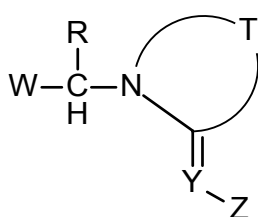


COMPUESTOS DE IMINO CON UN SUSTITUYENTE DE 2-CLOROPIRIMIDIN-5-ILO COMO AGENTES DE CONTROL DE PLAGAS

La presente invención se refiere a compuestos de imino que tienen un anillo de 2-cloropirimidin-5-ilo, que incluyen sus estereoisómeros, tautómeros y sales, y a las composiciones agrícolas o veterinarias que comprenden dichos compuestos. La invención también se refiere al uso de estos compuestos, sus estereoisómeros, tautómeros y/ sales, para combatir plagas de invertebrados. Asimismo, la invención se refiere a métodos para combatir plagas de invertebrados, que comprenden aplicar dichos compuestos, sus estereoisómeros, tautómeros y/o sales.

Las plagas de invertebrados, tales como las plagas de insectos, acáridos y nematodos destruyen cultivos en crecimiento y cosechados, y atacan viviendas y estructuras comerciales de madera, lo que causa grandes pérdidas económicas al suministro alimenticio y a la propiedad. Si bien se conoce una gran cantidad de agentes plaguicidas, debido a la capacidad de las plagas diana para desarrollar resistencia a aquellos agentes, hay una continua necesidad de hallar nuevos agentes para combatir las plagas de animales. En particular, las plagas de animales, tales como insectos y acáridos, son difíciles de controlar de modo eficaz.

EP 259738 describe los compuestos de la Fórmula A, que tienen acción insecticida:



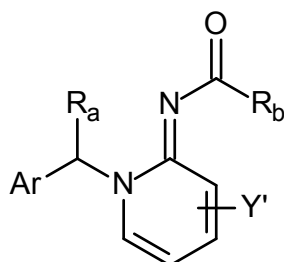
(A)

en donde W es un radical piridilo sustituido o un radical heterocíclico de 5 o 6 miembros, R es hidrógeno o alquilo, T, junto con los átomos a los que está unido, forma un anillo heterocíclico de 5 o 6 miembros, Y es, entre otros, un átomo de nitrógeno, y Z es un grupo atractor de electrones que se selecciona de nitro y ciano.

Los compuestos plaguicidas, que son similares a aquellos de EP 259738, se conocen de EP 639569, en donde la porción Z es un grupo atractor de electrones, tal como alcoxycarbonilo, arilcarbonilo, carbonilo heterocíclico, C₁-C₄-alquilsulfonilo, sulfamoilo o C₁-C₄-acilo.

US 2013/0150414 describe, entre otros, compuestos plaguicidas de la Fórmula

B



(B)

en donde Ar es un grupo arilo o un grupo heterocíclico de 5 o 6 miembros, R_a es hidrógeno o alquilo, Y' es hidrógeno, halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo alquilo o un grupo alcoxi, y R_b es un grupo alquilo sustituido con halógeno o un grupo alcoxi, opcionalmente sustituido con halógeno.

Los compuestos plaguicidas, que son similares a aquellos de US 2013/0150414, se conocen de WO 2013/129688.

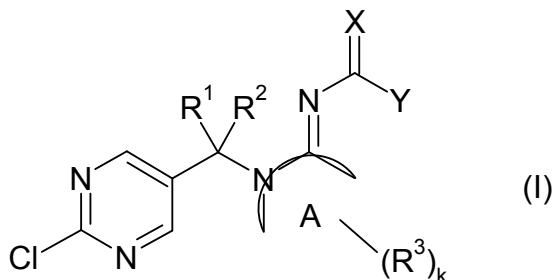
En WO 2015/028630 se describen los compuestos similares a los compuestos de la Fórmula (B), en donde Ar es un radical 3-tetrahidrofurilo opcionalmente sustituido, y R_b es un radical heterocíclico.

WO 2015/040116, WO 2015/075174 y PCT/EP 2015/056532 se refieren a compuestos heterocíclicos de N-acilimino.

La acción plaguicida de los compuestos aún no es satisfactoria. Por lo tanto, un objeto de la presente invención es proporcionar compuestos que tengan buena acción plaguicida, en especial, contra insectos y plagas de ácaridos difíciles de controlar.

SÍNTESIS DE LA INVENCION

Se descubrió que aquellos objetos se resuelven mediante los compuestos de imino de la Fórmula general (I) que se describen a continuación, mediante los estereoisómeros, los tautómeros y las sales de aquellos. Por lo tanto, la presente invención se refiere a un compuesto de amino de la Fórmula (I):



(I)

en donde

A es un anillo N-heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado de 5 o 6 miembros que puede contener 1 o 2 heteroátomos o grupos

de heteroátomos adicionales seleccionados de N, O, S, NO, SO y SO₂ como miembros del anillo;

X es O o S;

Y se selecciona de C₃-C₆-cicloalquilo que tiene uno o más sustituyentes R⁴, C₁-C₆-alquilo que tiene uno o más sustituyentes R⁵; y un radical de la Fórmula -C(R⁶)=N-O-R⁷;

R¹ y R², independientemente entre sí, se seleccionan del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₂-C₄-alquenilo, C₂-C₄-haloalquenilo, C₂-C₄-alquinilo, C₂-C₄-haloalquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R⁸, y un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados de N, O, S, NO, SO y SO₂ como miembros del anillo, en donde el anillo heterocíclico se sustituye opcionalmente con 1, 2, 3 o 4 sustituyentes R⁸;

o

R¹ y R² forman, junto con el átomo de carbono al que están unidos, un anillo heterocíclico o carbocíclico saturado o parcialmente insaturado de 3, 4, 5 o 6 miembros, en donde el anillo heterocíclico contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados de N, O, S, NO, SO y SO₂ como miembros del anillo, en donde el anillo carbocíclico o heterocíclico es no sustituido o tiene 1 o 2 radicales R⁸;

cada R³ se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, hidroxilo, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₂-C₆-haloalquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, NR^{11a}R^{11b}, S(O)_nR¹², S(O)_nNR^{11a}R^{11b}, C(=O)R¹³, C(=S)R¹³, C(=NR^{11a})R¹³ y Si(R¹⁴)₂R¹⁵;

o dos radicales R³ presentes en el mismo pueden formar juntos un grupo =O, =CR⁹R¹⁰, =S, =NR^{11a}, =NOR¹² o =NNR^{11a}R^{11b};

siempre que R³ no sea halógeno si está unido a un átomo de nitrógeno;

cada R⁴ se selecciona independientemente de ciano, nitro e hidroxilo;

R⁵ se selecciona de ciano, nitro, hidroxilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinilo, C₁-C₄-haloalquilsulfinilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-

haloalquilsulfonilo, C₁-C₄-alquilcarbonilo, C₁-C₄-haloalquilcarbonilo, C₁-C₄-alcoxicarbonilo, C₁-C₄-haloalcoxicarbonilo, amino, C₁-C₄-alquilamino, di-(C₁-C₄-alquil)-amino, fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R⁸, y un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados de N, O, S, NO, SO y SO₂ como miembros del anillo, en donde el anillo heterocíclico se sustituye opcionalmente con 1, 2, 3 o 4 sustituyentes R⁸;

R⁶ se selecciona de hidrógeno, halógeno, C₁-C₄-alquilo y C₁-C₄-haloalquilo;

R⁷ se selecciona de hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₂-C₆-haloalquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-halocicloalquil-C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalcoxi-C₁-C₄-alquilo, fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R⁸, y un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados de N, O, S, NO, SO y SO₂ como miembros del anillo, en donde el anillo heterocíclico se sustituye opcionalmente con 1, 2, 3 o 4 sustituyentes R⁸;

cada R⁸ se selecciona independientemente de halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₂-C₄-alquenilo, C₂-C₄-haloalquenilo, C₂-C₄-alquinilo, C₂-C₄-haloalquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados de halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₂-C₄-alquenilo, C₂-C₄-haloalquenilo, C₂-C₄-alquinilo, C₂-C₄-haloalquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo; y un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados de N, O, S, NO, SO y SO₂ como miembros del anillo, en donde el anillo heterocíclico se sustituye opcionalmente con 1, 2, 3 o 4 sustituyentes seleccionados de halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₂-C₄-alquenilo, C₂-C₄-haloalquenilo, C₂-C₄-alquinilo, C₂-C₄-haloalquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-

halocicloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinilo, C₁-C₄-haloalquilsulfinilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo;

R⁹ y R¹⁰, independientemente entre sí e independientemente de cada caso, se seleccionan del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, fenilo y bencilo;

R^{11a} y R^{11b}, independientemente entre sí e independientemente de cada caso, se seleccionan del grupo que consiste en hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₂-C₆-haloalquinilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₃-C₈-halocicloalquilo, C₃-C₈-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₈-halocicloalquil-C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinilo, C₁-C₄-haloalquilsulfinilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, C₁-C₄-alquilcarbonilo, C₁-C₄-haloalquilcarbonilo, C₁-C₄-alcoxycarbonilo, C₁-C₄-haloalcoxycarbonilo, amino, C₁-C₄-alquilamino, di-(C₁-C₄-alquil)-amino, fenilo, bencilo, 1-feniletilo, 2-feniletilo, en donde el anillo de fenilo en los últimos cuatro radicales mencionados es no sustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados de halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₂-C₄-alquenilo, C₂-C₄-haloalquenilo, C₂-C₄-alquinilo, C₂-C₄-haloalquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinilo, C₁-C₄-haloalquilsulfinilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo; y

un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado unido a C de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados de N, O, S, NO, SO y SO₂ como miembros del anillo, en donde el anillo heterocíclico se sustituye opcionalmente con 1, 2, 3 o 4 sustituyentes seleccionados de halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₂-C₄-alquenilo, C₂-C₄-haloalquenilo, C₂-C₄-alquinilo, C₂-C₄-haloalquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinilo, C₁-C₄-haloalquilsulfinilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo;

o

R^{11a} y R^{11b}, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros, en donde el anillo heterocíclico puede contener uno o dos

heteroátomos o grupos de heteroátomos adicionales seleccionados de N, O, S, NO, SO y SO₂ como miembros del anillo, y en donde el anillo heterocíclico se puede sustituir con 1, 2, 3 o 4 radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₂-C₄-alquenilo, C₂-C₄-haloalquenilo, C₂-C₄-alquinilo, C₂-C₄-haloalquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, fenilo, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados de halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₂-C₄-alquenilo, C₂-C₄-haloalquenilo, C₂-C₄-alquinilo, C₂-C₄-haloalquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinilo, C₁-C₄-haloalquilsulfinilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo; y un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados de N, O, S, NO, SO y SO₂ como miembros del anillo, en donde el anillo heterocíclico se sustituye opcionalmente con 1, 2, 3 o 4 sustituyentes seleccionados de halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₂-C₄-alquenilo, C₂-C₄-haloalquenilo, C₂-C₄-alquinilo, C₂-C₄-haloalquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinilo, C₁-C₄-haloalquilsulfinilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo;

cada R¹² se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, CN, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₂-C₆-haloalquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-halocicloalquil-C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-alquilcarbonilo, C₁-C₄-haloalquilcarbonilo, C₁-C₄-alcoxycarbonilo, C₁-C₄-haloalcoxycarbonilo, aminocarbonilo, C₁-C₄-alquilaminocarbonilo, di-(C₁-C₄-alquil)-aminocarbonilo, fenilo, fenil-C₁-C₄-alquilo, en donde el anillo de fenilo en los últimos dos radicales mencionados es no sustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R⁸; y un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados de N, O, S, NO, SO y SO₂ como miembros del anillo, en donde el anillo heterocíclico se sustituye opcionalmente con 1, 2, 3 o 4 sustituyentes R⁸; y

R¹², como un sustituyente en un átomo de azufre, además se selecciona del grupo que consiste en C₁-C₆-alcoxi y C₁-C₆-haloalcoxi;

cada R¹³ se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₂-C₆-haloalquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-halocicloalquil-C₁-C₄-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-haloalquiltio, C₁-C₆-alquilsulfinilo, C₁-C₆-haloalquilsulfinilo, C₁-C₆-alquilsulfonilo, C₁-C₆-haloalquilsulfonilo, fenilo, fenil-C₁-C₄-alquilo, en donde el anillo de fenilo en los dos últimos radicales mencionados se sustituye opcionalmente con 1, 2, 3, 4 o 5 radicales R⁸, y un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados de N, O, S, NO, SO y SO₂ como miembros del anillo, en donde el anillo heterocíclico se sustituye opcionalmente con 1, 2, 3 o 4 sustituyentes R⁸,

R¹⁴ y R¹⁵, independientemente entre sí e independientemente de cada caso, se seleccionan del grupo que consiste en C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₂-C₆-haloalquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-halocicloalquil-C₁-C₄-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₁-C₆-haloalcoxi-C₁-C₄-alquilo, fenilo y bencilo, en donde el anillo de fenilo en los últimos dos radicales es no sustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados independientemente de OH, halógeno, ciano, nitro, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi y C₁-C₆-haloalcoxi;

k es 0, 1, 2, 3 o 4; y

n es 0, 1 o 2;

y los estereoisómeros, los tautómeros y las sales de aquel aceptables en la agricultura o veterinaria.

Además, la presente invención se refiere e incluye las siguientes formas de realización:

- composiciones agrícolas y veterinarias que comprenden al menos un compuesto de la Fórmula (I) o un estereoisómero, un tautómero o una sal de aquel;
- el uso de los compuestos de la Fórmula (I), los estereoisómeros, los tautómeros o las sales de aquellos, para combatir plagas de invertebrados;
- el uso de los compuestos de la Fórmula (I), los estereoisómeros, los tautómeros o las sales de aquellos, para proteger las plantas en crecimiento contra el ataque o la infestación de plagas de invertebrados;

- el uso de los compuestos de la Fórmula (I), los estereoisómeros, los tautómeros o las sales de aquellos, para proteger el material de propagación de plantas, en especial, semillas, contra los insectos del suelo;
- el uso de los compuestos de la Fórmula (I), los estereoisómeros, los tautómeros o las sales de aquellos, para proteger las raíces de las plántulas y los brotes de las plantas contra los insectos foliares y del suelo;
- un método para combatir plagas de invertebrados, cuyo método comprende poner en contacto dichas plagas o su suministro de alimentos, hábitat o lugar de reproducción con una cantidad eficaz de plaguicida de al menos un compuesto de la Fórmula (I) o un estereoisómero, un tautómero o una sal de aquel (en donde el método, sin embargo, no incluye el tratamiento (médico) del cuerpo humano o animal);
- un método para proteger las plantas en crecimiento contra el ataque o la infestación de plagas de invertebrados, cuyo método comprende poner en contacto una planta, o el suelo o el agua en el que se cultiva la planta, con una cantidad eficaz de plaguicida de al menos un compuesto de la Fórmula (I) o un estereoisómero, un tautómero o una sal de aquel, en particular, un método para proteger las plantas de cultivo contra el ataque o la infestación de plagas de animales, que comprende poner en contacto a las plantas de cultivo con una cantidad eficaz de plaguicida de al menos un compuesto de la Fórmula (I) o un estereoisómero, un tautómero o una sal de aquel;
- un método para proteger el material de propagación vegetal, especialmente, las semillas, contra los insectos del suelo y a las raíces y los brotes de las plántulas contra los insectos del suelo y foliares, que comprende poner en contacto las semillas antes de la siembra y/o después de la pregerminación con, al menos, un compuesto de la Fórmula (I) o un estereoisómero, un tautómero o una sal de aquel;
- semillas que comprenden un compuesto de la Fórmula I o un enantiómero, un diastereómero o una sal de aquel;
- el uso de compuestos de la Fórmula (I), los estereoisómeros, los tautómeros o las sales, en particular, las sales aceptables en la veterinaria, de aquellos para combatir parásitos en o sobre animales, en particular, para el uso en el tratamiento de animales infestados o infectados por parásitos, para evitar que los animales se infecten o infesten con parásitos o para proteger a los animales contra la infestación o infección por parásitos;

- un método para tratar animales infestados o infectados por parásitos o para evitar que los animales se infecten o infesten con parásitos o para proteger a los animales contra la infestación o infección por parásitos, que comprende administrar o aplicar a los animales una cantidad eficaz de parasiticida de un compuesto de la Fórmula (I) o los estereoisómeros y/o las sales, en particular, las sales aceptables en la veterinaria, de aquel;
- un proceso para preparar una composición veterinaria, a fin de tratar, controlar, prevenir o proteger a los animales de la infestación o infección por parásitos, que comprende formular un compuesto de la Fórmula (I) o un estereoisómero, un tautómero y/o una sal de aquel aceptable en veterinaria con una composición de un portador adecuada para uso veterinario;
- el uso de un compuesto de la Fórmula (I) o los estereoisómeros, los tautómeros y/o las sales de aquel aceptables en veterinaria para la preparación de un medicamento, a fin de tratar, controlar, prevenir o proteger a los animales de la infestación o infección por parásitos;
- compuestos de la Fórmula (I) o los estereoisómeros, los tautómeros y/o las sales de aquellos aceptables en veterinaria para el uso en el tratamiento, el control y la prevención o la protección de los animales contra la infestación o infección por parásitos.

La presente invención también se refiere a materiales de propagación vegetal, en particular, como se mencionó anteriormente, a semillas, que contienen al menos un compuesto de la Fórmula (I), un estereoisómero, un tautómero y/o una sal de aquel aceptable en la agricultura.

Descripción detallada de la invención

Como se usan en la presente, las expresiones “compuestos de la presente invención” o “compuestos de acuerdo con la invención” se refieren a los compuestos de la Fórmula (I) definida anteriormente, que también se denominan “compuestos de la Fórmula I” o “compuestos I”, e incluyen sus sales, tautómeros, estereoisómeros y N-óxidos.

La presente invención se refiere a cualquier estereoisómero posible de los compuestos de la Fórmula (I), es decir, enantiómeros simples, diastereoisómeros e isómeros E/Z, así como mezclas de estos y las sales de estos. La presente invención se refiere a cada isómero individual, o a mezclas o combinaciones de los isómeros en cualquier proporción entre sí. Los compuestos adecuados de la Fórmula (I) también

incluyen todos los estereoisómeros geométricos posibles (isómeros cis/trans) y sus mezclas. En particular, el enlace doble C=N puede producir isómeros Z/E (la porción del anillo -C(X) puede ser Z o E con respecto al átomo de nitrógeno del anillo del anillo A). También los sustituyentes R³ en el anillo A pueden producir isómeros Z/E. Según el patrón de sustitución, los compuestos de la Fórmula (I) pueden tener uno o más centros de quiralidad, en cuyo caso están presentes como mezclas de enantiómeros o diastereómeros. La invención proporciona enantiómeros o diastereómeros puros y sus mezclas, y el uso de acuerdo con la invención de los enantiómeros o diastereómeros puros del compuesto I o sus mezclas.

