se prefieren hidrocarburos halogenados como por ejemplo diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; alcoholes como metanol o etanol; ácido fórmico, ácido acético, ácido propanoico o agua.

Son ejemplos de oxidantes adecuados peróxido de hidrógeno y ácido metacloroperbenzoico.

La reacción se puede realizar al vacío, a presión normal o sobrepresión y a temperaturas de -20°C a 120 °C.

Paso f)

Los compuestos de la fórmula (XIII) se pueden producir en un proceso de una etapa por oxidación de los compuestos de la fórmula (XI). La oxidación generalmente se realiza en un disolvente. Se prefieren hidrocarburos halogenados como por ejemplo diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; alcoholes como metanol o etanol; ácido fórmico, ácido acético, ácido propanoico o agua.

Son ejemplos de oxidantes adecuados peróxido de hidrógeno y ácido metacloroperbenzoico.

La reacción se puede realizar al vacío, a presión normal o sobrepresión y a temperaturas de -20°C a 120 °C.

Paso g)

- 10 La preparación de compuestos de fórmula (I') en los que R²-V representa un biciclo unido a N - con respecto al radical de la molécula -, se puede realizar por ejemplo de compuestos de la fórmula (XIII), en los que X² representa preferentemente halógeno de la serie cloro o bromo, de acuerdo a los métodos conocidos por la literatura (ver por ejemplo Organic Chemistry (2010), 69, 5578) por ejemplo en presencia de un yoduro de cobre (I) y auxiliares de reacción básicos como por ejemplo *trans*-N,N'-dimetilciclohexano-1,2-diamina y carbonato de potasio, en un disolvente o diluyente adecuado.

Los compuestos necesarios de la fórmula H-R²V están disponibles comercialmente o se pueden preparar por métodos conocidos.

- 20 Se consideran como disolventes o diluyentes todos los disolventes orgánicos inertes, por ejemplo hidrocarburos alifáticos o aromáticos. Preferiblemente se utiliza tolueno. Además, el acoplamiento de compuestos de la fórmula (XIII), en los que X² representa preferentemente halógeno de la serie flúor, cloro o bromo, puede tener lugar sin la catálisis de metal, en presencia de una base adecuada tal como carbonato de potasio o carbonato de cesio en un disolvente o diluyente adecuado. Se consideran como disolventes o diluyentes todos los disolventes orgánicos inertes, por ejemplo hidrocarburos alifáticos o aromáticos. Preferiblemente se utiliza acetronitrilo o dimetilformamida.

- 25 Los compuestos de la fórmula (I') en los que R²-V representa un biciclo unido a C - con respecto al radical de la molécula -, se pueden preparar por ejemplo mediante compuestos de la fórmula (XIII), en los que X² representa preferentemente halógeno de la serie cloro o bromo, mediante métodos generalmente conocidos (ver *Chem. Rev.* **1995**, 95, 2457-2483; *Tetrahedron* **2002**, 58, 9633-9695; *Metal-Catalyzed Cross-Coupling Reactions* (Eds.: A. de Meijere, F. Diederich), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, **2004**).

- 30 Por ejemplo se pueden transformar los compuestos de la fórmula (XIII), en los cuales X² representa preferentemente cloro o bromo, con ácidos aril borónico adecuados o sus ésteres mediante métodos conocidos (ver WO2010071819) en presencia de catalizadores adecuados de la serie de las sales de metales de transición, a compuestos de la fórmula (I'). Como catalizadores de acoplamiento se consideran por ejemplo preferentemente catalizadores de paladio tales como [1,1'-bis

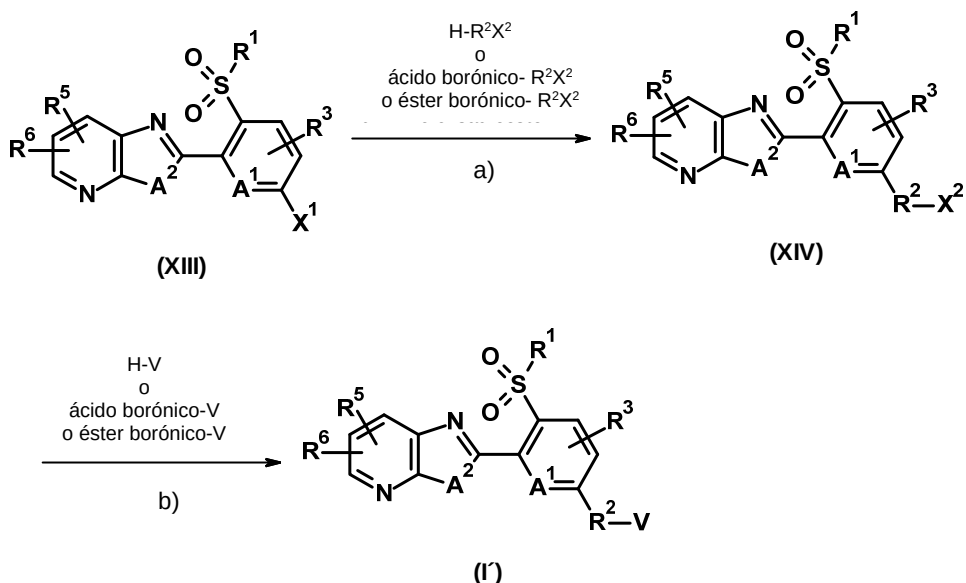
(difenilfosfino)ferroceno]dicloropaladio (II) o tetrakis(trifenilfosfina)paladio. Como auxiliares de reacción básicos adecuados para ejecutar el procedimiento se utilizan preferentemente carbonatos de sodio o potasio.

Los ácidos (hetero)arilborónicos o los ésteres (hetero)arilborónicos necesarios en algunos casos son conocidos y/o están disponibles comercialmente o se pueden producir según métodos conocidos (ver *Boronic Acids* (Eds.: D. G. Hall), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, **2011**).

La reacción según Paso g) también se puede preparar a partir de compuestos de las fórmulas (XI) o (XII).

Procedimiento B

El procedimiento general para la preparación de compuestos de la fórmula (I), en los que X representa H1, H2, H4, H5, H6, H7, H8, H9, H14, H19 o H20, se describe a continuación en base a los ejemplos H2, H5 o H8.



Los radicales R^1 , R^2 , R^3 , R^5 , R^6 , A^1 y V tienen los significados arriba mencionados, A^2 representa $-\text{N}-\text{R}^7$, O o S, donde R^7 tiene el significado arriba mencionado y X^1 o X^2 representan halógeno.

Paso a)

La preparación de compuestos de fórmula (XIV) en los que R^2-X^2 representa un anillo unido a N - con respecto al radical de la molécula -, se puede realizar por ejemplo de compuestos de la fórmula (XIII), en los que X^1 representa preferentemente halógeno de la serie cloro o bromo, de acuerdo a los métodos conocidos por la literatura (ver por ejemplo *Journal of Organic Chemistry* (2010), 69, 5578) por ejemplo en presencia de un yoduro de cobre (I) y auxiliares de reacción básicos como por ejemplo *trans*-N,N'-dimetilciclohexano-1,2-diamina y carbonato de potasio, en un disolvente o diluyente adecuado. Se consideran como disolventes o diluyentes todos los disolventes orgánicos inertes, por ejemplo

hidrocarburos alifáticos o aromáticos. Preferiblemente se utiliza tolueno. Además, el acoplamiento de compuestos de la fórmula (XIII), en los que X^1 representa preferentemente halógeno de la serie flúor, cloro o bromo, puede tener lugar sin la catálisis de metal, en presencia de una base adecuada tal como carbonato de potasio o carbonato de cesio en un disolvente o diluyente adecuado. Se consideran como
5 disolventes o diluyentes todos los disolventes orgánicos inertes, por ejemplo hidrocarburos alifáticos o aromáticos. Preferiblemente se utiliza acetonitrilo o dimetilformamida.

Los compuestos necesarios de la fórmula $H-R^2X^2$ están disponibles comercialmente o se pueden preparar por métodos conocidos.

Los compuestos de la fórmula (XIV) en los que R^2-X^2 representa un anillo unido a C - con respecto al
10 radical de la molécula -, se pueden preparar por ejemplo mediante compuestos de la fórmula (XIII), en los que X^1 representa preferentemente halógeno de la serie cloro o bromo, mediante métodos generalmente conocidos (ver *Chem. Rev.* **1995**, 95, 2457-2483; *Tetrahedron* **2002**, 58, 9633-9695; *Metal-Catalyzed Cross-Coupling Reactions* (Eds.: A. de Meijere, F. Diederich), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, **2004**).

Por ejemplo se pueden transformar los compuestos de la fórmula (XIII), en los cuales X^1 representa
15 preferentemente cloro o bromo, con ácidos aril borónicos adecuados o sus ésteres mediante métodos conocidos (ver WO2010071819) en presencia de catalizadores adecuados de la serie de las sales de metales de transición, a compuestos de la fórmula (XIV). Como catalizadores de acoplamiento se consideran por ejemplo preferentemente catalizadores de paladio tales como [1,1'-bis (difenilfosfina)ferroceno]dicloropaladio (II) o tetrakis(trifenilfosfina)paladio. Como auxiliares de
20 reacción básicos adecuados para ejecutar el procedimiento se utilizan preferentemente carbonatos de sodio o potasio.

Los ácidos (hetero)arilborónicos o los ésteres (hetero)arilborónicos necesarios en algunos casos son conocidos y/o están disponibles comercialmente o se pueden producir según métodos conocidos (ver *Boronic Acids* (Eds.: D. G. Hall), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, **2011**).

25 Paso b)

La preparación de compuestos de fórmula (I') en los que R^2-V representa un biciclo unido a N - con respecto al radical de la molécula -, se puede realizar por ejemplo de compuestos de la fórmula (XIV), en los que X^2 representa preferentemente halógeno de la serie cloro o bromo, de acuerdo a los métodos conocidos por la literatura (ver por ejemplo *Journal of Organic Chemistry* (2010), 69, 5578) por ejemplo
30 en presencia de un yoduro de cobre (I) y auxiliares de reacción básicos como por ejemplo *trans*-N,N'-dimetilciclohexano-1,2-diamina y carbonato de potasio, en un disolvente o diluyente adecuado. Se consideran como disolventes o diluyentes todos los disolventes orgánicos inertes, por ejemplo hidrocarburos alifáticos o aromáticos. Preferiblemente se utiliza tolueno. Además, el acoplamiento de compuestos de la fórmula (XIV), en los que X^2 representa preferentemente halógeno de la serie flúor,
35 cloro o bromo, puede tener lugar sin la catálisis de metal, en presencia de una base adecuada tal como

carbonato de potasio o carbonato de cesio en un disolvente o diluyente adecuado. Se consideran como disolventes o diluyentes todos los disolventes orgánicos inertes, por ejemplo hidrocarburos alifáticos o aromáticos. Preferiblemente se utiliza acetronitrilo o dimetilformamida.

5 Los compuestos necesarios de la fórmula H-V están disponibles comercialmente o se pueden preparar por métodos conocidos.

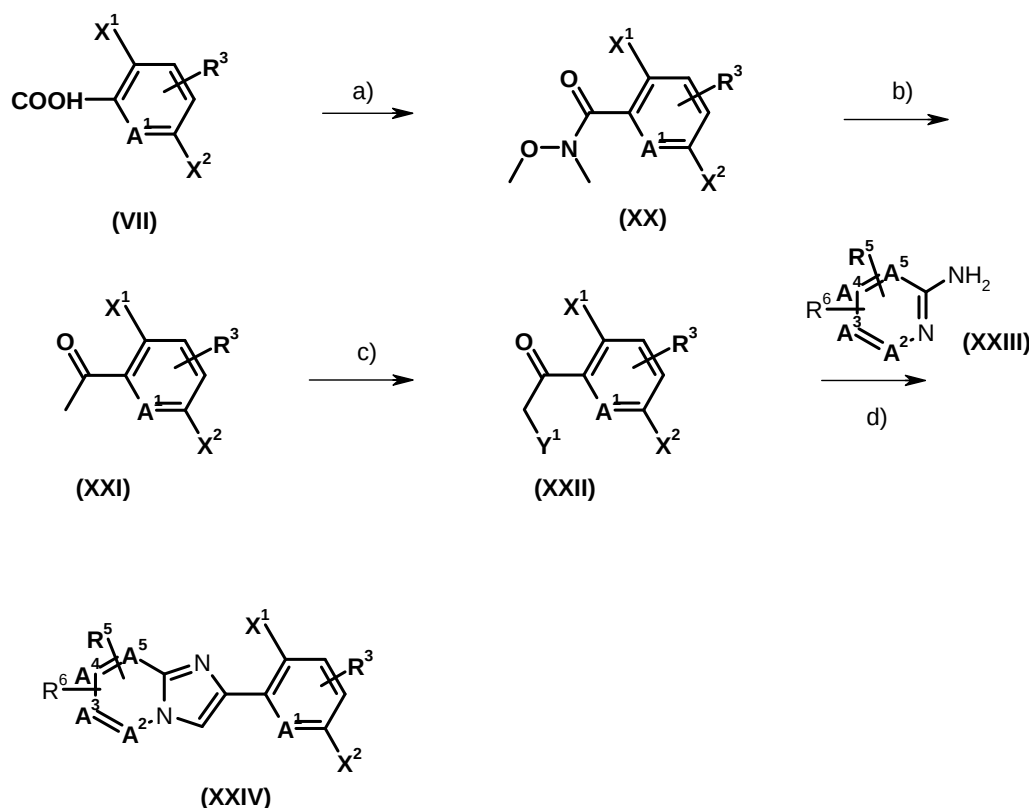
Los compuestos de la fórmula (I') en los que R²-V representa un bicyclo unido a C - con respecto al radical de la molécula -, se pueden preparar por ejemplo mediante compuestos de la fórmula (XIV), en los que X² representa preferentemente halógeno de la serie cloro o bromo, mediante métodos generalmente conocidos (ver *Chem. Rev.* **1995**, 95, 2457-2483; *Tetrahedron* **2002**, 58, 9633-9695; *Metal-Catalyzed*
10 *Cross-Coupling Reactions* (Eds.: A. de Meijere, F. Diederich), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, **2004**).

Por ejemplo se pueden transformar los compuestos de la fórmula (XIV), en los cuales X² representa preferentemente cloro o bromo, con ácidos aril borónico adecuados o sus ésteres mediante métodos conocidos (ver WO2010071819) en presencia de catalizadores adecuados de la serie de las sales de metales de transición, a compuestos de la fórmula (I'). Como catalizadores de acoplamiento se consideran
15 por ejemplo preferentemente catalizadores de paladio tales como [1,1'-bis (difenilfosfina)ferroceno]dicloropaladio (II) o tetrakis(trifenilfosfina)paladio. Como auxiliares de reacción básicos adecuados para ejecutar el procedimiento se utilizan preferentemente carbonatos de sodio o potasio.

Los ácidos (hetero)arilborónicos o los ésteres (hetero)arilborónicos necesarios en algunos casos son
20 conocidos y/o están disponibles comercialmente o se pueden producir según métodos conocidos (ver *Boronic Acids* (Eds.: D. G. Hall), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, **2011**).

Procedimiento C

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



Los radicales A^1 , R^3 , R^5 y R^6 tienen los significados arriba mencionados. X^1 , X^2 e Y^1 representan halógeno. A^2 , A^3 , A^4 y A^5 representan independientemente CH o N (donde A^2 , A^3 , A^4 y A^5 no representan simultáneamente N).

5 Paso a)

Los ácidos carboxílicos de la fórmula (VII), en forma análoga al procedimiento descrito en los documentos WO2011/75643 o EP-A-2671582 se transforman en presencia de hidrocloreuro de O,N-dimetil-hidroxilamina en amidas de Weinreb de la fórmula (XX).

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

Paso b, c)

Los compuestos de la fórmula (XX) a continuación se pueden transformar de acuerdo a métodos conocidos, por ejemplo, en forma análoga a los procedimientos descritos en el documento WO2011/75643, con un reactivo de Grignard, como por ejemplo bromuro de metilmagnesio en cetonas de la fórmula (XXI). Por subsiguiente halogenación, en forma análoga a los métodos conocidos descritos por ejemplo en el documento US2012/302573 o en Eur. J. Org. Chem. 2013, 1551-1557, se accede a

compuestos de la fórmula (XXII).

Paso d)

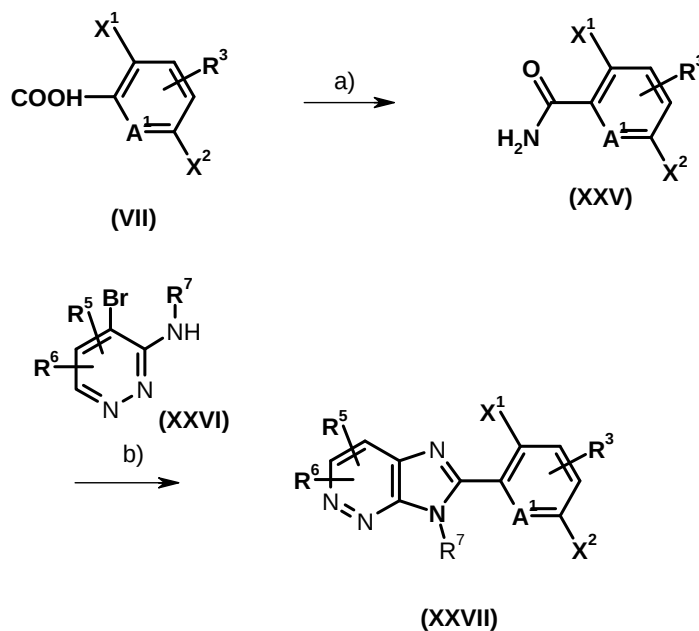
Los compuestos de la fórmula (XXIV) se pueden preparar por ciclación de compuestos de la fórmula (XXII) con aminas de la fórmula (XXIII). La ciclación por ejemplo ocurre en etanol, acetonitrilo, cloroformo, *tert*-butanol o N,N- dimetilformamida de acuerdo con métodos conocidos de forma análoga a los procedimientos descritos por ejemplo en los documentos WO2005/66177, WO2012/88411, WO2013/3298, US2009/203705, US2012/258951, WO2012/168733, WO2014/187762 o J. Med. Chem. **31** (1988) 1590-1595.

Los compuestos de la fórmula (XXIII) están disponibles comercialmente.

La reacción adicional de los compuestos de la fórmula (XXIV) en compuestos de la fórmula (I) ocurre de forma análoga a los procedimientos A a B.

Procedimiento D

Los compuestos de la fórmula (I), en los que X representa H17, se pueden producir según métodos conocidos, por ejemplo análogamente a los procedimientos descritos en los documentos.



15

Los radicales A¹, R³, R⁵, R⁶ y R⁷ tienen los significados arriba mencionados. X¹ y X² representan halógeno.

Paso a)

Los compuestos de la fórmula (XXV) se pueden producir de forma análoga al procedimiento descrito en el documento US5374646 o en Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters 2003, 13, 1093 - 1096 por la reacción de los compuestos de la fórmula (VII) con una fuente de amoníaco en presencia de un agente de

20

condensación.

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

La reacción de compuestos de la fórmula (VII) con la fuente de amoníaco se lleva a cabo preferentemente en un disolvente seleccionado entre los disolventes inertes habituales en las condiciones de reacción que prevalecen. Se prefieren éteres como por ejemplo dioxano o tetrahidrofurano.

Un agente de condensación adecuado es por ejemplo carbonildiimidazol.

- 10 La reacción se puede realizar al vacío, a presión normal o sobrepresión. Preferentemente la reacción se lleva a cabo a presión normal y a temperaturas de 20 a 70 °C.

Paso b)

- 15 Los compuestos de la fórmula (XXVII) se pueden preparar de forma análoga al procedimiento descrito en el documento WO2014/142292 por la reacción de compuestos de la fórmula (XXV) con compuestos de la fórmula (XXVI) en presencia de un catalizador de paladio en un medio básico.

Los compuestos de la fórmula (XXVI) se pueden preparar de forma análoga al procedimiento descrito en el documento WO2014/142292. Como catalizador de paladio se puede usar por ejemplo [1,1'-bis-(difenilfosfino)ferrocen]dicloropaladio(II). Como bases se usan con frecuencia bases inorgánicas tales como terc-butanolato de potasio.

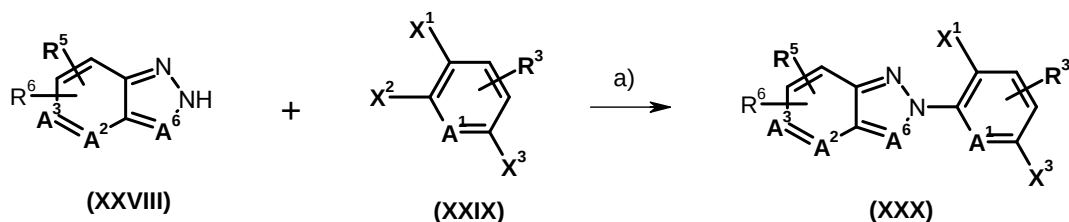
- 20 La reacción se lleva a cabo en un disolvente. Con frecuencia se usa tolueno.

La reacción se puede realizar al vacío, a presión normal o sobrepresión. Preferentemente la reacción se lleva a cabo a presión normal y a temperaturas de 20 a 110 °C.

La reacción adicional de los compuestos de la fórmula (XXVII) en compuestos de la fórmula (I) ocurre de forma análoga a los procedimientos A a B.

25 **Procedimiento E**

Los compuestos de la fórmula (I), en los que X representa H3, H12, H13 o H18, se pueden producir según métodos conocidos, por ejemplo análogamente a los procedimientos descritos en los documentos WO2010/091310, WO 2012/66061 o WO2013/099041.



Los radicales A¹, R³, R⁵ y R⁶ tienen los significados arriba mencionados. A², A³ y A⁶ representan independientemente CH o N (donde A² y A³ no representan simultáneamente N). X¹, X² y X³ representan halógeno.

5 Paso a)

Los compuestos de la fórmula (XXX) se pueden preparar por reacción de los compuestos de la fórmula (XXVIII) con los compuestos de la fórmula (XXIX) mediante N-arilación catalizada por paladio, por ejemplo en forma análoga al procedimiento descrito en Angewandte Chemie Int. Ed. 2011, 50, 8944-8947.

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

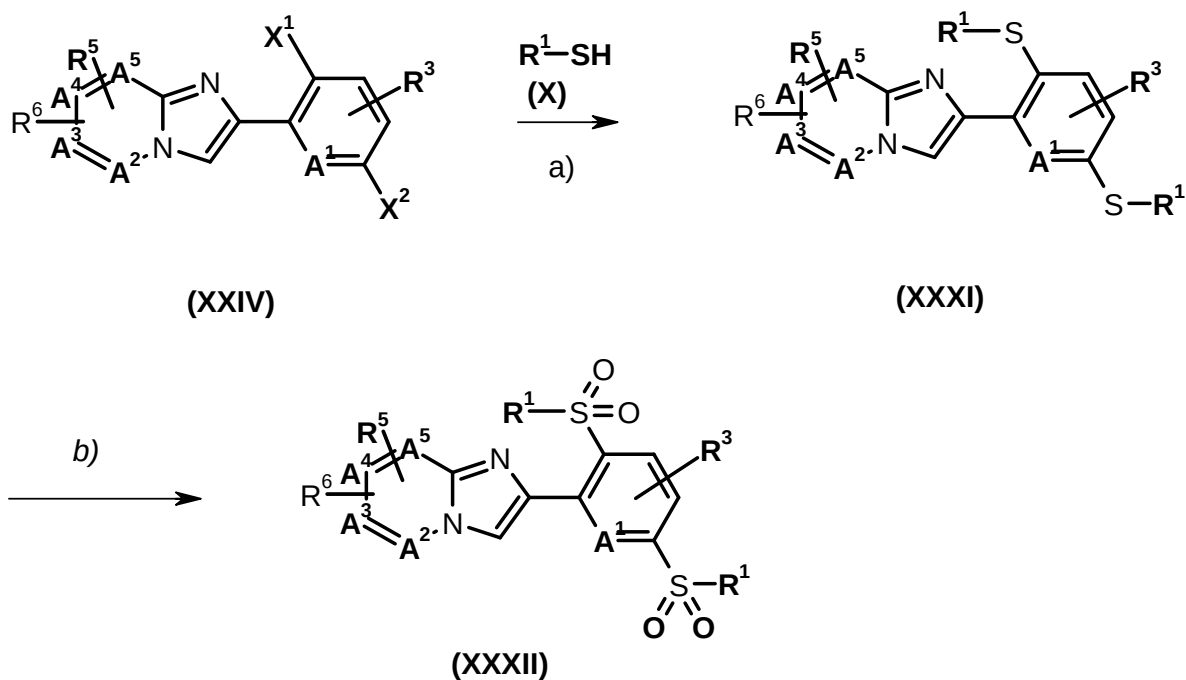
Los compuestos de la fórmula (XXIX) o bien están disponibles comercialmente o pueden producirse según métodos conocidos, por ejemplo análogamente a los procedimientos descritos en los documentos WO2013/43518, EP-A-2168965 o en Journal of Medicinal Chemistry 2003, 46, 1449 – 1455.

15 La reacción adicional de los compuestos de la fórmula (XXX) en compuestos de la fórmula (I) ocurre de forma análoga a los procedimientos A a B.

Procedimiento F

Los compuestos de la fórmula (I), en los que X representa H1, H2, H4, H5, H6, H7, H8, H9, H10, H11, H14, H15, H16, H17, H19 o H20, alternativamente se pueden preparar por el siguiente método. El método se describe a continuación basado en los ejemplos H10, H11, H15 o H16.

20



Los radicales A¹, R³, R⁵ y R⁶ tienen los significados arriba mencionados. X¹ y X² representan halógeno. A², A³, A⁴ y A⁵ representan independientemente CH o N (donde A², A³, A⁴ y A⁵ no representan simultáneamente N).

5 Paso a)

De forma análoga al procedimiento A, Paso c) a partir de los compuestos de la fórmula (XXIV) se puede formar disulfuro de la fórmula (XXXI) en lugar de sulfuro.

Paso b)

El disulfuro de la fórmula (XXXI) se puede convertir en forma análoga al procedimiento A, Paso f) en la disulfona de la fórmula (XXXII).

La reacción adicional de compuestos de la fórmula (XXXII) en compuestos de la fórmula (I) en los que R²-V representa un biciclo unido a N - con respecto al radical de la molécula -, se realiza de forma análoga al procedimiento A, Paso g) en presencia de una base adecuada tal como carbonato de potasio o carbonato de cesio en un disolvente o diluyente adecuado tal como acetonitrilo o dimetilformamida.

15 Procedimientos y usos

La invención refiere también a los procedimientos para el control de plagas animales, en los que se deja actuar a los compuestos de la fórmula (I) sobre las plagas animales y/o su hábitat. El control de plagas animales se realiza preferentemente en la agricultura y silvicultura y en la protección de materiales. Entre ellos se excluyen preferentemente procedimientos para el tratamiento quirúrgico o terapéutico del cuerpo humano o animal y los métodos de diagnóstico aplicados al cuerpo humano o animal.

La invención se refiere además al uso de los compuestos de la fórmula (I) como pesticida, especialmente como producto fitosanitario.

En el contexto de la presente solicitud, el término pesticida también incluye siempre producto fitosanitario.

Los compuestos de la fórmula (I) en combinación con una buena tolerancia de la planta, con una toxicidad favorable a animales de sangre caliente y con una buena tolerancia por el medio ambiente, son adecuados para proteger plantas y órganos de plantas de factores de estrés biótico y abiótico, para aumentar los rendimientos de las cosechas, para mejorar la calidad del material cosechado y para controlar plagas animales, en particular insectos, arácnidos, helmintos, nematodos y moluscos, que se encuentran en la agricultura, en la horticultura, en la ganadería, en la acuicultura, en bosques, en jardines e instalaciones de tiempo libre, en la protección de productos y materiales almacenados, así como en el sector de la higiene.

En el contexto de la presente solicitud de patente el término „higiene“ significa todas las medidas, procedimiento y prácticas, que tienen por objetivo prevenir enfermedades - especialmente enfermedades infecciosas - y para servir a la salud de las personas, animales y/o del medio ambiente y/o conservar la limpieza. Esto incluye de acuerdo a la invención en particular todas las medidas para la limpieza, desinfección y esterilización, por ejemplo de textiles o superficies duras, especialmente de vidrio, madera, hormigón, porcelana, cerámica, plástico o también de metal(es), y la limpieza de los mismos de las plagas sanitarias o sus heces. Según la invención se excluyen a este respecto procedimientos para el tratamiento quirúrgico o terapéutico del cuerpo humano o animal y los métodos de diagnóstico aplicados al cuerpo humano o animal.

El término „sector de la higiene“ por lo tanto comprende todos los ámbitos, áreas técnicas y usos comerciales, en las que este tipo de medidas, procedimientos y prácticas para la higiene son de importancia, tales como la higiene en cocinas, panaderías, aeropuertos, cuartos de baño, piscinas, grandes almacenes, hoteles, hospitales, establos, etc.

En consecuencia, se entiende por „plagas en la higiene“ una o más plagas animales, cuya presencia en el sector de la higiene es problemático, en particular por razones de salud. Es entonces el objetivo primordial evitar o minimizar las plagas en la higiene o el contacto con ellas en el sector de la higiene. Esto se puede hacer especialmente por la aplicación de un pesticida, usando el producto de forma profiláctica como también recién en caso de infestación para controlar la plaga. También es posible utilizar productos que evitan o reducen el contacto con la plaga. Se consideran plagas en la higiene por ejemplo los organismos enumerados a continuación.

El término "protección sanitaria" por lo tanto incluye todos los actos necesarios para mantener y/o mejorar dichas medidas, procedimientos y prácticas en materia de higiene.