La presente invención también se refiere a tautómeros potenciales de los compuestos de la Fórmula (I) y a las sales de dichos tautómeros. La presente invención se refiere al tautómero como tal y a mezclas o combinaciones de los tautómeros en cualquier proporción entre sí. El término "tautómeros" abarca isómeros, que derivan de los compuestos de la Fórmula (I) mediante el intercambio de un átomo de H que involucra al menos un átomo de H ubicado en un átomo de nitrógeno, oxígeno o azufre. Los ejemplos de las formas tautoméricas son las formas ceto-enol, imina-enamina, urea-isourea, tiourea-isotiourea, (tio)amida-(tio)imidato, etc.

Los compuestos de la presente invención, es decir, los compuestos de la Fórmula (I), sus estereoisómeros, sus tautómeros y sus sales, en particular, sus sales aceptables en la agricultura y sus sales aceptables en la veterinaria, pueden ser amorfos o pueden existir en uno o más estados cristalinos diferentes (polimorfos) o modificaciones que pueden tener diferentes propiedades macroscópicas, tales como la estabilidad, o mostrar diferentes propiedades biológicas, tales como las actividades. La presente invención incluye tanto compuestos amorfos como compuestos cristalinos de la Fórmula (I), mezclas de diferentes modificaciones o estados cristalinos de los respectivos estereoisómeros o tautómeros, así como sus sales amorfas o cristalinas.

Preferentemente, las sales de los compuestos de la Fórmula (I) son sales aceptables en la agricultura y veterinaria. Se pueden formar del método habitual, por ejemplo, haciendo reaccionar el compuesto con un ácido del anión en cuestión si el compuesto de la Fórmula (I) tiene una funcionalidad básica o haciendo reaccionar un compuesto ácido de la Fórmula (I) con una base adecuada.

Las sales adecuadas útiles en la agricultura o en veterinaria son, especialmente, las sales de los cationes o aniones, en particular, las sales de adición ácida de los ácidos cuyos cationes y aniones, respectivamente, no tienen ningún efecto adverso sobre la acción de los compuestos de acuerdo con la presente

invención. Los cationes adecuados son, en particular, los iones de los metales alcalinos, preferentemente, litio, sodio y potasio, de metales alcalinotérreos, preferentemente, calcio, magnesio y bario, y de metales de transición, preferentemente, manganeso, cobre, zinc y hierro, y también amonio (NH_4^+) y amonio sustituido, en donde de 1 a 4 de los átomos de hidrógeno se reemplazan por $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquilo, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -hidroxialquilo, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alcoxi, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alcoxi- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquilo, hidroxí- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alcoxi- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquilo, fenilo o bencilo. Los ejemplos de iones de amonio sustituidos comprenden metilamonio, isopropilamonio, dimetilamonio, diisopropilamonio, trimetilamonio, tetrametilamonio, tetraetilamonio, tetrabutilamonio, 2-hidroxietilamonio, 2-(2-hidroxietoxi)etil-amonio, bis(2-hidroxietil)amonio, benciltrimetilamonio y benciltriethylamonio, además de iones de fosfonio, iones de sulfonio, preferentemente, tri($\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquil)sulfonio, y iones de sulfoxonio, preferentemente, tri($\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquil)sulfoxonio.

Los aniones de sales de adición ácida útiles son, principalmente, cloruro, bromuro, fluoruro, sulfato de hidrógeno, sulfato, fosfato de dihidrógeno, fosfato de hidrógeno, fosfato, nitrato, carbonato de hidrógeno, carbonato, hexafluorosilicato, hexafluorofosfato, benzoato, y los aniones de los ácidos de $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alcanoicos, preferentemente, formiato, acetato, propionato y butirato. Se pueden formar haciendo reaccionar los compuestos de la Fórmula I con un ácido del anión correspondiente, preferentemente, de ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico o ácido nítrico.

La expresión "plaga de invertebrados" (también denominada "plaga de animales"), como se usa en la presente, abarca poblaciones de animales, tales como insectos, arácnidos y nematodos, que pueden atacar las plantas, y causar, de este modo, un daño considerable a las plantas atacadas, así como ectoparásitos que pueden infestar animales, en particular, animales de sangre caliente, por ejemplo, mamíferos o aves, u otros animales superiores, tales como reptiles, anfibios o peces, y así causar un daño considerable a los animales infestados. Para más detalles, véase más adelante.

La expresión "material de propagación vegetal" indica todas las partes generativas de la planta, tales como semillas y material vegetativo de la planta, tal como esquejes y tubérculos (por ejemplo, papas), que se pueden usar para la multiplicación de la planta. Esto incluye semillas, raíces, frutos, tubérculos, bulbos, rizomas, brotes, retoños y otras partes de las plantas, incluso plántulas y plantas jóvenes, que se trasplantarán después de la germinación o después de que surjan del

suelo. Los materiales de propagación vegetal se pueden tratar de manera profiláctica con un compuesto de protección para plantas, ya sea antes o al momento de la siembra o del trasplante. Dichas plantas jóvenes también se pueden proteger, antes de trasplantarlas, con un tratamiento total o parcial mediante inmersión o vertido.

El término "plantas" comprende cualquier tipo de planta, incluso "plantas no cultivadas" y, en particular, "plantas cultivadas".

La expresión "plantas no cultivadas" se refiere a cualquier especie de tipo silvestre o especie relacionada o género relacionado de una planta cultivada.

La expresión "plantas cultivadas" incluye plantas que se modificaron por reproducción, mutagénesis o ingeniería genética que incluye, entre otros, productos agrícolas biotecnológicos que se encuentran en el comercio o en desarrollo (cf. http://www.bio.org/speeches/pubs/er/agri_products.asp). Para más detalles, véase más adelante.

Las porciones orgánicas mencionadas en las definiciones anteriores de las variables son, al igual que el término halógeno, términos colectivos de enumeraciones individuales de cada uno de los miembros del grupo. El prefijo C_n - C_m indica, en cada caso, la posible cantidad de átomos de carbono en el grupo.

"Halógeno" significa flúor, cloro, bromo y yodo.

La expresión "parcial o totalmente halogenado" significa que uno o más, por ejemplo, 1, 2, 3, 4 o 5, o todos los átomos de hidrógeno de un radical determinado fueron reemplazados por un átomo de halógeno, en particular, por flúor o cloro. Por ejemplo, el alquilo parcial o totalmente halogenado también se denomina haloalquilo; el cicloalquilo parcial o totalmente halogenado también se denomina halocicloalquilo; el alquilenilo parcial o totalmente halogenado también se denomina haloalquilenilo; el alquilinilo parcial o totalmente halogenado también se denomina haloalquinilo; el alcoxi parcial o totalmente halogenado también se denomina haloalcoxi; el alquiltio parcial o totalmente halogenado también se denomina haloalquiltio; el alquilsulfinilo parcial o totalmente halogenado también se denomina haloalquilsulfinilo; el alquilsulfonilo parcial o totalmente halogenado también se denomina haloalsulfonilo; el cicloalquilalquilo parcial o totalmente halogenados también se denomina halocicloalquilalquilo.

Como se usa en la presente y en las porciones alquilo de alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilcarbonilo, alcoxicarbonilo, alquilamino, dialquilamino y similares, el término "alquilo" se refiere a radicales hidrocarburo saturados de cadena lineal o ramificada que tienen de 1 a 2 (" C_1 - C_2 -alquilo"), 1 a 3 (" C_1 - C_3 -alquilo"), 1 a 4

("C₁-C₄-alquilo") o 1 a 6 ("C₁-C₆-alquilo") átomos de carbono. C₁-C₂-alquilo es metilo o etilo. C₁-C₃-alquilo también es propilo e isopropilo. C₁-C₄-alquilo también es n-butilo, 1-metilpropilo (sec-butilo), 2-metilpropilo (isobutilo) o 1,1-dimetiletilo (ter-butilo). C₁-C₆-alquilo también es, por ejemplo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, hexilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo o 1-etil-2-metilpropilo.

Como se usa en la presente, el término "haloalquilo", que también se expresa como "alquilo que es parcial o totalmente halogenado", se refiere a grupos alquilo de cadena lineal o ramificada, que tienen de 1 a 2 ("C₁-C₂-haloalquilo"), de 1 a 3 ("C₁-C₃-haloalquilo"), de 1 a 4 ("C₁-C₄-haloalquilo") o de 1 a 6 ("C₁-C₆-haloalquilo") átomos de carbono (como se mencionó anteriormente), en donde algunos o todos los átomos de hidrógeno en estos grupos se reemplazan por átomos de halógeno, como se mencionó anteriormente: en particular, C₁-C₂-haloalquilo, tal como clorometilo, bromometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorodifluorometilo, 1-cloroetilo, 1-bromoetilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-cloro-2-fluoroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo o pentafluoroetilo. C₁-C₃-haloalquilo también es, por ejemplo, 1-fluoropropilo, 2-fluoropropilo, 3-fluoropropilo, 1,1-difluoropropilo, 2,2-difluoropropilo, 1,2-difluoropropilo, 3,3-difluoropropilo, 3,3,3-trifluoropropilo, heptafluoropropilo, 1,1,1-trifluoroprop-2-ilo, 3-cloropropilo y similares. Los ejemplos de C₁-C₄-haloalquilo son, además de los que se mencionaron para C₁-C₃-haloalquilo, 4-clorobutilo y similares.

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

Como se usa en la presente, el término "alquenilo" se refiere a radicales hidrocarburo monoinsaturados de cadena lineal o ramificada que tienen 2 a 3 ("C₂-C₃-alquenilo"), 2 a 4 ("C₂-C₄-alquenilo") o 2 a 6 ("C₂-C₆-alquenilo") átomos de carbono y un enlace doble en cualquier posición, por ejemplo, C₂-C₃-alquenilo, tal como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo o 1-metiletenilo; C₂-C₄-alquenilo, tal como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metiletenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo o 2-metil-2-propenilo; C₂-C₆-alquenilo, tal como

etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metiletenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-2-propenilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-metil-1-butenilo, 2-metil-1-butenilo, 3-metil-1-butenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1,2-dimetil-1-propenilo, 1,2-dimetil-2-propenilo, 1-etil-1-propenilo, 1-etil-2-propenilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1-metil-1-pentenilo, 2-metil-1-pentenilo, 3-metil-1-pentenilo, 4-metil-1-pentenilo, 1-metil-2-pentenilo, 2-metil-2-pentenilo, 3-metil-2-pentenilo, 4-metil-2-pentenilo, 1-metil-3-pentenilo, 2-metil-3-pentenilo, 3-metil-3-pentenilo, 4-metil-3-pentenilo, 1-metil-4-pentenilo, 2-metil-4-pentenilo, 3-metil-4-pentenilo, 4-metil-4-pentenilo, 1,1-dimetil-2-butenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, 1,2-dimetil-1-butenilo, 1,2-dimetil-2-butenilo, 1,2-dimetil-3-butenilo, 1,3-dimetil-1-butenilo, 1,3-dimetil-2-butenilo, 1,3-dimetil-3-butenilo, 2,2-dimetil-3-butenilo, 2,3-dimetil-1-butenilo, 2,3-dimetil-2-butenilo, 2,3-dimetil-3-butenilo, 3,3-dimetil-1-butenilo, 3,3-dimetil-2-butenilo, 1-etil-1-butenilo, 1-etil-2-butenilo, 1-etil-3-butenilo, 2-etil-1-butenilo, 2-etil-2-butenilo, 2-etil-3-butenilo, 1,1,2-trimetil-2-propenilo, 1-etil-1-metil-2-propenilo, 1-etil-2-metil-1-propenilo, 1-etil-2-metil-2-propenilo y similares.

Como se usa en la presente, el término "haloalquenilo", que también se expresa como "alquenilo que es parcial o totalmente halogenado", se refiere a radicales hidrocarburo insaturados de cadena lineal o ramificada, que tienen de 2 a 3 ("C₂-C₃-haloalquenilo"), de 2 a 4 ("C²-C₄-haloalquenilo") o de 2 a 6 ("C₂-C₆-haloalquenilo") átomos de carbono y un enlace doble en cualquier posición (como se mencionó anteriormente), en donde algunos o todos los átomos de hidrógeno en estos grupos se reemplazan por átomos de halógeno, como se mencionó anteriormente, en particular, flúor, cloro y bromo, por ejemplo, clorovinilo, cloroalilo y similares.

Como se usa en la presente, el término "alquinilo" se refiere a grupos hidrocarburo de cadena lineal o ramificada que tienen 2 a 3 ("C₂-C₃-alquinilo"), 2 a 4 ("C₂-C₄-alquinilo") o 2 a 6 ("C₂-C₆-alquinilo") átomos de carbono y un enlace triple en cualquier posición, por ejemplo, C₂-C₃-alquinilo, tal como etinilo, 1-propinilo o 2-propinilo; C₂-C₄-alquinilo, tal como etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo, 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 1-metil-2-propinilo y similares, C₂-C₆-alquinilo, tal como etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo, 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 1-metil-2-propinilo, 1-pentinilo, 2-pentinilo, 3-pentinilo, 4-pentinilo, 1-metil-2-butinilo, 1-metil-3-butinilo, 2-metil-3-butinilo, 3-metil-1-butinilo, 1,1-dimetil-2-propinilo, 1-etil-2-propinilo, 1-hexinilo, 2-hexinilo, 3-hexinilo, 4-

hexinilo, 5-hexinilo, 1-metil-2-pentinilo, 1-metil-3-pentinilo, 1-metil-4-pentinilo, 2-metil-3-pentinilo, 2-metil-4-pentinilo, 3-metil-1-pentinilo, 3-metil-4-pentinilo, 4-metil-1-pentinilo, 4-metil-2-pentinilo, 1,1-dimetil-2-butinilo, 1,1-dimetil-3-butinilo, 1,2-dimetil-3-butinilo, 2,2-dimetil-3-butinilo, 3,3-dimetil-1-butinilo, 1-etil-2-butinilo, 1-etil-3-butinilo, 2-etil-3-butinilo, 1-etil-1-metil-2-propinilo y similares;

Como se usa en la presente, el término "haloalquinilo", que también se expresa como "alquinilo que es parcial o totalmente halogenado", se refiere a radicales hidrocarburo insaturados de cadena lineal o ramificada, que tienen de 2 a 3 ("C₂-C₃-haloalquinilo"), de 2 a 4 ("C₂-C₄-haloalquinilo") o de 2 a 6 ("C₂-C₆-haloalquinilo") átomos de carbono y un enlace triple en cualquier posición (como se mencionó anteriormente), en donde algunos o todos los átomos de hidrógeno en estos grupos se reemplazan por átomos de halógeno, como se mencionó anteriormente, en particular, flúor, cloro y bromo;

El término "cicloalquilo", como se usa en la presente, se refiere a radicales hidrocarburo saturados monocíclicos que tienen de 3 a 6 ("C₃-C₆-cicloalquilo") átomos de carbono. Algunos ejemplos son ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo.

El término "halocicloalquilo", como se usa en la presente, que también se expresa como "cicloalquilo que es parcial o totalmente halogenado", se refiere a grupos hidrocarburo saturados monocíclicos que tienen de 3 a 6 ("C₃-C₆-halocicloalquilo") miembros del anillo de carbono (como se mencionó anteriormente) en donde algunos o todos los átomos de hidrógeno se reemplazan por átomos de halógeno como se mencionó anteriormente, en particular, flúor, cloro, bromo.

El término "cicloalquil-C₁-C₄-alquilo" se refiere a un grupo C₃-C₆-cicloalquilo ("C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo") que está unido al resto de la molécula mediante un grupo C₁-C₄-alquilo, como se definió anteriormente. Los ejemplos son ciclopropilmetilo, ciclopropil-1-etilo, ciclopropil-2-etilo, ciclopropil-1-propilo, ciclopropil-2-propilo, ciclopropil-3-propilo, ciclopropil-1-butilo, ciclopropil-2-butilo, ciclopropil-3-butilo, ciclopropil-4-butilo, ciclobutilmetilo, ciclobutil-1-etilo, ciclobutil-2-etilo, ciclobutil-1-propilo, ciclobutil-2-propilo, ciclobutil-3-propilo, ciclobutil-1-butilo, ciclobutil-2-butilo, ciclobutil-3-butilo, ciclobutil-4-butilo, ciclopentilmetilo, ciclopentil-1-etilo, ciclopentil-2-etilo, ciclopentil-1-propilo, ciclopentil-2-propilo, ciclopentil-3-propilo, ciclohexilmetilo, ciclohexil-1-etilo, ciclohexil-2-etilo, ciclohexil-1-propilo, ciclohexil-2-propilo y ciclohexil-3-propilo.

El término "C₃-C₆-cicloalquil-metilo" se refiere a un grupo C₃-C₆-cicloalquilo que está unido al resto de la molécula mediante un grupo metileno (CH₂). Los ejemplos son

ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo y ciclohexilmetilo.

El término "C₃-C₆-halocicloalquil-C₁-C₄-alquilo" se refiere a un grupo C₃-C₆-halocicloalquilo, como se definió anteriormente, que está unido al resto de la molécula mediante un grupo C₁-C₄-alquilo, como se definió anteriormente.

El término "C₁-C₂-alcoxi" es un grupo C₁-C₂-alquilo, como se definió anteriormente, unido mediante un átomo de oxígeno. El término "C₁-C₃-alcoxi" es un grupo C₁-C₃-alquilo, como se definió anteriormente, unido mediante un átomo de oxígeno. El término "C₁-C₄-alcoxi" es un grupo C₁-C₄-alquilo, como se definió anteriormente, unido mediante un átomo de oxígeno. El término "C₁-C₆-alcoxi" es un grupo C₁-C₆-alquilo, como se definió anteriormente, unido mediante un átomo de oxígeno. C₁-C₂-alcoxi es metoxi o etoxi. C₁-C₃-alcoxi también es, por ejemplo, n-propoxi y 1-metiletoxí (isopropoxi). C₁-C₄-alkoxi también es, por ejemplo, butoxi, 1-metilpropoxi (sec-butoxi), 2-metilpropoxi (isobutoxi) o 1,1-dimetiletoxí (ter-butoxi). C₁-C₆-alcoxi también es, por ejemplo, pentoxi, 1-metilbutoxi, 2-metilbutoxi, 3-metilbutoxi, 1,1-dimetilpropoxi, 1,2-dimetilpropoxi, 2,2-dimetilpropoxi, 1-etilpropoxi, hexoxi, 1-metilpentoxi, 2-metilpentoxi, 3-metilpentoxi, 4-metilpentoxi, 1,1-dimetilbutoxi, 1,2-dimetilbutoxi, 1,3-dimetilbutoxi, 2,2-dimetilbutoxi, 2,3-dimetilbutoxi, 3,3-dimetilbutoxi, 1-etilbutoxi, 2-etilbutoxi, 1,1,2-trimetilpropoxi, 1,2,2-trimetilpropoxi, 1-etil-1-metilpropoxi o 1-etil-2-metilpropoxi.

El término "C₁-C₂-haloalcoxi" es un grupo C₁-C₂-haloalquilo, como se definió anteriormente, unido mediante un átomo de oxígeno. El término "C₁-C₃-haloalcoxi" es un grupo C₁-C₃-haloalquilo, como se definió anteriormente, unido mediante un átomo de oxígeno. El término "C₁-C₄-haloalcoxi" es un grupo C₁-C₄-haloalquilo, como se definió anteriormente, unido mediante un átomo de oxígeno. El término "C₁-C₆-haloalcoxi" es un grupo C₁-C₆-haloalquilo, como se definió anteriormente, unido mediante un átomo de oxígeno. C₁-C₂-haloalcoxi es, por ejemplo, OCH₂F, OCHF₂, OCF₃, OCH₂Cl, OCHCl₂, OCCl₃, clorofluorometoxi, diclorofluorometoxi, clorodifluorometoxi, 2-fluoroetoxi, 2-cloroetoxi, 2-bromoetoxi, 2-iodoetoxi, 2,2-difluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2-fluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, 2,2-dicloro-2-fluoroetoxi, 2,2,2-tricloroetoxi o OC₂F₅. C₁-C₃-haloalcoxi también es, por ejemplo, 2-fluoropropoxi, 3-fluoropropoxi, 2,2-difluoropropoxi, 2,3-difluoropropoxi, 2-cloropropoxi, 3-cloropropoxi, 2,3-dicloropropoxi, 2-bromopropoxi, 3-bromopropoxi, 3,3,3-trifluoropropoxi, 3,3,3-tricloropropoxi, OCH₂-C₂F₅, OCF₂-C₂F₅, 1-(CH₂F)-2-fluoroetoxi, 1-(CH₂Cl)-2-cloroetoxi o 1-(CH₂Br)-2-bromoetoxi. C₁-C₄-haloalcoxi también es, por ejemplo, 4-fluorobutoxi, 4-clorobutoxi, 4-bromobutoxi o nonafluorobutoxi. C₁-C₆-

haloalcoxi también es, por ejemplo, 5-fluoropentoxi, 5-cloropentoxi, 5-bromopentoxi, 5-iodopentoxi, undecafluoropentoxi, 6-fluorohexoxi, 6-clorohexoxi, 6-bromohexoxi, 6-iodohexoxi o dodecafluorohexoxi.

Como se usa en la presente, el término "C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo" se refiere a un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada, que tiene de 1 a 4 átomos de carbono, como se definió anteriormente, en donde un átomo de hidrógeno se reemplaza por un grupo C₁-C₄-alcoxi, como se definió anteriormente. Como se usa en la presente, el término "C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alquilo" se refiere a un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada, que tiene de 1 a 4 átomos de carbono, como se definió anteriormente, en donde un átomo de hidrógeno se reemplaza por un grupo C₁-C₆-alcoxi, como se definió anteriormente. Los ejemplos son metoximetilo, etoximetilo, propoximetilo, isopropoximetilo, n-butoximetilo, sec-butoximetilo, isobutoximetilo, ter-butoximetilo, 1-metoxietilo, 1-etoxietilo, 1-propoxietilo, 1-isopropoxietilo, 1-n-butoxietilo, 1-sec-butoxietilo, 1-isobutoxietilo, 1-ter-butoxietilo, 2-metoxietilo, 2-etoxietilo, 2-propoxietilo, 2-isopropoxietilo, 2-n-butoxietilo, 2-sec-butoxietilo, 2-isobutoxietilo, 2-ter-butoxietilo, 1-metoxipropilo, 1-etoxipropilo, 1-propoxipropilo, 1-isopropoxipropilo, 1-n-butoxipropilo, 1-sec-butoxipropilo, 1-isobutoxipropilo, 1-ter-butoxipropilo, 2-metoxipropilo, 2-etoxipropilo, 2-propoxipropilo, 2-isopropoxipropilo, 2-n-butoxipropilo, 2-sec-butoxipropilo, 2-isobutoxipropilo, 2-ter-butoxipropilo, 3-metoxipropilo, 3-etoxipropilo, 3-propoxipropilo, 3-isopropoxipropilo, 3-n-butoxipropilo, 3-sec-butoxipropilo, 3-isobutoxipropilo, 3-ter-butoxipropilo y similares.

Como se usa en la presente, el término "C₁-C₄-alcoxi-metilo" se refiere a metilo, en donde un átomo de hidrógeno se reemplaza por un grupo C₁-C₄-alcoxi, como se definió anteriormente. Como se usa en la presente, el término "C₁-C₆-alcoxi-metilo" se refiere a metilo, en donde un átomo de hidrógeno se reemplaza por un grupo C₁-C₆-alcoxi, como se definió anteriormente. Los ejemplos son metoximetilo, etoximetilo, propoximetilo, isopropoximetilo, n-butoximetilo, sec-butoximetilo, isobutoximetilo, ter-butoximetilo, pentiloximetilo, hexiloximetilo y similares.

C₁-C₆-haloalcoxi-C₁-C₄-alquilo es un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada, que tiene de 1 a 4 átomos de carbono, en donde uno de los átomos de hidrógeno se reemplaza por un grupo C₁-C₆-alcoxi y en donde al menos uno, por ejemplo, 1, 2, 3, 4, o todos los átomos de hidrógeno restantes (ya sea en la porción alcoxi, en la porción alquilo o en ambas) se reemplazan por átomos de halógeno. C₁-C₄-haloalcoxi-C₁-C₄-alquilo es un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada, que tiene de 1 a 4 átomos de carbono, en donde uno de los átomos de hidrógeno se reemplaza

por un grupo C₁-C₄-alcoxi y en donde al menos uno, por ejemplo, 1, 2, 3, 4, o todos los átomos de hidrógeno restantes (ya sea en la porción alcoxi, en la porción alquilo o en ambas) se reemplazan por átomos de halógeno. Los ejemplos son difluorometoximetilo (CHF₂OCH₂), trifluorometoximetilo, 1-difluorometoxietilo, 1-trifluorometoxietilo, 2-difluorometoxietilo, 2-trifluorometoxietilo, difluoro-metoxi-metilo (CH₃OCF₂), 1,1-difluoro-2-metoxietilo, 2,2-difluoro-2-metoxietilo y similares.

El término "C₁-C₂-alquiltio" es un grupo C₁-C₂-alquilo, como se definió anteriormente, unido mediante un átomo de azufre. El término "C₁-C₃-alquiltio" es un grupo C₁-C₃-alquilo, como se definió anteriormente, unido mediante un átomo de azufre. El término "C₁-C₄-alquiltio" es un grupo C₁-C₄-alquilo, como se definió anteriormente, unido mediante un átomo de azufre. El término "C₁-C₆-alquiltio" es un grupo C₁-C₆-alquilo, como se definió anteriormente, unido mediante un átomo de azufre. C₁-C₂-alquiltio es metiltio o etiltio. C₁-C₃-alquiltio también es, por ejemplo, n-propiltio o 1-metiletiltio (isopropiltio). C₁-C₄-alquiltio también es, por ejemplo, butiltio, 1-metilpropiltio (sec-butiltio), 2-metilpropiltio (isobutiltio) o 1,1-dimetiletiltio (ter-butiltio). C₁-C₆-alquiltio también es, por ejemplo, pentiltio, 1-metilbutiltio, 2-metilbutiltio, 3-metilbutiltio, 1,1-dimetilpropiltio, 1,2-dimetilpropiltio, 2,2-dimetilpropiltio, 1-etilpropiltio, hexiltio, 1-metilpentiltio, 2-metilpentiltio, 3-metilpentiltio, 4-metilpentiltio, 1,1-dimetilbutiltio, 1,2-dimetilbutiltio, 1,3-dimetilbutiltio, 2,2-dimetilbutiltio, 2,3-dimetilbutiltio, 3,3-dimetilbutiltio, 1-etilbutiltio, 2-etilbutiltio, 1,1,2-trimetilpropiltio, 1,2,2-trimetilpropiltio, 1-etil-1-metilpropiltio o 1-etil-2-metilpropiltio.

El término "C₁-C₂-haloalquiltio" es un grupo C₁-C₂-haloalquilo, como se definió anteriormente, unido mediante un átomo de azufre. El término "C₁-C₃-haloalquiltio" es un grupo C₁-C₃-haloalquilo, como se definió anteriormente, unido mediante un átomo de azufre. El término "C₁-C₄-haloalquiltio" es un grupo C₁-C₄-haloalquilo, como se definió anteriormente, unido mediante un átomo de azufre. El término "C₁-C₆-haloalquiltio" es un grupo C₁-C₆-haloalquilo, como se definió anteriormente, unido mediante un átomo de azufre. C₁-C₂-haloalquiltio es, por ejemplo, SCH₂F, SCHF₂, SCF₃, SCH₂Cl, SCHCl₂, SCl₃, clorofluorometiltio, diclorofluorometiltio, clorodifluorometiltio, 2-fluoroetiltio, 2-cloroetiltio, 2-bromoetiltio, 2-iodoetiltio, 2,2-difluoroetiltio, 2,2,2-trifluoroetiltio, 2-cloro-2-fluoroetiltio, 2-cloro-2,2-difluoroetiltio, 2,2-dicloro-2-fluoroetiltio, 2,2,2-tricloroetiltio o SC₂F₅. C₁-C₃-haloalquiltio también es, por ejemplo, 2-fluoropropiltio, 3-fluoropropiltio, 2,2-difluoropropiltio, 2,3-difluoropropiltio, 2-cloropropiltio, 3-cloropropiltio, 2,3-dicloropropiltio, 2-bromopropiltio, 3-bromopropiltio, 3,3,3-trifluoropropiltio, 3,3,3-tricloropropiltio, SCH₂-C₂F₅, SCF₂-C₂F₅, 1-(CH₂F)-2-

fluoroetiltio, 1-(CH₂Cl)-2-cloroetiltio o 1-(CH₂Br)-2-bromoetiltio. C₁-C₄-haloalquiltio también es, por ejemplo, 4-fluorobutiltio, 4-clorobutiltio, 4-bromobutiltio o nonafluorobutiltio. C₁-C₆-haloalquiltio también es, por ejemplo, 5-fluoropentiltio, 5-cloropentiltio, 5-bromopentiltio, 5-iodopentiltio, undecafluoropentiltio, 6-fluorohexiltio, 6-clorohexiltio, 6-bromohexiltio, 6-iodohexiltio o dodecafluorohexiltio.

El término "C₁-C₂-alquilsulfinilo" es un grupo C₁-C₂-alquilo, como se definió anteriormente, unido mediante un grupo sulfinilo [S(O)]. El término "C₁-C₄-alquilsulfinilo" es un grupo C₁-C₄-alquilo, como se definió anteriormente, unido mediante un grupo sulfinilo [S(O)]. El término "C₁-C₆-alquilsulfinilo" es un grupo C₁-C₆-alquilo, como se definió anteriormente, unido mediante un grupo sulfinilo [S(O)]. C₁-C₂-alquilsulfinilo es metilsulfinilo o etilsulfinilo. C₁-C₄-alquilsulfinilo también es, por ejemplo, n-propilsulfinilo, 1-metiletilsulfinilo (isopropilsulfinilo), butilsulfinilo, 1-metilpropilsulfinilo (sec-butilsulfinilo), 2-metilpropilsulfinilo (isobutilsulfinilo) o 1,1-dimetiletilsulfinilo (ter-butilsulfinilo). C₁-C₆-alquilsulfinilo también es, por ejemplo, pentilsulfinilo, 1-metilbutilsulfinilo, 2-metilbutilsulfinilo, 3-metilbutilsulfinilo, 1,1-dimetilpropilsulfinilo, 1,2-dimetilpropilsulfinilo, 2,2-dimetilpropilsulfinilo, 1-etilpropilsulfinilo, hexilsulfinilo, 1-metilpentilsulfinilo, 2-metilpentilsulfinilo, 3-metilpentilsulfinilo, 4-metilpentilsulfinilo, 1,1-dimetilbutilsulfinilo, 1,2-dimetilbutilsulfinilo, 1,3-dimetilbutilsulfinilo, 2,2-dimetilbutilsulfinilo, 2,3-dimetilbutilsulfinilo, 3,3-dimetilbutilsulfinilo, 1-etilbutilsulfinilo, 2-etilbutilsulfinilo, 1,1,2-trimetilpropilsulfinilo, 1,2,2-trimetilpropilsulfinilo, 1-etil-1-metilpropilsulfinilo o 1-etil-2-metilpropilsulfinilo.

El término "C₁-C₂-haloalquilsulfinilo" es un grupo C₁-C₂-haloalquilo, como se definió anteriormente, unido mediante un grupo sulfinilo [S(O)]. El término "C₁-C₄-haloalquilsulfinilo" es un grupo C₁-C₄-haloalquilo, como se definió anteriormente, unido mediante un grupo sulfinilo [S(O)]. El término "C₁-C₆-haloalquilsulfinilo" es un grupo C₁-C₆-haloalquilo, como se definió anteriormente, unido mediante un grupo sulfinilo [S(O)]. C₁-C₂-haloalquilsulfinilo es, por ejemplo, S(O)CH₂F, S(O)CHF₂, S(O)CF₃, S(O)CH₂Cl, S(O)CHCl₂, S(O)CCl₃, clorofluorometilsulfinilo, diclorofluorometilsulfinilo, clorodifluorometilsulfinilo, 2-fluoroetilsulfinilo, 2-cloroetilsulfinilo, 2-bromoetilsulfinilo, 2-iodoetilsulfinilo, 2,2-difluoroetilsulfinilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfinilo, 2-cloro-2-fluoroetilsulfinilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilsulfinilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilsulfinilo, 2,2,2-tricloroetilsulfinilo o S(O)C₂F₅. C₁-C₄-haloalquilsulfinilo también es, por ejemplo, 2-fluoropropilsulfinilo, 3-fluoropropilsulfinilo, 2,2-difluoropropilsulfinilo, 2,3-difluoropropilsulfinilo, 2-cloropropilsulfinilo, 3-cloropropilsulfinilo,

2,3-dicloropropilsulfinilo, 2-bromopropilsulfinilo, 3-bromopropilsulfinilo, 3,3,3-trifluoropropilsulfinilo, 3,3,3-tricloropropilsulfinilo, $S(O)CH_2-C_2F_5$, $S(O)CF_2-C_2F_5$, 1-(CH_2F)-2-fluoroetilsulfinilo, 1-(CH_2Cl)-2-cloroetilsulfinilo, 1-(CH_2Br)-2-bromoetilsulfinilo, 4-fluorobutilsulfinilo, 4-clorobutilsulfinilo, 4-bromobutilsulfinilo o nonafluorobutilsulfinilo. C_1-C_6 -haloalquilsulfinilo también es, por ejemplo, 5-fluoropentilsulfinilo, 5-cloropentilsulfinilo, 5-bromopentilsulfinilo, 5-iodopentilsulfinilo, undecafluoropentilsulfinilo, 6-fluorohexilsulfinilo, 6-clorohexilsulfinilo, 6-bromohexilsulfinilo, 6-iodohexilsulfinilo o dodecafluorohexilsulfinilo.

El término " C_1-C_2 -alquilsulfonilo" es un grupo C_1-C_2 -alquilo, como se definió anteriormente, unido mediante un grupo sulfonilo $[S(O)_2]$. El término " C_1-C_3 -alquilsulfonilo" es un grupo C_1-C_3 -alquilo, como se definió anteriormente, unido mediante un grupo sulfonilo $[S(O)_2]$. El término " C_1-C_4 -alquilsulfonilo" es un grupo C_1-C_4 -alquilo, como se definió anteriormente, unido mediante un grupo sulfonilo $[S(O)_2]$. El término " C_1-C_6 -alquilsulfonilo" es un grupo C_1-C_6 -alquilo, como se definió anteriormente, unido mediante un grupo sulfonilo $[S(O)_2]$. C_1-C_2 -alquilsulfonilo es metilsulfonilo o etilsulfonilo. C_1-C_3 -alquilsulfonilo también es, por ejemplo, n-propilsulfonilo o 1-metiletilsulfonilo (isopropilsulfonilo). C_1-C_4 -alquilsulfonilo también es, por ejemplo, butilsulfonilo, 1-metilpropilsulfonilo (sec-butilsulfonilo), 2-metilpropilsulfonilo (isobutilsulfonilo) o 1,1-dimetiletilsulfonilo (ter-butilsulfonilo). C_1-C_6 -alquilsulfonilo también es, por ejemplo, pentilsulfonilo, 1-metilbutilsulfonilo, 2-metilbutilsulfonilo, 3-metilbutilsulfonilo, 1,1-dimetilpropilsulfonilo, 1,2-dimetilpropilsulfonilo, 2,2-dimetilpropilsulfonilo, 1-etilpropilsulfonilo, hexilsulfonilo, 1-metilpentilsulfonilo, 2-metilpentilsulfonilo, 3-metilpentilsulfonilo, 4-metilpentilsulfonilo, 1,1-dimetilbutilsulfonilo, 1,2-dimetilbutilsulfonilo, 1,3-dimetilbutilsulfonilo, 2,2-dimetilbutilsulfonilo, 2,3-dimetilbutilsulfonilo, 3,3-dimetilbutilsulfonilo, 1-etilbutilsulfonilo, 2-etilbutilsulfonilo, 1,1,2-trimetilpropilsulfonilo, 1,2,2-trimetilpropilsulfonilo, 1-etil-1-metilpropilsulfonilo o 1-etil-2-metilpropilsulfonilo.