Los compuestos de la fórmula (I) pueden emplearse preferiblemente como pesticidas. Son activos contra especies sensibles normales y resistentes así como contra todos los estadios de desarrollo o contra estadios de desarrollo individuales. Las plagas anteriormente citadas incluyen:

- Plagas de la cepa de Arthropoda, en especial de la clase de los Arachnida por ejemplo *Acarus* spp., por ejemplo *Acarus siro*, *Aceria kuko*, *Aceria sheldoni*, *Aculops* spp., *Aculus* spp., por ejemplo *Aculus fockeui*, *Aculus schlechtendali*, *Amblyomma* spp., *Amphitetranychus viennensis*, *Argas* spp., *Boophilus* spp., *Brevipalpus* spp., por ejemplo *Brevipalpus phoenicis*, *Bryobia graminum*, *Bryobia praetiosa*, *Centruroides* spp., *Choriotptes* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Dermatophagoides pteronyssinus*, *Dermatophagoides farinae*, *Dermacentor* spp., *Eotetranychus* spp., por ejemplo *Eotetranychus hicoriae*, *Epitrimerus pyri*, *Eutetranychus* spp., por ejemplo *Eutetranychus banksi*, *Eriophyes* spp., por ejemplo *Eriophyes pyri*, *Glycyphagus domesticus*, *Halotydeus destructor*, *Hemitarsonemus* spp., por ejemplo *Hemitarsonemus latus* (=Polyphagotarsonemus latus), *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Latrodectus* spp., *Loxosceles* spp., *Neutrombicula autumnalis*, *Nuphessa* spp., *Oligonychus* spp., por ejemplo *Oligonychus coffeae*, *Oligonychus coniferarum*, *Oligonychus ilicis*, *Oligonychus indicus*, *Oligonychus mangiferus*, *Oligonychus pratensis*, *Oligonychus punicae*, *Oligonychus yothersi*, *Ornithodorus* spp., *Ornithonyssus* spp., *Panonychus* spp., por ejemplo *Panonychus citri* (=Metatetranychus citri), *Panonychus ulmi* (=Metatetranychus ulmi), *Phyllocoptruta oleivora*, *Platytetranychus multidigituli*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psoroptes* spp., *Rhipicephalus* spp., *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., *Scorpio maurus*, *Steneotarsonemus* spp., *Steneotarsonemus spinki*, *Tarsonemus* spp., por ejemplo *Tarsonemus confusus*, *Tarsonemus pallidus*, *Tetranychus* spp., por ejemplo *Tetranychus canadensis*, *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus turkestanii*, *Tetranychus urticae*, *Trombicula alfreddugesi*, *Vaejovis* spp., *Vasates lycopersici*;

de la clase Chilopoda por ejemplo *Geophilus* spp., *Scutigera* spp.;

del orden o de la clase Collembola por ejemplo *Onychiurus armatus*; *Sminthurus viridis*;

de la clase Diplopoda por ejemplo *Blaniulus guttulatus*;

- de la clase Insecta, por ejemplo del orden Blattodea por ejemplo *Blatta orientalis*, *Blattella asahinai*, *Blattella germanica*, *Leucophaea maderae*, *Loboptera decipiens*, *Neostylopyga rhombifolia*, *Panchlora* spp., *Parcoblatta* spp., *Periplaneta* spp., por ejemplo *Periplaneta americana*, *Periplaneta australasiae*, *Pycnoscelus surinamensis*, *Supella longipalpa*;

- del orden Coleoptera por ejemplo *Acalymma vittatum*, *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus* spp., *Aethina tumida*, *Agelastica alni*, *Agriotes* spp., por ejemplo *Agriotes linneatus*, *Agriotes mancus*, *Alphitobius diaperinus*, *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora* spp., *Anthonomus* spp., por ejemplo *Anthonomus grandis*, *Anthrenus* spp., *Apion* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp., por ejemplo *Atomaria linearis*, *Attagenus* spp., *Baris caerulescens*, *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., por ejemplo *Bruchus pisorum*, *Bruchus rufimanus*, *Cassida* spp., *Cerotoma trifurcata*, *Ceutorrhynchus* spp., por ejemplo *Ceutorrhynchus assimilis*, *Ceutorrhynchus quadridens*, *Ceutorrhynchus rapae*, *Chaetocnema*

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

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

del orden *Diptera* por ejemplo *Aedes* spp., por ejemplo *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes sticticus*, *Aedes vexans*, *Agromyza* spp., por ejemplo *Agromyza frontella*, *Agromyza parvicornis*, *Anastrepha* spp., *Anopheles* spp., por ejemplo *Anopheles quadrimaculatus*, *Anopheles gambiae*, *Asphondylia* spp., *Bactrocera* spp., por ejemplo *Bactrocera cucurbitae*, *Bactrocera dorsalis*, *Bactrocera oleae*, *Bibio*

hortulanus, *Calliphora erythrocephala*, *Calliphora vicina*, *Ceratitis capitata*, *Chironomus* spp., *Chrysomya* spp., *Chrysops* spp., *Chrysozona pluvialis*, *Cochliomya* spp., *Contarinia* spp., por ejemplo *Contarinia johnsoni*, *Contarinia nasturtii*, *Contarinia pyrivora*, *Contarinia schulzi*, *Contarinia sorghicola*, *Contarinia tritici*, *Cordylobia anthropophaga*, *Cricotopus sylvestris*, *Culex* spp., por ejemplo *Culex pipiens*, *Culex quinquefasciatus*, *Culicoides* spp., *Culiseta* spp., *Cuterebra* spp., *Dacus oleae*, *Dasineura* spp., por ejemplo *Dasineura brassicae*, *Delia* spp., por ejemplo *Delia antiqua*, *Delia coarctata*, *Delia florilega*, *Delia platura*, *Delia radicum*, *Dermatobia hominis*, *Drosophila* spp., por ejemplo *Drosophila melanogaster*, *Drosophila suzukii*, *Echinocnemus* spp., *Euleia heraclei*, *Fannia* spp., *Gasterophilus* spp., *Glossina* spp., *Haematopota* spp., *Hydrellia* spp., *Hydrellia griseola*, *Hylemya* spp., *Hippobosca* spp., *Hypoderma* spp., *Liriomyza* spp., por ejemplo *Liriomyza brassicae*, *Liriomyza huidobrensis*, *Liriomyza sativae*, *Lucilia* spp., por ejemplo *Lucilia cuprina*, *Lutzomyia* spp., *Mansonia* spp., *Musca* spp., por ejemplo *Musca domestica*, *Musca domestica vicina*, *Oestrus* spp., *Oscinella frit*, *Paratanytarsus* spp., *Paralauterborniella subcincta*, *Pegomya* o *Pegomyia* spp., por ejemplo *Pegomya betae*, *Pegomya hyoscyami*, *Pegomya rubivora*, *Phlebotomus* spp., *Phorbia* spp., *Phormia* spp., *Piophilidae casei*, *Platyparea poeciloptera*, *Prodiptosis* spp., *Psila rosae*, *Rhagoletis* spp., por ejemplo *Rhagoletis cingulata*, *Rhagoletis completa*, *Rhagoletis fausta*, *Rhagoletis indifferens*, *Rhagoletis mendax*, *Rhagoletis pomonella*, *Sarcophaga* spp., *Simulium* spp., por ejemplo *Simulium meridionale*, *Stomoxys* spp., *Tabanus* spp., *Tetanops* spp., *Tipula* spp., por ejemplo *Tipula paludosa*, *Tipula simplex*, *Toxotrypana curvicauda*;

del orden Hemiptera por ejemplo *Acizzia acaciaebaileyanae*, *Acizzia dodonaeae*, *Acizzia uncatoides*, *Acrida turrita*, *Acyrtosiphon* spp., por ejemplo *Acyrtosiphon pisum*, *Acrogonia* spp., *Aeneolamia* spp., *Agonosцена* spp., *Aleurocanthus* spp., *Aleyrodes proletella*, *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus floccosus*, *Allocaridara malayensis*, *Amrasca* spp., por ejemplo *Amrasca bigutulla*, *Amrasca devastans*, *Anuraphis cardui*, *Aonidiella* spp., por ejemplo *Aonidiella aurantii*, *Aonidiella citrina*, *Aonidiella inornata*, *Aphanostigma piri*, *Aphis* spp., por ejemplo *Aphis citricola*, *Aphis craccivora*, *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis glycines*, *Aphis gossypii*, *Aphis hederiae*, *Aphis illinoisensis*, *Aphis middletoni*, *Aphis nasturtii*, *Aphis nerii*, *Aphis pomi*, *Aphis spiraeicola*, *Aphis viburniphila*, *Arboridia apicalis*, *Arytainilla* spp., *Aspidiella* spp., *Aspidiotus* spp., por ejemplo *Aspidiotus nerii*, *Atanus* spp., *Aulacorthum solani*, *Bemisia tabaci*, *Blastopsylla occidentalis*, *Boreioglycaspis melaleucae*, *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycolus* spp., *Brevicoryne brassicae*, *Cacopsylla* spp., por ejemplo *Cacopsylla pyricola*, *Calligypona marginata*, *Capulinia* spp., *Carneocephala fulgida*, *Ceratovacuna lanigera*, *Cercopidae*, *Ceroplastes* spp., *Chaetosiphon fragaefolii*, *Chionaspis tegalensis*, *Chlorita onukii*, *Chondracris rosea*, *Chromaphis juglandicola*, *Chrysomphalus aonidum*, *Chrysomphalus ficus*, *Cicadulina mbila*, *Cocomytilus halli*, *Coccus* spp., por ejemplo *Coccus hesperidum*, *Coccus longulus*, *Coccus pseudomagnoliarum*, *Coccus viridis*, *Cryptomyzus ribis*, *Cryptoneossa* spp., *Ctenarytaina* spp., *Dalbulus* spp., *Dialeurodes chittendeni*, *Dialeurodes citri*, *Diaphorina citri*, *Diaspis* spp., *Diuraphis* spp., *Doralis* spp., *Drosicha* spp., *Dysaphis* spp., por ejemplo *Dysaphis apiifolia*, *Dysaphis plantaginea*, *Dysaphis tulipae*, *Dysmicoccus* spp., *Empoasca* spp., por ejemplo *Empoasca abrupta*, *Empoasca fabae*, *Empoasca maligna*, *Empoasca solana*, *Empoasca stevensi*, *Eriosoma* spp., por ejemplo *Eriosoma americanum*, *Eriosoma lanigerum*, *Eriosoma*

- pyricola, *Erythroneura* spp., *Eucalyptolyma* spp., *Euphyllura* spp., *Euscelis bilobatus*, *Ferrisia* spp., *Fiorinia* spp., *Furcaspis oceanica*, *Geococcus coffeae*, *Glycaspis* spp., *Heteropsylla cubana*, *Heteropsylla spinulosa*, *Homalodisca coagulata*, *Hyalopterus arundinis*, *Hyalopterus pruni*, *Icerya* spp., por ejemplo *Icerya purchasi*, *Idiocerus* spp., *Idioscopus* spp., *Laodelphax striatellus*, *Lecanium* spp., por ejemplo
- 5 *Lecanium corni* (= *Parthenolecanium corni*), *Lepidosaphes* spp., por ejemplo *Lepidosaphes ulmi*, *Lipaphis erysimi*, *Lopholeucaspis japonica*, *Lycorma delicatula*, *Macrosiphum* spp., por ejemplo *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphum lillii*, *Macrosiphum rosae*, *Macrosteles facifrons*, *Mahanarva* spp., *Melanaphis sacchari*, *Metcalfiella* spp., *Metcalfa pruinosa*, *Metopolophium dirhodum*, *Monellia costalis*, *Monelliopsis pecanis*, *Myzus* spp., por ejemplo *Myzus ascalonicus*, *Myzus cerasi*, *Myzus ligustri*, *Myzus ornatus*,
- 10 *Myzus persicae*, *Myzus nicotianae*, *Nasonovia ribisnigri*, *Neomaskellia* spp., *Nephotettix* spp., por ejemplo *Nephotettix cincticeps*, *Nephotettix nigropictus*, *Nettigoniclla spectra*, *Nilaparvata lugens*, *Oncometopia* spp., *Orthezia praelonga*, *Oxya chinensis*, *Pachypsylla* spp., *Parabemisia myricae*, *Paratrioza* spp., por ejemplo *Paratrioza cockerelli*, *Parlatoria* spp., *Pemphigus* spp., por ejemplo *Pemphigus bursarius*, *Pemphigus populivenerae*, *Peregrinus maidis*, *Perkinsiella* spp., *Phenacoccus* spp.,
- 15 por ejemplo *Phenacoccus madeirensis*, *Phloeomyzus passerinii*, *Phorodon humuli*, *Phylloxera* spp., por ejemplo *Phylloxera devastatrix*, *Phylloxera notabilis*, *Pinnaspis aspidistrae*, *Planococcus* spp., por ejemplo *Planococcus citri*, *Prosopidopsylla flava*, *Protopulvinaria pyriformis*, *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pseudococcus* spp., por ejemplo *Pseudococcus calceolariae*, *Pseudococcus comstocki*, *Pseudococcus longispinus*, *Pseudococcus maritimus*, *Pseudococcus viburni*, *Psyllopsis* spp., *Psylla* spp., por ejemplo
- 20 *Psylla buxi*, *Psylla mali*, *Psylla pyri*, *Pteromalus* spp., *Pulvinaria* spp., *Pyrilla* spp., *Quadraspidotus* spp., por ejemplo *Quadraspidotus juglansregiae*, *Quadraspidotus ostreaeformis*, *Quadraspidotus perniciosus*, *Quesada gigas*, *Rastrococcus* spp., *Rhopalosiphum* spp., por ejemplo *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum oxyacanthae*, *Rhopalosiphum padi*, *Rhopalosiphum rufiabdominale*, *Saissetia* spp., por ejemplo *Saissetia coffeae*, *Saissetia miranda*, *Saissetia neglecta*, *Saissetia oleae*, *Scaphoideus titanus*,
- 25 *Schizaphis graminum*, *Selenaspidus articulatus*, *Sipha flava*, *Sitobion avenae*, *Sogata* spp., *Sogatella furcifera*, *Sogatodes* spp., *Stictocephala festina*, *Siphoninus phillyreae*, *Tenalaphara malayensis*, *Tetragonocephala* spp., *Tinocallis caryaefoliae*, *Tomaspis* spp., *Toxoptera* spp., por ejemplo *Toxoptera aurantii*, *Toxoptera citricidus*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Trioza* spp., por ejemplo *Trioza diospyri*, *Typhlocyba* spp., *Unaspis* spp., *Viteus vitifolii*, *Zygina* spp.;
- 30 del suborden Heteroptera por ejemplo *Aelia* spp., *Anasa tristis*, *Antestiopsis* spp., *Boisea* spp., *Blissus* spp., *Calocoris* spp., *Campylomma livida*, *Cavelerius* spp., *Cimex* spp., por ejemplo *Cimex adjunctus*, *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Cimex pilosellus*, *Collaria* spp., *Creontiades dilutus*, *Dasynus piperis*, *Dichelops furcatus*, *Diconocoris hewetti*, *Dysdercus* spp., *Euschistus* spp., por ejemplo *Euschistus heros*, *Euschistus servus*, *Euschistus tristigmus*, *Euschistus variolarius*, *Eurydema* spp., *Eurygaster* spp.,
- 35 *Halyomorpha halys*, *Heliopeltis* spp., *Horcias nobilellus*, *Leptocoris* spp., *Leptocoris varicornis*, *Leptoglossus occidentalis*, *Leptoglossus phyllopus*, *Lygocoris* spp., por ejemplo *Lygocoris pabulinus*, *Lygus* spp., por ejemplo *Lygus elisus*, *Lygus hesperus*, *Lygus lineolaris*, *Macropes excavatus*, *Megacopta cribraria*, *Miridae*, *Monalonion atratum*, *Nezara* spp., por ejemplo *Nezara viridula*, *Nysius* spp., *Oebalus*

spp., Pentomidae, *Piesma quadrata*, *Piezodorus* spp., por ejemplo *Piezodorus guildinii*, *Psallus* spp., *Pseudacysta perseae*, *Rhodnius* spp., *Sahlbergella singularis*, *Scaptocoris castanea*, *Scotinophora* spp., *Stephanitis nashi*, *Tibraca* spp., *Triatoma* spp.;

- del orden Hymenoptera por ejemplo *Acromyrmex* spp., *Athalia* spp., por ejemplo *Athalia rosae*, *Atta* spp.,
- 5 *Camponotus* spp., *Dolichovespula* spp., *Diprion* spp., por ejemplo *Diprion similis*, *Hoplocampa* spp., por ejemplo *Hoplocampa cookei*, *Hoplocampa testudinea*, *Lasius* spp., *Linepithema* (*Iridomyrmex*) *humile*, *Monomorium pharaonis*, *Paratrechina* spp., *Paravespula* spp., *Plagiolepis* spp., *Sirex* spp., *Solenopsis invicta*, *Tapinoma* spp., *Technomyrmex albipes*, *Urocerus* spp., *Vespa* spp., por ejemplo *Vespa crabro*, *Wasmannia auropunctata*, *Xeris* spp.;
- 10 del orden Isopoda por ejemplo *Armadillidium vulgare*, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*;
- del orden Isoptera por ejemplo *Coptotermes* spp., por ejemplo *Coptotermes formosanus*, *Cornitermes cumulans*, *Cryptotermes* spp., *Incisitermes* spp., *Kaloterms* spp., *Microtermes obesi*, *Nasutitermes* spp., *Odontotermes* spp., *Porotermes* spp., *Reticulitermes* spp., por ejemplo *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes hesperus*;
- 15 del orden Lepidoptera por ejemplo *Achroia grisella*, *Acronicta major*, *Adoxophyes* spp., por ejemplo *Adoxophyes orana*, *Aedia leucomelas*, *Agrotis* spp., por ejemplo *Agrotis segetum*, *Agrotis ipsilon*, *Alabama* spp., por ejemplo *Alabama argillacea*, *Amyelois transitella*, *Anarsia* spp., *Anticarsia* spp., por ejemplo *Anticarsia gemmatilis*, *Argyroplote* spp., *Autographa* spp., *Barathra brassicae*, *Blastodacna atra*, *Borbo cinnara*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Busseola* spp., *Cacoecia* spp., *Caloptilia*
- 20 *theivora*, *Capua reticulana*, *Carpocapsa pomonella*, *Carposina niponensis*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo* spp., por ejemplo *Chilo plejadellus*, *Chilo suppressalis*, *Choreutis pariana*, *Choristoneura* spp., *Chrysodeixis chalcites*, *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocerus* spp., *Cnaphalocrocis medinalis*, *Cnephasia* spp., *Conopomorpha* spp., *Conotrachelus* spp., *Copitarsia* spp., *Cydia* spp., por ejemplo *Cydia nigricana*, *Cydia pomonella*, *Dalaca noctuides*, *Diaphania* spp., *Diparopsis* spp., *Diatraea saccharalis*, *Earias* spp.,
- 25 *Ecdytolopha aurantium*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Eldana saccharina*, *Ephestia* spp., por ejemplo *Ephestia elutella*, *Ephestia kuehniella*, *Epinotia* spp., *Epiphyas postvittana*, *Erannis* spp., *Erschoviella musculana*, *Etiella* spp., *Eudocima* spp., *Eulia* spp., *Eupoecilia ambiguella*, *Euproctis* spp., por ejemplo *Euproctis chrysorrhoea*, *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Galleria mellonella*, *Gracillaria* spp., *Grapholitha* spp., por ejemplo *Grapholitha molesta*, *Grapholitha prunivora*, *Hedylepta* spp., *Helicoverpa* spp., por ejemplo *Helicoverpa*
- 30 *armigera*, *Helicoverpa zea*, *Heliothis* spp., por ejemplo *Heliothis virescens*, *Hofmannophila pseudospretella*, *Homoeosoma* spp., *Homona* spp., *Hyponomeuta padella*, *Kakivoria flavofasciata*, *Lampides* spp., *Laphygma* spp., *Laspeyresia molesta*, *Leucinodes orbonalis*, *Leucoptera* spp., por ejemplo *Leucoptera coffeella*, *Lithocolletis* spp., por ejemplo *Lithocolletis blancardella*, *Lithophane antennata*, *Lobesia* spp., por ejemplo *Lobesia botrana*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria* spp., por ejemplo *Lymantria*
- 35 *dispar*, *Lyonetia* spp., por ejemplo *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*, *Maruca testulalis*, *Mamestra brassicae*, *Melanitis leda*, *Mocis* spp., *Monopis obviella*, *Mythimna separata*, *Nemapogon cloacellus*,

- Nymphula spp., Oiketicus spp., Omphisa spp., Operophtera spp., Oria spp., Orthaga spp., Ostrinia spp., por ejemplo Ostrinia nubilalis, Panolis flammea, Parnara spp., Pectinophora spp., por ejemplo Pectinophora gossypiella, Perileucoptera spp., Phthorimaea spp., por ejemplo Phthorimaea operculella, Phyllocnistis citrella, Phyllonorycter spp., por ejemplo Phyllonorycter blancardella, Phyllonorycter crataegella, Pieris spp., por ejemplo Pieris rapae, Platynota stultana, Plodia interpunctella, Plusia spp., Plutella xylostella (= Plutella maculipennis), Prays spp., Prodenia spp., Protoparce spp., Pseudaletia spp., por ejemplo Pseudaletia unipuncta, Pseudoplusia includens, Pyrausta nubilalis, Rachiplusia nu, Schoenobius spp., por ejemplo Schoenobius bipunctifer, Scirpophaga spp., por ejemplo Scirpophaga innotata, Scotia segetum, Sesamia spp., por ejemplo Sesamia inferens, Sparganothis spp., Spodoptera spp., por ejemplo Spodoptera eradiana, Spodoptera exigua, Spodoptera frugiperda, Spodoptera praefica, Stathmopoda spp., Stenoma spp., Stomopteryx subsecivella, Synanthedon spp., Tecia solanivora, Thaumetopoea spp., Thermesia gemmatilis, Tinea cloacella, Tinea pellionella, Tineola bisselliella, Tortrix spp., Trichophaga tapetzella, Trichoplusia spp., por ejemplo Trichoplusia ni, Tryporyza incertulas, Tuta absoluta, Virachola spp.;
- 15 del orden Orthoptera o Saltatoria por ejemplo Acheta domesticus, Dichroplus spp., Gryllotalpa spp., por ejemplo Gryllotalpa gryllotalpa, Hieroglyphus spp., Locusta spp., por ejemplo Locusta migratoria, Melanoplus spp., por ejemplo Melanoplus devastator, Paratlanticus ussuriensis, Schistocerca gregaria;
- del orden Phthiraptera por ejemplo Damalinia spp., Haematopinus spp., Linognathus spp., Pediculus spp., Phylloxera vastatrix, Phthirus pubis, Trichodectes spp.;
- 20 del orden Psocoptera por ejemplo Lepinotus spp., Liposcelis spp.;
- del orden Siphonaptera por ejemplo Ceratophyllus spp., Ctenocephalides spp., por ejemplo Ctenocephalides canis, Ctenocephalides felis, Pulex irritans, Tunga penetrans, Xenopsylla cheopis;
- del orden Thysanoptera por ejemplo Anaphothrips obscurus, Baliothrips biformis, Chaetanaphothrips leeuweni, Drepanothrips reuteri, Enneothrips flavens, Frankliniella spp., por ejemplo Frankliniella fusca, 25 Frankliniella occidentalis, Frankliniella schultzei, Frankliniella tritici, Frankliniella vaccinii, Frankliniella williamsi, Haplothrips spp., Heliothrips spp., Hercinothrips femoralis, Kakothrips spp., Rhipiphorothrips cruentatus, Scirtothrips spp., Taeniothrips cardamomi, Thrips spp., por ejemplo Thrips palmi, Thrips tabaci;
- del orden Zygentoma (= Thysanura), por ejemplo Ctenolepisma spp., Lepisma saccharina, Lepismodes 30 inquilinus, Thermobia domestica;
- de la clase Symphyla por ejemplo Scutigera spp., por ejemplo Scutigera immaculata;
- plagas de la cepa Mollusca, en especial de la clase Bivalvia, por ejemplo Dreissena spp.;

así como de la clase Gastropoda por ejemplo *Arion* spp., por ejemplo *Arion ater rufus*, *Biomphalaria* spp., *Bulinus* spp., *Deroceras* spp., por ejemplo *Deroceras laeve*, *Galba* spp., *Lymnaea* spp., *Oncomelania* spp., *Pomacea* spp., *Succinea* spp.;

- parásitos humanos y de animales de las cepas Platyhelminthes y Nematoda, por ejemplo *Aelurostrongylus* spp., *Amidostomum* spp., *Ancylostoma* spp, por ejemplo *Ancylostoma duodenale*, *Ancylostoma ceylanicum*, *Ancylostoma braziliensis*, *Angiostrongylus* spp., *Anisakis* spp., *Anoplocephala* spp., *Ascaris* spp., *Ascaridia* spp., *Baylisascaris* spp., *Brugia* spp., por ejemplo *Brugia malayi*, *Brugia timori*, *Bunostomum* spp., *Capillaria* spp., *Chabertia* spp., *Clonorchis* spp., *Cooperia* spp., *Crenosoma* spp., *Cyathostoma* spp., *Dicrocoelium* spp., *Dictyocaulus* spp., por ejemplo *Dictyocaulus filaria*,
 10 *Diphyllbothrium* spp., por ejemplo *Diphyllbothrium latum*, *Dipylidium* spp., *Dirofilaria* spp., *Dracunculus* spp., por ejemplo *Dracunculus medinensis*, *Echinococcus* spp., por ejemplo *Echinococcus granulosus*, *Echinococcus multilocularis*, *Echinostoma* spp., *Enterobius* spp., por ejemplo *Enterobius vermicularis*, *Eucoleus* spp., *Fasciola* spp., *Fascioloides* spp., *Fasciolopsis* spp., *Filaroides* spp., *Gongylonema* spp., *Gyrodactylus* spp., *Habronema* spp., *Haemonchus* spp., *Heligmosomoides* spp.,
 15 *Heterakis* spp., *Hymenolepis* spp., por ejemplo *Hymenolepis nana*, *Hyostongylus* spp., *Litomosoides* spp., *Loa* spp., por ejemplo *Loa Loa*, *Metastrongylus* spp., *Metorchis* spp., *Mesocetoides* spp., *Moniezia* spp., *Muellerius* spp., *Necator* spp., *Nematodirus* spp., *Nippostrongylus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Ollulanus* spp., *Onchocerca* spp, por ejemplo *Onchocerca volvulus*, *Opisthorchis* spp., *Oslerus* spp., *Ostertagia* spp., *Oxyuris* spp., *Paracapillaria* spp., *Parafilaria* spp., *Paragonimus* spp., *Paramphistomum* spp., *Paranoplocephala* spp., *Parascaris* spp., *Passalurus* spp., *Protostrongylus* spp., *Schistosoma* spp.,
 20 *Setaria* spp., *Spirocercia* spp., *Stephanofilaria* spp., *Stephanurus* spp., *Strongyloides* spp., por ejemplo *Strongyloides fuelleborni*, *Strongyloides stercoralis*, *Strongylus* spp., *Syngamus* spp., *Taenia* spp., por ejemplo *Taenia saginata*, *Taenia solium*, *Teladorsagia* spp., *Thelazia* spp., *Toxascaris* spp., *Toxocara* spp., *Trichinella* spp., por ejemplo *Trichinella spiralis*, *Trichinella nativa*, *Trichinella britovi*, *Trichinella nelsoni*, *Trichinella pseudospiralis*, *Trichobilharzia* spp., *Trichostrongylus* spp., *Trichuris* spp., por
 25 ejemplo *Trichuris trichuria*, *Uncinaria* spp., *Wuchereria* spp., por ejemplo *Wuchereria bancrofti*;

- plagas de plantas de la cepa de Nematoda, es decir nemátodos parasitarios de plantas, en especial *Aglenchus* spp., por ejemplo *Aglenchus agricola*, *Anguina* spp., por ejemplo *Anguina tritici*, *Aphelenchoides* spp., por ejemplo *Aphelenchoides arachidis*, *Aphelenchoides fragariae*, *Belonolaimus* spp., por ejemplo *Belonolaimus gracilis*, *Belonolaimus longicaudatus*, *Belonolaimus nortoni*,
 30 *Bursaphelenchus* spp., por ejemplo *Bursaphelenchus cocophilus*, *Bursaphelenchus eremus*, *Bursaphelenchus xylophilus*, *Cacopaurus* spp., por ejemplo *Cacopaurus pestis*, *Criconemella* spp., por ejemplo *Criconemella curvata*, *Criconemella onoensis*, *Criconemella ornata*, *Criconemella rusium*, *Criconemella xenoplax* (= *Mesocriconema xenoplax*), *Criconemoides* spp., por ejemplo *Criconemoides ferniae*, *Criconemoides onoense*, *Criconemoides ornatum*, *Ditylenchus* spp., por ejemplo *Ditylenchus dipsaci*, *Dolichodorus* spp., *Globodera* spp., por ejemplo *Globodera pallida*, *Globodera rostochiensis*, *Helicotylenchus* spp., por ejemplo *Helicotylenchus dihystra*, *Hemicriconemoides* spp., *Hemicycliophora*

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

Además se puede combatir del subreino protozoo el orden Coccidia, por ejemplo Eimeria spp.

Los compuestos de la fórmula (I) en ciertas concentraciones o dosis de aplicación, también se pueden usar como herbicidas, protectores, reguladores del crecimiento o agentes que mejoren las propiedades de la
 15 planta, o como microbicidas o gamotocidas, por ejemplo como fungicidas, antimicóticos, bactericidas, viricidas (incluyendo agentes contra los viroides) o como agentes contra MLO (organismos como el micoplasma) y RLO (organismos como la rickettsia). También se pueden emplear como intermedios o precursores para la síntesis de otros principios activos.

Formulaciones

20 La presente invención se refiere además a formulaciones y sus formas de aplicación como pesticidas como por ejemplo licores para drench, drip y en aerosol comprendiendo al menos un compuesto de la fórmula (I). En caso dado las formas de aplicación contienen otros pesticidas y/o adyuvantes que mejoran el efecto como fomentadores de penetración, por ejemplo aceites vegetales tales como aceite de colza, aceite de girasol, aceites minerales tales como aceites de parafina, ésteres de alquilo de grasas vegetales tales como
 25 éster metílico de aceite de colza o de soja o alcoxilatos de alcano y/o agentes de difusión como por ejemplo alquilsiloxanos y/o sales por ejemplo sales orgánicas o inorgánicas de amonio o fosfonio como por ejemplo sulfato de amonio o hidrógeno fosfato diamónico y/o agentes fomentadores de retención como por ejemplo dioctilsulfosuccinato o polímeros hidroxipropilguar y/o humectantes como por ejemplo glicerina y/o fertilizantes como por ejemplo los que contienen amonio, potasio o fósforo.

30 Formulaciones habituales son por ejemplo líquidos solubles en agua (SL), concentrados en emulsión (EC), emulsiones en agua (EW), concentrados en suspensión (SC, SE, FS, OD), gránulos dispersables en agua (WG), gránulos (GR) y concentrados en cápsula (CS); estos y otros tipos de formulaciones posibles son descritos por ejemplo por Crop Life International y están en Pesticide Specifications, Manual on development and use of FAO and WHO specifications for pesticides, FAO Plant Production and
 35 Protection Papers – 173, prepared by the FAO/WHO Joint Meeting on Pesticide Specifications, 2004,

ISBN: 9251048576. En caso dado las formulaciones contienen además de uno o varios compuestos de la fórmula (I) otros activos agroquímicos.

Preferiblemente se trata de formulaciones o formas de aplicación que contienen excipientes como por ejemplo diluyentes, solventes, fomentadores de espontaneidad, agentes portadores, emulsionantes, dispersantes, anticongelantes, biocidas, espesantes y/u otros excipientes como por ejemplo adyuvantes. En este contexto un adyuvante es un componente que mejora la actividad biológica de la formulación, sin que el componente en sí tenga efecto biológico. Ejemplos de adyuvantes son agentes que promueven la retención, el comportamiento de difusión, la adhesión a la superficie de la hoja o la penetración.

Estas formulaciones se producen de un modo conocido, por ejemplo por medio de la mezcla de los compuestos de la fórmula (I) con excipientes como por ejemplo diluyentes, solventes y/o agentes transportadores sólidos y/o otros excipientes como por ejemplo surfactantes. Las formulaciones se preparan ya sea en plantas adecuadas o bien antes o durante la aplicación.

Como excipientes se usan aquellas sustancias que son adecuadas para impartir a la formulación de los compuestos de la fórmula (I) o a las formas de aplicación derivadas de ella (como por ejemplo pesticidas útiles como licores en aerosol o recubrimiento de semillas) propiedades particulares tales como ciertas propiedades físicas, técnicas y/o biológicas.

Diluyentes adecuados son, por ejemplo, agua, líquidos químicos orgánicos polares y no polares, por ejemplo, de la clase de los hidrocarburos aromáticos y no aromáticos (tales como parafina, alquilbencenos, alquilnaftalenos, clorobencenos), los alcoholes y polioles (que dado el caso se pueden sustituir, eterificar y/o esterificar), las cetonas (tales como la acetona, ciclohexanona), ésteres (incluyendo grasas y aceites) y (poli-)éteres, las aminas simples y sustituidas, amidas, lactamas (tales como N-alquilpirrolidonas) y lactonas, las sulfonas y sulfóxidos (tales como sulfóxido de dimetilo).