El término " C_1-C_2 -haloalquilsulfonilo" es un grupo C_1-C_2 -haloalquilo, como se definió anteriormente, unido mediante un grupo sulfonilo $[S(O)_2]$. El término " C_1-C_3 -haloalquilsulfonilo" es un grupo C_1-C_3 -haloalquilo, como se definió anteriormente, unido mediante un grupo sulfonilo $[S(O)_2]$. El término " C_1-C_4 -haloalquilsulfonilo" es un grupo C_1-C_4 -haloalquilo, como se definió anteriormente, unido mediante un grupo sulfonilo $[S(O)_2]$. El término " C_1-C_6 -haloalquilsulfonilo" es un grupo C_1-C_6 -haloalquilo, como se definió anteriormente, unido mediante un grupo sulfonilo $[S(O)_2]$. C_1-C_2 -haloalquilsulfonilo es, por ejemplo, $S(O)_2CH_2F$, $S(O)_2CHF_2$, $S(O)_2CF_3$, $S(O)_2CH_2Cl$,

S(O)₂CHCl₂, S(O)₂CCl₃, clorofluorometilsulfonilo, diclorofluorometilsulfonilo, clorodifluorometilsulfonilo, 2-fluoroetilsulfonilo, 2-cloroetilsulfonilo, 2-bromoetilsulfonilo, 2-iodoetilsulfonilo, 2,2-difluoroetilsulfonilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfonilo, 2-cloro-2-fluoroetilsulfonilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilsulfonilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilsulfonilo, 2,2,2-tricloroetilsulfonilo o S(O)₂C₂F₅. C₁-C₃-haloalquilsulfonilo también es, por ejemplo, 2-fluoropropilsulfonilo, 3-fluoropropilsulfonilo, 2,2-difluoropropilsulfonilo, 2,3-difluoropropilsulfonilo, 2-cloropropilsulfonilo, 3-cloropropilsulfonilo, 2,3-dicloropropilsulfonilo, 2-bromopropilsulfonilo, 3-bromopropilsulfonilo, 3,3,3-trifluoropropilsulfonilo, 3,3,3-tricloropropilsulfonilo, S(O)₂CH₂-C₂F₅, S(O)₂CF₂-C₂F₅, 1-(CH₂F)-2-fluoroetilsulfonilo, 1-(CH₂Cl)-2-cloroetilsulfonilo o 1-(CH₂Br)-2-bromoetilsulfonilo. C₁-C₄-haloalquilsulfonilo también es, por ejemplo, 4-fluorobutilsulfonilo, 4-clorobutilsulfonilo, 4-bromobutilsulfonilo o nonafluorobutilsulfonilo. C₁-C₆-haloalquilsulfonilo también es, por ejemplo, 5-fluoropentilsulfonilo, 5-cloropentilsulfonilo, 5-bromopentilsulfonilo, 5-iodopentilsulfonilo, undecafluoropentilsulfonilo, 6-fluorohexilsulfonilo, 6-clorohexilsulfonilo, 6-bromohexilsulfonilo, 6-iodohexilsulfonilo o dodecafluorohexilsulfonilo.

El término "alquilcarbonilo" es un grupo C₁-C₆-alquilo ("C₁-C₆-alquilcarbonilo"), preferentemente, un grupo C₁-C₄-alquilo ("C₁-C₄-alquilcarbonilo"), como se definió anteriormente, unido mediante un grupo carbonilo [C(=O)]. Los ejemplos son acetilo (metilcarbonilo), propionilo (etilcarbonilo), propilcarbonilo, isopropilcarbonilo, n-butilcarbonilo y similares.

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

El término "alcoxycarbonilo" es un grupo C₁-C₆-alcoxi ("C₁-C₆-alcoxycarbonilo"), preferentemente, un grupo C₁-C₄-alcoxi ("C₁-C₄-alcoxycarbonilo"), como se definió anteriormente, unido mediante un grupo carbonilo [C(=O)]. Los ejemplos son metoxycarbonilo, etoxycarbonilo, propoxycarbonilo, isopropoxycarbonilo, n-butoxycarbonilo y similares.

El término "haloalcoxycarbonilo" es C₁-C₆-haloalcoxi ("C₁-C₆-haloalcoxycarbonilo"), preferentemente, un grupo C₁-C₄-haloalcoxi ("C₁-C₄-haloalcoxycarbonilo"), como se definió anteriormente, unido mediante un grupo carbonilo [C(=O)]. Los ejemplos son trifluorometoxycarbonilo, 2,2,2-

trifluoroetoxicarbonilo y similares.

El término " C_1 - C_4 -alquilamino" es un grupo $-N(H)C_1-C_4$ -alquilo. Los ejemplos son metilamino, etilamino, propilamino, isopropilamino, butilamino y similares.

El término "di- $(C_1$ - C_4 -alquil)amino" es un grupo $-N(C_1-C_4$ -alquilo)₂. Los ejemplos son dimetilamino, dietilamino, etilmetilamino, dipropilamino, diisopropilamino, metilpropilamino, metilisopropilamino, etilpropilamino, etilisopropilamino, dibutilamino y similares.

El término " C_1 - C_4 -alquilaminocarbonilo" es un grupo $-C(O)N(H)C_1-C_4$ -alquilo. Algunos ejemplos son metilaminocarbonilo, etilaminocarbonilo, propilaminocarbonilo, isopropilaminocarbonilo, butilaminocarbonilo y similares.

La expresión "di- $(C_1$ - C_4 -alquil)aminocarbonilo" es un grupo $-C(O)-N(C_1-C_4$ -alquilo)₂. Algunos ejemplos son dimetilaminocarbonilo, dietilaminocarbonilo, etilmetilaminocarbonilo, dipropilaminocarbonilo, diisopropilaminocarbonilo, metilpropilaminocarbonilo, metilisopropilaminocarbonilo, etilpropilaminocarbonilo, etilisopropilaminocarbonilo, dibutilaminocarbonilo y similares.

Fenil- C_1 - C_4 -alquilo es un grupo C_1 - C_4 -alquilo, como se definió anteriormente, en donde uno de los átomos de hidrógeno se reemplaza por un anillo de fenilo. Los ejemplos son bencilo, fenil-1-etilo y fenetilo (fenil-2-etilo).

La expresión "anillos heterocíclicos saturados, parcialmente insaturados o totalmente insaturados de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros, que contienen 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados de N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo" indica un anillo heteromonocíclico saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados de N, O, S, NO, SO y SO₂, como miembros del anillo.

Los anillos insaturados contienen, al menos, un enlace doble C-C y/o C-N y/o N-N. Los anillos totalmente insaturados contienen tantos enlaces dobles C-C y/o C-N y/o N-N conjugados como lo que permita el tamaño del anillo y el tipo de los átomos del anillo. Los anillos parcialmente insaturados contienen enlaces dobles C-C y/o C-N y/o N-N menos conjugados que lo máximo que permite el tamaño del anillo y el tipo de los átomos del anillo. Los anillos heterocíclicos totalmente insaturados de 5 o 6 miembros son generalmente aromáticos (excepto, por ejemplo, los anillos insaturados de 5 miembros con dos átomos del anillo de oxígeno y/o azufre y anillos insaturados de 6 miembros con uno o más átomos del anillo de oxígeno y/o azufre). Los anillos de 7 miembros no pueden ser aromáticos; son homoaromáticos (3 enlaces dobles). El

anillo heterocíclico se puede unir al resto de la molécula mediante un miembro del anillo de carbono o mediante un miembro del anillo de nitrógeno. De hecho, el anillo heterocíclico contiene al menos un átomo del anillo de carbono. Si el anillo contiene más de un átomo del anillo de O, estos no son adyacentes.

En el caso del anillo A, la conjugación máxima no solo se determina por el tamaño del anillo, sino también por el hecho de que el átomo del anillo de nitrógeno es un punto de unión al grupo $-CR^1R^2$ y por el enlace exocíclico $=N$. Por lo tanto, el anillo A totalmente insaturado de 6 miembros contiene solo 2 enlaces dobles; en el caso de un átomo de oxígeno o azufre como miembro del anillo, un anillo A totalmente insaturado de 6 miembros contiene solo un enlace doble.

Los ejemplos de un anillo heterocíclico saturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros incluyen: Oxiranilo, tiiranilo, aziridinilo, oxetanilo, tietanilo, 1-oxotietanilo, 1,1-dioxotietanilo, azetidinilo, tetrahidrofuran-2-ilo, tetrahidrofuran-3-ilo, tetrahidrotien-2-ilo, tetrahidrotien-3-ilo, pirrolidin-1-ilo, pirrolidin-2-ilo, pirrolidin-3-ilo, pirazolidin-1-ilo, pirazolidin-3-ilo, pirazolidin-4-ilo, pirazolidin-5-ilo, imidazolidin-1-ilo, imidazolidin-2-ilo, imidazolidin-4-ilo, oxazolidin-2-ilo, oxazolidin-3-ilo, oxazolidin-4-ilo, oxazolidin-5-ilo, isoxazolidin-2-ilo, isoxazolidin-3-ilo, isoxazolidin-4-ilo, isoxazolidin-5-ilo, tiazolidin-2-ilo, tiazolidin-3-ilo, tiazolidin-4-ilo, tiazolidin-5-ilo, isotiazolidin-2-ilo, isotiazolidin-3-ilo, isotiazolidin-4-ilo, isotiazolidin-5-ilo, 1,2,4-oxadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-oxadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-triazolidin-3-ilo, 1,3,4-oxadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-tiadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-triazolidin-1-ilo, 1,3,4-triazolidin-2-ilo, 1,2,3,4-tetrazolidin-1-ilo, 1,2,3,4-tetrazolidin-2-ilo, 1,2,3,4-tetrazolidin-5-ilo, 2-tetrahidropiranilo, 4-tetrahidropiranilo, 1,3-dioxan-5-ilo, 1,4-dioxan-2-ilo, piperidin-1-ilo, piperidin-2-ilo, piperidin-3-ilo, piperidin-4-ilo, hexahidropiridazin-3-ilo, hexahidropiridazin-4-ilo, hexahidropirimidin-2-ilo, hexahidropirimidin-4-ilo, hexahidropirimidin-5-ilo, piperazin-1-ilo, piperazin-2-ilo, 1,3,5-hexahidrotiazin-1-ilo, 1,3,5-hexahidrotiazin-2-ilo y 1,2,4-hexahidrotiazin-3-ilo, morfolin-2-ilo, morfolin-3-ilo, morfolin-4-ilo, tiomorfolin-2-ilo, tiomorfolin-3-ilo, tiomorfolin-4-ilo, 1-oxotiomorfolin-2-ilo, 1-oxotiomorfolin-3-ilo, 1-oxotiomorfolin-4-ilo, 1,1-dioxotiomorfolin-2-ilo, 1,1-dioxotiomorfolin-3-ilo, 1,1-dioxotiomorfolin-4-ilo, azepan-1-, -2-, -3- o -4-ilo, oxepan-2-, -3-, -4- o -5-ilo, hexahidro-1,3-diazepinilo, hexahidro-1,4-diazepinilo, hexahidro-1,3-oxazepinilo, hexahidro-1,4-oxazepinilo, hexahidro-1,3-dioxepinilo, hexahidro-1,4-dioxepinilo y similares.

Los ejemplos de un anillo heterocíclico parcialmente insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros incluyen: 2,3-dihidrofur-2-ilo, 2,3-dihidrofur-3-ilo, 2,4-dihidrofur-2-ilo, 2,4-

dihidrofur-3-ilo, 2,3-dihidrotien-2-ilo, 2,3-dihidrotien-3-ilo, 2,4-dihidrotien-2-ilo, 2,4-dihidrotien-3-ilo, 2-pirrolin-2-ilo, 2-pirrolin-3-ilo, 3-pirrolin-2-ilo, 3-pirrolin-3-ilo, 2-isoxazolin-3-ilo, 3-isoxazolin-3-ilo, 4-isoxazolin-3-ilo, 2-isoxazolin-4-ilo, 3-isoxazolin-4-ilo, 4-isoxazolin-4-ilo, 2-isoxazolin-5-ilo, 3-isoxazolin-5-ilo, 4-isoxazolin-5-ilo, 2-isotiazolin-3-ilo, 3-isotiazolin-3-ilo, 4-isotiazolin-3-ilo, 2-isotiazolin-4-ilo, 3-isotiazolin-4-ilo, 4-isotiazolin-4-ilo, 2-isotiazolin-5-ilo, 3-isotiazolin-5-ilo, 4-isotiazolin-5-ilo, 2,3-dihidropirazol-1-ilo, 2,3-dihidropirazol-2-ilo, 2,3-dihidropirazol-3-ilo, 2,3-dihidropirazol-4-ilo, 2,3-dihidropirazol-5-ilo, 3,4-dihidropirazol-1-ilo, 3,4-dihidropirazol-3-ilo, 3,4-dihidropirazol-4-ilo, 3,4-dihidropirazol-5-ilo, 4,5-dihidropirazol-1-ilo, 4,5-dihidropirazol-3-ilo, 4,5-dihidropirazol-4-ilo, 4,5-dihidropirazol-5-ilo, 2,3-dihidrooxazol-2-ilo, 2,3-dihidrooxazol-3-ilo, 2,3-dihidrooxazol-4-ilo, 2,3-dihidrooxazol-5-ilo, 3,4-dihidrooxazol-2-ilo, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-4-ilo, 3,4-dihidrooxazol-5-ilo, 3,4-dihidrooxazol-2-ilo, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-4-ilo, 2,3-dihidro-1,2,4-triazol-1-, -2-, -3- o -5-ilo, 4,5-dihidro-1,3,4-triazol-1-, -2-, -4- o -5-ilo, 2,5-dihidro-1,3,4-triazol-1-, -2- o -5-ilo, 4,5-dihidro-1,2,3-triazol-1-, -4- o -5-ilo, 2,5-dihidro-1,2,3-triazol-1-, -2- o -5-ilo, 2,3-dihidro-1,2,3-triazol-1-, -2-, -3-, -4- o -5-ilo, 2,3-dihidro-1,2,3,4-tetrazol-1-, -2-, -3- o -5-ilo, 2,5-dihidro-1,2,3,4-tetrazol-1-, -2- o -5-ilo, 4,5-dihidro-1,2,3,4-tetrazol-1-, -4- o -5-ilo, 2-, 3-, 4-, 5- o 6-di- o tetrahidropiridinilo, 3-di- o tetrahidropiridazinilo, 4-di- o tetrahidropiridazinilo, 2-di- o tetrahidropirimidinilo, 4-di- o tetrahidropirimidinilo, 5-di- o tetrahidropirimidinilo, di- o tetrahidropirazinilo, 1,3,5-di- o tetrahidrotriazin-2-ilo, 1,2,4-di- o tetrahidrotriazin-3-ilo, 2,3,4,5-tetrahidro[1H]azepin-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, 3,4,5,6-tetrahidro[2H]azepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, 2,3,4,7-tetrahidro[1H]azepin-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, 2,3,6,7-tetrahidro[1H]azepin-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, tetrahidrooxepinilo, tales como 2,3,4,5-tetrahidro[1H]oxepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, 2,3,4,7-tetrahidro[1H]oxepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, 2,3,6,7-tetrahidro[1H]oxepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, tetrahidro-1,3-diazepinilo, tetrahidro-1,4-diazepinilo, tetrahidro-1,3-oxazepinilo, tetrahidro-1,4-oxazepinilo, tetrahidro-1,3-dioxepinilo y tetrahidro-1,4-dioxepinilo.

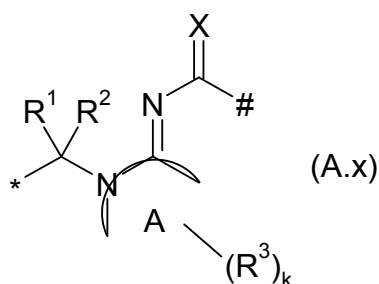
Los ejemplos para un anillo heterocíclico (que incluye aromático) totalmente insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros son anillos heteroaromáticos de 5 o 6 miembros, tales como 2-furilo, 3-furilo, 2-tienilo, 3-tienilo, 1-pirrolilo, 2-pirrolilo, 3-pirrolilo, 1-pirazolilo, 3-pirazolilo, 4-pirazolilo, 5-pirazolilo, 2-oxazolilo, 4-oxazolilo, 5-oxazolilo, 2-tiazolilo, 4-tiazolilo, 5-tiazolilo, 1-imidazolilo, 2-imidazolilo, 4-imidazolilo, 1,3,4-triazol-1-ilo, 1,3,4-triazol-2-ilo, 1,2,3,4-1H-tetrazol-1-ilo, 1,2,3,4-1H-tetrazol-5-ilo, 1,2,3,4-2H-

tetrazol-2-ilo, 1,2,3,4-2H-tetrazol-5-ilo, 2-piridinilo, 3-piridinilo, 4-piridinilo, 1-oxopiridin-2-ilo, 1-oxopiridin-3-ilo, 1-oxopiridin-4-ilo, 3-piridazinilo, 4-piridazinilo, 2-pirimidinilo, 4-pirimidinilo, 5-pirimidinilo, 2-pirazinilo, 1,3,5-triazin-2-ilo, 1,2,4-triazin-3-ilo y 1,2,4-triazin-5-ilo, y también radicales homoaromáticos, tales como 1H-azepina, 1H-[1,3]-diazepina y 1H-[1,4]-diazepina.

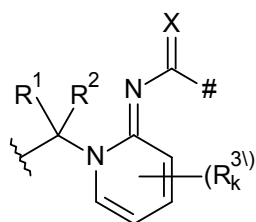
Cuando aparece # en una fórmula que muestra una subestructura de un compuesto de la presente invención, indica el enlace de unión en la molécula restante.

Las observaciones realizadas a continuación con respecto a las formas de realización preferidas de las variables de los compuestos de la Fórmula I, especialmente con respecto a sus sustituyentes A, X, Y, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R^{11a}, R^{11b}, R¹², R¹³, R¹⁴, R¹⁵, k y n, las características del uso y el método de acuerdo con la invención y de la composición de la invención son válidas por sí solas y, en particular, en todas las combinaciones posibles entre sí.