Si se usa agua como diluyente, también es posible emplear, por ejemplo, solventes orgánicos como solventes auxiliares. Esencialmente, los solventes líquidos adecuados son: aromáticos tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, aromáticos clorinados e hidrocarburos alifáticos clorinados tales como clorobencenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos tales como ciclohexano o parafinas, por ejemplo, fracciones de petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoholes tales como butanol o glicol y también sus éteres y ésteres, cetonas tales como acetona, cetona etílica de metilo, cetona isobutílica de metilo o ciclohexanona, solventes polares fuertes tales como dimetilformamida y sulfóxido de dimetilo y también agua.

Básicamente se pueden usar todos los solventes adecuados. Solventes adecuados son por ejemplo hidrocarburos aromáticos como por ejemplo xileno, tolueno o alquilnaftalenos, aromáticos clorinados e hidrocarburos alifáticos clorinados tales como clorobencenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos tales como ciclohexano o parafinas, fracciones de petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoholes tales como por ejemplo metanol, etanol, iso-propanol, butanol o glicol y también sus

éteres y ésteres, cetonas tales como acetona, cetona etílica de metilo, cetona isobutílica de metilo o ciclohexanona, solventes polares fuertes tales como sulfóxido de dimetilo y también agua.

Básicamente se pueden usar todos los portadores adecuados. Los portadores adecuados son en particular: por ejemplo las sales de amonio y minerales naturales del suelo tales como caolines, arcillas, talco, tiza, 5 cuarzo, atapulgita, montmorillonita o tierra de diatomeas, y minerales sintéticos del suelo, tales como sílice, alúmina y silicatos naturales o sintéticos altamente dispersos, resinas, ceras y/o fertilizantes sólidos. También se pueden usar mezclas de tales portadores. Portadores de gránulo son: por ejemplo rocas naturales trituradas y fraccionadas tales como calcita, mármol, pómez, sepiolita y dolomita, y también gránulos sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas, y gránulos de materiales orgánicos tales como el 10 aserrín, papel, cáscara de coco, marlo de maíz y tallos de tabaco.

También se pueden usar diluyentes o solventes licuados, en forma de gas. En particular son adecuados tales diluyentes o portadores que a temperatura y presión normal tienen forma de gas, por ejemplo gas propelente en aerosol como tales como hidrocarburos halogenados, así como butano, propano, nitrógeno y dióxido de carbono.

15 Ejemplos de emulsionadores y/o formadores de espuma, dispersantes o humectantes con propiedades iónicas y no-iónicas o mezclas de estos surfactantes son sales de ácido poliacrílico, sales de ácido lignosulfónico, sales de ácido fenolsulfónicos o ácido naftalenosulfónico, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o con ácidos grasos o con aminas grasas, con fenoles sustituidos (preferiblemente alquilfenoles o arilfenoles), sales de ésteres sulfo-ambar, derivados de taurina 20 (preferiblemente alquilotauratos), ésteres fosfóricos de alcoholes polietoxilados o fenoles, ésteres de ácidos grasos de polioles y derivados de los compuestos que contienen sulfatos, sulfonatos y fosfatos, por ejemplo éter alquilarylpoliglicol, alquilsulfonatos, alquilsulfatos, arilosulfonatos, hidrolizados de proteínas, licores de sulfito de lignina y metilcelulosa. La presencia de una sustancia surfactante es ventajosa cuando uno de los compuestos de la fórmula (I) y/o uno de los portadores inertes no es soluble 25 en agua y cuando la aplicación se realiza en agua.

Se pueden usar colorantes como excipientes adicionales en las formulaciones y en las formas de aplicación de ellas derivadas tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo óxido de hierro, óxido de titanio y Azul Prusiano, y colorantes orgánicos, tales como colorantes de alizarina, colorantes azoicos y colorantes de ftalocianina metálica, y nutrientes y micronutrientes tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, 30 cobalto, molibdeno y zinc.

También pueden estar presentes estabilizantes como estabilizadores de temperatura, conservantes, antioxidantes, protectores solares u otros agentes que mejoran la estabilidad química y/o física. También pueden estar presentes agentes espumantes o antiespumantes.

Se pueden usar además en las formulaciones fijadores tales como carboximetilcelulosa, polímeros 35 sintéticos y naturales en forma de polvo, gránulos o látex, tales como goma arábiga, alcohol de polivinilo

y acetato de polivinilo, así como también fosfolípidos naturales tales como cefalinas y lecitinas, y fosfolípidos sintéticos. Otros excipientes pueden ser aceites minerales y vegetales.

También pueden estar presentes otros excipientes adicionales en las formulaciones y en las formas de aplicación de ellas derivadas. Tales aditivos son, por ejemplo fragancias, coloides protectores, aglutinantes, adhesivos, espesantes, agentes tixotrópicos, fomentadores de penetración y de retención, estabilizantes, agentes secuestrantes, agentes complejantes, humectantes, dispersantes. En general los compuestos de la fórmula (I) pueden combinarse con cualquier aditivo sólido o líquido, que se utiliza habitualmente para los propósitos de formulación.

Como fomentadores de retención se consideran todas aquellas sustancias que reducen la tensión superficial dinámica como por ejemplo dioctilsulfosuccinato o los que aumentan la visco-elasticidad como por ejemplo polímeros hidroxipropilguar.

Como fomentadores de penetración en el presente contexto se consideran todas aquellas sustancias que se usan habitualmente para mejorar la penetración de los activos agroquímicos en las plantas. Los fomentadores de penetración en este contexto se definen de modo que penetran a partir del licor de aplicación (generalmente acuosa) y/o por pulverización en la cutícula de la planta y por lo tanto pueden aumentar la movilidad del material (movilidad) de los compuestos activos en la cutícula. El método descrito en la literatura (Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152) puede ser utilizado para determinar esta propiedad. A modo de ejemplo se mencionan alcoxilatos de alcohol como por ejemplo etoxilato de aceite de coco (10) o isotridecilo etoxilato (12), ésteres de ácidos grasos como por ejemplo éster metílico de aceite de colza o de soja, alcoxilatos de aminas grasas como por ejemplo tallow amina etoxilada (15) o sales de amonio y/o fosfonio como por ejemplo sulfato de amonio o hidrógeno fosfato diamónico.

Las formulaciones preferentemente comprenden entre el 0,00000001 y el 98 % en peso del compuesto de la fórmula (I), especialmente preferente entre 0,01 y 95 % en peso del compuesto de la fórmula (I), de forma muy especialmente preferente entre 0,5 y 90 % en peso del compuesto de la fórmula (I), basado en el peso de la formulación.

El contenido del compuesto de la fórmula (I) en las formas de aplicación (particularmente pesticidas) preparadas a partir de las formulaciones de aplicación puede variar dentro de amplios intervalos. La concentración del compuesto de la fórmula (I) en las formas de aplicación habitualmente puede estar entre 0,00000001 y 95 % en peso del compuesto de la fórmula (I), preferentemente entre 0,00001 y 1 % en peso, basado en el peso de la forma de aplicación. La aplicación se usa de una manera habitual adaptada a las formas de aplicación.

Mezclas

Los compuestos de la fórmula (I) se pueden usar en mezclas con uno o varios fungicidas, bactericidas, acaricidas, molusquicidas, nematicidas, insecticidas, microbiológica, sustancias beneficiosas, herbicidas, fertilizantes, repelentes de aves, fitotónicos, agentes esterilizantes, protectores, semioquímicos y/o sustancias reguladoras del crecimiento adecuadas, para por ejemplo para ampliar el espectro de actividad, para prolongar la duración de la acción, para aumentar la velocidad de la acción, prevenir la repelencia o el desarrollo de la resistencia. Además, tales combinaciones de sustancias activas pueden mejorar el crecimiento de las plantas y/o la tolerancia a factores abióticos como por ejemplo temperaturas altas o bajas, la sequía o al incremento de agua o de salinidad del suelo. También se puede mejorar el comportamiento de la floración y de la fruta, optimizar la germinación y el enraizamiento, facilitar la cosecha y aumentar los rendimientos de cultivos, afectar a la madurez, mejorar la calidad y/o el valor nutricional de los productos cosechados, extender la vida útil y/o la procesabilidad de los productos cosechados.

Además los compuestos de la fórmula (I) pueden estar presentes en mezclas con otros principios activos o semioquímicos, tales como feromonas y/o repelentes de aves y/o activadores de plantas y/o sustancias reguladoras del crecimiento y/o fertilizantes. Del mismo modo los compuestos de la fórmula (I) pueden utilizarse en mezclas con preparados para mejorar las propiedades de las plantas como por ejemplo crecimiento, rendimiento y calidad del cultivo.

En una realización particular de la invención los compuestos de la fórmula (I) están presentes en formulaciones y en las formas de aplicación derivadas de éstas en mezclas con otros compuestos, preferentemente en aquellos descriptos a continuación.

Si uno de los compuestos mencionados a continuación aparece en una de las distintas formas tautómeras, entonces también están comprendidas estas formas aunque no se nombren explícitamente en cada caso.

Insecticidas / Acaricidas / Nematicidas

Los principios activos aquí nombrados por su „common name“ son conocidos y están descriptos por ejemplo en el manual de pesticidas („The Pesticide Manual“ 16th Ed., British Crop Protection Council 2012) o pueden ser buscados en internet (por ejemplo <http://www.alanwood.net/pesticides>).

(1) Inhibidores de la acetilcolinesterasa (AChE), como por ejemplo carbamatos, por ejemplo alanicarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbarilo, carbofuran, carbosulfan, etiofencarb, fenobucarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, triazamato, trimetacarb, XMC y xililcarb; u organofosfatos, por ejemplo acefato, azametifos, azinfos (-metilo, -etilo), cadusafos, cloroetoxifos, clorofenvinfos, cloromefos, cloropirifos (-metilo), cumafos, cianofos, demeton-S-metilo, diazinona, diclorovos/DDVP, dicrotofos, dimetoato, dimetilvinfos, disulfoton, EPN, etion, etoprofos, famfur, fenamifos, fenitrothion, fention, fostiazato, heptenofos, isofenfos, O-(metoxiaminotio-fosforil)salicilato de isopropilo, isoxation, malation, mecarbam, metamidofos, metidation, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemeton-

metilo, paration (-metilo), fentoato, forato, fosadona, fosmet, fosfamidon, foxim, pirimifos (-metilo), profenofos, propetamfos, protiofos, piraclofos, piridafention, quinalfos, sulfotep, tebupirimfos, temefos, terbufos, tetraclorovinifos, tiometon, triazofos, triclorfon y vamidotion.

5 (2) Antagonistas del canal de cloruro controlado por GABA, como por ejemplo ciclodienos organoclorados, por ejemplo clorodanos y endosulfanos o fenilpirazoles (fiproles), por ejemplo etiproles y fipronilos.

(3) Moduladores del canal de sodio/bloqueadores del canal de sodio dependientes de la tensión, tales como, por ejemplo piretroides, por ejemplo acrinatrina, aletrina (d-cis-trans, d-trans), bifentrina, bioaletrina, isómero bioaletrin-S-ciclopentenilo, bioresmetrina, cicloprotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, 10 cihalotrina, lambda-cihalotrina, gamma- cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, beta-cipermetrina, theta-cipermetrina, zeta-cipermetrina, cifenotrina [isómero (1R)-trans], deltametrina, empentrina [isómero (EZ)-(1R)], esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flumetrina, tau-fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, cadetrina, momflúorotrina, permetrina, fenotrina [isómero (1R)-trans], praletrina, piretrina (piretrum), resmetrina, silafluofen, teflutrina, tetrametrina, tetrametrina 15 [isómero (1R)], tralometrina, transfiutrina o DDT o metoxicloro.

(4) Agonistas nicotínicos del receptor de acetilcolina (nAChR), como por ejemplo neonicotinoides, por ejemplo acetamiprid, clotianidina, dinotefuran, imidacloprid, nitenpiram, tiacloprid y tiametoxam o nicotina o sulfoxaflo o flupyradifurone.

20 (5) Activadores nicotínicos alostéricos del receptor de acetilcolina (nAChR), como por ejemplo espinosimas, por ejemplo espinetoram y espinosad.

(6) Activadores del canal de cloruro, tales como por ejemplo avermectina/milbemicina, por ejemplo abamectina, benzoato de emamectina, lepimectina y milbemectina.

(7) Imitadores de la hormona juvenil, como por ejemplo análogos de hormonas juveniles, por ejemplo hidropreno, quinopreno y metopreno o fenoxicarb o piriproxifeno.

25 (8) Principios activos con mecanismos de acción desconocidos o no específicos, como por ejemplo haluros de alquilo, por ejemplo bromuro de metilo y otros halo alcanos; o cloropirina o flúoruro de sulfurilo o bórax o tártaro emético.

(9) Inhibidores selectivos de la nutrición, por ejemplo pimetrozina o flonicamid.

30 (10) Inhibidores del crecimiento de ácaros, por ejemplo clofentezina, hexitiazox y diflovidazina o etoxazol.

- (11) Destruyentes microbianos de la membrana digestiva de insectos, tales como, por ejemplo, *Bacillus thuringiensis* subespecie israelensis, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* subespecie aizawai, *Bacillus thuringiensis* subespecie kurstaki, *Bacillus thuringiensis* subespecie tenebrionis y proteínas de plantas BT, por ejemplo Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry2Ab, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34/35Ab1.
- 5 (12) Inhibidores de la fosforilación oxidativa, disruptores de ATP, tales como por ejemplo diafenthiuron o compuestos de organoestano, por ejemplo azociclotina, cihexatina y óxido de fenbutatina o propargita o tetradifon.
- (13) Desacopladores de la fosforilación oxidativa mediante interrupción del gradiente del protón H, tales como por ejemplo clorfenapir, DNOC y sulfluramida.
- 10 (14) Antagonistas nicotínicos del receptor de acetilcolina, como por ejemplo bensultap, clorhidrato de cartap, tiocilam y tiosultap (-sodio).
- (15) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 0, tales como, por ejemplo bistrifluron, clorfluazuron, diflubenzuron, flucicloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron y triflumuron.
- 15 (16) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 1, tales como, por ejemplo buprofezina.
- (17) Principios activos que alteran la muda (particularmente en dípteros) tales como, por ejemplo, ciromazina
- (18) Agonistas receptores de la ecdisona, como por ejemplo cromafenocida, halofenocida, metoxifenocida y tebufenocida.
- 20 (19) Agonistas octopaminérgicos, tales como, por ejemplo amitraz.
- (20) Inhibidores del transporte de electrones del complejo III, tales como por ejemplo hidrametilnona, acequinocilo, fluacripirim.
- (21) Inhibidores del transporte de electrones del complejo I, como por ejemplo METI-acaricidas, por ejemplo fenazaquina, fenpiroximato, pirimidifeno, piridaben, tebufenpirad y tolfenpirad o rotenona
- 25 (derris).
- (22) Bloqueadores del canal de sodio dependientes de la tensión, por ejemplo indoxacarb o metaflumizona.
- (23) Inhibidores de la acetil-CoA-carboxilasa, tales como por ejemplo derivados de ácido tetrónico y del ácido tetrámico, por ejemplo espiroclorfen, espiromesifeno y espirotetramato.
- (24) Inhibidores del transporte de electrones del complejo IV, tales como por ejemplo fosfinas, por
- 30 ejemplo fosfuro de aluminio, fosfuro de calcio, fosfina y fosfuro de cinc o cianuro.

(25) Inhibidores del transporte de electrones del complejo II, tales como por ejemplo cienopirafeno y ciflumetofeno.

(28) Efectores del receptor de rianodina, tales como, por ejemplo diamidas, por ejemplo clorantraniliprol, ciantraniliprol y flubendiamida.

- 5 Otros principios activos con mecanismos de acción desconocidos o dudosos como por ejemplo afidopiropen, afoxolaner, azadiractina, bencloctiaz, benzoximato, bifenazato, broflanilide, bromopropilato, cinometionato, criolita, ciclaniliprol, cicloxaprid, cihalodiamida dicloromezotiaz, dicofol, diflovidazina, flometoquina, fluazaindolizina, fluensulfona, flufenerim, flufenoxistrobina, flufiprol, fluhexafon, fluopiram, fluralaner, fluxametamida, fufenozida, guadipir, heptaflutrina, imidaclotiz, iprodiona, lotilaner,
- 10 meperflutrina, paichongding, piflubumida, piridalilo, pirifluquinazon, piriminostrobina, Sarolaner, tetrametilflutrina, tetraniliprole, tetraclorantraniliprol, tiozafafen, tiofluoximato, triflumezopirim y yodometano; además preparados a base de *Bacillus firmus* *Bacillus firmus* (I-1582, BioNeem, Votivo), así como los siguientes compuestos activos: 1-{2-flúor-4-metilo-5-[(2,2,2-trifluoretil)sulfinilo]fenil}-3-(trifluórmethyl)-1H-1,2,4-triazol-5-amin (se conoce de WO2006/043635), {1'-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]-5-flúorspiro[indol-3,4'-piperidin]-1(2H)-il}(2-cloropiridina-4-il)metanona (se conoce de WO2003/106457),
- 15 2-cloro-N-[2-{1'-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]piperidin-4-il}-4-(trifluórmethyl)fenil]isonicotinamida (se conoce de WO2006/003494), 3-(2,5-Dimetilofenil)-4-hidroxi-8-metoxi-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-2-on (se conoce de WO2009/049851), 3-(2,5-Dimetilofenil)-8-metoxi-2-oxo-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-4-il-etilcarbonat (se conoce de WO2009/049851), 4-(But-2-in-1-iloxi)-6-(3,5-dimetilpiperidin-1-il)-5-flúorpirimidina (se conoce de WO2004/099160), 4-(But-2-in-1-iloxi)-6-(3-clorofenil)pirimidina (se conoce de WO2003/076415), PF1364 (CAS-Reg.No. 1204776-60-2), metilo-2-[2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridina-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonilo} amino)-5-cloro-3-metilbenzoilo]-2-carboxilato metilhidracina (se conoce de WO2005/085216), metilo-2-[2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridina-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonilo} amino)-5-cian-3-metilbenzoilo]-2-acetato de
- 25 carboxilato de hidracina (se conoce de WO2005/085216), metilo-2-[2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridina-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonilo} amino)-5-cian-3-metilbenzoilo]-2-carboxilato metilhidracina (se conoce de WO2005/085216), metilo-2-[3,5-dibromo-2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridina-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonilo} amino)benzoilo]-2-acetato de carboxilato de hidracina (se conoce de WO2005/085216), N-[2-(5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-il)-4-cloro-6-metilofenil]-3-bromo-1-(3-cloropiridina-2-il)-1H-pirazol-5-carboxamida (se conoce de CN102057925), 4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluórmethyl)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-2-metilo-N-(1-oxidotietan-3-il)benzamid (se conoce de WO2009/080250), N-[(2E)-1-[(6-cloropiridina-3-il)metilo]piridina-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoracetamid (se conoce de WO2012/029672), 1-[(2-cloro-1,3-tiazol-5-il)metilo]-4-oxo-3-fenil-4H-pirido[1,2-a]pirimidina-1-ium-2-olat (se conoce de WO2009/099929), 1-[(6-cloropiridina-3-il)metilo]-4-oxo-3-fenil-4H-pirido[1,2-a]pirimidina-1-ium-2-olat (se conoce de WO2009/099929), 4-(3-{2,6-dicloro-4-[(3,3-dicloroprop-2-en-1-il)oxi]fenoxi}propoxi)-2-metoxi-6-(trifluórmethyl)pirimidina (se conoce de CN101337940), N-[2-(tert-butilo carbamoil)-4-cloro-6-metilofenil]-1-(3-cloropiridina-2-il)-3-(flúormetoxi)-1H-pirazol-5-
- 35

carboxamida (se conoce de WO2008/134969, butil-[2-(2,4-diclorofenil)-3-oxo-4-oxaspiro[4.5]dec-1-en-1-il]-carbonat (se conoce de CN 102060818), 3E)-3-[1-[(6-cloro-3-piridilo)metilo]-2-piridilo iden]-1,1,1-trifluor-propano-2-on (se conoce de WO2013/144213, N-(metilosulfonilo)-6-[2-(piridina-3-il)-1,3-tiazol-5-il]piridina-2-carboxamida (se conoce de WO2012/000896), N-[3-(bencilocarbamoil)-4-clorofenil]-1-metilo-3-(pentafluoretil)-4-(trifluormetilo)-1H-pirazol-5-carboxamida se conoce de WO2010/051926), 5-bromo-4-cloro-N-[4-cloro-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenilo]-2-(3-cloro-2-piridil)pirazoles-3-carboxamida (se conoce de CN103232431).

Fungicidas

Los principios activos aquí especificados por su “common name” son conocidos, están descriptos por ejemplo en el manual de pesticidas “Pesticide Manual” o en Internet (por ejemplo: <http://www.alanwood.net/pesticides>).

Todos los componentes de combinación fungicidas de las clases (1) a (15) opcionalmente pueden formar sales con las bases o los ácidos correspondientes, siempre y cuando haya grupos funcionales adecuados. Además se incluye en los componentes de combinación fungicidas de las clases (1) a (15) formas tautómeras, en tanto la tautomería sea posible.

1) Inhibidores de la biosíntesis de ergosterol, por ejemplo (1.01) Aldimorf, (1.02) Azaconazol, (1.03) Bitertanol, (1.04) bromuconazol, (1.05) ciproconazol, (1.06) Diclobutrazol, (1.07) Difenoconazol, (1.08) Diniconazol, (1.09) Diniconazol-M, (1.10) dodemorf, (1.11) acetato de dodemorf, (1.12) Epoxiconazol, (1.13) Etaconazol, (1.14) Fenarimol, (1.15) Fenbuconazol, (1.16) Fenhexamida, (1.17) Fenpropidina, (1.18) fenpropimorf, (1.19) Fluquinconazol, (1.20) Flurprimidol, (1.21) Flusilazol, (1.22) Flutriafol, (1.23) Furconazol, (1.24) Furconazol-cis, (1.25) Hexaconazol, (1.26) Imazalil, (1.27) sulfato de Imazalil, (1.28) Imibenconazol, (1.29) Iponazol, (1.30) Metconazol, (1.31) miclobutanil, (1.32) Naftifin, (1.33) Nuarimol, (1.34) Oxpconazol, (1.35) Paclobutrazol, (1.36) Pefurazoat, (1.37) Penconazol, (1.38) Piperlina, (1.39) Procloraz, (1.40) Propiconazol, (1.41) Protioconazol, (1.42) piributicarb, (1.43) Pirifenox, (1.44) Quinconazol, (1.45) Simeconazol, (1.46) espiroxamina, (1.47) Tebuconazol, (1.48) Terbinafin, (1.49) Tetraconazol, (1.50) Triadimefon, (1.51) Triadimenol, (1.52) Tridemorf, (1.53) Triflumizol, (1.54) Triforina, (1.55) triticonazol, (1.56) Uniconazol, (1.57) Uniconazol-p, (1.58) Viniconazol, (1.59) Voriconazol, (1.60) 1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)cicloheptanol, (1.61) 1-(2,2-Dimetilo-2,3-dihidro-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-éster metílico del ácido carboxílico, (1.62) N'-{5-(difluormetilo)-2-metilo-4-[3-(trimetilsililo)propoxi]fenil}-N-etil-N-metiloimidoformamida, (1.63) N-etilo-N-metilo-N'-{2-metilo-5-(trifluormetilo)-4-[3-(trimetilsililo)propoxi]fenil} imidoformamida, (1.64) O-[1-(4-metoxifenoxi)-3,3-dimetilbutano-2-il]-1H-imidazol-1-carbotioato, (1.65) Pyrisoxazol, (1.66) 2-{[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorfenil)oxiran-2-il]metilo}-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tion, (1.67) 1-{[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorfenil)oxiran-2-il]metilo}-1H-1,2,4-triazol-5-iltiocianat, (1.68) 5-(alilsulfanil)-1-{[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorfenil)oxiran-2-il]metilo}-1H-1,2,4-triazol, (1.69) 2-[1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetiloheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tion, (1.70) 2-

{[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluórfenil)oxiran-2-il]metilo}-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tion, (1.71) 2-{[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluórfenil)oxiran-2-il]metilo}-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tion, (1.72) 1-{[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluórfenil)oxiran-2-il]metilo}-1H-1,2,4-triazol-5-iltiocianato, (1.73) 1-{[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluórfenil)oxiran-2-il]metilo}-1H-1,2,4-triazol-5-iltiocianato, (1.74) 5-(alilsulfanil)-1-{[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluórfenil)oxiran-2-il]metilo}-1H-1,2,4-triazol, (1.75) 5-(alilsulfanil)-1-{[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluórfenil)oxiran-2-il]metilo}-1H-1,2,4-triazol, (1.76) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetiloheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tion, (1.77) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetiloheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tion, (1.78) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetiloheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tion, (1.79) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetiloheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tion, (1.80) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetiloheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tion, (1.81) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetiloheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tion, (1.82) 2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetiloheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tion, (1.83) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetiloheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tion, (1.84) 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluórmétilo)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propano-2-ol, (1.85) 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluórmétilo)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.86) 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluórmétilo)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)pentan-2-ol, (1.87) 2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.88) 2-[2-cloro-4-(2,4-diclorofenoxi)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propano-2-ol, (1.89) (2R)-2-(1-clorociclopropilo)-4-[(1R)-2,2-diclorociclopropilo]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.90) (2R)-2-(1-clorociclopropilo)-4-[(1S)-2,2-diclorociclopropilo]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.91) (2S)-2-(1-clorociclopropilo)-4-[(1S)-2,2-diclorociclopropilo]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.92) (2S)-2-(1-clorociclopropilo)-4-[(1R)-2,2-diclorociclopropilo]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.93) (1S,2R,5R)-5-(4-clorobencilo)-2-(clorometilo)-2-metilo-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetilo)ciclopentanol, (1.94) (1R,2S,5S)-5-(4-clorobencilo)-2-(clorometilo)-2-metilo-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetilo)ciclopentanol, (1.95) 5-(4-clorobencilo)-2-(clorometilo)-2-metilo-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetilo)ciclopentanol.

2) Inhibidores de la cadena respiratoria del complejo I o II, por ejemplo (2.01) bixafen, (2.02) boscalid, (2.03) carboxin, (2.04) diflumentorim, (2.05) fenfuram, (2.06) fluopiram, (2.07) flutolanil, (2.08) fluxapiraxad, (2.09) furametpir, (2.10) furmeciclox, (2.11) isopirazam (mezcla de racemato syn-epimérico 1RS,4SR,9RS y racemato anti-epimérico 1RS,4SR,9SR), (2.12) isopirazam (racemato anti-epimérico 1RS,4SR,9SR), (2.13) isopirazam (enantiómero anti-epimérico 1R,4S,9S), (2.14) isopirazam (enantiómero anti-epimérico 1S,4R,9R), (2.15) isopirazam (racemato syn-epimérico 1RS,4SR,9RS), (2.16) isopirazam (enantiómero syn-epimérico 1R,4S,9R), (2.17) isopirazam (enantiómero syn-epimérico 1S,4R,9S), (2.18) mepronil, (2.19) oxicarboxina, (2.20) penflufen, (2.21) pentiopirad, (2.22) sedaxan, (2.23) tifulzamida, (2.24) 1-metilo-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluóretoxi)fenil]-3-(trifluórmétilo)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.25) 3-(difluórmétilo)-1-metilo-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluóretoxi)fenil]-1H-pirazol-4-

- carboxamida, (2.26) 3-(difluórmétilo)-N-[4-flúor-2-(1,1,2,3,3,3-hexaflúorpropoxi)fenil]-1-métilo-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.27) N-[1-(2,4-diclorofenil)-1-metoxipropano-2-il]-3-(difluórmétilo)-1-métilo-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.28) 5,8-difluór-N-[2-(2-flúor-4-{[4-(trifluórmétilo)piridina-2-il]oxi}fenil)etil]quinazolina-4-amin, (2.29) benzovindiflupir, (2.30) N-[(1S,4R)-9-(diclorometiloen)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4- metano naftaleno -5-il]-3-(difluórmétilo)-1-métilo-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.31) N-[(1R,4S)-9-(diclorometiloen)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4- metano naftaleno -5-il]-3-(difluórmétilo)-1-métilo-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.32) 3-(difluórmétilo)-1-métilo-N-(1,1,3-trimetilo-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.33) 1,3,5-trimetilo-N-(1,1,3-trimetilo-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.34) 1-métilo-3-(trifluórmétilo)-N-(1,1,3-trimetilo-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.35) 1-métilo-3-(trifluórmétilo)-N-[(3R)-1,1,3-trimetilo-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.36) 1-métilo-3-(trifluórmétilo)-N-[(3S)-1,1,3-trimetilo-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.37) 3-(difluórmétilo)-1-métilo-N-[(3S)-1,1,3-trimetilo-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.38) 3-(difluórmétilo)-1-métilo-N-[(3R)-1,1,3-trimetilo-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.39) 1,3,5-trimetilo-N-[(3R)-1,1,3-trimetilo-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.40) 1,3,5-trimetilo-N-[(3S)-1,1,3-trimetilo-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.41) benodanil, (2.42) 2-cloro-N-(1,1,3-trimetilo-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)piridina-3-carboxamida, (2.43) Isofetamid, (2.44) 1-métilo-3-(trifluórmétilo)-N-[2'-(trifluórmétilo)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.45) N-(4'-clorobifenil-2-il)-3-(difluórmétilo)-1-métilo-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.46) N-(2',4'-diclorobifenil-2-il)-3-(difluórmétilo)-1-métilo-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.47) 3-(difluórmétilo)-1-métilo-N-[4'-(trifluórmétilo)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.48) N-(2',5'-difluórbifenil-2-il)-1-métilo-3-(trifluórmétilo)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.49) 3-(difluórmétilo)-1-métilo-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.50) 5-flúor-1,3-dimetilo-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.51) 2-cloro-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]nicotinamida, (2.52) 3-(difluórmétilo)-N-[4'-(3,3-dimetilbutano-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1-métilo-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.53) N-[4'-(3,3-dimetilbutano-1-in-1-il)bifenil-2-il]-5-flúor-1,3-dimetilo-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.54) 3-(difluórmétilo)-N-(4'-bifenilo etílico-2-il)-1-métilo-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.55) N-(4'-etinilbifenil-2-il)-5-flúor-1,3-dimetilo-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.56) 2-cloro-N-(4'-bifenilo etílico-2-il)nicotinamida, (2.57) 2-cloro-N-[4'-(3,3-dimetilbutano-1-in-1-il)bifenil-2-il]nicotinamida, (2.58) 4-(difluórmétilo)-2-métilo-N-[4'-(trifluórmétilo)bifenil-2-il]-1,3-tiazol-5-carboxamida, (2.59) 5-flúor-N-[4'-(3-hidroxi-3-metilobut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1,3-dimetilo-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.60) 2-cloro-N-[4'-(3-hidroxi-3-metilobut-1-in-1-il)bifenil-2-il]nicotinamida, (2.61) 3-(difluórmétilo)-N-[4'-(3-metoxi-3-metilobut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1-métilo-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.62) 5-flúor-N-[4'-(3-metoxi-3-metilobut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1,3-dimetilo-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.63) 2-cloro-N-[4'-(3-metoxi-3-metilobut-1-in-1-il)bifenil-2-il]nicotinamida, (2.64) 1,3-dimetilo-N-(1,1,3-trimetilo-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.65) 1,3-dimetilo-N-[(3R)-1,1,3-trimetilo-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.66) 1,3-Dimetilo-N-[(3S)-1,1,3-trimetilo-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.67) 3-(difluórmétilo)-N-

- metoxi-1-metilo-N-[1-(2,4,6-triclorofenil)propano-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.68) 3-(difluórmétilo)-N-(7-flúor-1,1,3-trimetilo-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1-metilo-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.69) 3-(difluórmétilo)-N-[(3R)-7-flúor-1,1,3-trimetilo-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1-metilo-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.70) 3-(difluórmétilo)-N-[(3S)-7-flúor-1,1,3-trimetilo-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1-metilo-1H-pirazol-4-carboxamida.
- 3) Inhibidores de la cadena respiratoria del complejo III, por ejemplo (3.01) Ametotradin, (3.02) Amisulbromo, (3.03) Azoxistrobina, (3.04) ciazofamida, (3.05) Coumetoxistrobina, (3.06) Coumoxistrobina, (3.07) Dimoxistrobina, (3.08) Enoxastrobina, (3.09) Famoxadon, (3.10) Fenamidon, (3.11) Flufenoxistrobina, (3.12) Fluoxastrobina, (3.13) cresoxim-metilo, (3.14) Metominostrobin, (3.15) orisastrobina, (3.16) picoxistrobina, (3.17) piraclostrobina, (3.18) Pirametostrobin, (3.19) Piraxistrobina, (3.20) Piribencarb, (3.21) triclopiricarb, (3.22) trifloxistrobina, (3.23) (2E)-2-(2-{[6-(3-cloro-2-metilfenoxi)-5-flúorpirimidina-4-il]oxi}fenil)-2-(metoxiimino)-N-metiloacetamida, (3.24) (2E)-2-(metoxiimino)-N-metilo-2-(2-{[(1E)-1-[3-(trifluórmétilo)fenil]etiliden}amino]oxi}metilo)-fenil)acetamida, (3.25) (2E)-2-(metoxiimino)-N-metilo-2-{2-[(E)-{1-[3-(trifluórmétilo)fenil]etoxi}imino]metilo}fenil}acetamida, (3.26) (2E)-2-{2-[(E)-{1-[3-(trifluórmétilo)fenil]etoxi}imino]metilo}fenil}acetamida, (3.27) fenaminostrobin, (3.28) 5-metoxi-2-metilo-4-(2-{[(1E)-1-[3-(trifluórmétilo)fenil]etiliden}amino]oxi}metilo}fenil)-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-on, (3.29) (2E)-2-{2-[(ciclopropilo[4-metoxifenil]imino]metilo)sulfanil}metilo}fenil}-3-éster metílico del ácido metoxiacrílico, (3.30) N-(3-etilo-3,5,5-trimetilociclohexil)-3-formamida-2-hidroxibenzamida, (3.31) 2-{2-[(2,5-dimetilfenoxi)metilo]fenil}-2-metoxi-N-metiloacetamida, (3.32) 2-{2-[(2,5-dimetilfenoxi)metilo]fenil}-2-metoxi-N-metiloacetamida, (3.33) (2E,3Z)-5-{[1-(4-clorofenil)-1H-pirazol-3-il]oxi}-2-(metoxiimino)-N,3-dimetilopent-3-enamida.
- 4) Inhibidores de la mitosis y la división celular, por ejemplo (4.01) benomilo, (4.02) carbendazim, (4.03) clorfenazol, (4.04) dietofencarb, (4.05) etaboxam, (4.06) fluopicolid, (4.07) fuberidazol, (4.08) Pencicuron, (4.09) tiabendazol, (4.10) tiofanato-metilo, (4.11) tiofanato, (4.12) zoxamida, (4.13) 5-cloro-7-(4-metilopiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluórfenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina, (4.14) 3-cloro-5-(6-cloropiridina-3-il)-6-metilo-4-(2,4,6-trifluórfenil)piridazina.
- 5) Compuestos capaces de atacar en varios puntos („Multisite Action“), por ejemplo (5.01) caldo bordelés, (5.02) Captafol, (5.03) Captan, (5.04) clorotalonio, (5.05) hidróxido de cobre, (5.06) naftenato de cobre, (5.07) óxido de cobre, (5.08) oxiclورو de cobre, (5.09) sulfato de cobre (2+), (5.10) diclofluanida, (5.11) ditianón, (5.12) dodina, (5.13) base libre de dodina, (5.14) ferbam, (5.15) flúorfolpet, (5.16) folpet, (5.17) guazatina, (5.18) acetato de guazatina, (5.19) iminoctadina, (5.20) albesilato de iminoctadina, (5.21) triacetato de iminoctadina, (5.22) mancozeb, (5.23) Mancozeb, (5.24) Maneb, (5.25) Metiram, (5.26) Metiram-cinc, (5.27) Oxina-cobre, (5.28) Propamidina, (5.29) Propineb, (5.30) azufre y preparaciones de

azufre incluyendo polisulfuro de calcio, (5.31) tiram, (5.32) tolilfluanida, (5.33) Zineb, (5.34) Ziram, (5.35) Anilazina.

6) Compuestos capaces de inducir una defensa en el huésped, como por ejemplo (6.01) acibenzolar-S-metilo, (6.02) isotianilo, (6.03) probenazol, (6.04) tiadinilo, (6.05) laminarina.

5 7) Inhibidores del aminoácido y/o biosíntesis de proteínas, por ejemplo (7.01) andoprim, (7.02) blasticidina-S, (7.03) Ciprodinilo, (7.04) kasugamicina, (7.05) hidrato de clorhidrato de kasugamicina, (7.06) mepanipirim, (7.07) pirimetanilo, (7.08) 3-(5-flúor-3,3,4,4-tetrametilo-3,4-dihidroisoquinolina-1-il)quinolina, (7.09) oxitetraciclina, (7.10) estreptomycin.

8) Inhibidores de la producción de ATP, por ejemplo (8.01) acetato de fentina, (8.02) cloruro de fentina,
10 (8.03) hidróxido de fentina, (8.04) siltiofam.

9) Inhibidores de la síntesis de paredes celulares por ejemplo (9.01) Bentiavalicarb, (9.02) Dimetomorf, (9.03) Flumorf, (9.04) Iprovalicarb, (9.05) Mandipropamida, (9.06) Polioxinas, (9.07) Polioxorim, (9.08) validamicina A, (9.09) valifenalato, (9.10) Polyoxin B, (9.11) (2E)-3-(4-tert.-butilfenil)-3-(2-cloropiridina-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-on, (9.12) (2Z)-3-(4-tert.-butilfenil)-3-(2-cloropiridina-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-on.
15

10) Inhibidores de la síntesis de lípidos y de membranas, por ejemplo (10.01) bifenilo, (10.02) cloroneb, (10.03) diclorán, (10.04) edifenfos, (10.05) etridiazol, (10.06) yodocarb, (10.07) iprobenfos, (10.08) isoprotiolano, (10.09) propamocarb, (10.10) clorhidrato de propamocarb, (10.11) protiocarb, (10.12) pirazofos, (10.13) quintoceno, (10.14) tecnaceno, (10.15) tolclofos-metilo.

20 11) Inhibidores de la biosíntesis de melanina, por ejemplo (11.01) Carpropamida, (11.02) Diclocimet, (11.03) Fenoxanilo, (11.04) ftalida, (11.05) piroquilon, (11.06) triciclazol, (11.07) 2,2,2-trifluoroetilo {3-metilo-1-[(4-metilbenzoilo)amino]butan-2-il}carbamato.

12) Inhibidores de la síntesis de ácidos nucleicos, por ejemplo (12.01) benalaxilo, (12.02) benalaxilo-M (kiralaxilo), (12.03) bupirimato, (12.04) clozilacon, (12.05) dimetirimol, (12.06) etirimol, (12.07) furalaxilo, (12.08) himexazol, (12.09) metalaxilo, (12.10) metalaxilo-M (Mefenoxam), (12.11) ofurace, (12.12) oxadixilo, (12.13) ácido oxolínico, (12.14) octilinona.
25

13) Inhibidores de la transducción de la señal por ejemplo (13.01) clozolinato, (13.02) fenpiclonilo, (13.03) fludioxonilo, (13.04) iprodione, (13.05) procimidona, (13.06) quinoxifeno, (13.07) vinclozolina, (13.08) proquinazid.

30 14) Compuestos capaces de actuar como desacopladores como por ejemplo (14.01) binapacril, (14.02) dinocap, (14.03) ferimzon, (14.04) fluazinam, (14.05) Meptildinocap.

- 15) Otros compuestos, por ejemplo (15.001) bentiazol, (15.002) betoxazina, (15.003) capsimicina, (15.004) Carvona, (15.005) Cinometionat, (15.006) Piriofenon (Chlazafenon), (15.007) Cufraneb, (15.008) Ciflufenamid, (15.009) Cimoxanilo, (15.010) Ciprosulfamida, (15.011) Dazomet, (15.012) Debacarb, (15.013) diclorofeno, (15.014) Diclomezina, (15.015) Difenzoquat, (15.016) Difenzoquat
- 5 metilsulfato, (15.017) Difenilamina, (15.018) Ecomato, (15.019) fenpirazamina, (15.020) Flumetover, (15.021) flúoroimida, (15.022) Flusulfamida, (15.023) Flutianilo, (15.024) fosetil-aluminio, (15.025) fosetil-calcio, (15.026) fosetil-sodio, (15.027) hexaclorobenceno, (15.028) irumamicina, (15.029) Metasulfocarb, (15.030) metilisotiocianato, (15.031) metrafenona, (15.032) mildiomicina, (15.033) natamicina, (15.034) dimetiltiocarbamato de níquel, (15.035) nitrotal-isopropilo, (15.036) Oxamocarb,
- 10 (15.037) oxifentiina, (15.038) pentaclorofenol y sales, (15.039) fenotrina, (15.040) ácido fosforico y sus sales, (15.041) fosetilato de propamocarb, (15.042) propanosina-sodio, (15.043) pirimorf, (15.044) pirrolnitrina, (15.045) tebufloquina, (15.046) tecloftalam, (15.047) Tolnifanid, (15.048) triazoxida, (15.049) triclamida, (15.050) zarilamida, (15.051) 2-ácido metilpropanoico-(3S,6S,7R,8R)-8-bencilo-3-[[{3-[(isobutiriloxi)metoxi]-4-metoxipiridina-2-il} carbonilo)amino]-6-metilo-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-
- 15 ilester, (15.052) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-difluórfenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il} piperidin-1-il)-2-[5-metilo-3-(trifluórmétilo)-1H-pirazol-1-il]etanona, (15.053) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-difluórfenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il} piperidin-1-il)-2-[5-metilo-3-(trifluórmétilo)-1H-pirazol-1-il]etanona, (15.054) oxatiapirolina, (15.055) 1H-Imidazol-1-ácido carboxílico-1-(4-metoxifenoxi)-3,3-dimetilbutano-2-ilester, (15.056) 2,3,5,6-Tetracloro-4-(metilosulfonilo)piridina, (15.057) 2,3-Dibutilo-6-
- 20 clorotieno[2,3-d]pirimidina-4(3H)-on, (15.058) 2,6-Dimetilo-1H,5H-[1,4]ditiino[2,3-c:5,6-c']dipirrol-1,3,5,7(2H,6H)-tetron, (15.059) 2-[5-metilo-3-(trifluórmétilo)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(5R)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il} piperidin-1-il)etanona, (15.060) 2-[5-metilo-3-(trifluórmétilo)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(5S)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il} piperidin-1-il)etanona, (15.061) 2-[5-metilo-3-(trifluórmétilo)-1H-pirazol-1-il]-1-{4-[4-(5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il)-1,3-tiazol-2-il] piperidin-1-il}etanona, (15.062) 2-Butoxi-6-iod-3-propilo-4H-chromen-4-on, (15.063) 2-cloro-5-[2-cloro-1-(2,6-difluór-4-metoxifenil)-4-metilo-1H-imidazol-5-il]piridina, (15.064) 2-fenilofenol y sales, (15.065) 3-(4,4,5-Trifluór-3,3-dimetilo-3,4-dihidroisoquinolina-1-il)quinolina, (15.066) 3,4,5-Tricloropiridina-2,6-diácido carboxiliconitril, (15.067) 3-cloro-5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluórfenil)-6-metilopiridazina, (15.068) 4-(4-clorofenil)-5-(2,6-difluórfenil)-3,6-dimetilopiridazina, (15.069) 5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-tiol, (15.070) 5-cloro-N'-fenil-N'-(prop-2-in-1-il)tiofeno-2-hidracido de sulfuro, (15.071) 5-flúor-2-[(4-flúorbencilo)oxi]pirimidina-4-amin, (15.072) 5-flúor-2-[(4-metilobencilo)oxi]pirimidina-4-amin, (15.073) 5-metilo-6-octyl[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina-7-amin, (15.074) (2Z)-3-amino-2-ciano-3-fenil ácido acrílico éster etílico, (15.075) N'-(4-{[3-(4-clorobencilo)-1,2,4-tiadiazol-5-il]oxi}-2,5-dimetilofenil)-N-etil-N-metiloimidoformamida, (15.076) N-(4-clorobencilo)-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]propanoamida, (15.077) N-[(4-clorofenil)(ciano)metilo]-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]propanoamida, (15.078) N-[(5-bromo-3-cloropiridina-2-il)metilo]-2,4-dicloronicotinamida, (15.079) N-[1-(5-bromo-3-cloropiridina-2-il)etil]-2,4-dicloronicotinamida, (15.080) N-[1-(5-bromo-3-
- 35

- cloropiridina-2-il)etil]-2-flúor-4- yodo de nicotinamida, (15.081) N-{(E)-[(ciclopropilometoxi)imino][6-(difluórmotexi)-2,3-difluórfenil]metilo}-2-fenilacetamida, (15.082) N-{(Z)-[(ciclopropilometoxi)imino][6-(difluórmotexi)-2,3-difluórfenil]metilo}-2-fenilacetamida, (15.083) N'-{4-[(3-tert.-butil-4-ciano-1,2-tiazol-5-il)oxi]-2-cloro-5-metilofenil}-N-etil-N-metiloimidoformamida, (15.084) N-metilo-2-(1-{[5-metilo-3-(trifluórmotexi)-1H-pirazol-1-il]acetilo}piperidin-4-il)-N-(1,2,3,4-tetrahidronaftalina-1-il)-1,3-tiazol-4-carboxamida, (15.085) N-metilo-2-(1-{[5-metilo-3-(trifluórmotexi)-1H-pirazol-1-il]acetilo}piperidin-4-il)-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidronaftalina-1-il]-1,3-tiazol-4-carboxamida, (15.086) N-metilo-2-(1-{[5-metilo-3-(trifluórmotexi)-1H-pirazol-1-il]acetilo}piperidin-4-il)-N-[(1S)-1,2,3,4-tetrahidronaftalina-1-il]-1,3-tiazol-4-carboxamida, (15.087) {6-[(1-metilo-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilo]amino}oxi)metilo]piridina-2-il} pentilester de ácido carboxílico, (15.088) fenazin-1-ácido carboxílico, (15.089) quinoleína-8-ol, (15.090) quinoleína-8-olsulfat (2:1), (15.091) {6-[(1-metilo-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilo]amino}oxi)metilo]piridina-2-il} ácido carbámico-tert.-butilester, (15.092) (5-bromo-2-metoxi-4-metilopiridina-3-il)(2,3,4-trimetoxi-6-metilofenil)metanona, (15.093) N-[2-(4-{[3-(4-clorofenil)prop-2-in-1-il]oxi}-3-metoxifenil)etil]-N2-(metilosulfonilo)valinamid, (15.094) 4-Oxo-4-[(2-feniletil)amino] ácido butírico, (15.095) {6-[(1-metilo-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilo]amino}oxi)metilo]piridina-2-il} ácido carbámico but-3-in-1-ilester, (15.096) 4-amino-5-fluórpirimidina-2-ol (forma tautómera: 4-amino-5-fluórpirimidina-2(1H)-on), (15.097) 3,4,5-ácido trihidroxibenzoico propílico, (15.098) [3-(4-cloro-2-fluórfenil)-5-(2,4-difluórfenil)-1,2-oxazol-4-il](piridina-3-il)metanol, (15.099) (S)-[3-(4-cloro-2-fluórfenil)-5-(2,4-difluórfenil)-1,2-oxazol-4-il](piridina-3-il)metanol, (15.100) (R)-[3-(4-cloro-2-fluórfenil)-5-(2,4-difluórfenil)-1,2-oxazol-4-il](piridina-3-il)metanol, (15.101) 2-fluor-6-(trifluórmotexi)-N-(1,1,3-trimetilo-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)benzamid, (15.102) 2-(6-bencilopiridina-2-il)quinazolina, (15.103) 2-[6-(3-fluor-4-metoxifenil)-5-metilopiridina-2-il]quinazolina, (15.104) 3-(4,4-difluor-3,3-dimetilo-3,4-dihidroisoquinolina-1-il)quinolina, (15.105) ácido abscísico, (15.106) N'-[5-bromo-6-(2,3-dihidro-1H-inden-2-iloxi)-2-metilopiridina-3-il]-N-etil-N-metiloimidoformamida, (15.107) N'-{5-bromo-6-[1-(3,5-difluórfenil)etoxi]-2-metilopiridina-3-il}-N-etil-N-metiloimidoformamida, (15.108) N'-{5-bromo-6-[(1R)-1-(3,5-difluórfenil)etoxi]-2-metilopiridina-3-il}-N-etil-N-metiloimidoformamida, (15.109) N'-{5-bromo-6-[(1S)-1-(3,5-difluórfenil)etoxi]-2-metilopiridina-3-il}-N-etil-N-metiloimidoformamida, (15.110) N'-{5-bromo-6-[(cis-4-isopropilciclohexilo)oxi]-2-metilopiridina-3-il}-N-etil-N-metiloimidoformamida, (15.111) N'-{5-bromo-6-[(trans-4-isopropilciclohexilo)oxi]-2-metilopiridina-3-il}-N-etil-N-metiloimidoformamida, (15.112) N-ciclopropilo-3-(difluórmotexi)-5-fluor-N-(2-isopropilobencilo)-1-metilo-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.113) N-ciclopropilo-N-(2-ciclopropilobencilo)-3-(difluórmotexi)-5-fluor-1-metilo-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.114) N-(2-tert.-butilbencilo)-N-ciclopropilo-3-(difluórmotexi)-5-fluor-1-metilo-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.115) N-(5-cloro-2-etilbencilo)-N-ciclopropilo-3-(difluórmotexi)-5-fluor-1-metilo-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.116) N-(5-cloro-2-isopropilobencilo)-N-ciclopropilo-3-(difluórmotexi)-5-fluor-1-metilo-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.117) N-ciclopropilo-3-(difluórmotexi)-N-(2-etil-5-fluorobencilo)-5-fluor-1-metilo-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.118) N-ciclopropilo-3-(difluórmotexi)-5-fluor-N-(5-fluor-2-

- isopropilobencilo)-1-metilo-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.119) N-ciclopropilo-N-(2-ciclopropilo-5-flúorbencilo)-3-(difluórmético)-5-flúor-1-metilo-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.120) N-(2-ciclopentilo-5-flúorbencilo)-N-ciclopropilo-3-(difluórmético)-5-flúor-1-metilo-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.121) N-ciclopropilo-3-(difluórmético)-5-flúor-N-(2-flúor-6-isopropilobencilo)-1-metilo-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.122) N-ciclopropilo-3-(difluórmético)-N-(2-etil-5-metilobencilo)-5-flúor-1-metilo-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.123) N-ciclopropilo-3-(difluórmético)-5-flúor-N-(2-isopropilo-5-metilobencilo)-1-metilo-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.124) N-ciclopropilo-N-(2-ciclopropilo-5-metilobencilo)-3-(difluórmético)-5-flúor-1-metilo-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.125) N-(2-tert.-butil-5-metilobencilo)-N-ciclopropilo-3-(difluórmético)-5-flúor-1-metilo-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.126)
- 10 N-[5-cloro-2-(trifluórmético)bencilo]-N-ciclopropilo-3-(difluórmético)-5-flúor-1-metilo-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.127) N-ciclopropilo-3-(difluórmético)-5-flúor-1-metilo-N-[5-metilo-2-(trifluórmético)bencilo]-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.128) N-[2-cloro-6-(trifluórmético)bencilo]-N-ciclopropilo-3-(difluórmético)-5-flúor-1-metilo-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.129) N-[3-cloro-2-flúor-6-(trifluórmético)bencilo]-N-ciclopropilo-3-(difluórmético)-5-flúor-1-metilo-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.130) N-ciclopropilo-3-(difluórmético)-N-(2-etil-4,5-dimetilobencilo)-5-flúor-1-metilo-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.131) N-ciclopropilo-3-(difluórmético)-5-flúor-N-(2-isopropilobencilo)-1-metilo-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.132) N'-(2,5-Dimetilo-4-fenoxifenil)-N-etil-N-metiloimidoformamida, (15.133) N'-{4-[(4,5-dicloro-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilofenil}-N-etil-N-metiloimidoformamida, (15.134) N-(4-cloro-2,6-difluórfenil)-4-(2-cloro-4-flúorfenil)-1,3-dimetilo-1H-pirazol-5-amin, (15.135)
- 20 9-flúor-2,2-dimetilo-5-(quinolina-3-il)-2,3-dihidro-1,4-benzoxazepin, (15.136) 2-{2-flúor-6-[(8-flúor-2-metiloquinolina-3-il)oxi]fenil}propano-2-ol, (15.137) 2-{2-[(7,8-difluórfenil)-2-metiloquinolina-3-il)oxi]-6-flúorfenil}propano-2-ol, (15.138) 4-(2-cloro-4-flúorfenil)-N-(2-flúorfenil)-1,3-dimetilo-1H-pirazol-5-amin, (15.139) 4-(2-cloro-4-flúorfenil)-N-(2,6-difluórfenil)-1,3-dimetilo-1H-pirazol-5-amin, (15.140) 4-(2-cloro-4-flúorfenil)-N-(2-cloro-6-flúorfenil)-1,3-dimetilo-1H-pirazol-5-amin, (15.141) 4-(2-bromo-4-flúorfenil)-N-(2-cloro-6-flúorfenil)-1,3-dimetilo-1H-pirazol-5-amin, (15.142) N-(2-bromo-6-flúorfenil)-4-(2-cloro-4-flúorfenil)-1,3-dimetilo-1H-pirazol-5-amin, (15.143) 4-(2-bromo-4-flúorfenil)-N-(2-bromofenil)-1,3-dimetilo-1H-pirazol-5-amin, (15.144) 4-(2-bromo-4-flúorfenil)-N-(2-bromo-6-flúorfenil)-1,3-dimetilo-1H-pirazol-5-amin, (15.145) 4-(2-bromo-4-flúorfenil)-N-(2-clorofenil)-1,3-dimetilo-1H-pirazol-5-amin, (15.146) N-(2-bromofenil)-4-(2-cloro-4-flúorfenil)-1,3-dimetilo-1H-pirazol-5-amin, (15.147) 4-(2-cloro-4-flúorfenil)-N-(2-clorofenil)-1,3-dimetilo-1H-pirazol-5-amin, (15.148) 4-(2-bromo-4-flúorfenil)-N-(2,6-difluórfenil)-1,3-dimetilo-1H-pirazol-5-amin, (15.149) 4-(2-bromo-4-flúorfenil)-N-(2-flúorfenil)-1,3-dimetilo-1H-pirazol-5-amin, (15.150) N'-(4-{3-[(difluórmético)sulfanil]fenoxi}-2,5-dimetilofenil)-N-etil-N-metiloimidoformamida, (15.151) N'-(2,5-Dimetilo-4-{3-[(1,1,2,2-tetrafluóretil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-metiloimidoformamida, (15.152)
- 35 N'-(2,5-Dimetilo-4-{3-[(2,2,2-trifluóretil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-metiloimidoformamida, (15.153) N'-(2,5-Dimetilo-4-{3-[(2,2,3,3-tetrafluóropropilo)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-metiloimidoformamida, (15.154) N'-(2,5-Dimetilo-4-{3-[(pentafluóretil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-metiloimidoformamida, (15.155) N'-(4-{3-[(difluórmético)sulfanil]fenoxi}-2,5-dimetilofenil)-N-etil-N-

metiloimidoformamida, (15.156) N'-(2,5-Dimetilo-4-{[3-(1,1,2,2-tetraflúoretóxi)fenil]sulfanil}fenil)-N-etil-N-metiloimidoformamida, (15.157) N'-(2,5-Dimetilo-4-{[3-(2,2,2-triflúoretóxi)fenil]sulfanil}fenil)-N-etil-N-metiloimidoformamida, (15.158) N'-(2,5-Dimetilo-4-{[3-(2,2,3,3-tetraflúorpropoxi)fenil]sulfanil}fenil)-N-etil-N-metiloimidoformamida, (15.159) N'-(2,5-Dimetilo-4-{[3-(pentaflúoretóxi)fenil]sulfanil}fenil)-N-etil-N-metiloimidoformamida, (15.160) 2-[3,5-bis(difluórmétilo)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15.161) 2-[3,5-bis(difluórmétilo)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-flúor-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15.162) 2-[3,5-bis(difluórmétilo)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-cloro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15.163) 2-{3-[2-(1-{[3,5-bis(difluórmétilo)-1H-pirazol-1-il]acetilo}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il}fenilmetanosulfonato, (15.164) 2-{3-[2-(1-{[3,5-bis(difluórmétilo)-1H-pirazol-1-il]acetilo}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il}-3-clorofenilmetanosulfonato, (15.165) 2-[3,5-bis(difluórmétilo)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{(5S)-5-[2-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15.166) 2-[3,5-bis(difluórmétilo)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{(5R)-5-[2-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15.167) 2-[3,5-bis(difluórmétilo)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{(5S)-5-[2-flúor-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15.168) 2-[3,5-bis(difluórmétilo)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{(5R)-5-[2-flúor-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15.169) 2-[3,5-bis(difluórmétilo)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{(5S)-5-[2-cloro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15.170) 2-[3,5-bis(difluórmétilo)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{(5R)-5-[2-cloro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15.171) 2-{(5S)-3-[2-(1-{[3,5-bis(difluórmétilo)-1H-pirazol-1-il]acetilo}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il}fenilmetanosulfonato, (15.172) 2-{(5R)-3-[2-(1-{[3,5-bis(difluórmétilo)-1H-pirazol-1-il]acetilo}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il}fenilmetanosulfonato, (15.173) 2-{(5S)-3-[2-(1-{[3,5-bis(difluórmétilo)-1H-pirazol-1-il]acetilo}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il}-3-clorofenilmetanosulfonato, (15.174) 2-{(5R)-3-[2-(1-{[3,5-bis(difluórmétilo)-1H-pirazol-1-il]acetilo}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il}-3-clorofenilmetanosulfonato.

Pesticidas biológicos como componentes de mezcla

Los compuestos de la fórmula (I) se pueden combinar con pesticidas biológicos.

Los pesticidas biológicos comprenden en particular bacterias, hongos, levaduras, extractos de plantas, y los productos producidos por microorganismos, inclusive proteínas y metabolitos secundarios.

Los pesticidas biológicos comprenden bacterias como bacterias formadoras de esporas, bacterias colonizadoras de la raíz y bacterias, que actúan como insecticidas biológicos, fungicidas o nematocidas.

Ejemplos de bacterias que se utilizan como pesticidas biológicos o que pueden utilizarse son:

Bacillus amyloliquefaciens, grupo FZB42 (DSM 231179), o *Bacillus cereus*, en particular *B. cereus* grupo CNCM I-1562 o *Bacillus firmus*, grupo I-1582 (Accession number CNCM I-1582) o *Bacillus pumilus*, en particular grupo GB34 (Accession No. ATCC 700814) y grupo QST2808 (Accession No. NRRL B-30087), o *Bacillus subtilis*, en particular grupo GB03 (Accession No. ATCC SD-1397), o *Bacillus subtilis* grupo QST713 (Accession No. NRRL B-21661) o *Bacillus subtilis* grupo OST 30002 (Accession No. NRRL B-50421) *Bacillus thuringiensis*, en particular *B. thuringiensis* subespecies *israelensis* (serotipo H-14), grupo AM65-52 (Accession No. ATCC 1276), o *B. thuringiensis subsp. aizawai*, en particular grupo ABTS-1857 (SD-1372), o *B. thuringiensis subsp. kurstaki* grupo HD-1, o *B. thuringiensis subsp. tenebrionis* grupo NB 176 (SD-5428), *Pasteuria penetrans*, *Pasteuria spp.* (Rotylenchulus reniformis nematode)-PR3 (Accession Number ATCC SD-5834), *Streptomyces microflavus* grupo AQ6121 (= QRD 31.013, NRRL B-50550), *Streptomyces galbus* grupo AQ 6047 (Accession Number NRRL 30232).

Ejemplos de hongos y levaduras que se utilizan como pesticidas biológicos o que pueden utilizarse son:

Beauveria bassiana, en particular grupo ATCC 74040, *Coniothyrium minitans*, en particular grupo CON/M/91-8 (Accession No. DSM-9660), *Lecanicillium spp.*, en particular grupo HRO LEC 12, *Lecanicillium lecanii*, (antiguamente conocido como *Verticillium lecanii*), en particular grupo KV01, *Metarhizium anisopliae*, en particular grupo F52 (DSM3884/ ATCC 90448), *Metschnikowia fructicola*, en particular grupo NRRL Y-30752, *Paecilomyces fumosoroseus* (nuevo: *Isaria fumosorosea*), en particular grupo IFPC 200613, o grupo Apopka 97 (Accession No. ATCC 20874), *Paecilomyces lilacinus*, en particular *P. lilacinus* grupo 251 (AGAL 89/030550), *Talaromyces flavus*, en particular grupo V117b, *Trichoma atroviride*, en particular grupo SC1 (Accession Number CBS 122089), *Trichoma harzianum*, en particular *T. harzianum rifai T39*. (Accession Number CNCM I-952).

Ejemplos de virus que se utilizan como pesticidas biológicos o que pueden utilizarse son:

Adoxophyes orana (polilla de la cáscara de manzana) Granulosevirus (GV), *Cydia pomonella* (polilla de la manzana) Granulosevirus (GV), *Helicoverpa armigera* (gusano rosado) Nuklear Polyhedrosis Virus (NPV), *Spodoptera exigua* (gandarma) mNPV, *Spodoptera frugiperda* (gusano cogollero) mNPV, *Spodoptera littoralis* (Rosquilla Negra) NPV.

También comprende bacterias y hongos que se agregan como „inoculantes” a plantas o a partes de las plantas o a órganos de las plantas y que por sus características especiales fomentan el crecimiento y el estado fitosanitario de las plantas. Como ejemplos se mencionan:

Agrobacterium spp., *Azorhizobium caulinodans*, *Azospirillum spp.*, *Azotobacter spp.*, *Bradyrhizobium spp.*, *Burkholderia spp.*, en particular *Burkholderia cepacia* (antiguamente conocido como *Pseudomonas cepacia*), *Gigaspora spp.*, o *Gigaspora monosporum*, *Glomus spp.*, *Laccaria spp.*, *Lactobacillus buchneri*, *Paraglomus spp.*, *Pisolithus tinctorius*, *Pseudomonas spp.*, *Rhizobium spp.*, en particular *Rhizobium*

trifolii, *Rhizopogon* spp., *Scleroderma* spp., *Suillus* spp., *Streptomyces* spp.