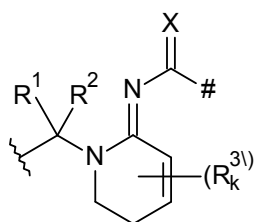
En una forma de realización preferida (forma de realización 1), el anillo A deriva de dihidropiridina, tetrahidropiridina, piperidina, imidazolina, imidazolidina, tiazolina o tiazolidina, por lo que la porción A.x



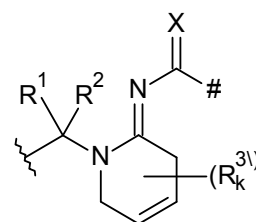
se selecciona de las porciones de las Fórmulas A.a a A.i



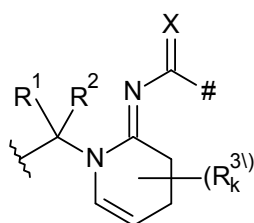
A.a



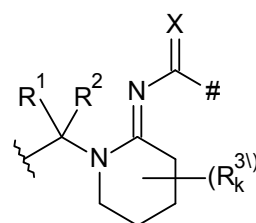
A.b



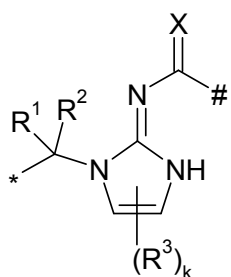
A.c



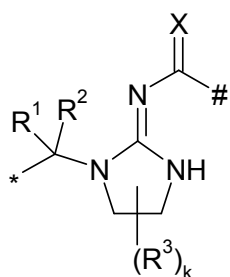
A.d



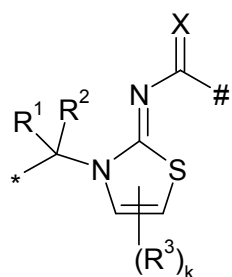
A.e



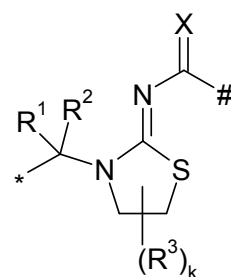
A.f



A.g



A.h



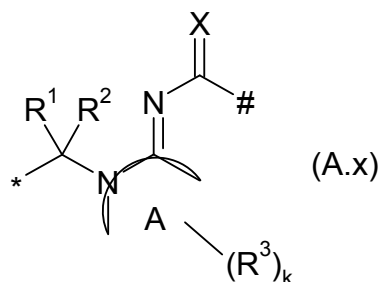
A.i

en donde X, R¹, R², R³ y k tienen uno de los significados generales anteriores o, en particular, uno de los siguientes significados preferidos; siempre que R³ no sea halógeno si está unido a un átomo de nitrógeno;

indica el punto de unión a Y; y

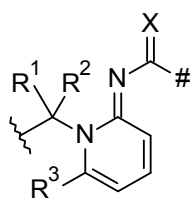
* indica el punto de unión al anillo de 2-cloropirimidin-5-ilo.

Con mayor preferencia (forma de realización 1.1), la porción de la Fórmula A.x

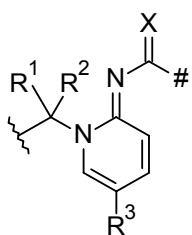


(A.x)

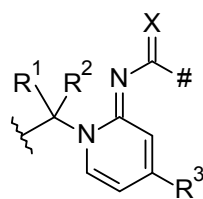
se selecciona de las porciones de las Fórmulas A.1 a A.21:



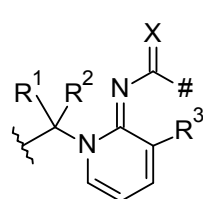
A.1



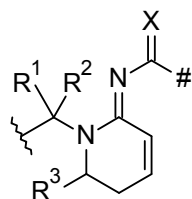
A.2



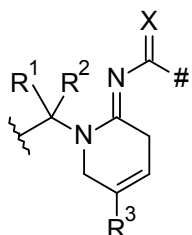
A.3



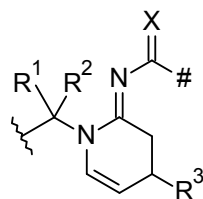
A.4



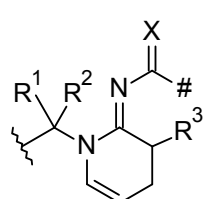
A.5



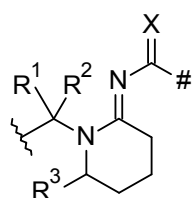
A.6



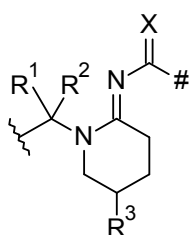
A.7



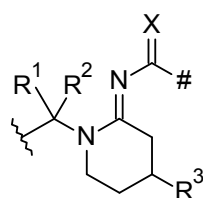
A.8



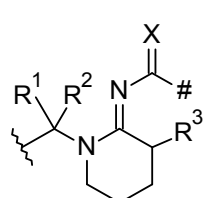
A.9



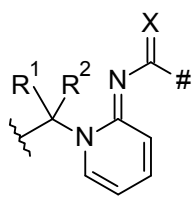
A.10



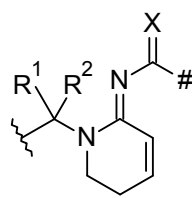
A.11



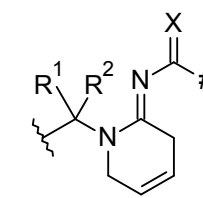
A.12



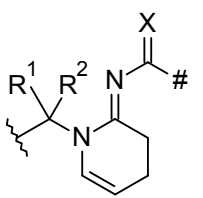
A.13



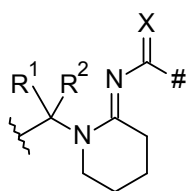
A.14



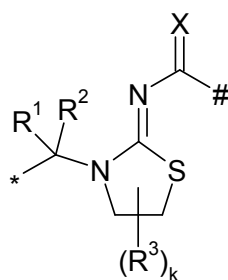
A.15



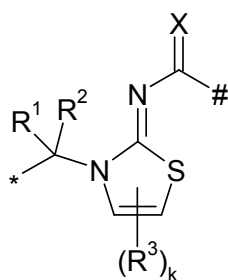
A.16



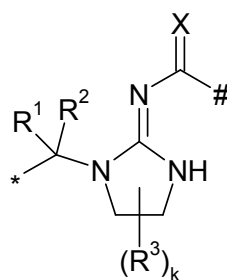
A.17



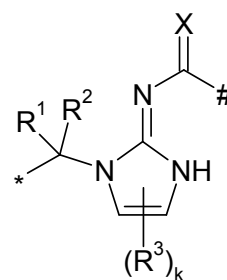
A.18



A.19



A.20



A.21

en donde

indica el punto de unión a Y;

* indica el punto de unión al anillo de 2-cloropirimidin-5-ilo;

X, R¹, R² y R³ tienen uno de los significados generales anteriores o, en particular, uno de los siguientes significados preferidos, en donde si R³ está unido a un átomo de nitrógeno, R³ no es halógeno; y

k es 0, 1 o 2.

En particular (forma de realización 1.1.1), la porción A.x se selecciona de las porciones de las Fórmulas A.1, A.2, A.3, A.4, A.13 y A.19. Específicamente (forma de realización 1.1.1.1), la porción A.x se selecciona de A.13 y A.19.

Preferentemente (forma de realización 1.1.1.2), en A.19 R³ es metilo, y k es 0 o 1.

En una forma de realización (forma de realización 2), Y se selecciona de C₃-C₆-cicloalquilo que tiene uno o más sustituyentes R⁴, en donde R⁴ tiene uno de los significados generales anteriores o, en particular, uno de los siguientes significados preferidos.

Preferentemente (forma de realización 2.1), Y se selecciona de C₃-C₆-cicloalquilo que tiene un sustituyente R⁴, en donde R⁴ es ciano. Con mayor preferencia (forma de realización 2.1.1), Y se selecciona de C₃-C₆-cicloalquilo que tiene un sustituyente R⁴, en donde R⁴ es ciano y A es como se define en la forma de realización 1, 1.1, 1.1.1, 1.1.1.1 o 1.1.1.2.

En particular (forma de realización 2.2), Y es ciclopropilo que tiene un sustituyente R⁴, en donde R⁴ es ciano. Más en particular (forma de realización 2.2.1), Y es ciclopropilo que tiene un sustituyente R⁴, en donde R⁴ es ciano, y A es como se define en la forma de realización 1, 1.1, 1.1.1, 1.1.1.1 o 1.1.1.2.

Específicamente (forma de realización 2.3), Y es 1-cianociclopropilo. Más específicamente (forma de realización 2.3.1), Y es 1-cianociclopropilo, y A es como se define en la forma de realización 1, 1.1, 1.1.1, 1.1.1.1 o 1.1.1.2.

En otra forma de realización (forma de realización 3), Y se selecciona de C₁-C₆-alquilo que tiene uno o más sustituyentes R⁵, en donde R⁵ tiene uno de los significados generales anteriores o, en particular, uno de los siguientes significados preferidos.

Preferentemente (forma de realización 3.1), Y se selecciona de C₁-C₄-alquilo que tiene un sustituyente R⁵, en donde R⁵ es ciano. Con mayor preferencia (forma de realización 3.1.1), Y se selecciona de C₁-C₄-alquilo que tiene un sustituyente R⁵, en donde R⁵ es ciano, y A es como se define en la forma de realización 1, 1.1, 1.1.1, 1.1.1.1 o 1.1.1.2.

En particular (forma de realización 3.2), Y es metilo que tiene un sustituyente R⁵, en donde R⁵ es ciano. Más en particular (forma de realización 3.2.1), Y es metilo que tiene un sustituyente R⁵, en donde R⁵ es ciano, y A es como se define en la forma de realización 1, 1.1, 1.1.1, 1.1.1.1 o 1.1.1.2.

Específicamente (forma de realización 3.3), Y es CH₂CN. Más específicamente (forma de realización 3.3.1), Y es CH₂CN, y A es como se define en la forma de realización 1, 1.1, 1.1.1, 1.1.1.1 o 1.1.1.2

Aun en otra forma de realización (forma de realización 4), Y se selecciona de un radical de la Fórmula -C(R⁶)=N-O-R⁷, en donde R⁶ y R⁷ tienen uno de los significados generales anteriores.

Preferentemente (forma de realización 4.1), Y es un radical de la Fórmula -C(R⁶)=N-O-R⁷; en donde

R⁶ se selecciona de hidrógeno y C₁-C₄-alquilo; y

R⁷ se selecciona de C₁-C₆-alquilo y C₁-C₆-haloalquilo.

Con mayor preferencia (forma de realización 4.1.1), Y es un radical de la Fórmula -C(R⁶)=N-O-R⁷; en donde

R⁶ se selecciona de hidrógeno y C₁-C₄-alquilo; y

R⁷ se selecciona de C₁-C₆-alquilo y C₁-C₆-haloalquilo;

y A es como se define en la forma de realización 1, 1.1, 1.1.1, 1.1.1.1 o 1.1.1.2

En particular (forma de realización 4.2), Y es un radical de la Fórmula -C(R⁶)=N-O-R⁷; en donde

R⁶ se selecciona de hidrógeno y C₁-C₄-alquilo; y

R⁷ es C₁-C₄-alquilo;

Más en particular (forma de realización 4.2.1), Y es un radical de la Fórmula -C(R⁶)=N-O-R⁷; en donde

R⁶ se selecciona de hidrógeno y C₁-C₄-alquilo; y

R⁷ es C₁-C₄-alquilo;

y A es como se define en la forma de realización 1, 1.1, 1.1.1, 1.1.1.1 o 1.1.1.2

Específicamente (forma de realización 4.3), Y es $-\text{CH}=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_3$. Más específicamente (forma de realización 4.3.1), Y es $-\text{CH}=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_3$, y A es como se define en la forma de realización 1, 1.1, 1.1.1, 1.1.1.1 o 1.1.1.2.

En una forma de realización preferida (forma de realización 5),

R¹ y R², independientemente entre sí, se seleccionan del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo y C₃-C₆-halocicloalquilo;

R¹ y R² forman, junto con el átomo de carbono al que están unidos, un anillo carbocíclico saturado de 3, 4 o 5 miembros.

Con mayor preferencia (forma de realización 5.1),

R¹ y R², independientemente entre sí, se seleccionan del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo y C₃-C₆-halocicloalquilo; o

R¹ y R² forman, junto con el átomo de carbono al que están unidos, un anillo carbocíclico saturado de 3, 4 o 5 miembros; y

A e Y son como se definen en la forma de realización 1, 1.1, 1.1.1, 1.1.1.1, 1.1.1.2, 2, 2.1, 2.1.1, 2.2, 2.2.1, 2.3, 2.3.1, 3, 3.1, 3.1.1, 3.2, 3.2.1, 3.3, 3.3.1, 4, 4.1, 4.1.1, 4.2, 4.2.1, 4.3 y 4.3.1.

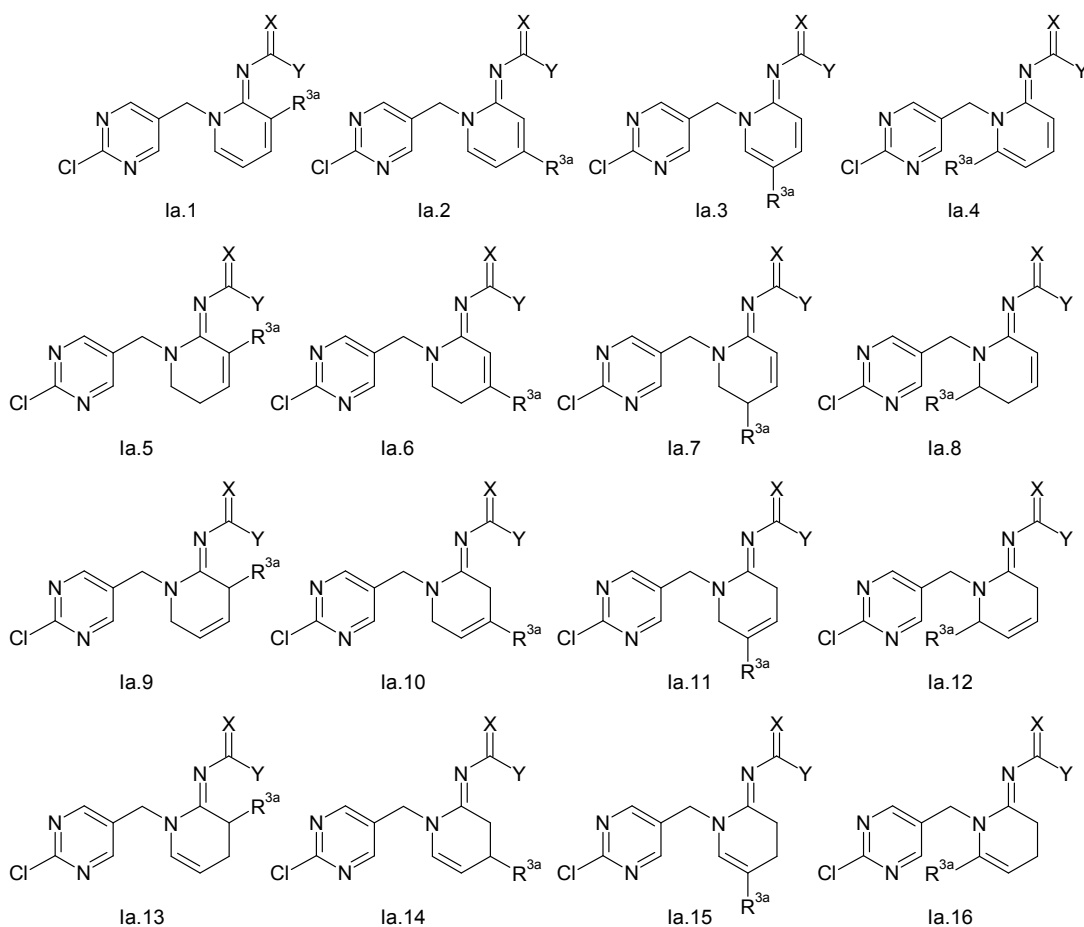
En particular (forma de realización 5.2), R¹ y R² son hidrógeno. Mas en particular (forma de realización 5.2.1), R¹ y R² son hidrógeno, y A e Y son como se define en la forma de realización 1, 1.1, 1.1.1, 1.1.1.1, 1.1.1.2, 2, 2.1, 2.1.1, 2.2, 2.2.1, 2.3, 2.3.1, 3, 3.1, 3.1.1, 3.2, 3.2.1, 3.3, 3.3.1, 4, 4.1, 4.1.1, 4.2, 4.2.1, 4.3 y 4.3.1.

En una forma de realización preferida (forma de realización 6), cada R³ se selecciona independientemente de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi. Con mayor preferencia (forma de realización 6.1), cada R³ se selecciona independientemente de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi, y A, Y, R¹ y R² son como se define en la forma de realización 1, 1.1, 1.1.1, 1.1.1.1, 1.1.1.2, 2, 2.1, 2.1.1, 2.2, 2.2.1, 2.3, 2.3.1, 3, 3.1, 3.1.1, 3.2, 3.2.1, 3.3, 3.3.1, 4, 4.1, 4.1.1, 4.2, 4.2.1, 4.3, 4.3.1, 5, 5.1, 5.2 o 5.2.1.

En particular (forma de realización 6.2), R³ es C₁-C₄-alquilo, específicamente metilo. Más en particular (forma de realización 6.2.1), R³ es C₁-C₄-alquilo, específicamente metilo, y A, Y, R¹ y R² son como se define en la forma de realización 1, 1.1, 1.1.1, 1.1.1.1, 1.1.1.2, 2, 2.1, 2.1.1, 2.2, 2.2.1, 2.3, 2.3.1, 3, 3.1, 3.1.1, 3.2, 3.2.1, 3.3, 3.3.1, 4, 4.1, 4.1.1, 4.2, 4.2.1, 4.3, 4.3.1, 5, 5.1, 5.2 o 5.2.1.

En particular, k es 0 o 1. Más en particular, k es 0 o 1, y A, Y, R¹, R² y R³ son como se define en la forma de realización 1, 1.1, 1.1.1, 1.1.1.1, 1.1.1.2, 2, 2.1, 2.1.1, 2.2, 2.2.1, 2.3, 2.3.1, 3, 3.1, 3.1.1, 3.2, 3.2.1, 3.3, 3.3.1, 4, 4.1, 4.1.1, 4.2, 4.2.1, 4.3, 4.3.1, 5, 5.1, 5.2, 5.2.1, 6, 6.1, 6.2 o 6.2.1.

Los ejemplos de compuestos preferidos son compuestos de las siguientes Fórmulas Ia.1 a Ia.28, en donde X e Y tienen uno de los significados generales o preferidos anteriores, y R^{3a} y R^{3b} son hidrógeno o tienen uno de los significados generales o preferidos antes indicados para R³. Los ejemplos de compuestos preferidos son cada uno de los compuestos recopilados en las siguientes Tablas 1 a 616. Además, los significados mencionados más adelante para las variables individuales en las tablas son, independientemente de la combinación en la que se mencionan, una forma de realización particularmente preferida de los sustituyentes en cuestión.