Ejemplos de extractos de plantas y productos producidos por microorganismos, inclusive proteínas y metabolitos secundarios que se utilizan como pesticidas biológicos o que pueden utilizarse son:

5 Allium sativum, Artemisia absinthium, Azadirachtin, Biokeeper WP, Cassia nigricans, Celastrus angulatus, Chenopodium anthelminticum, Chitin, Armour-Zen, Dryopteris filix-mas, Equisetum arvense, Fortune Aza, Fungastop, Heads Up (Chenopodium quinoa-Saponinextrakt), Pyrethrum/Pyrethrins, Quassia amara, Quercus, Quillaja, Regalia, „Requiem TM Insecticide“, Rotenon, Ryania/Ryanodine, Symphytum officinale, Tanacetum vulgare, Thymol, Triact 70, TriCon, Tropaeolum majus, Urtica dioica, Veratrin, Viscum album, extracto de Brassicaceae, en particular polvo de colza o mostaza.

10 **Protectores como componentes de combinación**

Los compuestos de la fórmula (I) se pueden combinar con protectores como por ejemplo benoxacor, cloquintocet (-mexil), ciometrinil, cipsosulfamida, diclormid, fenclorazol (-etil), fenclorim, flurazole, fluxofenim, furilazole, isoxadifen (-etil), mefenpir (-dietil), anhídrido naftálico, oxabetrinil, 2-metoxi-N- (4-[(metilcarbamoil)amino]fenil)sulfonilo)benzamida (CAS 129531-12-0), 4-(dicloroacetilo)-1-oxa-4-
15 azaspiro[4.5]decane (CAS 71526-07-3), 2,2,5-trimetilo-3-(dicloroacetilo)-1,3-oxazolidine (CAS 52836-31-4).

Plantas y partes de las plantas

De acuerdo con la invención pueden tratarse todas las plantas y partes de plantas. Por plantas se entienden a este respecto todas las plantas y poblaciones de plantas como plantas silvestres deseadas y no deseadas
20 o plantas de cultivo (incluyendo plantas de cultivo que se producen naturalmente), por ejemplo cereales (trigo, arroz, triticale, cebada, centeno, avena), maíz, soja, papa, remolacha azucarera, caña de azúcar, tomates, pimientos y chile, pepinos, melones, zanahorias, sandías, cebollas, lechugas, espinacas, puerros, frijoles, *Brassica oleracea* (por ejemplo coles) y otras verduras, algodón, tabaco, colza, así como frutales (con las frutas manzanas, peras, cítricos y uvas). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que se obtienen
25 por métodos de cultivo y optimización convencionales o mediante métodos biotecnológicos y de ingeniería genética o por sus combinaciones, incluyendo las plantas transgénicas e incluyendo las variedades de plantas que pueden protegerse o que no pueden protegerse por el derecho de protección de la obtención de vegetales. Debe entenderse por plantas todos los estados de desarrollo de las plantas, por ejemplo semillas, esquejes así como plantas jóvenes (inmaduras) llegando hasta plantas maduras. Por
30 partes de plantas se entenderán todas las partes y órganos de las plantas aéreos y subterráneos, tales como brote, hoja, flor y raíz, nombrándose a modo de ejemplo hojas, agujas, tallos, troncos, flores, cuerpos fructíferos, frutos y semillas así como raíces, tubérculos y rizomas. A las partes de las plantas pertenecen también la cosecha (plantas cosechadas o partes de plantas) así como el material de propagación vegetativo y generativo, por ejemplo esquejes, tubérculos, rizomas, acodos y semillas.

El tratamiento de las plantas y partes de plantas según la invención con los compuestos de la fórmula (I) se realiza directamente o mediante actuación sobre el entorno, hábitat o lugar de almacenamiento según los métodos de tratamiento habituales, por ejemplo mediante inmersión, rociado, vaporización, nebulización, espolvoreado, extensión, inyección y en el caso de material de propagación, especialmente en el caso de semillas, además mediante envolturas de una o varias capas.

Como ya se ha mencionado anteriormente, de acuerdo con la invención se pueden tratar todas las plantas y sus partes. En una forma de realización preferida se tratan tipos y variedades de plantas silvestres u obtenidas por métodos de cultivo biológico convencionales, tal como cruce o fusión de protoplastos así como sus partes. En otra forma de ejecución preferida se tratan plantas transgénicas y variedades de plantas que se obtuvieron mediante métodos de ingeniería genética dado el caso en combinación con métodos convencionales (Genetically Modified Organisms (organismos modificados genéticamente)) y sus partes. El término „partes“ o la expresión „partes de plantas“ o se explicó anteriormente. De manera especialmente preferente, según la invención se tratan plantas de las variedades de plantas utilizadas o habituales en el comercio respectivamente. Por variedades de plantas se entienden plantas con nuevas propiedades (“características”), que se han cultivado tanto mediante cultivo convencional, mediante mutagénesis o mediante técnicas de ADN recombinante. Pueden ser variedades, raza, biotipos y genotipos.

Plantas transgénicas, tratamiento de semillas y eventos de integración

Las plantas o variedades de plantas transgénicas (obtenidas mediante ingeniería genética) preferentes según la invención, incluyen todas las plantas que a través de la modificación genética recibieron material genético que confiere a estas plantas propiedades (“características”) valiosas particularmente ventajosas. Ejemplos de tales propiedades son un mejor crecimiento de las plantas, tolerancia elevada frente a altas o bajas temperaturas, tolerancia elevada contra la sequía o contra el contenido en sal del agua o del terreno, rendimiento de floración elevado, cosecha más fácil, aceleración de la maduración, mayor rendimiento de la cosecha, mayor calidad y/o mayor valor alimenticio de los productos de cosecha, mayor capacidad de almacenamiento y/o procesabilidad de los productos de cosecha. Ejemplos adicionales y destacados especialmente de tales propiedades son una elevada defensa de las plantas contra plagas animales y microbianas, tal como frente a insectos, ácaros, nematodos y caracoles por ejemplo mediante toxinas que se generan en las plantas, especialmente aquellas que se generan mediante el material genético de *Bacillus Thuringiensis* (por ejemplo por los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF así como sus combinaciones). Se destaca también especialmente la elevada defensa de las plantas contra hongos, bacterias y virus fitopatógenos causado por ejemplo mediante resistencia sistémica adquirida (SAR), sistemina, fitoalexina, elicitores así como genes de resistencia y proteínas y toxinas expresadas de manera correspondiente. Como propiedades (“características”) se destacan además especialmente la tolerancia elevada de las plantas frente a determinados principios activos herbicidas, por ejemplo imidazolinonas, sulfonilureas, glifosato o fosfínotricina (p.ej gen “PAT”). Los genes que confieren las propiedades (“características”) deseadas

respectivamente pueden aparecer también en combinaciones entre sí en las plantas transgénicas. Como ejemplos de plantas transgénicas se mencionan las plantas de cultivo importantes, como cereales (trigo, arroz, triticale, cebada, centeno, avena), maíz, soja, papas, remolacha azucarera, caña, tomates, arvejas y otras verduras, algodón, tabaco, colza, así como frutales (con las frutas manzanas, peras, cítricos y uvas) destacándose especialmente maíz, soja, trigo, arroz, papas, algodón, caña, tabaco y colza. Como propiedades (“características”) se destacan especialmente la defensa elevada de las plantas contra insectos, arácnidos, nematodos y caracoles.

Protección fitosanitaria – Tipos de tratamiento

El tratamiento de las plantas y partes de plantas con los compuestos de la fórmula (I) se lleva a cabo directamente o mediante la acción en su medio ambiente, hábitat o espacio de almacenamiento por los procedimientos de tratamiento habituales por ejemplo inmersión, atomización, pulverización, rociado, vaporizado, espolvoreado, nebulización, esparcido, espumado, recubrimiento, extendiendo o inyectando la preparación, vertiendo (drench), riego por goteo y en el material de propagación, en particular en semillas, además por suspensión en seco y suspensión húmeda, suspensión líquida, incrustación, envolturas de una o varias capas, etc. Además es posible aplicar los compuestos de la fórmula (I) según el procedimiento Ultra-Low-Volume o inyectar la forma de aplicación o el propio compuesto de la fórmula (I) en el suelo.

Una forma preferida de aplicación directa en las plantas es la aplicación sobre las hojas, es decir se aplican los compuestos de la fórmula (I) sobre las hojas, debiendo ajustarse la frecuencia del tratamiento y la dosis de aplicación al riesgo de infestación por la plaga pertinente.

Cuando se trata de compuestos activos por vía sistemática, los compuestos de la fórmula (I) alcanzan las plantas también por las raíces. El tratamiento de las plantas se lleva a cabo entonces por la acción de los compuestos de fórmula (I) en el hábitat de la planta. Esto se puede hacer por ejemplo por vertido, mezclando en el suelo o por medio del caldo nutritivo, es decir se impregna el lugar de la planta (por ejemplo, suelo o sistemas hidropónicos) con una forma líquida de los compuestos de fórmula (I), o por aplicación en el suelo, es decir, los compuestos de fórmula (I) se introducen en forma sólida (por ejemplo, en forma de gránulos) en la ubicación de las plantas. En cultivos de arrozales el compuesto de fórmula (I) se puede dosificar aplicando el compuesto en forma sólida (por ejemplo en forma de gránulos) en un campo de arroz inundado.

30 Tratamiento de Semillas

El control de plagas animales tratando las semillas de las plantas se conoce desde hace tiempo y es objeto de continuas mejoras. Sin embargo se plantean una serie de problemas en el tratamiento de semillas que no siempre se pueden solucionar de manera satisfactoria. Por lo tanto, es deseable desarrollar métodos para proteger la semilla y la planta en germinación de manera que no sea necesario o que al menos se pueda reducir considerablemente la aplicación adicional de pesticidas en el almacenamiento, después de

la siembra o después del surgimiento de la planta. Además es deseable optimizar la cantidad del principio activo utilizado en el sentido que las semillas y la planta en germinación sean protegidas de la mejor manera contra el ataque de plagas animales, pero sin dañar la planta misma por el compuesto activo empleado. En particular, los métodos para el tratamiento de la semilla también deben incluir las propiedades insecticidas o nematicidas intrínsecas de las plagas resistentes o plantas transgénicas tolerantes para lograr una protección óptima de la semilla y de la planta en germinación con un mínimo de pesticidas.

La presente invención por lo tanto, en particular, también se refiere a un método para proteger la semilla y la germinación de las plantas del ataque de plagas, en el que se trata las semillas con uno de los compuestos de la fórmula (I). El procedimiento según la invención para la protección de la semilla y de las plantas en germinación del ataque de plagas, comprende además un procedimiento, en el que las semillas se tratan al mismo tiempo en una sola operación o secuencialmente con un compuesto de la fórmula (I) y una combinación de mezclas. Comprende además un procedimiento en el que las semillas se tratan en diferentes momentos con un compuesto de la fórmula (I) y una combinación de mezclas.

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

Además la invención refiere a semillas que han sido tratadas con uno de los compuestos de la fórmula (I) para la protección contra plagas animales. La invención también se refiere a semillas que han sido tratadas al mismo tiempo con un compuesto de la fórmula (I) y con combinación de mezclas. La invención también se refiere a semillas que han sido tratadas en diferentes momentos con un compuesto de la fórmula (I) y con combinación de mezclas. En el caso de las semillas que se ha tratado en diferentes momentos con un compuesto de fórmula (I) y con combinación de mezclas, las sustancias individuales pueden estar contenidas en las diferentes capas en la semilla. En este caso, las capas que contienen un compuesto de fórmula (I) y una combinación de mezclas, eventualmente pueden estar separadas por una capa intermedia.

La invención también se refiere a semillas, en las que un compuesto de la fórmula (I) y una combinación de mezclas se aplican como parte de un recubrimiento o como capa adicional o capas adicionales a un recubrimiento.

Además la invención se refiere a semillas que después del tratamiento con un compuesto de la fórmula (I) se somete a un procedimiento de recubrimiento de película para evitar la abrasión del polvo en la semilla.

Una de las ventajas cuando uno de los compuestos de la fórmula (I) actúa en forma sistemática es que el tratamiento de las semillas no solo protege contra plagas animales a las semillas en sí, sino también las plantas resultantes de ellas. De esta manera se puede prescindir del tratamiento inmediato del cultivo en el momento de la siembra o poco después.

Otra ventaja es que mediante el tratamiento de las semillas con un compuesto de la fórmula (I) se puede fomentar la germinación y surgimiento de las semillas tratadas.

También debe verse como ventaja que los compuestos de la fórmula (I) también se pueden usar en particular en semillas transgénicas.

Los compuestos de la fórmula (I) además se pueden usar en combinación con medios de la tecnología de señal, por lo que se produce una mejor colonización con simbiontes como por ejemplo *Rhizobium*, micorrizas y/o bacterias u hongos endófitos, y/o se produce una mejor fijación optimizada de nitrógeno.

Los compuestos de la fórmula (I) son adecuados para semillas de cualquier variedad de plantas que se usan en la agricultura, en el invernadero, en los bosques o en el sector hortofrutícola. Se trata particularmente de semillas de cereales (por ejemplo trigo, cebada, centeno, mijo y avena), maíz, algodón, soja, arroz, papa, girasol, café, tabaco, canola, colza, remolacha (por ejemplo remolacha azucarera y forrajera), maní, verduras (por ejemplo tomate, pepino, frijoles, plantas de col, cebollas y lechuga), frutales, césped y plantas ornamentales. De particular importancia es el tratamiento de semillas de cereales (como trigo, cebada, centeno y avena), maíz, soja, algodón, canola, colza, verdura y arroz.

Como mencionado anteriormente, también es de particular importancia el tratamiento de semillas transgénicas con un compuesto de la fórmula (I). Se trata de las semillas de plantas que generalmente contienen al menos un gen heterólogo que controla la expresión de un polipéptido con propiedades insecticidas o nemadocidas en particular. Los genes heterólogos en las semillas transgénicas pueden derivar de microorganismos como *Bacillus*, *Rhizobium*, *Pseudomonas*, *Serratia*, *Trichoderma*, *Clavibacter*, *Glomus* o *Gliocladium*. La presente invención es adecuada especialmente para el tratamiento de semillas transgénicas que contienen al menos un gen heterólogo que deriva de *Bacillus* sp. De forma particularmente preferente, se trata de un gen heterólogo derivado de *Bacillus thuringiensis*.

En la presente invención, el compuesto de fórmula (I) se aplica a la semilla. Preferiblemente la semilla se trata en un estado tan estable, que no se producen daños durante el tratamiento. Por lo general el tratamiento de las semillas se puede realizarse en cualquier momento entre la cosecha y la siembra. Por lo general se usan semillas que fueron separadas de la planta y liberados de la mazorca, cáscaras, tallos, recubrimientos, lana o pulpa. Así por ejemplo se utilizan semillas que se han cosechado, limpiado y secado hasta lograr un contenido de humedad apto para que sean almacenadas. Alternativamente también se pueden utilizar semillas que después de secadas se trataron con agua por ejemplo con agua y luego se secaron de nuevo, por ejemplo Priming. En el caso de semillas de arroz también es posible utilizar semillas que han sido pre-hinchadas hasta cierta etapa (pigeon breast Stadium (etapa de pecho de paloma)) por ejemplo en agua, lo que lleva a una germinación mejorada y un surgimiento más uniforme.

En general se debe tener cuidado durante el tratamiento de las semillas que la cantidad del compuesto de la fórmula (I) y/o otros aditivos que se elige aplicar a las semillas, sea tal que la germinación de las semillas no se vea afectada o la planta resultante no sea dañada. Esto debe considerarse especialmente cuando los principios activos pueden mostrar efectos fitotóxicos en determinadas cantidades de aplicación.

Los compuestos de la fórmula (I) se aplican generalmente en la forma de una formulación adecuada a la semilla. El técnico conoce las formulaciones y los procedimientos adecuados para el tratamiento de semillas.

5 Los compuestos de la fórmula (I) se pueden transformar en las formulaciones de recubrimiento habituales, como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvo, espumas, slurries u otros recubrimientos para semillas, así como formulaciones de ultra bajo volumen (ULV).

Esas formulaciones se producen de manera conocida mezclando compuestos de la fórmula (I) con aditivos convencionales como por ejemplo diluyentes convencionales así como disolventes o diluyentes, colorantes, humectantes, dispersantes, emulsionantes, antiespumantes, conservantes, espesantes
10 secundarios, aglutinantes, giberelinas y también agua.

Se pueden considerar todos los colorantes usuales para tales fines como colorantes que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento según la invención. Se pueden utilizar pigmentos poco solubles en agua como colorantes solubles en agua. Como ejemplos se mencionan los colorantes conocidos con los nombres Rhodamin B, C.I. Pigment Red 112 y C.I. Solvent Red 1.

15 Dentro de los humectantes que pueden incluirse en las formulaciones de recubrimiento según la invención, se consideran todas las formulaciones de los principios activos agroquímicos habituales para promover la humectación. De preferencia se utilizan sulfonatos de alquilnaftalenos, como sulfonatos naftalenos diisopropilo o diisobutilo.

Dentro de los dispersantes y/o emulsionantes que pueden incluirse en las formulaciones de recubrimiento según la invención, se consideran todos los dispersantes no iónicos, aniónicos y catiónicos habituales para la formulación de principios activos agroquímicos. De preferencia se utilizan dispersantes no iónicos o aniónicos o mezclas de dispersantes no iónicos o aniónicos. Como dispersantes no iónicos se deben nombrar en particular polímeros de bloque etilenoóxido-propilenoóxido, éter alquilfenol poliglicólico así como éter triestirilfenol poliglicólico y sus derivados fosfatados o sulfatados. Dispersantes aniónicos
25 adecuados son en particular ligninsulfonatos, sales de ácido poliacrílico y condensados de formaldehído arilsulfonato.

Dentro de los antiespumantes que pueden incluirse en las formulaciones de recubrimiento según la invención están todas las sustancias inhibidoras de espuma habituales en las formulaciones de los principios activos agroquímicos. Se usan preferentemente sustancias inhibidoras de espuma de silicona y
30 estearato de magnesio.

En las formulaciones de recubrimiento según la invención se pueden usar como conservantes todas las sustancias agroquímicas utilizables para tales fines. Como ejemplo se nombran diclorofeno y alcohol bencílico hemiformal.

Como espesantes secundarios que pueden estar incluidos en las formulaciones de recubrimiento según la invención, se consideran todas las sustancias agroquímicas utilizables para tales fines. Preferentemente se consideran derivados de celulosa, de ácido acrílico, xantano, arcillas modificadas y sílice altamente disperso.

- 5 Como aglutinantes que pueden estar incluidos en las formulaciones de recubrimiento según la invención, se consideran todos los aglutinantes habituales que se usan en todos los recubrimientos. Se nombran de preferencia polivinilpirrolidona, acetato de polivinilo, alcohol polivinílico y tilosa.

- Como giberelinas que pueden estar incluidos en las formulaciones de recubrimientos según la invención, se consideran preferentemente giberelinas A1, A3 (= ácido giberélico), A4 y A7, se usa especialmente
10 preferente el ácido giberélico. Las giberelinas son conocidas (véase R. Wegler „Chemie der Pflanzenschutz- y Schädlingsbekämpfungsmittel“, Bd. 2, Springer Verlag, 1970, S. 401-412 („Química de los pesticidas y plaguicidas“, tomo 2, Edit. Springer, 190, pág. 401-412)).

- Las formulaciones de recubrimientos según la invención se pueden utilizar directamente o después de la dilución previa con agua para el tratamiento de semillas de diversos tipos. Así los concentrados o las
15 preparaciones resultantes de la dilución con agua se pueden emplear para el recubrimiento de semillas de cereales como trigo, cebada, centeno, avena y triticale, así como semillas de maíz, arroz, colza, arvejas, frijoles, algodón, girasol, soja y remolachas o también de semillas de vegetales de la más variada naturaleza. Las formulaciones de recubrimientos según la invención o sus formas de aplicación diluías también pueden usarse para recubrir semillas de plantas transgénicas.

- 20 Para el tratamiento de las semillas con las formulaciones de recubrimiento según la invención o las formas de aplicación elaboradas a partir de ellas, se consideran todos los mezcladores que se utilizan habitualmente para el recubrimiento. En particular en el recubrimiento se procede de tal manera que se vierten las semillas en un mezclador en funcionamiento discontinuo o continuo, se agrega la cantidad deseada de la formulación de recubrimiento como tal o diluida previamente en agua y se mezcla hasta que
25 la formulación se haya distribuido uniformemente sobre las semillas. Opcionalmente sigue una operación de secado.

- La velocidad de aplicación de la formulación de recubrimiento según la invención a emplear, puede variar dentro de un rango relativamente amplio. Depende del respectivo contenido de los compuestos de fórmula (I) en las formulaciones y de la semilla. Las velocidades de aplicación en el compuesto de la fórmula (I)
30 generalmente están entre 0,001 y 50 g por kilogramo de semillas, preferentemente entre 0,01 y 15 g por kilogramo de semillas.

Tiergesundheit

En el campo de la sanidad animal, es decir en el campo de la medicina veterinaria, los compuestos de la fórmula (I) son efectivos contra parásitos, en particular ectoparásitos o endoparásitos. El término

endoparásitos comprende en particular helmintos y protozoos como coccidia. Los ectoparásitos son típicamente y preferentemente artrópodos, en particular insectos y ácaros.

En el campo de la medicina veterinaria los compuestos de la fórmula (I) que tienen una toxicidad favorable a los animales de sangre caliente, son apropiados para el control de parásitos que aparecen en la reproducción de animales y en la cría de animales de ganadería, animales reproductores, animales de zoológico, animales de laboratorio, animales de experimentación y animales domésticos. Son eficaces contra todas las etapas del desarrollo o contra etapas individuales del desarrollo del parásito.

Los animales de granja incluyen por ejemplo mamíferos como ovejas, cabras, caballos, burros, camellos, búfalos, conejos, renos, ciervos en barbecho y en particular ganado vacuno y cerdos; aves como pavos, patos, gansos y en particular pollos; en la acuicultura por ejemplo, peces y crustáceos y también en insectos como abejas.

Los animales domésticos incluyen por ejemplo mamíferos como hámster, cuyes, ratas, ratones, chinchillas, hurones y en particular perros, gatos, pájaros enjaulados, reptiles, anfibios y peces de acuario.

De acuerdo con una realización preferida, los compuestos de fórmula (I) se administran a mamíferos.

De acuerdo con otra realización preferida, los compuestos de fórmula (I) se administran a pájaros, precisamente pájaros enjaulados y en particular aves.

Mediante el uso de los compuestos de la fórmula (I) para el control de los parásitos se disminuyen y previenen enfermedades, muertes y reducción de rendimiento (en carne, leche, lana, pieles, huevos, miel y similares), de manera de alcanzar una cría de animales más económica y sencilla y un mejor bienestar animal.

En relación con el campo de la salud animal, el término "el control" o "controlar", significa que mediante los compuestos de la fórmula (I) se puede reducir eficazmente la aparición de los parásitos en un animal infectado en una medida inocua con esos parásitos. En concreto, "controlar" en este contexto significa que el compuesto de la fórmula (I) puede matar los parásitos correspondientes, impedir su crecimiento o su proliferación.

Entre los artrópodos se encuentran:

del orden Anoplurida, por ejemplo *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp., *Solenopotes* spp.; del orden Mallophagida y los sub-órdenes Amblycerina y Ischnocerina, por ejemplo *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp., *Felicola* spp.; del orden Diptera y los sub-órdenes Nematocerina y Brachycerina, por ejemplo *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp., *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides* spp., *Chrysops* spp., *Odagmia* spp., *Wilhelmia* spp., *Hybomitra* spp., *Atylotus* spp., *Tabanus* spp., *Haematopota* spp., *Philipomyia* spp., *Braula* spp., *Musca*

spp., *Hydrotaea* spp., *Stomoxys* spp., *Haematobia* spp., *Morellia* spp., *Fannia* spp., *Glossina* spp., *Calliphora* spp., *Lucilia* spp., *Chrysomyia* spp., *Wohlfahrtia* spp., *Sarcophaga* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Gasterophilus* spp., *Hippobosca* spp., *Lipoptena* spp., *Melophagus* spp., *Rhinoestrus* spp., *Tipula* spp.; del orden Siphonaptera, por ejemplo *Pulex* spp., *Ctenocephalides* spp., *Tunga* spp.,
 5 *Xenopsylla* spp., *Ceratophyllus* spp.;

del orden Heteroptera, por ejemplo *Cimex* spp., *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp.; así como plagas del orden Blattaria.

Además se encuentran entre los artrópodos:

De la subclase Akari (Acarina) y del orden Metastigmata, por ejemplo de la familia Argasidae, como
 10 *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., de la familia Ixodidae, como *Ixodes* spp., *Amblyomma* spp., *Rhipicephalus* (*Boophilus*) spp., *Dermacentor* spp., *Haemophysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Rhipicephalus* spp. (originalmente la especie de la garrapata hospedera); del orden Mesostigmata, como *Dermanyssus* spp., *Ornithonyssus* spp., *Pneumonyssus* spp., *Railletia* spp., *Pneumonyssus* spp., *Sternostoma* spp., *Varroa* spp., *Acarapis* spp.; del orden Actinotrichida (Prostigmata), por ejemplo *Acarapis* spp., *Cheyletiella*
 15 spp., *Ornithocheyletiella* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Neotrombicula* spp., *Listrophorus* spp.; y del orden Acaridida (Astigmata), por ejemplo *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp., *Laminosioptes* spp..

Entre los parásitos protozoarios se encuentran:

20 *Mastigophora* (Flagellata), como por ejemplo *Trypanosomatidae*, por ejemplo *Trypanosoma* b. *brucei*, *T.b. gambiense*, *T.b. rhodesiense*, *T. congolense*, *T. cruzi*, *T. evansi*, *T. equinum*, *T. lewisi*, *T. percae*, *T. simiae*, *T. vivax*, *Leishmania* *brasiliensis*, *L. donovani*, *L. tropica*, como por ejemplo *Trichomonadidae*, por ejemplo *Giardia lamblia*, *G. canis*;

Sarcomastigophora (*Rhizopoda*), como *Entamoebidae*, por ejemplo *Entamoeba histolytica*,
 25 *Hartmannellidae*, por ejemplo *Acanthamoeba* sp., *Harmanella* sp.;

Apicomplexa (*Sporozoa*), como *Eimeridae*, por ejemplo *Eimeria* *acervulina*, *E. adenoides*, *E. alabamensis*, *E. anatis*, *E. anserina*, *E. arloingi*, *E. ashata*, *E. auburnensis*, *E. bovis*, *E. brunetti*, *E. canis*, *E. chinchillae*, *E. clupearum*, *E. columbae*, *E. contorta*, *E. crandallii*, *E. debbiei*, *E. dispersa*, *E. ellipsoides*, *E. falciformis*, *E. faurei*, *E. flavescens*, *E. gallopavonis*, *E. hagani*, *E. intestinalis*, *E. iroquoia*, *E. irrisidua*,
 30 *E. labbeana*, *E. leucarti*, *E. magna*, *E. maxima*, *E. media*, *E. meleagridis*, *E. meleagritidis*, *E. mitis*, *E. necatrix*, *E. ninakohlyakimovae*, *E. ovis*, *E. parva*, *E. pavonis*, *E. perforans*, *E. phasani*, *E. piriformis*, *E. praecox*, *E. residua*, *E. scabra*, *E. spec.*, *E. stiedai*, *E. suis*, *E. tenella*, *E. truncata*, *E. truttae*, *E. zuernii*, *Globidium spec.*, *Isospora belli*, *I. canis*, *I. felis*, *I. ohioensis*, *I. rivolta*, *I. spec.*, *I. suis*, *Cystispora spec.*, *Cryptosporidium spec.*, insbesondere *C. parvum*; como *Toxoplasmatidae*, por ejemplo *Toxoplasma*

- gondii, Hammondia heydornii, Neospora caninum, Besnoitia besnoitii; como Sarcocystidae, por ejemplo Sarcocystis bovicanis, S. bovi hominis, S. ovis, S. ovifelis, S. neurona, S. spec., S. suihominis, como Leucozoidea, por ejemplo Leucozytozoon simondi, como Plasmodiidae, por ejemplo Plasmodium berghei, P. falciparum, P. malariae, P. ovale, P. vivax, P. spec., como Piroplasma, por ejemplo Babesia argentina, B. bovis, B. canis, B. spec., Theileria parva, Theileria spec., como Adeleina, por ejemplo Hepatozoon canis, H. spec.

Dentro de los endoparásitos patógenos donde se incluyen los helmintos, se encuentran los gusanos planos (por ejemplo Monogenea, Cestodes y Trematodes), nematodos, Acanthocephala y Pentastoma. Estos incluyen:

- 10 Monogenea: por ejemplo: Gyrodactylus spp., Dactylogyrus spp., Polystoma spp.;

Cestodes: del orden Pseudophyllidea por ejemplo: Diphyllbothrium spp., Spirometra spp., Schistocephalus spp., Ligula spp., Bothridium spp., Diplogonoporus spp.;

- del orden Cyclophyllida por ejemplo: Mesocestoides spp., Anoplocephala spp., Paranoplocephala spp., Moniezia spp., Thysanosoma spp., Thysaniezia spp., Avitellina spp., Stilesia spp., Cittotaenia spp.,
15 Andrya spp., Bertiella spp., Taenia spp., Echinococcus spp., Hydatigera spp., Davainea spp., Raillietina spp., Hymenolepis spp., Echinolepis spp., Echinocotyle spp., Diorchis spp., Dipylidium spp., Joyeuxiella spp., Diplopylidium spp.;

- Trematodes: de la clase Digenea por ejemplo: Diplostomum spp., Posthodiplostomum spp., Schistosoma spp., Trichobilharzia spp., Ornithobilharzia spp., Austrobilharzia spp., Gigantobilharzia spp.,
20 Leucochloridium spp., Brachylaima spp., Echinostoma spp., Echinoparyphium spp., Echinochasmus spp., Hypoderaeum spp., Fasciola spp., Fascioloides spp., Fasciolopsis spp., Cyclocoelum spp., Typhlocoelum spp., Paramphistomum spp., Calicophoron spp., Cotylophoron spp., Gigantocotyle spp., Fiscoederius spp., Gastrothylacus spp., Notocotylus spp., Catatropis spp., Plagiorchis spp., Prosthogonimus spp., Dicrocoelium spp., Eurytrema spp., Troglotrema spp., Paragonimus spp., Collyriclum spp., Nanophyetus
25 spp., Opisthorchis spp., Clonorchis spp., Metorchis spp., Heterophyes spp., Metagonimus spp.;

Nematodos: Trichinellida por ejemplo: Trichuris spp., Capillaria spp., Paracapillaria spp., Eucolus spp., Trichomosoides spp., Trichinella spp.;

del orden Tylenchida por ejemplo: Micronema spp., Strongyloides spp.;

- del orden Rhabditida por ejemplo: Strongylus spp., Triodontophorus spp., Oesophagodontus spp.,
30 Trichonema spp., Gyaloccephalus spp., Cyathopharynx spp., Poterostomum spp., Cyclocercus spp., Cylicostephanus spp., Oesophagostomum spp., Chabertia spp., Stephanurus spp., Ancylostoma spp., Uncinaria spp., Necator spp., Bunostomum spp., Globocephalus spp., Syngamus spp., Cyathostoma spp., Metastrongylus spp., Dictyocaulus spp., Muellerius spp., Protostrongylus spp., Neostongylus spp.,

Cystocaulus spp., Pneumostongylus spp., Spicocaulus spp., Elaphostongylus spp. Parelaphostongylus spp., Crenosoma spp., Paracrenosoma spp., Oslerus spp., Angiostrongylus spp., Aelurostrongylus spp., Filaroides spp., Parastrongylus spp., Trichostrongylus spp., Haemonchus spp., Ostertagia spp., Teladorsagia spp., Marshallagia spp., Cooperia spp., Nippostrongylus spp., Heligmosomoides spp.,
 5 Nematodirus spp., Hyostrongylus spp., Obeliscoides spp., Amidostomum spp., Ollulanus spp.;

del orden Spirurida por ejemplo: Oxyuris spp., Enterobius spp., Passalurus spp., Syphacia spp., Aspicularis spp., Heterakis spp.; Ascaris spp., Toxascaris spp., Toxocara spp., Baylisascaris spp., Parascaris spp., Anisakis spp., Ascaridia spp.; Gnathostoma spp., Physaloptera spp., Thelazia spp., Gongylonema spp., Habronema spp., Parabronema spp., Draschia spp., Dracunculus spp.;
 10 spp., Parafilaria spp., Setaria spp., Loa spp., Dirofilaria spp., Litomosoides spp., Brugia spp., Wuchereria spp., Onchocerca spp., Spirocerca spp.;

Acanthocephala: del orden Oligacanthorhynchida por ejemplo: Macracanthorhynchus spp., Prosthonorchis spp.; del orden Polymorphida por ejemplo: Filicollis spp.; del orden Moniliformida por ejemplo: Moniliformis spp.;

15 del orden Echinorhynchida por ejemplo Acanthocephalus spp., Echinorhynchus spp., Leptorhynchoides spp.;

Pentastoma: del orden Porocephalida por ejemplo Linguatula spp.

En el campo de la medicina veterinaria y en la cría animal, la administración de los compuestos de la fórmula (I) se realiza de acuerdo a los métodos conocidos como enteral, parenteral, dermal o nasal en
 20 forma de preparaciones adecuadas. La administración puede ser terapéuticamente o profilácticamente.

Por lo tanto, una realización de la presente invención se refiere al uso de un compuesto de fórmula (I) como medicamento.

Otro aspecto se refiere al uso de un compuesto de la fórmula (I) como anti-endoparasitario, en particular como helminticida o como un agente contra protozoos. Los compuestos de la fórmula (I) son adecuados
 25 para su uso como anti-endoparasitario, en particular como helminticida o como un agente contra protozoos, por ejemplo en la reproducción y en la cría de animales de ganadería, en corrales y en el sector de la higiene.

Otro aspecto a su vez refiere al uso de un compuesto de la fórmula (I) como anti-ectoparasitario, en particular un artropodocida como un insecticida o un acaricida. Otro aspecto se refiere al uso de un
 30 compuesto de la fórmula (I) como anti-ectoparasitario, en particular un artropodocida como un insecticida o un acaricida, por ejemplo en la reproducción y en la cría de animales de ganadería, en corrales y en el sector de la higiene.

Componentes de mezcla antihelmínticos

A modo de ejemplo se nombran los siguientes componentes de mezcla antihelmínticos:

Principios activos antihelmínticos, inclusive principios activos trematicidas y cestocidas:

de la clase de las **lactonas macrocíclicas**, por ejemplo: Abamectin, Doramectin, Emamectin, Eprinomectin, Ivermectin, Milbemycin, Moxidectin, Nemadectin, Selamectin;

- 5 de la clase de los **benzimidazoles y probenzimidazoles**, por ejemplo: Albendazol, sulfóxido de albendazol, Cambendazol, Cyclobendazol, Febantel, Fenbendazol, Flubendazol, Mebendazol, Netobimin, Oxfendazol, Oxibendazol, Parbendazol, Thiabendazol, Thiophanat, Triclabendazol;

de la clase de los **ciclooctadepsipeptidos**, por ejemplo: Emodepsid, PF1022;

de la clase de los **derivados de aminoacetonitril**, por ejemplo: Monepantel;

- 10 de la clase de la **tetrahidropirimidina**, por ejemplo: Morantel, Pyrantel, Oxantel;

de la clase de los **imidazotiazole**, por ejemplo: Butamisol, Levamisol, Tetramisol;

de la clase de las **salicilanilidas**, por ejemplo: Bromoxanid, Brotianid, Clioxanid, Closantel, Niclosamid, Oxcyclozanid, Rafoxanid, Tribromsalan;

de la clase de las **paraherquamidas**, por ejemplo: Derquantel, Paraherquamid;

- 15 de la clase de las **aminofenilamidinas**, por ejemplo: Amidantel, Amidantel desacilado (dAMD), Tribendimidin;

de la clase de los **organofosfatos**, por ejemplo: Coumaphos, Cruformat, Diclorvos, Haloxon, Naftalofos, Triclorfon;

- 20 de la clase de los **fenoles sustituidos**, por ejemplo: Bitionaol, Disofenol, Hexaclorofen, Niclofolan, Meniclofolan, Nitroxinil;

de la clase de las **piperazinonas**, por ejemplo: Praziquantel, Epsiprantel;

- 25 de otras **clases diversas**, por ejemplo: Amoscanat, Befenio, Bunamidin, Clonazepam, Clorsulon, Diamfenetid, Diclorofeno, Dietilcarbamazin, Emetin, Hetolin, Hicantone, Lucantone, Miracil, Mirasan, Niclosamid, Niridazol, Nitroxinil, Nitroscanat, Oltipraz, Omfalotin, Oxamniquin, Paromomicin, Piperazin, Resorantel.

Control de vectores

Los compuestos de la fórmula (I) también pueden emplearse en el control de vectores. Un vector en el sentido de la presente invención es un artrópodo, en particular un insecto o arácnido que está en

condiciones de transmitir agentes patógenos como por ejemplo virus, lombrices, unicelulares y bacterias desde un depósito (planta, animal, ser humano, etc.) a un huésped. Los agentes patógenos pueden transmitirse al huésped ya sea mecánicamente (por ejemplo tracoma por la mosca no-picadora) o por inyección (por ejemplo parásito de la Malaria por mosquitos).

5 Ejemplos de vectores y de las enfermedades o agentes patógenos respectivamente por ellos transmitidos son:

1) Mosquitos

- Anopheles: malaria, filariasis;
- Culex: encefalitis japonesa, filariasis, otras enfermedades virales, transmisión de lombrices;
- 10 - Aedes: fiebre amarilla, fiebre del Dengue, filariasis, otras enfermedades virales;
- Simuliidae: transmisión de lombrices en particular Onchocerca volvulus;

2) Piojos: infecciones de la piel, fiebre tifoidea (epidemic typhus);

3) Pulgas: Peste, fiebre tifoidea endémica;

4) Moscas: enfermedad del sueño (Tripanosomiasis); cólera, otras enfermedades bacteriales;

15 5) Ácaros: acariosis, fiebre tifoidea, Rickettsiosis exantemática, Tularamia, encefalitis de Saint-Louis, meningitis viral (FSME), fiebre hemorrágica de Crimea-Congo, enfermedad de Lyme;

6) Garrapatas: enfermedades de Lyme como Borrelia duttoni, encefalitis transmitida por garrapatas, fiebre Q (Coxiella burnetii), Babesia (Babesia canis canis).

20 Ejemplos para vectores en el sentido de la presente invención son insectos como áfidos, moscas, cicádidos o tisanópteros que pueden transmitir virus de plantas a las plantas. Otros vectores que transmiten virus de plantas son ácaros rojos, piojos, coleópteros y nematodos.

Otros ejemplos para vectores en el sentido de la presente invención son insectos y arácnidos como mosquitos, en particular del género Aedes, Anopheles, por ejemplo A. gambiae, A. arabiensis, A. funestus, A. dirus (Malaria) y Culex, piojos, pulgas, moscas, ácaros y garrapatas que pueden transmitir agentes
25 patógenos a animales y/o seres humanos.

También es posible un control de vectores cuando los compuestos de la fórmula (I) son un “quiebra-resistencia”.

Los compuestos de la fórmula (I) son apropiados para prevenir enfermedades o agentes patógenos respectivamente, que fueron transmitidos por vectores. Por lo tanto otro aspecto de la presente invención

es el uso de compuestos de la fórmula (I) para el control de vectores, por ejemplo en la agricultura, en la horticultura, en bosques, en jardines e instalaciones de ocio así como en la protección de productos almacenados y materiales.

Protección de materiales técnicos

- 5 Los compuestos de la fórmula (I) son apropiados para la protección de materiales técnicos contra el ataque o la destrucción por insectos, por ejemplo del orden Coleóptera, Himenóptera, Isóptera, Lepidóptera, Psocóptera y Zygentoma.

Por materiales técnicos se entiende en este contexto materiales inanimados como preferentemente plásticos, adhesivos, colas, papeles y cartones, cuero, madera, productos para el procesamiento de madera
10 y pinturas. El uso de la invención para la protección de madera es especialmente preferente.

En otra forma de ejecución los compuestos de la fórmula (I) se usan junto con al menos otro insecticida y/o al menos un fungicida.

En otra forma de ejecución los compuestos de la fórmula (I) se presentan como un pesticida pronto para usar (ready-to-use), es decir, se puede aplicar sin más cambios en el material en cuestión. Como
15 insecticidas o fungicidas adicionales, entran en consideración los arriba mencionados en particular.

Sorprendentemente, también se encontró, que los compuestos de la fórmula (I) se pueden usar también en la protección contra la incrustación en objetos, en particular de cascos de barco, filtros, redes, obras, muelles y equipos de señalización que están en contacto con agua de mar o agua salobre. Asimismo los compuestos de la fórmula (I) se pueden usar por sí solos o en combinación con otros principios activos
20 como agentes anti incrustantes.

El control de plagas de animales en el sector de la higiene

Los compuestos de la fórmula (I) son adecuados para el control de plagas animales en el sector de la higiene. En especial la invención se puede usar en la protección del hogar, de la higiene y de los productos almacenados, especialmente para el control de insectos, arácnidos y ácaros que aparecen en ambientes
25 cerrados como por ejemplo viviendas, edificios industriales, oficinas, cabinas de vehículos. Para controlar plagas de animales, los compuestos de la fórmula (I) se utilizan solos o en combinación con otros principios activos y/o excipientes. Se utilizan preferentemente en productos insecticidas para el hogar. Los compuestos de fórmula (I) son activos contra especies sensibles y resistentes así como contra todos los estadios de desarrollo.

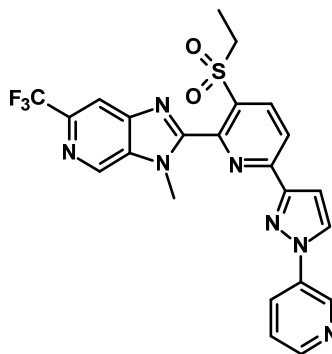
30 Estas plagas incluyen, por ejemplo plagas de la clase Arachnida, de los órdenes Scorpiones, Araneae y Opiliones, de las clases Chilopoda y Diplopoda, de la clase Insecta el orden Blattodea, de los órdenes Coleoptera, Dermaptera, Diptera, Heteroptera, Hymenoptera, Isoptera, Lepidoptera, Phthiraptera,

Psocoptera, Saltatoria o Orthoptera, Siphonaptera y Zygentoma y de la clase Malacostraca el orden Isopoda.

- Se aplican por ejemplo mediante aerosoles, productos de pulverización sin presión, por ejemplo pulverizadores de bomba y pulverizadores, máquinas de niebla, foggers, espumas, geles, productos
- 5 evaporadores con plaquetas con evaporadores de celulosa o plástico, evaporadores de líquidos, evaporadores de gel y membranas, evaporadores de hélice, evaporadores sin energía o pasivos, papel antipolillas, bolsitas antipolillas y geles antipolillas, en forma de gránulos o polvos, en cebo para espolvorear o estaciones de cebo.

Ejemplos de preparación:**Ejemplo I-30**

2-{3-(etilsulfonilo)-6-[1-(piridina-3-il)-1H-pirazol-3-il]piridina-2-il}-3-metil-6-(trifluórmetil)-3H-imidazo[4,5-c]piridina



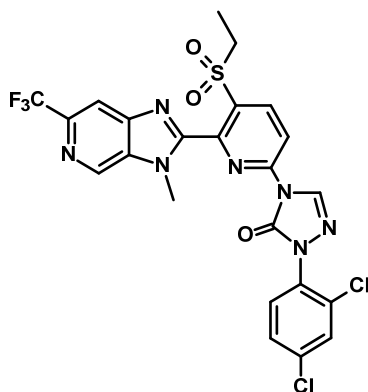
5

100 mg (0,24 mmol) 2-(6-cloro-3-etilsulfonilo-2-piridilo)-3-metil-6-(trifluórmetil)imidazo[4,5-c]piridina, 47 mg (0,24 mmol) [1-(piridina-3-il)-1H-pirazol-3-il]ácido borónico (para la síntesis del éster borónico correspondiente véase Tetrahedron Letters 2011, 52, 1506-1508) y 9 mg (0,01 mmol) tetrakis(trifenilfosfin)paladio(0) se sometieron a una mezcla de dioxano desgasificado (2 mL) y solución desgasificada de carbonato de sodio (1M, 1 mL) bajo una atmósfera de argón y se agitó durante 14 h a 96° C. Se enfrió luego a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se concentró a vacío y el residuo se recogió en agua y diclorometano. Las fases se separaron, la fase acuosa se extrajo tres veces con diclorometano y las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se filtraron. El disolvente se separó por destilación en vacío y el residuo se purificó por cromatografía en columna con un gradiente de agua/acetonitrilo como eluyente.

logP (neutral): 2,73; MH^+ : 514; ^1H -NMR(400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1,23 (t, 3H), 3,82 (q, 2H), 3,97 (s, 3H), 7,31 (d, 1H), 7,62-7,65 (m, 1H), 8,33 (s, 1H), 8,39-8,41 (m, 1H), 8,58-8,65 (m, 3H), 8,81 (d, 1H), 9,26 (d, 1H), 9,33 (s, 1H).

20 Ejemplo I-2

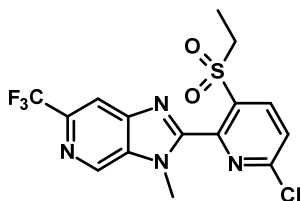
2-(2,4-diclorofenil)-4-[5-etilsulfonilo-6-[3-metil-6-(trifluórmetil)imidazo[4,5-c]piridina-2-il]-2-piridilo]-1,2,4-triazol-3-on



50 mg (0,12 mmol) 2-(6-cloro-3-etilsulfonilo-2-piridilo)-3-metil-6-(trifluórmetil)imidazo[4,5-c]piridina se disolvieron en 5 ml acetonitrilo, se agregaron 85,25 mg (0,37 mmol) 2-(2,4-diclorofenil)-4H-1,2,4-triazol-3-on, 20,49 mg (0,14 mmol) carbonato de potasio y 32,19 mg (0,09 mmol) carbonato de cesio y se agitó durante 16 h a 65-70°C. Luego se filtró la mezcla de reacción, se separó el agua madre en vacío del disolvente y el residuo se purificó por cromatografía en columna por HPLC preparativa con un gradiente de agua/acetonitrilo como eluyente.

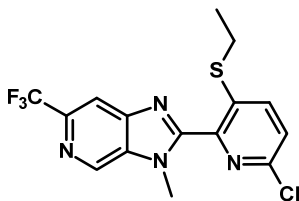
logP (neutral): 3,71; MH^+ : 598; ^1H -NMR (400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1,23 (t, 3H), 3,84 (q, 2H), 4,00 (s, 3H), 7,65-7,73 (m, 2H), 7,94 (d, 1H), 8,34 (s, 1H), 8,70, (d, 1H), 8,78 (d, 1H), 9,09 (s, 1H), 9,35 (s, 1H).

2-(6-cloro-3-etilsulfonilo-2-piridilo)-3-metil-6-(trifluórmetil)imidazo[4,5-c]piridina



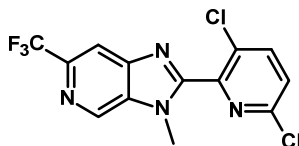
900 mg (2,41 mmol) 2-(6-cloro-3-etilsulfonilo-2-piridilo)-3-metil-6-(trifluórmetil)imidazo[4,5-c]piridina se disolvieron en 50 ml diclorometano, a temperatura ambiente se agregaron 555,6 mg (12,0 mmol) ácido fórmico y 1,64 g (16,8 mmol) peróxido de hidrógeno al 35 % y luego se agitó durante 5 h a temperatura ambiente. La mezcla se diluyó con agua y se mezcló con una solución de bisulfito de sodio, se agitó durante 1 h y a continuación se mezcló con una solución saturada de bicarbonato de sodio. La fase orgánica se separó, la fase acuosa se extrajo dos veces con diclorometano y las fases orgánicas combinadas a continuación se separaron a vacío del disolvente. El residuo se purificó por cromatografía en columna por HPLC preparativa con un gradiente de agua/acetonitrilo como eluyente.

logP (neutral): 2,54; MH^+ : 405; ^1H -NMR(400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 1,20 (t, 3H), 3,77 (q, 2H), 3,91 (s, 3H), 8,13 (d, 1H), 8,32 (s, 1H), 8,56 (d, 1H), 9,30 (s, 1H).

2-(6-cloro-3-etilsulfanil-2-piridilo)-3-metil-6-(trifluórmetil)imidazo[4,5-c]piridina

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

logP (neutral): 3,06; MH⁺: 373

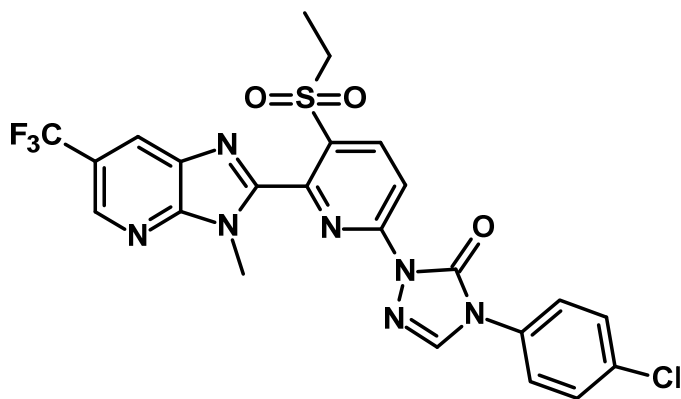
2-(3,6-dicloro-2-piridilo)-3-metil-6-(trifluórmetil)imidazo[4,5-c]piridina

20 g (104,6 mmol) N³-metilo-6-(trifluórmetil)piridina-3,4-diamin, 25,11 g (130,8 mmol) 3,6-
 15 dicloropiridina-2-ácido carboxílico y 20,06 g (104,6 mmol) 1-(3-dimetilaminopropilo)-3-hidrocloruro de
 etilcarbodiimida (EDCI) se agitaron en 200 ml piridina durante 8 h a 120 °C. La mezcla de reacción se
 separó del disolvente a vacío, se mezcló con agua y se extrajo tres veces con acetato de etilo. Las fases
 orgánicas se combinaron, se secaron sobre sulfato de sodio y luego se separó el disolvente por destilación
 a vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna con un gradiente de ciclohexano/acetato de
 20 etilo como eluyente.

logP (neutral): 2,81; MH⁺: 347; ¹H-NMR(400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 3,99 (s, 3H), 7,89 (d, 1H), 8,32
 (s, 1H), 8,35 (d, 1H), 9,28 (s, 1H).

Ejemplo I-33

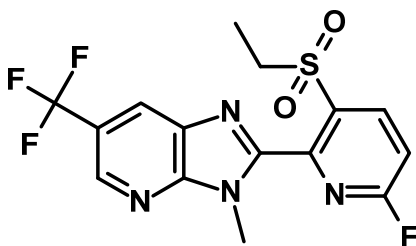
4-(4-clorofenilo)-2-{5-(etilsulfonilo)-6-[3-metil-6-(trifluórmetil)-3H-imidazo[4,5-b]piridina-2-
 25 il]piridina-2-il}-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-on



Bajo atmósfera de argón se disolvió 2-[3-(etilsulfonilo)-6-flúorpiridina-2-il]-3-metil-6-(trifluórmetil)-3H-imidazo[4,5-b]piridina (50 mg, 0.12 mmol, 1 eq.) en 8 ml acetonitrilo. Se agregaron carbonato de cesio (62 mg, 0.19 mmol, 1.5 eq.), yoduro de potasio (11 mg, 0.06 mmol, 0.5 eq.) y 4-(4-clorofenilo)-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-on (50 mg, 0.25 mmol, 2 eq.) y se calentó durante 4 h a 65-70°C. Luego de enfriar a temperatura ambiente se retiraron todos los sólidos por filtración y se añadió gel de sílice a la solución de reacción. El disolvente orgánico se retiró en un evaporador rotatorio y el residuo se purificó por cromatografía (eluyente: ciclohexano, acetato de etilo).

logP (neutral): 3.52; MH^+ : 564; ^1H -NMR (400MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 8.92 (s, 1H), 8.87 (s, 1H), 8.72 – 8.70 (m, 1H), 8.50 – 8.48 (m, 1H), 7.80 – 7.77 (m, 2H), 7.67 – 7.65 (m, 2H), 3.90 – 3.85 (m, 5H), 1.27 – 1.23 (m, 3H).

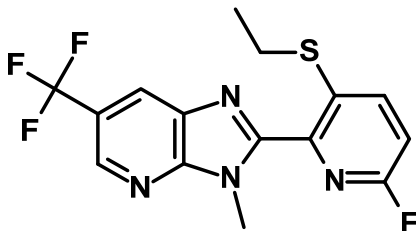
2-[3-(etilsulfonilo)-6-flúorpiridina-2-il]-3-metil-6-(trifluórmetil)-3H-imidazo[4,5-b]piridina



2-[3-(etilsulfonilo)-6-flúorpiridina-2-il]-3-metil-6-(trifluórmetil)-3H-imidazo[4,5-b]piridina (5.0 g, 14 mmol) se disolvió a temperatura ambiente en 144 ml diclorometano. Se agregó ácido fórmico (3.2 g, 70 mmol) y una solución acuosa de peróxido de hidrógeno (35%, 9.5 g, 98 mmol). Luego de agitar durante 12 h a temperatura ambiente se agregaron 20 ml agua y después lentamente 20 ml de una solución de bisulfito de sodio al 40% para finalizar la reacción. La mezcla se agitó durante 1 h, luego se separaron las fases. La fase acuosa se extrajo 3 veces con diclorometano, a continuación se lavaron los extractos orgánicos combinados con una solución saturada de NaHCO₃. La fase orgánica se secó sobre MgSO₄, se filtró y se separó del disolvente a vacío.

logP (neutral): 2.80; MH^+ : 389; ^1H -NMR(400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 8.91 (m, 1H), 8.70 (m, 2H), 7.81 (dd, 1H), 3.82 (m, 5H), 1.22 (t, 3H)

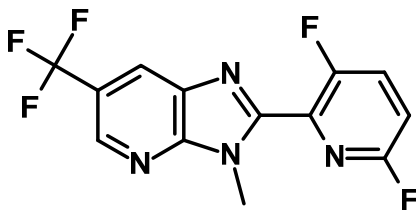
2-[3-(etilsulfanil)-6-flúorpiridina-2-il]-3-metil-6-(trifluórmetil)-3H-imidazo[4,5-b]piridina



- 5 2-(3,6-difluórpíridina-2-il)-3-metil-6-(trifluórmetil)-3H-imidazo[4,5-b]piridina (2.5 g, 8.17 mmol) se disolvió en 19 ml THF seco y se enfrió hasta $-10^{\circ}C$. Se agregó NaH (60%, 340 mg, 8.5 mmol) y la mezcla se calentó a temperatura ambiente mientras se agitaba. Muy lentamente se agregó gota a gota etilmercaptano (559 mg, 9.0 mmol) disuelto en 10 ml THF seco y se agitó durante 3 h a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se diluyó con acetato de etilo y se lavó dos veces con una solución saturada de NaCl. Después de secar la fase orgánica, esta se concentró a vacío el residuo se purificó por
- 10 cromatografía (eluyente: ciclohexano, acetato de etilo).

logP (neutral): 3.45; MH^+ : 357; ^1H -NMR(400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 8.87 (s, 1H), 8.68 (m, 1H), 8.29 (m, 1H), 7.49 (dd, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.01 (q, 2H), 1.19 (t, 3H).

2-(3,6-difluórpíridina-2-il)-3-metil-6-(trifluórmetil)-3H-imidazo[4,5-b]piridina



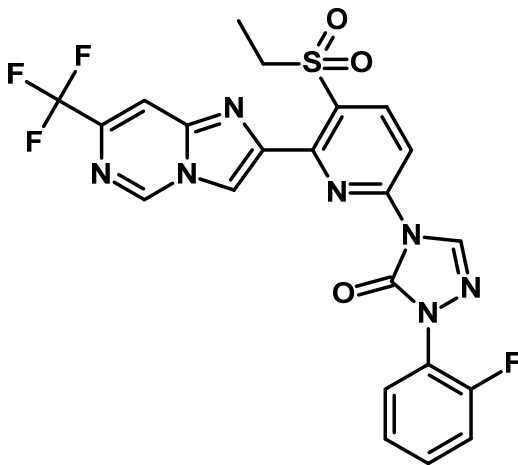
15

- Bajo atmósfera de argón se disolvió N2-metilo-5-(trifluórmetil)piridina-2,3-diamin (5.0 g, 18.3 mmol) en 100 ml piridina seca y se agregaron 3,6-difluórpíridina-2-ácido carboxílico (2.9 g, 18.3 mmol) así como N-(3-dimetilaminopropilo)-N'-hidrocloruro de etilcarbodiimida (3.5 g, 18.3 mmol). La mezcla se agitó durante 9 h a $120^{\circ}C$. Luego de enfriar a temperatura ambiente la mezcla se concentró a vacío y luego se
- 20 diluyó con acetato de etilo. La fase orgánica se lavó con agua, se secó sobre $MgSO_4$ y se concentró a vacío. El producto se puede purificar parcialmente por recristalización a partir de éter metilo-terc-butilo.

(logP (neutral): 2.72; MH^+ : 315; ^1H -NMR(400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 8.88 (m, 1H), 8.70 (m, 1H), 8.29 (m, 1H), 7.60 (m, 1H), 4.07 (s, 3H).

Ejemplo I-35

4-{5-(etilsulfonilo)-6-[7-(trifluórmetil)imidazo[1,2-c]pirimidina-2-il]piridina-2-il}-2-(2-flúorfenilo)-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-on

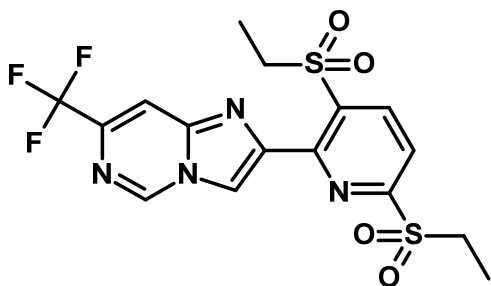


- 5 2-[3,6-bis(etilsulfonilo)piridina-2-il]-7-(trifluórmetil)imidazo[1,2-c]pirimidina (46 mg, 0.1 mmol, 1 eq.) se disolvió bajo atmósfera de argón en 3 ml acetonitrilo y se agregó carbonato de cesio (50 mg, 0.15 mmol, 1.5 eq.), yoduro de potasio (8 mg, 0.05 mmol, 0.5 eq.) y 2-(2-fluorofenil)-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-on (37 mg, 0.2 mmol, 2 eq.). La mezcla se agitó durante 12 h a temperatura ambiente y luego se calentó durante 1 h hasta reflujo. Luego de enfriar a temperatura ambiente se retiraron todos los sólidos por
10 filtración y la solución se concentró en evaporador rotatorio. El residuo se purificó por cromatografía (eluyente: ciclohexano, acetato de etilo).

logP (neutral): 3.16; MH^+ : 534 ; ^1H -NMR (400MHz, D6-DMSO) δ ppm: 9.65 (s, 1H), 9.17 (s, 1H), 9.02 (s, 1H), 8.72-8.67 (m, 1H), 8.48 – 8.46 (m, 1H), 8.41 (s, 1H), 7.70 – 7.65 (m, 1H), 7.60 – 7.54 (m, 1H), 7.52 – 7.45 (m, 1H), 7.42 – 7.39 (m, 1H), 4.22 – 4.17 (m, 2H), 1.30 – 1.27 (m, 3H).

15

2-[3,6-bis(etilsulfonilo)piridina-2-il]-7-(trifluórmetil)imidazo[1,2-c]pirimidina



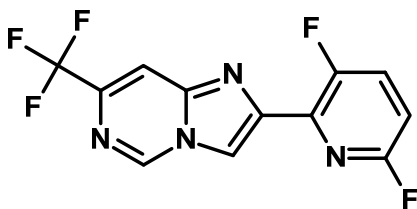
2-[3,6-bis(etilsulfanil)piridina-2-il]-7-(trifluórmetil)imidazo[1,2-c]pirimidina (100 mg, 0.33 mmol, 1 eq.)

se disolvió bajo atmósfera de argón en 2 ml DMF seca. Se agregó etanotiolato de sodio (168 mg, 1.99 mmol, 6 eq.) y se agitó durante 12 h a temperatura ambiente. La mezcla se diluyó con acetato de etilo y se lavó con una solución saturada de cloruro de sodio. La fase orgánica se secó sobre sulfato de sodio y el disolvente se eliminó en un evaporador rotatorio. El producto bruto se usó sin purificación adicional en la siguiente reacción.

2-[3,6-bis(etilsulfanil)piridina-2-il]-7-(trifluórmetil)imidazo[1,2-c]pirimidina (75 mg, 0.19 mmol, 1 eq.) se disolvió en 9 ml diclorometano. A temperatura ambiente se agregaron ácido fórmico (90 mg, 1.95 mmol, 10 eq.) y una solución de peróxido de hidrógeno (35%, 265 mg, 12.7 mmol, 14 eq.) y la mezcla se agitó durante 12 h. Luego de agregar 1 ml agua se agregaron lentamente gota a gota 3 ml de una solución de bisulfito de sodio al 40% y se agitó durante 1 h. A continuación se separó la fase orgánica, se lavó con una solución saturada de bicarbonato de sodio, se secó sobre sulfato de sodio y se concentró. El residuo se purificó por cromatografía (eluyente: ciclohexano, acetato de etilo).

logP (neutral): 2.28; MH^+ : 449; ^1H -NMR (400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 9.67 (s, 1H), 8.86 (s, 1H), 8.82 – 8.80 (m, 1H), 8.41 (s, 1H), 8.36 – 8.34 (m, 1H), 4.23 – 4.18 (m, 2H), 3.64 – 3.59 (m, 2H), 1.30 – 1.23 (m, 6H).