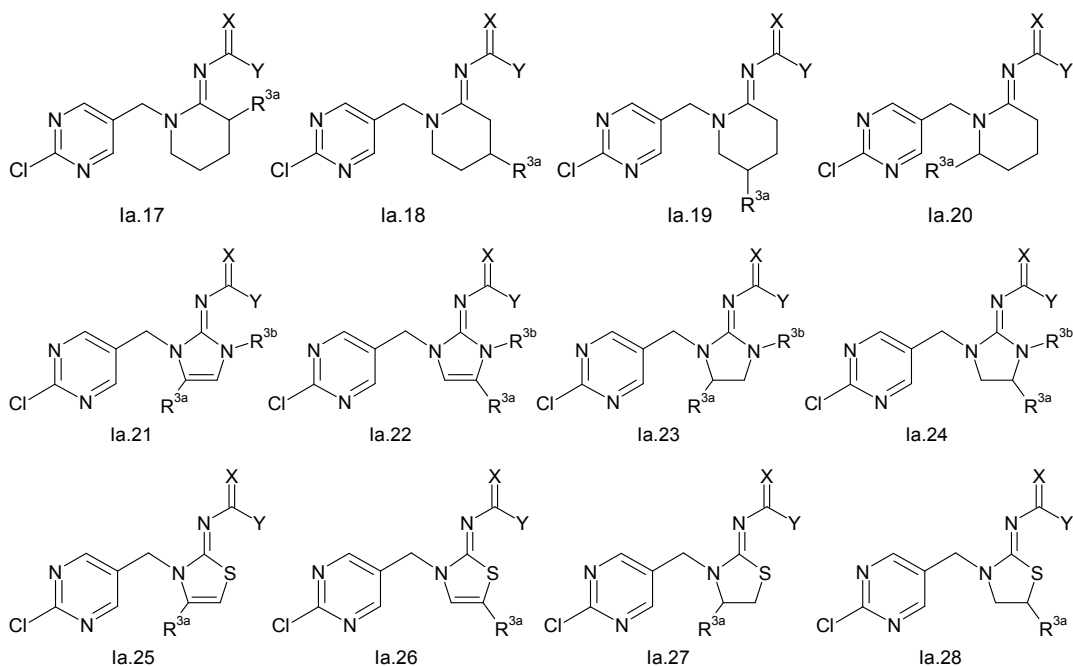


Tabla 1

Los compuestos de la Fórmula Ia.1 en donde X es O, Y es 1-cianociclopropilo, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A

Tabla 2

Los compuestos de la Fórmula Ia.1 en donde X es S, Y es 1-cianociclopropilo, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A

Tabla 3

Los compuestos de la Fórmula Ia.1 en donde X es O, Y es $-\text{CH}_2\text{-CN}$, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A

Tabla 4

Los compuestos de la Fórmula Ia.1 en donde X es S, Y es $-\text{CH}_2\text{-CN}$, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A

Tabla 5

Los compuestos de la Fórmula Ia.1 en donde X es O, Y es $-\text{CH}_2\text{-NO}_2$, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A

Tabla 6

Los compuestos de la Fórmula Ia.1 en donde X es S, Y es $-\text{CH}_2\text{-NO}_2$, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A

Tabla 7

Los compuestos de la Fórmula Ia.1 en donde X es O, Y es $-\text{CH=N-O-CH}_3$, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A

Tabla 8

Los compuestos de la Fórmula Ia.1 en donde X es S, Y es $-\text{CH}=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_3$, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A

Tabla 9

Los compuestos de la Fórmula Ia.1 en donde X es O, Y es $-\text{CH}=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_2\text{CH}_3$, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A

Tabla 10

Los compuestos de la Fórmula Ia.1 en donde X es S, Y es $-\text{CH}=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_2\text{CH}_3$, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A

Tabla 11

Los compuestos de la Fórmula Ia.1 en donde X es O, Y es $-\text{CH}=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A

Tabla 12

Los compuestos de la Fórmula Ia.1 en donde X es S, Y es $-\text{CH}=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A

Tabla 13

Los compuestos de la Fórmula Ia.1 en donde X es O, Y es $-\text{CH}=\text{N}-\text{O}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A

Tabla 14

Los compuestos de la Fórmula Ia.1 en donde X es S, Y es $-\text{CH}=\text{N}-\text{O}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A

Tabla 15

Los compuestos de la Fórmula Ia.1 en donde X es O, Y es $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_3$, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A

Tabla 16

Los compuestos de la Fórmula Ia.1 en donde X es S, Y es $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_3$, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A

Tabla 17

Los compuestos de la Fórmula Ia.1 en donde X es O, Y es $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_2\text{CH}_3$, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A

Tabla 18

Los compuestos de la Fórmula Ia.1 en donde X es S, Y es $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_2\text{CH}_3$, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A

Tabla 19

Los compuestos de la Fórmula Ia.1 en donde X es O, Y es $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A

Tabla 20

Los compuestos de la Fórmula Ia.1 en donde X es S, Y es $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A

Tabla 21

Los compuestos de la Fórmula Ia.1 en donde X es O, Y es $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{N}-\text{O}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A

Tabla 22

Los compuestos de la Fórmula Ia.1 en donde X es S, Y es $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{N}-\text{O}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A

Tablas 23 a 44

Los compuestos de la Fórmula Ia.2 en donde X e Y son como se define en las Tablas 1 a 22, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A

Tablas 45 a 66

Los compuestos de la Fórmula Ia.3 en donde X e Y son como se define en las Tablas 1 a 22, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A

Tablas 67 a 88

Los compuestos de la Fórmula Ia.4 en donde X e Y son como se define en las Tablas 1 a 22, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A

Tablas 89 a 110

Los compuestos de la Fórmula Ia.5 en donde X e Y son como se define en las Tablas 1 a 22, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A

Tablas 111 a 132

Los compuestos de la Fórmula Ia.6 en donde X e Y son como se define en las Tablas 1 a 22, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A

Tablas 133 a 154

Los compuestos de la Fórmula Ia.7 en donde X e Y son como se define en las Tablas 1 a 22, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A

Tablas 155 a 176

Los compuestos de la Fórmula Ia.8 en donde X e Y son como se define en las Tablas 1 a 22, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A

Tablas 177 a 198

Los compuestos de la Fórmula Ia.9 en donde X e Y son como se define en las Tablas 1 a 22, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A

Tablas 199 a 220

Los compuestos de la Fórmula Ia.10 en donde X e Y son como se define en las Tablas

1 a 22, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A
Tablas 221 a 242

Los compuestos de la Fórmula Ia.11 en donde X e Y son como se define en las Tablas
1 a 22, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A
Tablas 243 a 264

Los compuestos de la Fórmula Ia.12 en donde X e Y son como se define en las Tablas
1 a 22, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A
Tablas 265 a 286

Los compuestos de la Fórmula Ia.13 en donde X e Y son como se define en las Tablas
1 a 22, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A
Tablas 287 a 308

Los compuestos de la Fórmula Ia.14 en donde X e Y son como se define en las Tablas
1 a 22, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A
Tablas 309 a 330

Los compuestos de la Fórmula Ia.15 en donde X e Y son como se define en las Tablas
1 a 22, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A
Tablas 331 a 352

Los compuestos de la Fórmula Ia.16 en donde X e Y son como se define en las Tablas
1 a 22, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A
Tablas 353 a 374

Los compuestos de la Fórmula Ia.17 en donde X e Y son como se define en las Tablas
1 a 22, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A
Tablas 375 a 396

Los compuestos de la Fórmula Ia.18 en donde X e Y son como se define en las Tablas
1 a 22, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A
Tablas 397 a 418

Los compuestos de la Fórmula Ia.19 en donde X e Y son como se define en las Tablas
1 a 22, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A
Tablas 419 a 440

Los compuestos de la Fórmula Ia.20 en donde X e Y son como se define en las Tablas
1 a 22, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A
Tablas 441 a 462

Los compuestos de la Fórmula Ia.21 en donde X e Y son como se define en las Tablas
1 a 22, y la combinación de R^{3a} y R^{3b} para un compuesto corresponde, en cada caso,
a una fila de la Tabla B

Tablas 463 a 484

Los compuestos de la Fórmula Ia.22 en donde X e Y son como se define en las Tablas 1 a 22, y la combinación de R^{3a} y R^{3b} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla B

Tablas 485 a 506

Los compuestos de la Fórmula Ia.23 en donde X e Y son como se define en las Tablas 1 a 22, y la combinación de R^{3a} y R^{3b} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla B

Tablas 507 a 528

Los compuestos de la Fórmula Ia.24 en donde X e Y son como se define en las Tablas 1 a 22, y la combinación de R^{3a} y R^{3b} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla B

Tablas 529 a 550

Los compuestos de la Fórmula Ia.25 en donde X e Y son como se define en las Tablas 1 a 22, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A

Tablas 551 a 572

Los compuestos de la Fórmula Ia.26 en donde X e Y son como se define en las Tablas 1 a 22, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A

Tablas 573 a 594

Los compuestos de la Fórmula Ia.27 en donde X e Y son como se define en las Tablas 1 a 22, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A

Tablas 595 a 616

Los compuestos de la Fórmula Ia.28 en donde X e Y son como se define en las Tablas 1 a 22, y R^{3a} para un compuesto corresponde, en cada caso, a una fila de la Tabla A

Tabla A

N.º	R ^{3a}
A-1	H
A-2	CH ₃
A-3	C ₂ H ₅
A-4	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-5	CH(CH ₃) ₂
A-6	CHF ₂
A-7	CF ₃
A-8	OCH ₃

N.º	R ^{3a}
A-9	OC ₂ H ₅
A-10	OCH ₂ CH ₂ CH ₃
A-11	OCH(CH ₃) ₂
A-12	OCHF ₂
A-13	OCF ₃
A-14	F
A-15	Cl
A-16	Br

Tabla B

N.º	R ^{3a}	R ^{3b}
B-1	H	H
B-2	CH ₃	H
B-3	C ₂ H ₅	H
B-4	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H
B-5	CH(CH ₃) ₂	H
B-6	CHF ₂	H
B-7	CF ₃	H
B-8	OCH ₃	H
B-9	OC ₂ H ₅	H
B-10	OCH ₂ CH ₂ CH ₃	H
B-11	OCH(CH ₃) ₂	H
B-12	OCHF ₂	H
B-13	OCF ₃	H
B-14	F	H
B-15	Cl	H
B-16	Br	H
B-17	H	CH ₃
B-18	CH ₃	CH ₃
B-19	C ₂ H ₅	CH ₃
B-20	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
B-21	CH(CH ₃) ₂	CH ₃
B-22	CHF ₂	CH ₃
B-23	CF ₃	CH ₃
B-24	OCH ₃	CH ₃

N.º	R ^{3a}	R ^{3b}
B-25	OC ₂ H ₅	CH ₃
B-26	OCH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
B-27	OCH(CH ₃) ₂	CH ₃
B-28	OCHF ₂	CH ₃
B-29	OCF ₃	CH ₃
B-30	F	CH ₃
B-31	Cl	CH ₃
B-32	Br	CH ₃
B-33	H	C ₂ H ₅
B-34	CH ₃	C ₂ H ₅
B-35	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
B-36	CH ₂ CH ₂ CH ₃	C ₂ H ₅
B-37	CH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅
B-38	CHF ₂	C ₂ H ₅
B-39	CF ₃	C ₂ H ₅
B-40	OCH ₃	C ₂ H ₅
B-41	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅
B-42	OCH ₂ CH ₂ CH ₃	C ₂ H ₅
B-43	OCH(CH ₃) ₂	C ₂ H ₅
B-44	OCHF ₂	C ₂ H ₅
B-45	OCF ₃	C ₂ H ₅
B-46	F	C ₂ H ₅
B-47	Cl	C ₂ H ₅
B-48	Br	C ₂ H ₅

Entre los compuestos anteriores, se prefieren los compuestos la.1 y la.25.

En una forma de realización específica, los compuestos I se seleccionan de los compuestos especificados en los ejemplos, ya sea como una base libre o en forma de una sal aceptable en la agricultura o veterinaria, un N-óxido o un estereoisómero de aquellos.

Los compuestos de la Fórmula (I) se pueden preparar mediante los métodos según se describen en los esquemas descritos más adelante y/o en las descripciones

de síntesis de los ejemplos de trabajo o mediante los métodos estándar de la química orgánica.

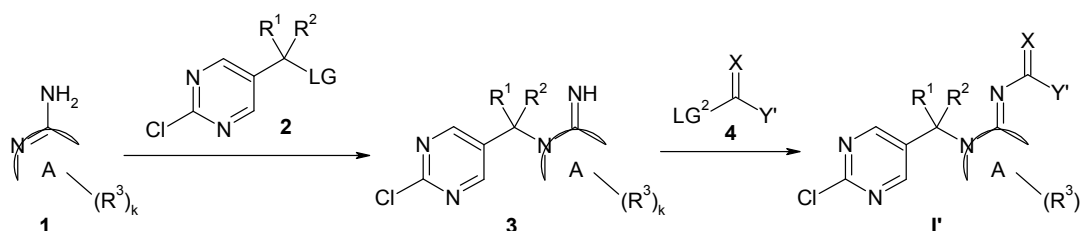
Las definiciones de A, X, R¹, R², R³, R⁶ y k de las estructuras moleculares indicadas en los esquemas son como se definieron anteriormente. Y' tiene uno de los significados proporcionados anteriormente para Y o es un precursor de este. Por ejemplo, en compuestos en donde Y es un grupo alquilo o cicloalquilo que tiene un sustituyente ciano, el precursor Y' puede contener otro grupo en lugar de CN; por ejemplo, un átomo de halógeno, un grupo sulfonato de C₁-C₄-alquilo, sulfonato de C₁-C₄-haloalquilo, sulfonato de arilo, fosfato o fosfonato de C₁-C₄-alquilo.

Temperatura ambiente significa un rango de temperatura de aproximadamente 20 a 25 °C.

Un ejemplo de un método general para la preparación de compuestos de la Fórmula (I) se muestra a continuación en el Esquema A. De ese modo, la construcción del elemento heterocíclico 3 presente en los compuestos de la Fórmula (I) se puede lograr, por ejemplo, mediante la alquilación del precursor 1 de heterociclo 2-amina correspondiente con el reactivo correspondiente de la Fórmula 2. Preferentemente, la transformación se lleva a cabo en solventes polares, tales como acetonitrilo, acetona, diclorometano, 1,4-dioxano, tetrahidrofurano, N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilpirrolidinona o un C₁-C₆-alcohol; la temperatura de reacción varía adecuadamente entre temperatura ambiente y la temperatura de reflujo del solvente. Las condiciones de reacción representativas para la alquilación de los compuestos análogos a la Fórmula 1 se indican en Tetrahedron Lett. 2011, 52(23), 3033-3037. La síntesis de los compuestos de la Fórmula I se puede lograr mediante la acilación de la funcionalidad de la amina en compuestos de la Fórmula 3 usando derivados del ácido carboxílico 4 que se activan *in situ*. Preferentemente, la transformación se lleva a cabo en solventes polares, tales como acetonitrilo, acetona, 1,4-dioxano, tetrahidrofurano, N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilpirrolidinona, o en un solvente inerte como diclorometano, 1,2-dicloroetano, o 1,2-dimetoxietano, a temperaturas que varían entre temperatura ambiente y la temperatura de reflujo del solvente. Una condición de un procedimiento representativo para la acilación se indica en Journal of Medicinal Chemistry, 2012, 55, 7378-7391. Los ejemplos de grupos salientes (LG) adecuados en la Fórmula 2 incluyen, entre otros: halógeno, sulfonato de alquilo, sulfonato de haloalquilo, sulfonato de arilo, fosfonato de alquilo. Los ejemplos de grupos salientes (LG²) adecuados en la Fórmula 4 incluyen, entre otros: halógeno, sulfonato de alquilo, sulfonato de haloalquilo, sulfonato de arilo,

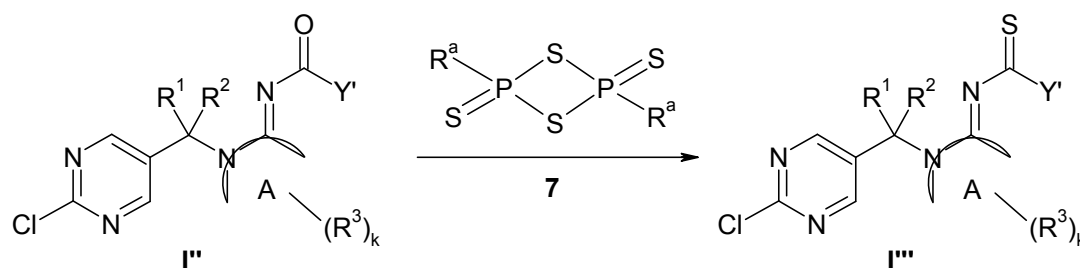
fosfonato de alquilo y distintos ésteres activados derivados de la reacción de un ácido carboxílico libre con un reactivo de acoplamiento de péptidos en presencia de una base de amina; las condiciones de reacción representativas se pueden encontrar en la siguiente reseña, y las referencias allí citadas: *Chem. Rev.*, **2011**, 111 (11), 6557-6602. Una inversión del orden de estas dos etapas daría también como resultado una síntesis aceptable de los compuestos deseados.

Esquema A:



En los casos en donde X representa un átomo de azufre, el átomo de azufre se instala mejor en una etapa posterior del compuesto I o cualquier precursor de este (por ejemplo, el compuesto I' en donde Y' es un precursor de Y) en donde X es un átomo de oxígeno como se detalló en el Esquema B. El compuesto de carbonilo I'' (compuesto I' o I en donde X = O) se transforma en el compuesto de tiocarbonilo I''' correspondiente (compuesto I en donde X = S). La transformación utiliza preferentemente un reactivo de subestructura **7** en solventes polares, tales como acetonitrilo, acetona, tetrahidrofurano, N,N-dimetilformamida, o en un solvente inerte tal como diclorometano, 1,2-dicloroetano o 1,2-dimetoxietano a temperaturas que varían entre temperatura ambiente y la temperatura de reflujo del solvente. Los grupos R^a adecuados para **7** son: tio, alquilo, arilo o arilo sustituido. Por ejemplo, se pueden utilizar los reactivos de Lawesson (R^a = 4-metoxifenilo). Las condiciones de reacción representativas para la tionación de sustratos análogos se indican en *European Journal of Organic Chemistry*, 2000, 3273-3278, y *Chemical Reviews*, 2007, 107, 5210-5278.

Esquema B:

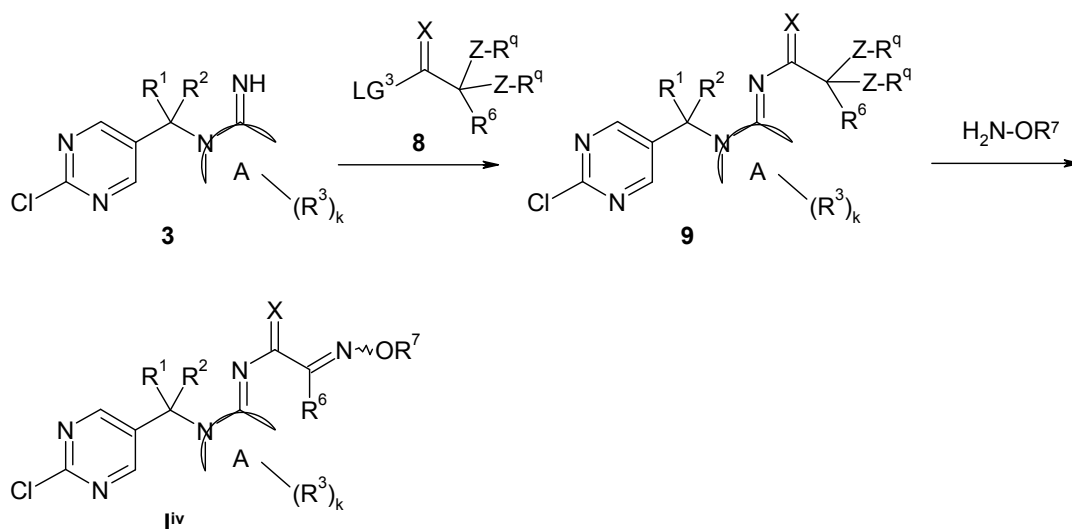


Si Y' es un precursor de Y, especialmente si Y' es un grupo alquilo o cicloalquilo que tiene un átomo de halógeno, un grupo sulfonato de C₁-C₄-alquilo, sulfonato de C₁-C₄-haloalquilo, sulfonato de arilo, fosfato o fosfonato de C₁-C₄-alquilo en lugar del sustituyente ciano deseado, tal compuesto I' se hace reaccionar de manera adecuada con un compuesto M-CN. M es hidrógeno, un metal del grupo 1, 2, 11 o 12 de la tabla periódica (mediante la numeración moderna IUPAC), Si(C₁-C₄-alquilo)₃ o C(CH₃)₂OH. Los ejemplos de los compuestos M-CN adecuados son: LiCN, NaCN, KCN, CuCN, Cu(CN)₂, Zn(CN)₂, HCN, TMS-CN (trimetilsililcianuro) y acetona cianhidrina. Preferentemente, la transformación se lleva a cabo en solventes polares, tales como acetonitrilo, acetona, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilpirrolidinona, un C₁-C₆ alcohol o en un solvente inerte, tal como diclorometano, 1,2-dicloroetano, 1,2-dimetoxietano, benceno, tolueno, mesitileno, cimenos o xilenos a temperaturas que varían entre temperatura ambiente y la temperatura de reflujo del solvente. Las condiciones de un procedimiento representativo para tal reacción se indican en Journal of Medicinal Chemistry, 1989, 32, 1673-1681. Una inversión del orden de estas etapas daría también como resultado una síntesis aceptable de los compuestos deseados de la Fórmula I.

Los compuestos I en donde Y es un grupo -C(R⁶)=N-O-R⁷ (en adelante denominado I^{iv}) se pueden preparar de manera alternativa como se muestra a continuación en el Esquema C. El compuesto **3** se acila con un reactivo de la Fórmula **8**, en donde Z es oxígeno, azufre o N-R^z, en donde R^z es hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, bencilo o C₃-C₆-cicloalquilo; R^q es C₁-C₆-alquilo, bencilo o C₃-C₆-cicloalquilo; y LG³ es un grupo saliente, tal como halógeno (por ejemplo, cloro o bromo), sulfonato de C₁-C₄-alquilo (por ejemplo, sulfonato de metilo o etilo), sulfonato de C₁-C₄-haloalquilo (por ejemplo, sulfonato de trifluorometilo), sulfonato de arilo (por ejemplo, sulfonato de fenilo o sulfonato de tolilo), fosfonato de C₁-C₄-alquilo, fosfonato de C₁-C₄-haloalquilo y distintos ésteres activados de la reacción de un ácido carboxílico libre con un reactivo de acoplamiento de péptidos en presencia de una base de amina como se describe, por ejemplo, en *Chem. Rev.*, **2011**, 111 (11), 6557-6602. Preferentemente, la transformación se lleva a cabo en solventes polares, tales como acetonitrilo, acetona, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilpirrolidinona o un C₁-C₆ alcohol, o en un solvente inerte como diclorometano, 1,2-dicloroetano o 1,2-dimetoxietano, a temperaturas que varían entre temperatura ambiente y la temperatura de reflujo del solvente. Una condición de un procedimiento representativo para la acilación se indica en Journal of Chemical Ecology, 1999, 25, 7,

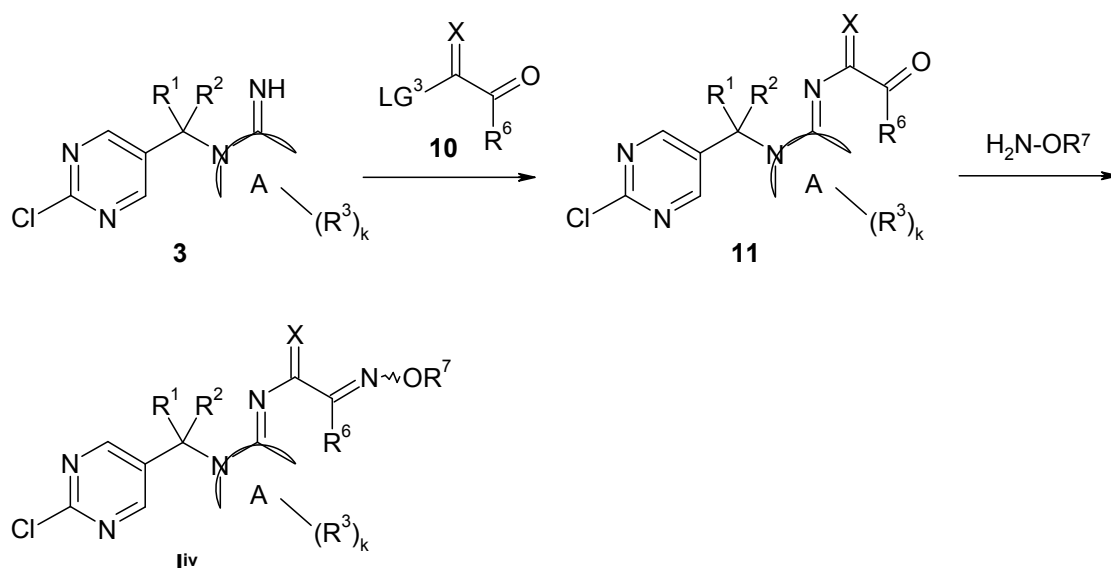
1543-1554. **9** luego se hace reaccionar con la O-amina H_2N-OR^7 para obtener el compuesto de la Fórmula I^{iv}. Preferentemente, la transformación se lleva a cabo en solventes polares, tales como acetonitrilo, acetona, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilpirrolidinona, un C_1-C_6 alcohol o en un solvente inerte, tal como diclorometano, 1,2-dicloroetano, 1,2-dimetoxietano, benceno, tolueno, mesitileno, cimeno o xilenos; la temperatura de reacción varía entre temperatura ambiente y la temperatura de reflujo del solvente. Puede ser conveniente realizar la reacción en presencia de un ácido orgánico o inorgánico. Las condiciones de un procedimiento representativo para tal reacción se indican en *Il Farmaco*, 1996, 51, 255. Una inversión del orden de estas etapas daría también como resultado una síntesis aceptable de los compuestos deseados de la Fórmula I^{iv}.

Esquema C:



Los compuestos I^{iv} se pueden preparar de manera alterativa como se muestra en el Esquema D a continuación. **3** se acila con un reactivo de la Fórmula **10**. Preferentemente, la transformación se lleva a cabo en solventes polares, tales como acetonitrilo, acetona, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilpirrolidinona o un C₁-C₆ alcohol, o en un solvente inerte como diclorometano, 1,2-dicloroetano o 1,2-dimetoxietano; la temperatura de reacción varía entre temperatura ambiente y la temperatura de reflujo del solvente. LG³ en **10** es un grupo saliente, tal como halógeno, sulfonato de alquilo o sulfonato de haloalquilo, fosfonato de alquilo, halofosfato y distintos ésteres activados derivados de la reacción del ácido carbónico libre con un reactivo de acoplamiento de péptidos en presencia de una base de amina (*Chem. Rev.*, **2011**, 111 (11), 6557-6602). El compuesto resultante **11** luego se hace reaccionar con la O-amina H₂N-OR⁷ para obtener el compuesto de la Fórmula I^{iv}. Preferentemente, la transformación se lleva a cabo en solventes polares, tales como acetonitrilo, acetona, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilpirrolidinona, un C₁-C₆ alcohol o en un solvente inerte, tal como diclorometano, 1,2-dicloroetano, 1,2-dimetoxietano, benceno, tolueno, mesitileno, cimeno o xilenos; la temperatura de reacción varía entre temperatura ambiente y la temperatura de reflujo del solvente. Se pueden usar un ácido inorgánico u orgánico, opcionalmente en combinación con una base inorgánica u orgánica, como aditivo para realizar la transformación deseada. Las condiciones de un procedimiento representativo para la acilación se indican en *Org. Lett.*, 2012, 14 (18), 4810–4813. Una inversión del orden de estas etapas daría también como resultado una síntesis aceptable de los compuestos deseados de la Fórmula I^{iv}.

Esquema D:



Si se desea, los compuestos I^{iv} en donde X es O se pueden convertir en el análogo S respectivo en las condiciones descritas anteriormente para el Esquema B.

En general, los compuestos de la Fórmula I, incluso sus estereoisómeros, sales y N-óxidos, y sus precursores en el proceso de síntesis, se pueden preparar con los métodos descritos anteriormente. Si los compuestos individuales no se pueden preparar mediante las vías descritas anteriormente, se pueden preparar mediante la derivatización de otros compuestos I o del precursor respectivo o mediante modificaciones habituales de las vías de síntesis descritas. Por ejemplo, en casos individuales, ciertos compuestos de la Fórmula (I) se pueden preparar de manera conveniente de otros compuestos de la Fórmula (I) mediante derivatización, por ejemplo, hidrólisis del éster, amidación, esterificación, escisión del éter, olefinación, reducción, oxidación y similares, o mediante las modificaciones habituales de las vías de síntesis descritas.

Las mezclas de reacción se preparan de la manera habitual, por ejemplo, mediante mezcla con agua, separación de las fases y, de ser adecuado, purificación de los productos crudos mediante cromatografía, por ejemplo, sobre alúmina o gel de sílice. Algunos de los productos finales e intermediarios se pueden obtener en forma de aceites viscosos ligeramente parduscos o incoloros, que se liberan o purifican de componentes volátiles a presión reducida y a una temperatura moderadamente elevada. Si los intermediarios y productos finales se obtienen como sólidos, estos se pueden purificar por recristalización o trituración.

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

En consecuencia, la presente invención también proporciona un método para combatir o controlar plagas de invertebrados, que comprende tratar las plagas, su suministro alimenticio, hábitat o lugar de reproducción o una planta cultivada, materiales de propagación vegetal (tales como semillas), suelo, área, material o entorno donde las plagas crecen o pueden crecer, o los materiales, las plantas cultivadas, los materiales de propagación vegetal (tales como semillas), los suelos, superficies o espacios que desean protegerse contra el ataque o la infestación de plagas con una cantidad eficaz como plaguicida de un compuesto de la presente invención o una composición como se definió anteriormente. La invención también se refiere al uso de un compuesto de la invención, de un estereoisómero y/o de una sal de aquel aceptable en la agricultura o veterinaria para combatir plagas de invertebrados.

Preferentemente, el método de la invención sirve para proteger el material de propagación vegetal (tal como semillas) y la planta que crece de este del ataque o de la infestación de plagas de invertebrados, y comprende tratar el material de propagación vegetal (tal como semillas) con una cantidad eficaz como plaguicida de un compuesto de la presente invención, como se definió con anterioridad, o con una cantidad eficaz como plaguicida de una composición agrícola, como se definió con anterioridad y a continuación. El método de la invención no se limita a la protección del "sustrato" (planta, materiales de propagación, material del suelo, etc.) que se trató de acuerdo con la invención, sino que también tiene un efecto preventivo; de este modo, por ejemplo, brinda protección a una planta que crece de materiales de propagación vegetal tratados (tales como semilla), en donde la planta misma no ha sido tratada.

De preferencia alternativa, el método de la invención sirve para proteger las plantas contra el ataque o infestación por plagas de invertebrados, cuyo método comprende el tratamiento de las plantas con una cantidad eficaz de plaguicida de al menos un compuesto de la invención, un estereoisómero y/o al menos una sal de aquel aceptable en la agricultura.

En el sentido de la presente invención, las "plagas de invertebrados" se seleccionan, preferentemente, de artrópodos, gastrópodos y nematodos, con mayor preferencia, de insectos dañinos, arácnidos y nematodos, y aun con mayor preferencia, de insectos, acáridos y nematodos. En el sentido de la presente invención, las "plagas de invertebrados" son, con máxima preferencia, insectos.

La invención también proporciona una composición agrícola para combatir plagas de invertebrados, que comprende al menos un compuesto de acuerdo con la

invención y al menos un portador sólido y/o líquido inerte aceptable en la agronomía que tiene acción plaguicida y, si se desea, al menos un tensioactivo.

Dicha composición pueden comprender un solo compuesto activo de la presente invención o una mezcla de varios compuestos activos de la presente invención. La composición de acuerdo con la presente invención puede comprender un isómero individual o mezclas de isómeros o una sal, así como tautómeros individuales o mezclas de tautómeros.

Plagas:

Los compuestos de la presente invención son especialmente adecuados para combatir de manera eficaz plagas de animales, tales como artrópodos, gasterópodos y nematodos, que incluyen, entre otros, los siguientes:

insectos del orden **Lepidoptera**, por ejemplo, *Achroia grisella*, *Acleris* spp., tales como *A. fimbriana*, *A. gloverana*, *A. variana*; *Acrolepiopsis assectella*, *Acronicta major*, *Adoxophyes* spp., tales como *A. cyrtosema*, *A. orana*; *Aedia leucomelas*, *Agrotis* spp., tales como *A. exclamationis*, *A. fucosa*, *A. epsilon*, *A. orthogona*, *A. segetum*, *A. subterranea*; *Alabama argillacea*, *Aleurodicus dispersus*, *Alsophila pometaria*, *Ampelophaga rubiginosa*, *Amyelois transitella*, *Anacamptis sarcitella*, *Anagasta kuehniella*, *Anarsia lineatella*, *Anisota senatoria*, *Antheraea pernyi*, *Anticarsia* (= *Thermesia*) spp., tales como *A. gemmatilis*; *Apamea* spp., *Aproaerema modicella*, *Archips* spp., tales como *A. argyrospila*, *A. fuscocupreanus*, *A. rosana*, *A. xylosteanus*; *Argyresthia conjugella*, *Argyroplote* spp., *Argyrotaenia* spp., tales como *A. velutinana*; *Athetis mindara*, *Austroasca viridigrisea*, *Autographa gamma*, *Autographa nigrisigna*, *Barathra brassicae*, *Bedellia* spp., *Bonagota salubricola*, *Borbo cinnara*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Busseola* spp., *Cacoecia* spp., tales como *C. murinana*, *C. podana*; *Cactoblastis cactorum*, *Cadra cautella*, *Calingo braziliensis*, *Caloptilis theivora*, *Capua reticulana*, *Carposina* spp., tales como *C. niponensis*, *C. sasakii*; *Cephus* spp., *Chaetocnema aridula*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo* spp., tales como *C. indicus*, *C. suppressalis*, *C. partellus*; *Choreutis pariana*, *Choristoneura* spp., tales como *C. conflictana*, *C. fumiferana*, *C. longicellana*, *C. murinana*, *C. occidentalis*, *C. rosaceana*; *Chrysodeixis* (= *Pseudoplusia*) spp., tales como *C. eriosoma*, *C. includens*, *Cirphis unipuncta*, *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocerus* spp., *Cnaphalocrocis medinalis*, *Cnephasia* spp., *Cochylis hospes*, *Coleophora* spp., *Colias eurytheme*, *Conopomorpha* spp., *Conotrachelus* spp., *Copitarsia* spp., *Corcyra cephalonica*, *Crambus caliginosellus*, *Crambus teterrellus*, *Crociosema* (= *Epinotia*) *aporema*, *Cydalima*

(=Diaphania) *perspectalis*, *Cydia* (=Carpocapsa) spp., tales como *C. pomonella*, *C. latiferreana*; *Dalaca noctuides*, *Datana integerrima*, *Dasychira pinicola*, *Dendrolimus* spp., tales como *D. pini*, *D. spectabilis*, *D. sibiricus*; *Desmia funeralis*, *Diaphania* spp., tales como *D. nitidalis*, *D. hyalinata*; *Diatraea grandiosella*, *Diatraea saccharalis*, *Diphthera festiva*, *Earias* spp., tales como *E. insulana*, *E. vittella*; *Ecdytolopha aurantianu*, *Egira* (=Xylomyges) *curialis*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Eldana saccharina*, *Endopiza viteana*, *Ennomos subsignaria*, *Eoreuma loftini*, *Ephestia* spp., tales como *E. cautella*, *E. elutella*, *E. kuehniella*; *Epinotia aporema*, *Epiphyas postvittana*, *Erannis tiliaria*, *Erionota thrax*, *Etiella* spp., *Eulia* spp., *Eupoecilia ambiguella*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Euxoa* spp., *Evetria bouliana*, *Faronta albilinea*, *Feltia* spp., tales como *F. subterranean*; *Galleria mellonella*, *Gracillaria* spp., *Grapholita* spp., tales como *G. funebrana*, *G. molesta*, *G. inopinata*; *Halysidota* spp., *Harrisina americana*, *Hedylepta* spp., *Helicoverpa* spp., tales como *H. armigera* (=Heliothis armigera), *H. zea* (=Heliothis zea); *Heliothis* spp., tales como *H. assulta*, *H. subflexa*, *H. virescens*; *Hellula* spp., tales como *H. undalis*, *H. rogatalis*; *Helocoverpa gelotopoeon*, *Hemileuca oliviae*, *Herpetogramma licarsisalis*, *Hibernia defoliaria*, *Hofmannophila pseudospretella*, *Homoeosoma electellum*, *Homona magnanima*, *Hypena scabra*, *Hyphantria cunea*, *Hyponomeuta padella*, *Hyponomeuta malinellus*, *Kakivoria flavofasciata*, *Keiferia lycopersicella*, *Lambdina fiscellaria fiscellaria*, *Lambdina fiscellaria lugubrosa*, *Lamprosema indicata*, *Laspeyresia molesta*, *Leguminivora glycinivorella*, *Lerodea eufala*, *Leucinodes orbonalis*, *Leucoma salicis*, *Leucoptera* spp., tales como *L. coffeella*, *L. scitella*; *Leuminivora lycinivorella*, *Lithocolletis blancardella*, *Lithophane antennata*, *Llattia octo* (=Amyna axis), *Lobesia botrana*, *Lophocampa* spp., *Loxagrotis albicosta*, *Loxostege* spp., tales como *L. sticticalis*, *L. cereralis*; *Lymantria* spp., tales como *L. dispar*, *L. monacha*; *Lyonetia clerkella*, *Lyonetia prunifoliella*, *Malacosoma* spp., tales como *M. americanum*, *M. californicum*, *M. constrictum*, *M. neustria*; *Mamestra* spp., tales como *M. brassicae*, *M. configurata*; *Mamstra brassicae*, *Manduca* spp., tales como *M. quinquemaculata*, *M. sexta*; *Marasmia* spp, *Marmara* spp., *Maruca testulalis*, *Megalopyge lanata*, *Melanchra picta*, *Melanitis leda*, *Mocis* spp., tales como *M. lapites*, *M. repanda*; *Mocis latipes*, *Monochroa fragariae*, *Mythimna separata*, *Nemapogon cloacella*, *Neoleucinodes elegantalis*, *Nepytia* spp., *Nymphula* spp., *Oiketicus* spp., *Omiodes indicata*, *Omphis anastomosalis*, *Operophtera brumata*, *Orgyia pseudotsugata*, *Oria* spp., *Orthaga thyrisalis*, *Ostrinia* spp., tales como *O. nubilalis*; *Oulema oryzae*, *Paleacrita vernata*, *Panolis flammea*, *Parnara* spp., *Papaipema nebris*, *Papilio cresphontes*, *Paramyelois transitella*, *Paranthrene regalis*,