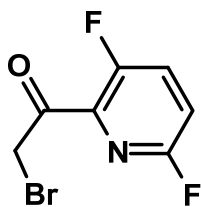
2-(3,6-difluórpíridina-2-il)-7-(trifluórmetil)imidazo[1,2-c]pirimidina



En un segundo recipiente de reacción se disolvieron o suspendieron 6-(trifluorometilo)pirimidina-4-amin (201 mg, 1.23 mmol, 1 eq.) y bicarbonato de sodio (155 mg, 1.85 mmol, 1.5 eq.) en 3 ml cloroformo. Se agregó gota a gota 2-bromo-1-(3,6-difluórpíridina-2-il)etanona (502 mg, 1.23 mmol, 1 eq.) disuelto en 1 ml cloroformo, luego la mezcla de reacción se calentó durante 4 h a 60°C. Se retiró el bicarbonato de sodio por filtración y se concentró la fase orgánica. El residuo se purificó por cromatografía (gel de sílice, eluyente ciclohexano/acetato de etilo).

logP (neutral): 2.02; ; MH^+ : 301; ^1H -NMR(400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 9.64 (s, 1H), 8.77 (d, 1H), 8.35 (s, 1H), 8.17 – 8.10 (m, 1H), 7.36 – 7.32 (m, 1H).

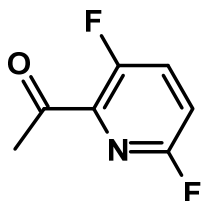
2-bromo-1-(3,6-difluórpíridina-2-il)etanona



1-(3,6-difluoropyridin-2-yl)etanona (6.4 g, 40.7 mmol) se disolvió en 96 ml etanol y se agregó bromuro de cobre (II) (13.7 g, 61.1 mmol). La mezcla de reacción se calentó durante 4 h a 60 °C. Luego de enfriar a temperatura ambiente el disolvente se eliminó en un evaporador rotatorio y el residuo se recogió con una solución saturada de cloruro de amonio y con acetato de etilo. La fase acuosa se extrajo dos veces con acetato de etilo. Los extractos orgánicos combinados se lavaron con una solución saturada de cloruro de sodio, se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron. El producto se aisló como una mezcla y se utilizó sin purificación adicional en la siguiente reacción.

logP (neutral): 1.95; MH^+ : 2.38; ^1H -NMR(400 MHz, $CDCl_3$) δ ppm: 8.17 – 8.10 (m, 1H), 7.62 – 7.57 (m, 1H), 2.56 (s, 2H)

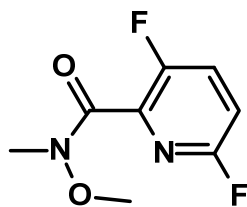
1-(3,6-difluoropyridin-2-yl)etanona



Bajo una atmósfera de argón se disolvió 3,6-difluor-N-metoxi-N-metilpiridina-2-carboxamida (10.1 g, 50.2 mmol) en 270 ml THF seca y se enfrió a 0°C. Lentamente se agregó gota a gota bromuro de metilmagnesio (3M en éter dietílico, 50 ml, 150 mmol) y luego se agitó durante 2 h a 0°C. Para terminar la reacción, se añadieron lentamente bajo enfriamiento 50 ml de una solución de cloruro de amonio. La fase orgánica se separó, se lavó con una solución saturada de cloruro de sodio y se concentró. El producto se usó sin purificación adicional en la siguiente reacción.

logP (neutral): 1.24; MH^+ : 158; ^1H -NMR(400 MHz, $CDCl_3$) δ ppm: 8.16 – 8.10 (m, 1H), 7.61 – 7.57 (m, 1H), 2.56 – 2.55 (m, 3H).

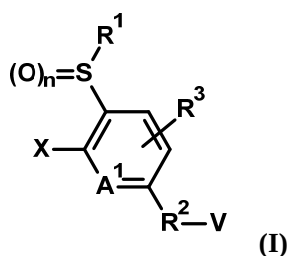
3,6-difluor-N-metoxi-N-metilpiridina-2-carboxamida



3,6-difluoropiridina-2-ácido carboxílico (15 g, 94 mmol) y N,O-hidrocloruro de dimetilhidroxilamina (9.1 g, 94.2 mmol) se disolvieron en 600 ml diclorometano y se enfriaron a 0°C. Se agregaron 4-dimetilaminopiridina (DMAP, 13.8 g, 113 mmol) y N-(dimetilaminopropilo)-N'-hidrocloruro de etilcarbodiimida (EDCI, 19.9 g, 103 mmol). La mezcla de reacción se agitó durante 2 h a 0°C, y luego durante 12 h a temperatura ambiente. La solución se lavó una vez con una solución saturada de bicarbonato de sodio y una vez con una solución de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de sodio y se concentró. El producto bruto se usó sin purificación adicional en la siguiente reacción.

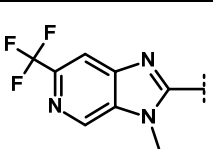
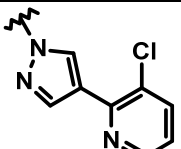
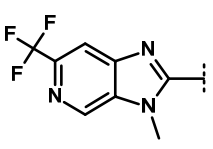
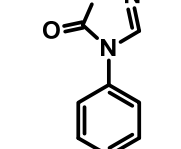
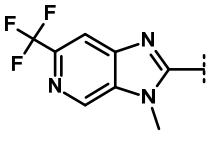
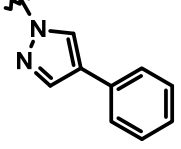
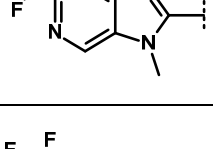
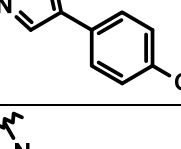
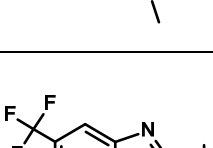
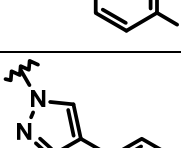
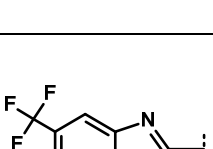
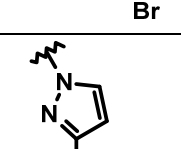
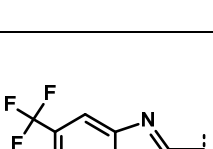
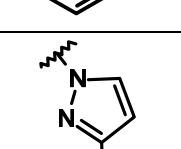
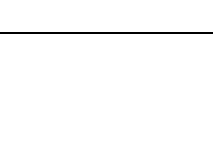
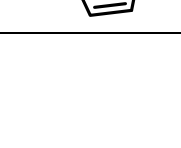
logP (neutral): 1.05; MH⁺: 203; ¹H-NMR(400 MHz,CDCl₃) δ ppm: 8.15 – 8.09 (m, 1H), 7.44 – 7.42 (m, 1H), 3.57 (s, 3H), 3.31 (s, 3H).

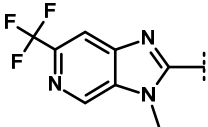
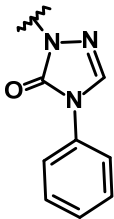
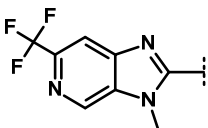
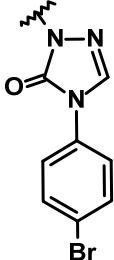
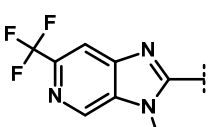
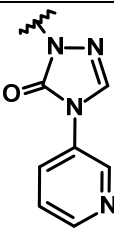
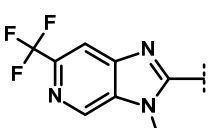
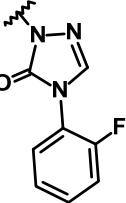
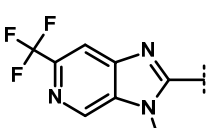
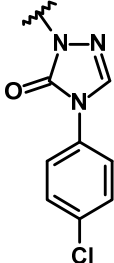
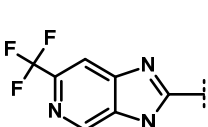
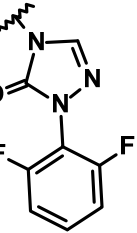
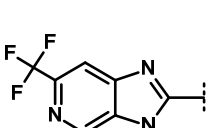
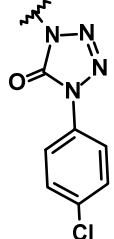
En analogía a los ejemplos y de acuerdo a los métodos de preparación descritos anteriormente, se pueden obtener los siguientes compuestos de la fórmula (I):

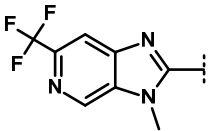
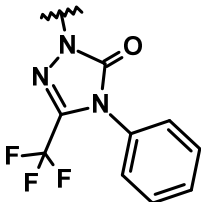
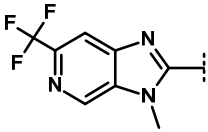
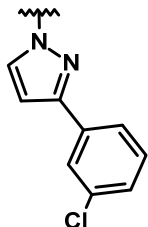
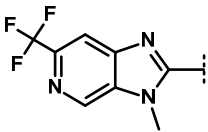
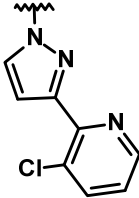
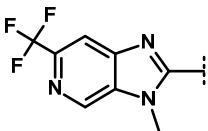
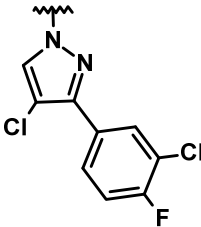
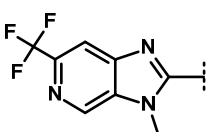
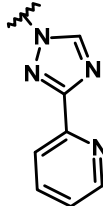
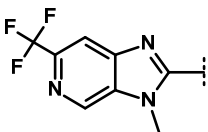
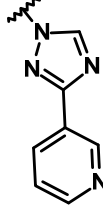
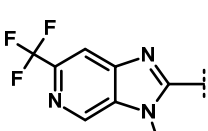
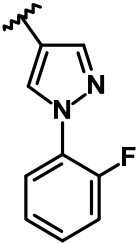


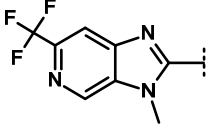
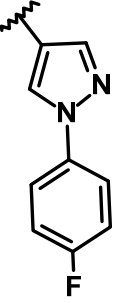
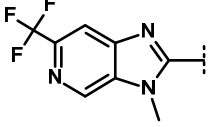
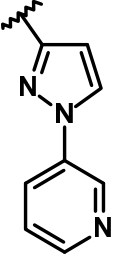
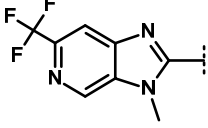
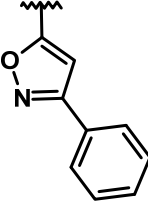
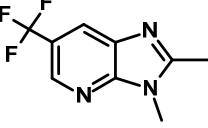
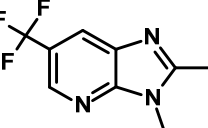
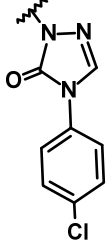
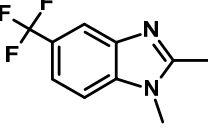
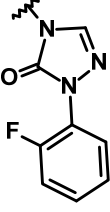
en donde los sustituyentes R¹, R², R³, A¹, X, V y n tienen los significados indicados en la siguiente tabla y donde el enlace de R²-V a la molécula radical está marcada con una línea ondulada y el enlace de X a la molécula radical está marcada con una línea punteada:

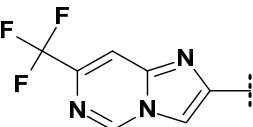
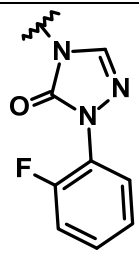
Ej.	R ¹	n	A ¹	R ³	X	R ² -V
I-1	-CH ₂ CH ₃	2	N	-H		
I-2	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-3	-CH ₂ CH ₃	2	N	-H		
I-4	-CH ₂ CH ₃	2	N	-H		
I-5	-CH ₂ CH ₃	2	N	-H		
I-6	-CH ₂ CH ₃	2	N	-H		

I-7	-CH ₂ CH ₃	2	N	-H		
I-8	-CH ₂ CH ₃	2	N	-H		
I-9	-CH ₂ CH ₃	2	N	-H		
I-10	-CH ₂ CH ₃	2	N	-H		
I-11	-CH ₂ CH ₃	2	N	-H		
I-12	-CH ₂ CH ₃	2	N	-H		
I-13	-CH ₂ CH ₃	2	N	-H		
I-14	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		

I-15	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-16	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-17	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-18	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-19	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-20	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-21	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		

I-22	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-23	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-24	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-25	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-26	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-27	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-28	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		

I-29	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-30	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-31	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-32	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-33	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
I-34	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		

I-35	-CH ₂ CH ₃	2	N	H		
------	----------------------------------	---	---	---	---	---

Ejemplo I-1: logP (neutral): 3.03

¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,352(4,6);9,070(6,9);8,791(2,3);8,768(4,5);8,724(4,5);8,702(2,4);8,339(4,9);7,677(0,9);7,662(1,6);7,658(1,8);7,642(0,9);7,638(1,0);7,598(0,3);7,581(0,9);7,564(1,1);7,550(0,7);7,546(0,6);7,519(1,3);7,496(1,5);7,474(0,7);7,426(1,2);7,405(1,9);7,388(0,8);4,005(16,0);3,873(1,0);3,855(3,5);3,836(3,5);3,818(1,1);3,315(67,6);2,670(1,0);2,505(123,3);2,501(159,0);2,497(120,2);2,328(1,0);2,324(0,7);2,073(0,6);1,253(3,8);1,235(8,4);1,216(3,7);0,000(11,1)

Ejemplo I-3: logP (neutral): 3.87

¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,326(4,7);9,288(0,5);8,854(3,0);8,832(4,1);8,686(3,8);8,663(3,0);8,324(5,0);8,314(1,1);8,304(0,4);8,291(0,6);8,243(0,4);7,767(2,1);7,744(7,6);7,727(7,5);7,705(2,2);7,664(0,4);7,639(3,7);7,630(4,0);7,616(0,4);7,587(0,4);7,565(0,5);7,548(0,5);7,510(0,6);7,491(0,4);7,446(3,7);7,437(3,6);7,417(0,5);7,368(0,4);7,361(0,3);7,126(0,3);3,980(0,8);3,968(16,0);3,954(0,8);3,902(1,3);3,875(0,5);3,868(0,5);3,823(1,6);3,802(3,6);3,784(3,8);3,766(1,4);3,702(0,3);3,685(0,4);3,385(0,4);3,361(0,7);3,319(476,1);2,671(2,9);2,666(2,1);2,506(375,7);2,501(483,5);2,497(351,0);2,332(2,2);2,328(2,9);1,268(0,4);1,242(4,1);1,223(8,7);1,205(4,3);1,184(1,5);1,166(1,0);1,150(0,6);1,132(0,6);1,115(0,4);1,105(0,4);0,000(25,3);-0,008(1,0)

Ejemplo I-4: logP (neutral): 3.34

¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,323(4,0);8,866(3,3);8,844(3,9);8,580(3,9);8,558(3,6);8,348(4,3);7,843(3,0);7,839(1,8);7,824(3,9);7,820(2,4);7,737(0,8);7,732(0,9);7,718(1,7);7,713(1,6);7,698(1,2);7,693(1,1);7,678(1,4);7,674(1,4);7,659(1,7);7,655(1,6);7,639(0,6);7,636(0,6);3,998(16,0);3,888(0,9);3,870(3,3);3,851(3,3);3,833(1,0);3,319(75,1);2,676(0,4);2,671(0,6);2,667(0,4);2,524(1,3);2,511(33,7);2,507(71,0);2,502(95,3);2,498(69,4);2,493(34,6);2,333(0,4);2,329(0,6);2,324(0,4);1,263(3,6);1,244(8,1);1,226(3,5);0,008(0,5);0,000(15,8);-0,008(0,7)

Ejemplo I-5: logP (neutral): 3.86

¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,305(4,0);8,681(3,3);8,658(4,4);8,470(3,9);8,447(3,4);8,313(0,5);8,299(4,2);7,735(0,4);7,727(4,0);7,722(1,4);7,710(1,4);7,705(5,0);7,697(0,5);7,502(0,5);7,494(5,2);7,489(1,5);7,477(1,3);7,471(4,4);7,463(0,4);4,162(0,9);4,144(1,9);4,137(1,3);4,122(1,8);4,026(1,7);4,005(1,8);3,985(0,9);3,942(16,0);3,764(1,0);3,745(3,2);3,727(3,3);3,708(0,9);3,317(129,2);2,675(0,7);2,670(1,0);2,666(0,8);2,661(0,4);2,524(2,4);2,519(3,7);2,510(60,0);2,506(128,2);2,501(174,0);2,497(125,1);2,492(59,4);2,337(0,3);2,333(0,7);2,328(1,0);2,323(0,7);2,319(0,3);2,073(3,5);1,234(0,8);1,223(3,6);1,205(8,1);1,186(3,5);0,146(0,4);0,008(2,7);0,000(88,7);-0,008(3,0);-0,150(0,4)

Ejemplo I-6: logP (neutral): 4.62

¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,344(4,0);8,809(3,9);8,802(4,0);8,705(3,2);8,683(4,0);8,470(3,9);8,448(3,4);8,336(4,2);8,334(4,3);8,313(0,4);8,074(0,6);8,068(4,4);8,063(1,6);8,051(1,6);8,046(5,1);8,040(0,7);7,604(0,7);7,598(5,0);7,593(1,7);7,581(1,5);7,576(4,8);7,259(3,7);7,252(3,7);4,092(0,4);4,003(16,0);3,852(0,9);3,833(3,3);3,815(3,3);3,796(1,0);3,320(150,6);2,675(0,6);2,671(0,9);2,666(0,7);2,524(2,4);2,511(55,3);2,506(116,2);2,502(156,5);2,497(113,1);2,493(54,5);2,333(0,7);2,329(0,9);2,324(0,7);2,074(0,9);1,258(3,5);1,240(8,1);1,221(3,4);0,008(0,9);0,000(25,1);-0,008(1,0)

Ejemplo I-7: logP (neutral): 3.66

¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,389(0,4);9,326(3,9);9,247(5,1);9,246(5,4);9,205(0,4);8,727(3,4);8,705(4,1);8,640(5,3);8,638(5,5);8,611(2,1);8,607(2,3);8,599(2,3);8,596(2,3);8,565(0,4);8,465(3,9);8,457(0,4);8,453(0,4);8,443(3,6);8,346(0,4);8,338(4,1);8,337(4,2);8,048(2,1);8,045(2,2);8,028(2,3);8,024(2,2);7,404(2,2);7,393(2,1);7,384(1,9);7,373(2,0);4,450(1,2);4,093(1,2);4,005(16,0);3,854(0,9);3,835(3,1);3,817(3,2);3,798(0,9);3,321(74,6);2,676(0,5);2,672(0,6);2,667(0,5);2,525(1,5);2,512(38,4);2,507(80,9);2,503(108,5);2,498(78,1);2,494(37,4);2,334(0,4);2,329(0,6);2,325(0,5);1,323(0,6);1,260(3,5);1,242(8,1);1,223(3,5);0,008(0,5);0,000(16,4);-0,009(0,6)

Ejemplo I-8: logP (neutral): 2.75

¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,311(4,0);8,815(9,1);8,710(3,2);8,688(4,2);8,522(4,2);8,500(3,6);8,327(4,2);8,326(4,2);8,313(0,6);8,147(1,2);7,789(2,2);7,783(0,9);7,776(2,4);7,771(1,4);7,766(2,7);7,759(0,9);7,754(2,6);7,462(2,7);7,456(0,8);7,440(4,3);7,423(0,7);7,418(2,4);4,316(0,4);3,977(16,0);3,849(0,9);3,831(3,3);3,812(3,3);3,794(1,0);3,780(0,5);3,317(81,6);2,679(0,5);2,675(1,0);2,670(1,5);2,666(1,1);2,524(3,3);2,519(5,1);2,510(85,2);2,506(183,7);2,501(249,8);2,497(180,2);2,492(85,3);2,332(1,0);2,328(1,5);2,323(1,1);2,073(0,8);1,988(0,4);1,447(0,4);1,430(0,4);1,250(3,6);1,231(8,1);1,213(3,5);1,175(0,4);0,146(1,4);0,008(10,3);0,000(329,0);-0,009(11,3);-0,150(1,4)

Ejemplo I-9: logP (neutral): 3.92

¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,364(4,1);9,170(5,0);8,683(3,4);8,661(4,1);8,535(5,1);8,409(3,9);8,387(3,6);8,344(4,3);8,312(0,7);7,823(3,2);7,805(3,4);7,420(1,9);7,401(3,8);7,382(2,4);7,302(1,3);7,284(1,9);7,266(0,8);4,454(0,4);4,029(16,0);3,853(0,9);3,834(3,2);3,815(3,3);3,797(1,0);3,324(225,0);2,675(1,2);2,671(1,7);2,666(1,3);2,524(4,2);2,511(103,9);2,506(219,7);2,502(297,2);2,497(215,9);2,493(105,4);2,333(1,2);2,329(1,7);2,324(1,3);1,261(3,6);1,242(8,4);1,224(3,6);0,146(1,3);0,008(10,2);0,000(295,2);-0,008(11,8);-0,150(1,3)

Ejemplo I-10: logP (neutral): 4.33

¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,407(0,7);9,368(4,3);9,341(0,4);9,228(5,1);9,218(1,0);9,140(0,5);8,697(0,6);8,686(3,2);8,675(0,8);8,664

(3,9);8,554(5,2);8,508(0,9);8,458(0,5);8,419(0,9);8,407(3,8);8,397(0,6);8,385(3,4);8,365(0,8);8,344(4,6);8,314(3,6);8,218(0,3);7,911(0,7);7,889(0,8);7,874(4,4);7,857(1,9);7,853(5,0);7,837(0,6);7,642(0,4);7,621(0,4);7,513(0,8);7,492(0,7);7,469(5,1);7,464(2,0);7,448(4,7);7,441(1,0);7,403(0,4);7,383(0,3);4,447(2,6);4,113(1,6);4,056(0,4);4,038(1,4);4,027(16,0);4,002(0,6);3,854(1,0);3,835(3,2);3,817(3,3);3,798(1,0);3,317(19,0);3,293(1,8);2,675(1,6);2,670(2,2);2,666(1,6);2,524(5,5);2,510(134,9);2,506(276,1);2,501(366,7);2,497(267,2);2,333(1,5);2,328(2,1);2,324(1,6);2,073(1,5);1,988(4,5);1,337(0,7);1,319(1,3);1,301(0,6);1,259(3,7);1,241(8,3);1,222(3,6);1,193(1,2);1,175(2,4);1,157(1,2);0,146(1,9);0,008(16,5);0,000(418,8);-0,009(19,1);-0,150(1,9)

Ejemplo I-11: logP (neutral): 4.17

¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,394(0,4);9,343(3,8);8,872(0,3);8,865(0,4);8,795(3,9);8,788(4,1);8,713(0,4);8,700(3,3);8,691(0,5);8,678(4,1);8,472(0,4);8,463(4,0);8,450(0,4);8,441(3,5);8,359(0,4);8,336(3,9);8,334(4,1);8,313(0,7);8,097(2,1);8,092(0,9);8,083(2,4);8,075(2,4);8,067(1,1);8,061(2,0);7,379(2,2);7,357(4,4);7,340(0,7);7,335(2,3);7,238(0,4);7,228(3,6);7,221(3,7);4,430(1,4);4,092(0,6);4,003(16,0);3,848(0,9);3,829(3,2);3,811(3,2);3,792(0,9);3,319(149,9);2,680(0,6);2,675(1,2);2,671(1,7);2,666(1,2);2,662(0,6);2,524(4,3);2,519(6,6);2,511(95,8);2,506(205,5);2,501(279,9);2,497(200,6);2,492(94,3);2,333(1,1);2,328(1,6);2,324(1,1);2,319(0,5);2,073(1,0);1,340(0,4);1,321(0,8);1,303(0,4);1,257(3,5);1,239(8,0);1,220(3,4);0,146(0,7);0,008(6,0);0,000(183,7);-0,009(6,3);-0,150(0,7)

Ejemplo I-12: logP (neutral): 4.48

¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,372(3,8);9,294(4,6);8,690(3,6);8,668(4,3);8,599(4,7);8,412(4,1);8,390(3,8);8,346(4,0);8,314(0,5);8,103(1,7);8,098(3,0);8,094(1,8);7,855(1,4);7,835(1,5);7,480(0,9);7,478(1,1);7,476(1,0);7,473(1,0);7,458(1,5);7,455(1,6);7,453(1,4);7,376(1,9);7,356(2,9);7,336(1,3);4,451(0,3);4,031(16,0);3,857(0,9);3,839(3,0);3,820(3,1);3,802(0,9);3,316(100,2);2,675(1,0);2,670(1,4);2,666(1,0);2,661(0,5);2,524(3,8);2,519(6,0);2,510(86,0);2,506(182,3);2,501(245,4);2,497(174,9);2,492(82,5);2,337(0,5);2,333(1,1);2,328(1,4);2,323(1,1);2,073(0,4);1,260(3,5);1,242(8,3);1,223(3,5);0,146(1,2);0,008(10,9);0,000(304,0);-0,009(10,9);-0,150(1,2)

Ejemplo I-13: logP (neutral): 4.58

¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,345(4,2);9,323(0,3);8,831(3,8);8,824(4,0);8,708(3,2);8,686(3,9);8,454(4,0);8,432(3,6);8,364(0,3);8,338(4,4);8,312(1,4);7,929(1,5);7,918(1,7);7,911(1,1);7,905(1,7);7,643(1,4);7,637(1,0);7,631(1,6);7,627(1,2);7,620(1,9);7,611(0,5);7,529(0,6);7,514(2,9);7,503(3,1);7,497(1,9);7,491(2,3);7,479(0,6);7,125(3,8);7,118(4,0);4,438(0,6);4,099(1,0);4,009(16,0);3,853(1,0);3,834(3,4);3,816(3,5);3,797(1,2);3,473(0,4);3,436(0,7);3,410(1,1);3,369(4,2);3,330(517,0);3,239(0,6);3,204(0,4);3,167(0,4);3,146(0,3);2,675(2,2);2,671(3,0);2,666(2,2);2,579(0,5);2,555(0,8);2,524(8,3);2,510(185,4);2,506(374,0);2,501(494,0);2,497(366,3);2,493(184,0);2,438(0,4);2,432(0,4);2,333(2,2);2,328(3,2);2,324(2,3);1,320(0,4);1,258(3,6);1,239(8,3);1,220(3,6);0,146(0,4);0,008(3,6);0,000(109,6);-0,008(4,4);-0,150(0,4)

Ejemplo I-14: logP (neutral): 3.47

¹H-NMR(601,6 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,340(4,7);8,781(3,5);8,776(3,5);8,686(3,0);8,672(3,3);8,387(3,4);8,372(3,1);8,329(4,9);8,311(0,4);7,854(3,7);7,067(2,9);7,062(3,0);7,007(3,4);7,003(3,4);6,684(2,2);6,681(2,7);6,678(2,6);6,676(2,2);3,999(16,0);3,835(1,3);3,823(3,6);3,810(3,8);3,798(1,3);3,310(91,2);2,613(1,3);2,501(218,0);2,498(182,8);2,385(1,4);2,072(2,2);1,248(3,8);1,236(8,3);1,224(4,3);0,000(4,6)

Ejemplo I-15: logP (neutral): 2.70

¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,313(4,0);8,851(7,9);8,710(3,2);8,688(4,1);8,534(4,0);8,512(3,4);8,330(4,2);7,746(2,2);7,743(3,0);7,724(3,5);7,601(2,0);7,582(3,5);7,562(2,3);7,478(1,4);7,459(2,0);7,441(0,7);3,979(16,0);3,849(0,9);3,830(3,3);3,812(3,3);3,793(1,0);3,385(0,5);3,370(0,7);3,320(1057,6);2,675(2,2);2,670(3,0);2,665(2,3);2,523(7,4);2,510(181,1);2,505(376,4);2,501(504,7);2,496(370,6);2,492(182,8);2,332(2,2);2,328(3,0);2,323(2,2);1,250(3,6);1,232(8,2);1,213(3,5);0,008(0,9);0,000(28,9);-0,008(1,2)

Ejemplo I-16: logP (neutral): 3.17

¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,310(4,6);8,864(6,6);8,710(3,9);8,688(5,0);8,515(5,1);8,493(4,5);8,323(3,8);8,308(1,5);7,803(3,5);7,798(1,4);7,787(1,8);7,781(6,9);7,775(1,1);7,740(0,9);7,733(6,6);7,728(1,9);7,716(1,3);7,711(3,7);3,977(16,0);3,848(1,1);3,830(3,5);3,811(3,6);3,793(1,2);3,345(291,1);3,340(207,5);3,329(264,8);3,328(285,2);2,676(1,0);2,672(1,4);2,667(1,0);2,663(0,5);2,542(0,6);2,525(3,8);2,520(6,1);2,512(79,3);2,507(163,8);2,503(217,6);2,498(158,0);2,494(76,6);2,339(0,4);2,334(1,0);2,329(1,4);2,325(1,0);1,251(3,9);1,232(8,9);1,214(3,9);0,000(6,7)

Ejemplo I-17: logP (neutral): 2.06

¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,314(3,7);8,965(2,4);8,958(2,4);8,920(7,7);8,721(3,3);8,699(4,2);8,660(1,8);8,656(1,9);8,648(1,9);8,644(1,9);8,523(4,0);8,501(3,5);8,331(3,9);8,199(1,0);8,196(1,2);8,193(1,1);8,189(1,0);8,179(1,1);8,175(1,2);8,172(1,3);8,168(1,1);7,654(1,3);7,653(1,3);7,642(1,2);7,641(1,3);7,634(1,2);7,632(1,2);7,622(1,2);7,620(1,2);3,979(16,0);3,852(0,9);3,833(3,1);3,815(3,2);3,796(0,9);3,321(215,0);2,675(0,5);2,670(0,7);2,666(0,5);2,524(1,6);2,519(2,4);2,510(40,5);2,506(86,2);2,501(116,3);2,497(84,3);2,492(40,6);2,333(0,5);2,328(0,7);2,323(0,5);1,251(3,7);1,233(8,5);1,214(3,4);0,000(4,4)

Ejemplo I-18: logP (neutral): 2.73

¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,309(4,6);8,713(5,2);8,710(4,5);8,688(3,8);8,499(3,8);8,477(3,2);8,329(4,8);7,753(0,9);7,733(1,9);7,717(1,0);7,713(1,0);7,627(0,4);7,610(0,9);7,592(1,3);7,579(0,8);7,575(0,7);7,559(1,4);7,536(1,6);7,515(0,7);7,447(1,2);7,429(1,9);7,412(0,9);3,977(16,0);3,850(1,1);3,832(3,5);3,813(3,6);3,795(1,2);3,387(0,3);3,324(445,6);2,671(1,2);2,506(151,2);2,502(197,0);2,497(156,1);2,328(1,2);2,073(1,4);1,249(3,9);1,230(8,4);1,212(3,7);0,000(4,5);-0,090(1,4)

Ejemplo I-19: logP (neutral): 2.82

¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,311(1,8);8,866(2,8);8,712(1,1);8,690(1,4);8,516(1,4);8,494(1,2);8,324(1,9);7,798(1,6);7,776(2,2);7,671(2,2);7,649(1,6);3,978(5,9);3,850(0,5);3,832(1,4);3,813(1,4);3,795(0,6);3,743(0,4);3,725(0,6);3,651(16,0);2,671(0,3);2,506(41,8);2,502(54,1);2,498(43,2);1,251(1,4);1,232(3,0);1,214(1,4);0,000(19,7)

Ejemplo I-20: logP (neutral): 3.13

¹H-NMR(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,350(4,2);9,137(7,5);8,788(2,7);8,766(4,4);8,698(4,4);8,676(2,9);8,339(4,5);8,312(0,4);7,736(0,7);7,730(0,6);7,714(1,3);7,698(0,7);7,693(0,8);7,677(0,4);7,454(2,2);7,433(3,7);7,413(1,8);4,038(0,4);4,020(0,7);4,009(16,0);3,875(1,0);3,856(3,4);3,8

37(3,4);3,819(1,0);3,322(135,3);3,319(117,3);2,675(0,6);2,671(0,8);2,666(0,6);2,524(2,0);2,510(49,1);2,506(98,0);2,502(128,9);2,497(96,7);2,329(0,8);2,324(0,6);2,073(0,7);1,988(1,6);1,252(3,7);1,234(8,2);1,215(3,6);1,193(0,4);1,175(0,8);1,157(0,4);0,008(1,0);0,000(29,7)
Ejemplo I-21: logP (neutral): 3.71 1H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 9,326(4,8);8,875(3,2);8,853(3,7);8,572(3,8);8,550(3,5);8,349(5,0);7,946(4,5);7,924(5,6);7,735(5,5);7,713(4,6);3,991(16,0);3,894(1,1);3,876(3,5);3,857(3,6);3,839(1,1);3,332(358,8);2,671(0,6);2,506(81,6);2,502(105,3);2,498(80,8);2,329(0,6);1,265(3,7);1,247(8,1);1,228(3,7);0,000(2,2)
Ejemplo I-22: logP (neutral): 3.44 1H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 9,310(1,5);8,782(1,2);8,760(1,5);8,559(1,4);8,537(1,2);8,332(1,4);7,627(6,2);3,965(5,6);3,842(0,4);3,823(1,2);3,805(1,2);3,786(0,4);3,349(49,6);3,339(37,4);3,332(31,4);2,525(0,5);2,512(12,3);2,508(24,2);2,503(31,3);2,499(23,0);2,494(11,6);2,072(16,0);1,246(1,3);1,227(3,0);1,209(1,3);0,000(2,4)
Ejemplo I-23: logP (neutral): 4.64 1H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 9,346(3,7);8,820(3,9);8,813(4,1);8,699(3,3);8,677(4,3);8,512(4,2);8,490(3,6);8,345(0,3);8,338(3,9);8,336(3,8);8,313(0,4);8,104(1,7);8,099(2,9);8,095(1,7);8,017(1,0);8,014(1,6);8,010(1,0);7,999(1,1);7,995(1,8);7,992(1,1);7,576(0,9);7,556(2,4);7,537(2,1);7,525(1,5);7,522(2,0);7,517(1,6);7,505(0,7);7,500(0,8);7,497(0,6);7,315(3,5);7,308(3,6);4,432(0,4);4,095(1,0);4,007(16,0);3,857(0,9);3,839(3,1);3,820(3,2);3,802(0,9);3,321(107,8);2,680(0,3);2,675(0,7);2,671(1,0);2,666(0,7);2,524(2,6);2,519(4,2);2,511(60,2);2,506(127,2);2,502(170,9);2,497(121,7);2,493(57,0);2,337(0,3);2,333(0,7);2,328(1,0);2,324(0,7);1,260(3,4);1,241(8,0);1,223(3,3);0,146(0,4);0,008(3,7);0,000(14,6);-0,009(4,2);-0,150(0,4)
Ejemplo I-24: logP (neutral): 2.80 1H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 9,348(4,2);8,840(4,0);8,833(4,1);8,728(3,5);8,706(4,2);8,701(2,3);8,697(2,3);8,689(2,3);8,686(2,2);8,446(4,1);8,424(3,7);8,341(4,5);8,314(0,5);8,139(2,2);8,135(2,1);8,118(2,4);8,115(2,2);7,545(2,2);7,534(2,1);7,525(2,0);7,513(2,0);7,184(4,0);7,177(4,1);4,018(16,0);3,859(0,9);3,841(3,3);3,822(3,3);3,804(1,0);3,316(90,6);2,675(1,0);2,671(1,4);2,666(1,0);2,524(4,0);2,510(81,8);2,506(166,2);2,501(227,2);2,497(168,8);2,493(81,2);2,333(1,0);2,328(1,3);2,324(0,9);2,073(0,5);1,260(3,5);1,241(8,1);1,223(3,4);0,146(0,6);0,008(5,3);0,000(147,0);-0,008(5,0);-0,150(0,6)
Ejemplo I-25: logP (neutral): 5.23 1H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 9,360(4,9);9,136(7,4);8,724(3,3);8,702(3,8);8,512(3,8);8,490(3,2);8,340(5,2);8,313(0,4);8,172(1,7);8,167(1,8);8,154(1,7);8,149(1,8);8,040(0,9);8,035(0,9);8,029(1,0);8,023(1,0);8,019(1,1);8,013(1,1);8,007(1,0);8,002(0,9);7,671(1,7);7,649(2,9);7,626(1,5);4,020(16,0);3,885(1,1);3,867(3,5);3,848(3,6);3,830(1,1);3,320(222,3);2,671(1,0);2,506(121,5);2,502(161,9);2,498(125,0);2,329(1,0);2,073(3,6);1,264(3,7);1,245(8,1);1,227(3,7);0,146(0,7);0,000(130,8);-0,150(0,6)
Ejemplo I-26: logP (neutral): 2.43 1H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 9,668(7,7);9,367(4,6);9,283(0,4);8,818(3,3);8,796(3,9);8,772(1,7);8,762(1,7);8,461(3,8);8,440(3,6);8,351(4,9);8,318(0,4);8,312(0,8);8,237(2,0);8,218(2,5);8,035(1,0);8,031(1,0);8,016(1,8);8,012(1,8);7,997(1,0);7,992(1,0);7,570(1,2);7,558(1,3);7,551(1,3);7,539(1,1);4,140(1,3);4,087(0,4);4,042(16,0);3,908(1,0);3,890(3,5);3,871(3,5);3,852(1,2);3,315(285,7);2,670(2,0);2,505(255,8);2,501(349,9);2,497(265,6);2,328(2,1);2,073(1,1);1,276(3,7);1,257(8,2);1,239(3,8);-0,001(4,4)
Ejemplo I-27: logP (neutral): 2.54 1H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 9,696(6,7);9,368(4,9);9,347(3,1);9,342(3,1);8,821(3,3);8,799(3,7);8,749(2,1);8,746(2,0);8,737(2,1);8,734(2,0);8,510(1,2);8,506(1,8);8,491(1,3);8,486(1,8);8,460(3,7);8,438(3,4);8,350(5,2);7,635(1,5);7,622(1,5);7,615(1,5);7,603(1,4);4,035(16,0);3,904(1,1);3,885(3,5);3,867(3,6);3,849(1,1);3,319(112,4);2,671(0,9);2,506(119,0);2,502(149,9);2,498(112,5);2,328(0,9);2,073(1,4);1,273(3,9);1,254(8,4);1,236(3,7);0,146(0,6);0,007(7,0);0,000(116,0);-0,150(0,6)
Ejemplo I-28: logP (neutral): 3.38 1H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 10,198(0,4);9,323(3,8);9,058(2,7);9,052(2,7);8,565(5,5);8,538(3,3);8,517(4,4);8,363(3,9);8,341(3,3);8,314(4,3);8,312(4,1);7,953(0,4);7,882(0,7);7,878(0,8);7,862(1,5);7,860(1,4);7,842(0,8);7,839(0,8);7,552(0,4);7,536(1,3);7,531(1,9);7,527(1,0);7,513(2,5);7,511(2,4);7,505(1,5);7,500(1,2);7,496(1,0);7,428(1,0);7,421(0,9);7,414(0,5);7,407(1,2);7,402(1,1);7,393(0,5);7,390(0,5);7,386(0,6);5,755(3,2);3,956(16,0);3,818(0,9);3,800(3,2);3,781(3,3);3,763(1,0);3,319(43,5);2,891(3,2);2,732(2,5);2,676(0,3);2,672(0,4);2,525(1,1);2,520(1,8);2,512(22,2);2,507(45,3);2,502(61,5);2,498(44,1);2,493(20,1);2,329(0,4);1,246(3,4);1,227(8,0);1,209(3,3);0,008(1,4);0,000(38,1);-0,009(1,1)
Ejemplo I-29: logP (neutral): 3.50 1H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 9,340(9,3);8,886(0,8);8,789(11,6);8,558(2,9);8,536(3,6);8,519(5,8);8,477(0,4);8,471(0,4);8,316(5,2);8,290(2,9);8,050(12,8);8,002(2,2);7,990(2,4);7,985(1,6);7,980(2,5);7,968(2,4);7,914(0,9);7,897(0,6);7,888(5,3);7,876(5,6);7,870(3,5);7,865(6,0);7,853(5,7);7,767(0,5);7,755(0,5);7,749(0,4);7,744(0,5);7,734(0,6);7,645(1,1);7,627(2,1);7,615(1,5);7,598(1,6);7,574(1,1);7,566(1,3);7,557(1,0);7,550(1,2);7,537(0,4);7,530(0,4);7,422(2,3);7,416(1,3);7,406(6,3);7,401(5,8);7,384(10,1);7,362(4,9);7,339(1,1);7,322(0,4);7,301(0,4);7,279(0,7);7,257(0,4);6,540(0,4);5,754(3,1);3,985(0,5);3,965(16,0);3,813(1,0);3,794(3,4);3,775(3,4);3,757(1,0);3,568(1,3);3,318(38,0);2,696(0,4);2,671(1,0);2,524(2,8);2,506(126,9);2,502(171,7);2,498(130,6);2,333(0,8);2,329(1,0);1,247(3,8);1,229(8,5);1,210(3,7);0,008(1,6);-0,001(41,9)
Ejemplo I-30: logP (neutral): 2.73 1H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 9,334(4,5);9,266(2,8);9,260(2,9);8,809(3,3);8,802(3,4);8,645(2,0);8,624(7,0);8,616(2,4);8,613(2,3);8,599(4,9);8,578(2,0);8,410(1,1);8,407(1,4);8,404(1,3);8,389(1,2);8,386(1,4);8,383(1,4);8,328(4,8);8,314(0,4);7,650(1,5);7,639(1,5);7,630(1,5);7,618(1,4);7,312(3,5);7,305(3,7);5,754(6,7);3,967(16,0);3,846(1,0);3,827(3,5);3,809(3,5);3,790(1,1);3,318(66,1);2,671(0,9);2,667(0,7);2,506(109,6);2,502(146,9);2,498(115,5);2,329(0,9);1,253(3,7);1,234(8,3);1,216(3,6);0,000(33,2)
Ejemplo I-31: logP (neutral): 3.81 1H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 10,196(0,7);9,356(4,0);9,301(0,5);9,273(0,4);9,267(0,4);8,813(0,4);8,807(0,4);8,770(3,6);8,749(4,2);8,53

3(3,9);8,512(3,4);8,408(0,4);8,389(0,4);8,344(4,2);8,314(0,9);8,280(0,5);8,198(0,3);8,048(6,6);8,020(2,0);8,011(2,5);8,002(2,5);7,996(2,3);7,988(0,3);7,643(0,4);7,627(0,5);7,609(0,3);7,598(0,3);7,572(1,1);7,564(3,4);7,561(3,3);7,553(4,9);7,547(5,3);7,538(0,6);7,339(0,4);7,333(0,4);5,754(2,6);4,542(1,7);3,990(16,0);3,937(0,4);3,877(1,1);3,872(1,2);3,858(3,3);3,839(3,4);3,821(1,0);3,317(208,5);2,675(1,5);2,671(2,1);2,666(1,5);2,524(5,3);2,519(8,2);2,510(112,3);2,506(235,3);2,501(328,1);2,497(243,9);2,492(116,8);2,337(0,7);2,333(1,4);2,328(2,0);2,324(1,5);1,261(3,7);1,242(8,5);1,224(3,7);0,146(0,7);0,008(5,8);0,000(178,0);-0,009(6,4);-0,150(0,7)
Ejemplo I-32: logP (neutral): 3.52 1H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 9,102(9,2);8,936(2,3);8,932(2,4);8,795(2,5);8,773(4,7);8,726(7,0);8,722(2,8);8,703(2,7);7,683(0,7);7,679(0,7);7,664(1,4);7,660(1,5);7,645(0,8);7,640(0,8);7,589(0,4);7,583(0,6);7,580(0,7);7,566(0,7);7,563(0,9);7,558(0,6);7,549(0,6);7,545(0,5);7,521(1,0);7,518(1,1);7,500(0,7);7,495(1,2);7,492(1,1);7,474(0,6);7,471(0,6);7,426(1,0);7,423(0,9);7,407(1,5);7,404(1,4);7,388(0,7);7,384(0,7);5,754(0,6);4,039(0,6);4,021(0,6);3,910(16,0);3,896(3,3);3,878(3,2);3,859(0,9);3,318(29,5);2,524(0,6);2,511(17,0);2,507(36,1);2,502(48,5);2,497(34,5);2,493(16,1);1,989(2,5);1,268(3,3);1,250(7,7);1,231(3,4);1,193(0,7);1,175(1,4);1,158(0,7);0,146(0,3);0,008(2,7);0,000(79,3);-0,009(2,7);-0,150(0,3)
Ejemplo I-33: logP (neutral): 3.52 1H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 8,923(2,5);8,920(2,7);8,868(7,6);8,718(5,7);8,713(2,9);8,695(3,9);8,506(3,8);8,483(3,3);7,805(0,4);7,798(4,0);7,793(1,4);7,781(1,6);7,776(5,8);7,768(0,7);7,679(0,7);7,671(5,7);7,666(1,7);7,654(1,4);7,649(4,1);7,642(0,4);5,755(9,6);3,896(16,0);3,882(3,3);3,863(3,3);3,845(1,0);3,320(35,8);2,676(0,4);2,671(0,5);2,667(0,4);2,525(1,3);2,511(27,8);2,507(57,7);2,502(80,1);2,498(59,9);2,494(29,1);2,333(0,3);2,329(0,5);2,324(0,3);1,398(0,5);1,266(3,5);1,248(7,8);1,230(3,6);0,008(2,5);0,000(67,3);-0,008(2,4)
Ejemplo I-34: logP (neutral): 3.62 1H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 9,072(8,5);8,768(2,6);8,746(4,7);8,694(4,6);8,672(2,8);8,158(2,6);8,002(1,7);7,981(2,1);7,762(1,4);7,758(1,5);7,740(1,2);7,737(1,2);7,683(0,7);7,679(0,8);7,663(1,4);7,659(1,6);7,644(0,8);7,640(0,9);7,587(0,4);7,582(0,6);7,578(0,7);7,575(0,6);7,561(0,9);7,556(0,6);7,548(0,6);7,543(0,5);7,520(1,0);7,516(1,1);7,499(0,7);7,494(1,2);7,490(1,2);7,473(0,6);7,469(0,6);7,425(1,0);7,422(0,9);7,405(1,5);7,387(0,7);7,383(0,7);5,753(9,3);3,940(0,9);3,921(3,2);3,902(4,4);3,897(16,0);3,885(1,2);3,322(38,9);2,524(0,6);2,511(15,6);2,507(33,1);2,502(44,5);2,497(32,0);2,493(15,3);1,988(0,6);1,398(0,4);1,259(3,5);1,241(7,8);1,222(3,3);1,175(0,3);0,008(2,3);0,000(68,7);-0,009(2,6)
Ejemplo I-35: logP (neutral): 3.16 1H-NMR(400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 9,653(6,9);9,175(13,7);9,022(10,3);8,720(5,8);8,699(7,3);8,481(7,0);8,459(6,1);8,411(6,8);7,697(1,4);7,694(1,6);7,678(3,0);7,674(3,3);7,659(1,7);7,655(1,8);7,602(0,6);7,598(0,6);7,589(0,7);7,581(1,5);7,563(2,0);7,559(1,4);7,550(1,2);7,546(1,2);7,519(2,3);7,496(2,6);7,474(1,3);7,426(2,1);7,408(3,4);7,386(1,5);4,221(2,0);4,203(6,6);4,184(6,7);4,166(2,0);3,319(59,0);2,675(1,4);2,671(1,9);2,667(1,5);2,541(1,3);2,524(4,7);2,506(246,0);2,502(324,7);2,498(236,9);2,333(1,4);2,329(1,9);1,301(7,3);1,282(16,0);1,263(7,2);1,234(0,4);0,146(1,0);0,008(7,9);0,000(220,7);-0,007(9,4);-0,149(1,1)

La medición de los valores logP se realizó de acuerdo a las directivas EEC Directive 79/831 Annex V.A8 mediante HPLC (High Performance Liquid Chromatography (Cromatografía líquida de alta resolución)) en una columna de fase inversa (C 18). Temperatura: 55°C.

- La determinación con LC-MS en el rango ácido se realiza a pH 2,7 con 0,1 % ácido fórmico acuoso y acetonitrilo (contiene 0,1% ácido fórmico) como eluyente; gradiente lineal de 10% acetonitrilo a 95% acetonitrilo. Se menciona en la tabla como logP (HCOOH).

- La determinación con LC-MS en el rango neutro se realiza a pH 7.8 con 0,001 de una solución molar acuosa de bicarbonato de amonio y acetonitrilo como eluyente; gradiente lineal de 10 % acetonitrilo a 95 % acetonitrilo. Se menciona en la tabla como logP (neutro).

La calibración se lleva a cabo usando alcan-2-onas no ramificadas (con 3 a 16 átomos de carbono) cuyos valores logP son conocidos (la determinación de los valores logP en base a los tiempos de retención por interpolación lineal entre dos alcanonas sucesivas).

- Los datos NMR de ejemplos seleccionados se indican ya sea en forma clásica (valores δ , división multiplete, número de átomos H) o como lista de picos NMR.

El disolvente, en el cual se recogió el espectro NMR está indicado en cada caso.

Procedimientos de lista de picos NMR

Los datos ^1H -NMR de ejemplos seleccionados se enumeran en forma de listas de picos ^1H -NMR. Para cada pico de señal primero se indica el valor δ en ppm y después la intensidad de la señal en paréntesis. Los pares de números valor δ – intensidad de señal de distintos picos de señal se enumeran separados por punto y coma.

La lista de picos de un ejemplo tiene entonces la siguiente forma:

δ_1 (intensidad₁); δ_2 (intensidad₂);; δ_i (intensidad_i);; δ_n (intensidad_n)

La intensidad de señales agudas está correlacionada con el nivel de las señales en un ejemplo impreso de un espectro NMR en cm y muestra las relaciones reales de las intensidades de señal. En caso de señales amplias se pueden mostrar varios picos o el centro de la señal y su intensidad relativa en comparación con la señal más intensa en el espectro.

Para la calibración del desplazamiento químico de espectros ^1H -NMR usamos tetrametilosilan y/o el desplazamiento químico del disolvente, en especial en el caso de espectros que se miden en DMSO. Por lo tanto en las listas de picos RNM puede aparecer el pico tetrametilosilan, pero no necesariamente.

Las listas de los picos ^1H -NMR son similares al clásico impreso ^1H -NMR y por lo general contienen todos los picos que se enumeran en una interpretación NMR clásica.

Por otra parte pueden mostrar como impresos clásicos ^1H -NMR señales de disolventes, señales de estereoisómeros de los compuestos diana, que también son objeto de la invención, y/o picos de impurezas.

Al especificar señales de enlace en la zona del Delta de disolventes y/o agua nuestras listas de picos ^1H -NMR muestran los picos de disolventes habituales, por ejemplo picos de DMSO en DMSO- D_6 y el pico de agua, los que en promedio habitualmente muestran una intensidad alta.

Los picos de estereoisómeros de los compuestos diana y/o picos de impurezas por lo general tienen una media inferior a los picos de intensidad de los compuestos diana (por ejemplo con una pureza de >90%).

Tales estereoisómeros y/o impurezas pueden ser típico para el proceso de fabricación respectivo. Sus picos por tanto pueden ayudar a reconocer la reproducción de nuestro proceso de fabricación basado en “huellas digitales” de subproductos.

Un experto que calcula los picos de los compuestos diana mediante los procedimientos conocidos (MestreC, ACD-Simulation, pero también con valores esperados empíricamente evaluados), puede aislar los picos de los compuestos diana según se requiera, donde se pueden utilizar filtros de intensidad adicionales. Este aislamiento sería similar al Peak-Picking en la interpretación ^1H -NMR clásica.

Más detalles relativos a las listas de picos ^1H -NMR se pueden tomar de Research Disclosure Database Number 564025.

Ejemplos de aplicación**Ctenocephalides felis – ensayo de contacto in-vitro con pulgas adultas de gatos**

Para recubrir el tubo de ensayo se disuelve primeramente 9 mg de principio activo en 1 ml acetona p.a. y a continuación se diluye con acetona p.a. hasta la concentración deseada. 250 µl de la solución se distribuye en forma homogénea en las paredes interiores y en la parte inferior de un tubo de vidrio de 25ml mediante rotación e inclinación en un agitador rotatorio (2 h de oscilación en rotación a 30 rpm). Con 900 ppm de principio activo y 44,7 cm² de superficie interior y una distribución homogénea se logra una dosis de área de 5 µg/cm².

Después de que se haya evaporado el disolvente los tubitos se infestan con 5-10 pulgas adultas de gatos (*Ctenocephalides felis*), se cierran con una tapa de plástico perforada y se dejan incubar en posición horizontal a temperatura ambiente y humedad ambiental. Luego de 48 h se determina la eficacia. Para ello se colocan los tubitos en posición vertical y se dejan caer las pulgas al fondo del tubito. Las pulgas que permanecen inmóviles en el suelo o si su movimiento es descoordinado, se consideran muertas o resentidas.

Una sustancia muestra buena eficacia contra *Ctenocephalides felis*, si en este ensayo, con una cantidad de concentración de 5 µg/cm², se logra al menos 80% de eficacia. A este respecto el 100% de eficacia representa que todas las pulgas se resintieron o habían muerto; 0% representa que ninguna pulga se resintió.

En este ensayo por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 100% en una velocidad de aplicación de 5 µg/cm² (500g/ha): I-1, I-15, I-18, I-24

Boophilus microplus – ensayo de inyección

Disolvente: sulfóxido de dimetilo

Para la producción de una preparación de principio activo conveniente se mezcla 10 mg de principio activo con 0,5 ml disolvente y se diluye el concentrado con disolvente hasta la concentración deseada.

Se inyecta 1µl de una preparación de principio activo en el abdomen de 5 garrapatas de bovino (*Boophilus microplus*) hembras, empapadas y adultas. Los animales se transfieren a los platos y mantienen en una habitación climatizada.

Después de 7 días se controla la eficacia en busca de deposición de huevos fértiles. Huevos, cuya fertilidad no es visible desde el exterior, se mantienen en una cámara climática hasta que salen de la larva aprox. después de 42 días. Una eficacia del 100% representa que ninguna de las garrapatas ha puesto huevos fértiles, 0% representa que todos los huevos son fértiles.

En este ensayo por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 95% en una velocidad de aplicación de 20µg/animal: I-3, I-18

En este ensayo por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 90% en una velocidad de aplicación de 20µg/animal: I-12

- 5 En este ensayo por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 80% en una velocidad de aplicación de 20µg/animal: I-1, I-15, I-19, I-32

Ctenocephalides felis – ensayo oral

Disolvente: sulfóxido de dimetilo

- 10 Para la producción de una preparación de principio activo conveniente se mezcla 10 mg de principio activo con 0,5 ml sulfóxido de dimetilo. Diluyendo con sangre de ganado citradas se obtiene la concentración deseada.

- 15 Se colocan aprox. 20 pulgas de gato (*Ctenocephalides felis*) adultas sobrias en una cámara que está sellada arriba y abajo con gasa. Sobre la cámara se coloca un cilindro de metal, cuya parte inferior está cubierta con parafilm. El cilindro contiene la preparación de principio activo de sangre que puede ser absorbida por las pulgas a través de la membrana de parafilm.

Después de 2 días se determina la muerte en %. A este respecto el 100 % representa que todas las pulgas habían muerto; 0 % representa que ninguna de las pulgas había muerto.

- 20 En este ensayo por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 100% en una velocidad de aplicación de 100ppm: I-1, I-3, I-7, I-12, I-15, I-16, I-18, I-19, I-23, I-28, I-29, I-32

En este ensayo por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 95% en una velocidad de aplicación de 100ppm: I-17

En este ensayo por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 90% en una velocidad de aplicación de 100ppm: I-6

- 25 En este ensayo por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 80% en una velocidad de aplicación de 100ppm: I-21

Lucilia cuprina – ensayo

Disolvente: sulfóxido de dimetilo

Para la producción de una preparación de principio activo conveniente se mezcla 10 mg de principio activo con 0,5 ml sulfóxido de dimetilo y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

5 Aprox. 20 larvas-L1 de moscardones de oveja australiana (*Lucilia cuprina*) se transfieren a un tubo de ensayo que contiene carne de caballo picada y la preparación del producto activo en la concentración deseada.

Después de 2 días se determina la muerte en %. A este respecto el 100 % representa que todas las larvas habían muerto; 0 % representa que ninguna de las larvas había muerto.

10 En este ensayo por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 100% en una velocidad de aplicación de 100ppm: I-1, I-2, I-3, I-6, I-7, I-12, I-15, I-16, I-17, I-18, I-19, I-21, I-23, I-24, I-28, I-29, I-30, I-32

Musca domestica – ensayo

Disolvente: sulfóxido de dimetilo

15 Para la producción de una preparación de principio activo conveniente se mezcla 10 mg de principio activo con 0,5 ml sulfóxido de dimetilo y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

Recipientes que contienen una esponja tratada con una solución azucarada y una preparación de principio activo en la concentración deseada, se infestan con 10 moscas domésticas adultas (*Musca domestica*).

20 Después de 2 días se determina la muerte en %. A este respecto el 100 % representa que todas las moscas habían muerto; 0 % representa que ninguna de las moscas había muerto.

En este ensayo por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 100% en una velocidad de aplicación de 100ppm: I-32

25 En este ensayo por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 90% en una velocidad de aplicación de 100ppm: I-2, I-3

En este ensayo por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 85% en una velocidad de aplicación de 100ppm: I-18

En este ensayo por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 80% en una velocidad de aplicación de 100ppm: I-1, I-16, I-19

Meloidogyne incognita - ensayo

Disolvente: 125,0 partes en peso acetona

Para la producción de una preparación de principio activo conveniente se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y se diluye el concentrado con agua hasta la
5 concentración deseada.

Se llenan los recipientes con arena, una preparación de principio activo, una suspensión de larvas de huevo de nematodo de nudo-raíz del sur (*Meloidogyne incognita*) y semillas de lechuga. Las semillas de lechuga germinan y las plantitas se desarrollan. En las raíces se forman agallas.

A los 14 días se determina la acción nematicida por la formación de agallas en %. A este respecto el 100
10 % representa que no se encontraron agallas; el 0 % representa que el número de agallas en las plantas tratadas corresponde al control no tratado.

En este ensayo por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 100% en una velocidad de aplicación de 20ppm: I-15, I-17, I-33

En este ensayo por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una
15 eficacia de 90% en una velocidad de aplicación de 20ppm: I-8, I-30

Myzus persicae - ensayo de pulverización

Disolvente: 78 partes en peso acetona
1,5 partes en peso dimetilformamida

Emulsionante: alquilarilpoliglicol éter

20 Para la producción de una preparación de principio activo conveniente se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y se llena con agua, que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm hasta lograr la concentración deseada. Para la producción de otras concentraciones de prueba se disuelve con agua que contiene emulsionante.

25 Las hojas de la col china (*Brassica pekinensis*), que están intensamente infectadas por pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*), se pulverizan con la preparación de un principio activo de la concentración deseada.

A los 5-6 se determina la eficacia en %. A este respecto el 100 %, representa que todos los pulgones habían muerto; 0 % representa que no había muerto ningún pulgón.

En este ensayo por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una
30 eficacia de 100% en una velocidad de aplicación de 500g/ha: I-8, I-30

En este ensayo por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 90% en una velocidad de aplicación de 500g/ha: I-1, I-3, I-17, I-18, I-26, I-29, I-32, I-33

Phaedon cochleariae - ensayo de pulverización

Disolvente: 78,0 partes en peso acetona
5 1,5 partes en peso dimetilformamida
Emulsionante: alquilarilpoliglicol éter

Para la producción de una preparación de principio activo conveniente se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y se llena con agua, que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm hasta lograr la concentración deseada. Para la producción
10 de otras concentraciones de prueba se disuelve con agua que contiene emulsionante.

Las hojas de la col china (*Brassica pekinensis*) se pulverizan con una preparación de principio activo de la concentración deseada y luego de secado se infestan con larvas de escarabajo de la mostaza (*Phaedon cochleariae*).

A los 7 días se determina la eficacia en %. A este respecto el 100 % representa que todas las larvas de
15 coleópteros habían muerto; el 0 % representa que ninguna larva de coleópteros había muerto.

En este ensayo por ejemplo el siguiente compuesto de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 100% en una velocidad de aplicación de 500g/ha: I-1, I-2, I-3, I-5, I-6, I-7, I-8, I-9, I-10, I-11, I-12, I-13, I-15, I-16, I-17, I-18, I-19, I-21, I-22, I-23, I-24, I-25, I-26, I-27, I-28, I-29, I-30, I-32, I-33, I-34, I-35

Spodoptera frugiperda - ensayo de pulverización

Disolvente: 78,0 partes en peso acetona
1,5 partes en peso dimetilformamida
Emulsionante: alquilarilpoliglicol éter

Para la producción de una preparación de principio activo conveniente se mezcla 1 parte en peso de
25 principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y se llena con agua, que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm hasta lograr la concentración deseada. Para la producción de otras concentraciones de prueba se disuelve con agua que contiene emulsionante.

Las hojas de maíz (*Zea mays*) se pulverizan con una preparación de principio activo de la concentración deseada y luego de secado se infestan con orugas del gusano cogollero (*Spodoptera frugiperda*).

A los 7 días se determina la eficacia en %. A este respecto el 100 % significa que todos los gusanos
30 habían muerto; el 0 % significa que ningún gusano había muerto.

En este ensayo por ejemplo el siguiente compuesto de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 100% en una velocidad de aplicación de 500g/ha: I-1, I-2, I-3, I-4, I-5, I-7, I-8, I-9, I-12, I-15, I-16, I-18, I-19, I-21, I-22, I-23, I-24, I-26, I-27, I-28, I-29, I-30, I-31, I-32, I-33, I-34, I-35

En este ensayo por ejemplo el siguiente compuesto de los ejemplos de preparación muestran una
5 eficacia de 83% en una velocidad de aplicación de 500g/ha: I-6

Tetranychus urticae – ensayo de pulverización, resistente a OP

Disolvente: 78,0 partes en peso Aceton
 1,5 partes en peso dimetilformamida
Emulsionante : alquilarilpoliglicol éter

10 Para la producción de una preparación de principio activo conveniente se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y se llena con agua, que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm hasta lograr la concentración deseada. Para la producción de otras concentraciones de prueba se disuelve con agua que contiene emulsionante.

15 Las hojas de frijoles (*Phaseolus vulgaris*), infestadas con todos los estadios de la arañuela roja común (*Tetranychus urticae*), se pulverizan con una preparación de principio activo de la concentración deseada.

A los 6 días se determina la eficacia en %. A este respecto el 100 % significa que todas las arañuelas rojas habían muerto; 0 % significa que ninguna arañuela roja había muerto.

En este ensayo por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una
20 eficacia de 100% en una velocidad de aplicación de 500g/ha: I-1

En este ensayo por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 90% en una velocidad de aplicación de 500g/ha: I-17, I-33

En este ensayo por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 70% en una velocidad de aplicación de 500g/ha: I-15