Paysandisia archon, *Pectinophora* spp., tales como *P. gossypiella*; *Peridroma saucia*, *Perileucoptera* spp., tales como *P. coffeella*; *Phalera bucephala*, *Phryganidia californica*, *Phthorimaea* spp., tales como *P. operculella*; *Phyllocnistis citrella*, *Phyllonorycter* spp., tales como *P. blancardella*, *P. crataegella*, *P. issikii*, *P. ringoniella*; *Pieris* spp., tales como *P. brassicae*, *P. rapae*, *P. napi*; *Pilocrocis tripunctata*, *Plathypena scabra*, *Platynota* spp., tales como *P. flavedana*, *P. idaeusalis*, *P. stultana*; *Platyptilia carduidactyla*, *Plebejus argus*, *Plodia interpunctella*, *Plusia* spp., *Plutella maculipennis*, *Plutella xylostella*, *Pontia protodica*, *Prays* spp., *Prodenia* spp., *Proxenus lepigone*, *Pseudaletia* spp., tales como *P. sequax*, *P. unipuncta*; *Pyrausta nubilalis*, *Rachiplusia nu*, *Richia albicosta*, *Rhizobius ventralis*, *Rhyacionia frustrana*, *Sabulodes aegrotata*, *Schizura concinna*, *Schoenobius* spp., *Schreckensteinia festaliella*, *Scirpophaga* spp., tales como *S. incertulas*, *S. innotata*; *Scotia segetum*, *Sesamia* spp., tales como *S. inferens*, *Seudyra subflava*, *Sitotroga cerealella*, *Sparganothis pilleriana*, *Spilonota lechriaspis*, *S. ocellana*, *Spodoptera* (=Lamphygma) spp., tales como *S. cosmoides*, *S. eridania*, *S. exigua*, *S. frugiperda*, *S. latifascia*, *S. littoralis*, *S. litura*, *S. omithogalli*; *Stigmella* spp., *Stomopteryx subsecivella*, *Strymon bazochii*, *Sylepta derogata*, *Synanthedon* spp., tales como *S. exitiosa*, *Tecia solanivora*, *Telehin licus*, *Thaumatopoea pityocampa*, *Thaumatotibia* (=Cryptophlebia) *leucotreta*, *Thaumatopoea pityocampa*, *Thecla* spp., *Theresimima ampelophaga*, *Thyrinitea* spp., *Tildenia inconspicua*, *Tinea* spp., tales como *T. cloacella*, *T. pellionella*; *Tineola bisselliella*, *Tortrix* spp., tales como *T. viridana*; *Trichophaga tapetzella*, *Trichoplusia* spp., tales como *T. ni*; *Tuta* (=Scrobipalpula) *absoluta*, *Udea* spp., tales como *U. rubigalis*, *U. rubigalis*; *Virachola* spp., *Yponomeuta padella* y *Zeiraphera canadensis*;

insectos del orden **Coleoptera**, por ejemplo, *Acalymma vittatum*, *Acanthoscehdes obtectus*, *Adoretus* spp., *Agelastica alni*, *Agrilus* spp., tales como *A. anxius*, *A. planipennis*, *A. sinuatus*; *Agriotes* spp., tales como *A. fuscicollis*, *A. lineatus*, *A. obscurus*; *Alphitobius diaperinus*, *Amphimallus solstitialis*, *Anisandrus dispar*, *Anisoplia austriaca*, *Anobium punctatum*, *Anomala corpulenta*, *Anomala rufocuprea*, *Anoplophora* spp., tales como *A. glabripennis*; *Anthonomus* spp., tales como *A. eugenii*, *A. grandis*, *A. pomorum*; *Anthrenus* spp., *Aphthona euphoridae*, *Apion* spp., *Apogonia* spp., *Athous haemorrhoidalis*, *Atomaria* spp., tales como *A. linearis*; *Attagenus* spp., *Aulacophora femoralis*, *Blastophagus piniperda*, *Blitophaga undata*, *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., tales como *B. lentis*, *B. pisorum*, *B. rufimanus*; *Byctiscus betulae*, *Callidiellum rufipenne*, *Callopietria floridensis*, *Callosobruchus chinensis*, *Cameraria ohridella*, *Cassida nebulosa*, *Cerotoma trifurcata*, *Cetonia aurata*,

Ceuthorhynchus spp., tales como *C. assimilis*, *C. napi*; *Chaetocnema tibialis*, *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., tales como *C. vespertinus*; *Conotrachelus nenuphar*, *Cosmopolites* spp., *Costelytra zealandica*, *Crioceris asparagi*, *Cryptolestes ferrugineus*, *Cryptorhynchus lapathi*, *Ctenicera* spp., tales como *C. destructor*; *Curculio* spp., *Cylindrocopturus* spp., *Cyclocephala* spp., *Dactylispa balyi*, *Dectes texanus*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., tales como *D. undecimpunctata*, *D. speciosa*, *D. longicornis*, *D. semipunctata*, *D. virgifera*; *Diaprepes abbreviatus*, *Dichocrocis* spp., *Dicladispa armigera*, *Diloboderus abderus*, *Diocalandra frumenti* (*Diocalandra stigmaticollis*), *Enaphalodes rufulus*, *Epilachna* spp., tales como *E. varivestis*, *E. vigintioctomaculata*; *Epitrix* spp., tales como *E. hirtipennis*, *E. similis*; *Eutheola humilis*, *Eutinobothrus brasiliensis*, *Faustinus cubae*, *Gibbium psyllodes*, *Gnathocerus cornutus*, *Hellula undalis*, *Heteronychus arator*, *Hylamorpha elegans*, *Hylobius abietis*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera* spp., tales como *H. brunneipennis*, *H. postica*; *Hypomeces squamosus*, *Hypothenemus* spp., *Ips typographus*, *Lachnosterna consanguinea*, *Lasioderma serricorne*, *Latheticus oryzae*, *Lathridius* spp., *Lema* spp., tales como *L. bilineata*, *L. melanopus*; *Leptinotarsa* spp., tales como *L. decemlineata*; *Leptispa pygmaea*, *Limonius californicus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lixus* spp., *Luperodes* spp., *Lyctus* spp., tales como *L. bruneus*; *Liogenys fuscus*, *Macroductylus* spp., tales como *M. subspinosus*; *Maladera matrida*, *Megaplatypus mutatus*, *Megascelis* spp., *Melanotus communis*, *Meligethes* spp., tales como *M. aeneus*; *Melolontha* spp., tales como *M. hippocastani*, *M. melolontha*; *Metamasius hemipterus*, *Microtheca* spp., *Migdolus* spp., tales como *M. fryanus*, *Monochamus* spp., tales como *M. alternatus*; *Naupactus xanthographus*, *Niptus hololeucus*, *Oberia brevis*, *Oemona hirta*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Oryzaphagus oryzae*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Otiorrhynchus ovatus*, *Oulema melanopus*, *Oulema oryzae*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon* spp., tales como *P. brassicae*, *P. cochleariae*; *Phoracantha recurva*, *Phyllobius pyri*, *Phyllopertha horticola*, *Phyllophaga* spp., tales como *P. helleri*; *Phyllotreta* spp., tales como *P. chrysocephala*, *P. nemorum*, *P. striolata*, *P. vittula*; *Phyllopertha horticola*, *Popillia japonica*, *Premnotrypes* spp., *Psacotheca hilaris*, *Psylliodes chrysocephala*, *Prostephanus truncatus*, *Psylliodes* spp., *Ptinus* spp., *Pulga saltona*, *Rhizopertha dominica*, *Rhynchophorus* spp., tales como *R. billineatus*, *R. ferrugineus*, *R. palmarum*, *R. phoenicis*, *R. vulneratus*; *Saperda candida*, *Scolytus schevyrewi*, *Scyphophorus acupunctatus*, *Sitona lineatus*, *Sitophilus* spp., tales como *S. granaria*, *S. oryzae*, *S. zeamais*; *Sphenophorus* spp., tales como *S. levis*; *Stegobium paniceum*, *Sternechus* spp., tales como *S. subsignatus*;

Strophomorphus ctenotus, *Symphyletes* spp., *Tanymecus* spp., *Tenebrio molitor*, *Tenebrioides mauretanicus*, *Tribolium* spp., tales como *T. castaneum*; *Trogoderma* spp., *Tychius* spp., *Xylotrechus* spp., tales como *X. pyrrhoderus*; y *Zabrus* spp., tales como *Z. tenebrioides*;

insectos del orden **Diptera**, por ejemplo, *Aedes* spp., tales como *A. aegypti*, *A. albopictus*, *A. vexans*; *Anastrepha ludens*, *Anopheles* spp., tales como *A. albimanus*, *A. crucians*, *A. freeborni*, *A. gambiae*, *A. leucosphyrus*, *A. maculipennis*, *A. minimus*, *A. quadrimaculatus*, *A. sinensis*; *Bactrocera invadens*, *Bibio hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*, *Calliphora vicina*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomyia* spp., tales como *C. bezziana*, *C. hominivorax*, *C. macellaria*; *Chrysops atlanticus*, *Chrysops discalis*, *Chrysops silacea*, *Cochliomyia* spp., tales como *C. hominivorax*; *Contarinia* spp., tales como *C. sorghicola*; *Cordylobia anthropophaga*, *Culex* spp., tales como *C. nigripalpus*, *C. pipiens*, *C. quinquefasciatus*, *C. tarsalis*, *C. tritaeniorhynchus*; *Culicoides furens*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Cuterebra* spp., *Dacus cucurbitae*, *Dacus oleae*, *Dasineura brassicae*, *Dasineura oxycoccana*, *Delia* spp., tales como *D. antique*, *D. coarctata*, *D. platura*, *D. radicum*; *Dermatobia hominis*, *Drosophila* spp., tales como *D. suzukii*, *Fannia* spp., tales como *F. canicularis*; *Gastrophilus* spp., tales como *G. intestinalis*; *Geomyza tipunctata*, *Glossina* spp., tales como *G. fuscipes*, *G. morsitans*, *G. palpalis*, *G. tachinoides*; *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hippelates* spp., *Hylemyia* spp., tales como *H. platura*; *Hypoderma* spp., tales como *H. lineata*; *Hyppobosca* spp., *Hydrellia philippina*, *Leptoconops torrens*, *Liriomyza* spp., tales como *L. sativae*, *L. trifolii*; *Lucilia* spp., tales como *L. caprina*, *L. cuprina*, *L. sericata*; *Lycoria pectoralis*, *Mansonia titillanus*, *Mayetiola* spp., tales como *M. destructor*; *Musca* spp., tales como *M. autumnalis*, *M. domestica*; *Muscina stabulans*, *Oestrus* spp., tales como *O. ovis*; *Opomyza florum*, *Oscinella* spp., tales como *O. frit*; *Orseolia oryzae*, *Pegomya hysocyami*, *Phlebotomus argentipes*, *Phorbia* spp., tales como *P. antiqua*, *P. brassicae*, *P. coarctata*; *Phytomyza gymnostoma*, *Prosimulium mixtum*, *Psila rosae*, *Psorophora columbiae*, *Psorophora discolor*, *Rhagoletis* spp., tales como *R. cerasi*, *R. cingulate*, *R. indifferens*, *R. mendax*, *R. pomonella*; *Rivellia quadrifasciata*, *Sarcophaga* spp., tales como *S. haemorrhoidalis*; *Simulium vittatum*, *Sitodiplosis mosellana*, *Stomoxys* spp., tales como *S. calcitrans*; *Tabanus* spp., tales como *T. atratus*, *T. bovinus*, *T. lineola*, *T. similis*; *Tannia* spp., *Thecodiplosis japonensis*, *Tipula oleracea*, *Tipula paludosa* y *Wohlfahrtia* spp;

insectos del orden **Thysanoptera**, por ejemplo, *Baliothrips biformis*, *Dichromothrips corbetti*, *Dichromothrips* ssp., *Echinothrips americanus*, *Enneothrips*

flavens, *Frankliniella* spp., tales como *F. fusca*, *F. occidentalis*, *F. tritici*; *Heliethrips* spp., *Hercinothrips femoralis*, *Kakothrips* spp., *Microcephalothrips abdominalis*, *Neohydatothrips samayunkur*, *Pezothrips kellyanus*, *Rhipiphorothrips cruentatus*, *Scirtothrips* spp., tales como *S. citri*, *S. dorsalis*, *S. perseae*; *Stenchaetothrips* spp., *Taeniothrips cardamoni*, *Taeniothrips inconsequens*, *Thrips* spp., tales como *T. imagines*, *T. hawaiiensis*, *T. oryzae*, *T. palmi*, *T. parvispinus*, *T. tabaci*;

insectos del orden **Hemiptera**, por ejemplo, *Acizzia jamatonica*, *Acrosternum* spp., tales como *A. hilare*; *Acyrtosipon* spp., tales como *A. onobrychis*, *A. pisum*; *Adelges laricis*, *Adelges tsugae*, *Adelphocoris* spp., tales como *A. rapidus*, *A. superbus*; *Aeneolamia* spp., *Agonoscena* spp., *Aulacorthum solani*, *Aleurocanthus woglumi*, *Aleurodes* spp., *Aleurodicus disperses*, *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus* spp., *Amrasca* spp., *Anasa tristis*, *Antestiopsis* spp., *Anuraphis cardui*, *Aonidiella* spp., *Aphanostigma piri*, *Aphidula nasturtii*, *Aphis* spp., tales como *A. craccivora*, *A. fabae*, *A. forbesi*, *A. gossypii*, *A. grossulariae*, *A. maidiradicis*, *A. pomi*, *A. sambuci*, *A. schneideri*, *A. spiraecola*; *Arboridia apicalis*, *Arilus critatus*, *Aspidiella* spp., *Aspidiotus* spp., *Atanus* spp., *Aulacaspis yasumatsui*, *Aulacorthum solani*, *Bactericera cockerelli* (*Paratrioza cockerelli*), *Bemisia* spp., tales como *B. argentifolii*, *B. tabaci* (*Aleurodes tabaci*); *Blissus* spp., tales como *B. leucopterus*; *Brachycaudus* spp., tales como *B. cardui*, *B. helichrysi*, *B. persicae*, *B. prunicola*; *Brachycolus* spp., *Brachycorynella asparagi*, *Brevicoryne brassicae*, *Cacopsylla* spp., tales como *C. fulguralis*, *C. pyricola* (*Psylla piri*); *Calligypona marginata*, *Calocoris* spp., *Campylomma livida*, *Capitophorus horni*, *Carneocephala fulgida*, *Cavelerius* spp., *Ceraplastes* spp., *Ceratovacuna lanigera*, *Ceroplastes ceriferus*, *Cerosipha gossypii*, *Chaetosiphon fragaefolii*, *Chionaspis tegalensis*, *Chlorita onukii*, *Chromaphis juglandicola*, *Chrysomphalus ficus*, *Cicadulina mbila*, *Cimex* spp., tales como *C. hemipterus*, *C. lectularius*; *Coccoxylus halli*, *Coccus* spp., tales como *C. hesperidum*, *C. pseudomagnoliarum*; *Corythucha arcuata*, *Creontiades dilutus*, *Cryptomyzus ribis*, *Chrysomphalus aonidum*, *Cryptomyzus ribis*, *Ctenarytaina spatulata*, *Cyrtopeltis notatus*, *Dalbulus* spp., *Dasynus piperis*, *Dialeurodes* spp., tales como *D. citrifolii*; *Dalbulus maidis*, *Diaphorina* spp., tales como *D. citri*; *Diaspis* spp., tales como *D. bromeliae*; *Dichelops furcatus*, *Diconocoris hewetti*, *Doralis* spp., *Dreyfusia nordmannianae*, *Dreyfusia piceae*, *Drosicha* spp., *Dysaphis* spp., tales como *D. plantaginea*, *D. pyri*, *D. radicola*; *Dysaulacorthum pseudosolani*, *Dysdercus* spp., tales como *D. cingulatus*, *D. intermedius*; *Dysmicoccus* spp., *Edessa* spp., *Geocoris* spp., *Empoasca* spp., tales como *E. fabae*, *E. solana*; *Epidiaspis leperii*, *Eriosoma* spp., tales como *E. lanigerum*,

E. pyricola; *Erythroneura* spp., *Eurygaster* spp., tales como *E. integriceps*; *Euscelis bilobatus*, *Euschistus* spp., tales como *E. heros*, *E. impictiventris*, *E. servus*; *Fiorinia theae*, *Geococcus coffeae*, *Glycaspis brimblecombei*, *Halyomorpha* spp., tales como *H. halys*; *Heliopeltis* spp., *Homalodisca vitripennis* (= *H. coagulata*), *Horcias nobilellus*, *Hyalopterus pruni*, *Hyperomyzus lactucae*, *Icerya* spp., tales como *I. purchasi*; *Idiocerus* spp., *Idioscopus* spp., *Laodelphax striatellus*, *Lecanium* spp., *Lecanoides floccissimus*, *Lepidosaphes* spp., tales como *L. ulmi*; *Leptocorisa* spp., *Leptoglossus phyllopus*, *Lipaphis erysimi*, *Lygus* spp., tales como *L. hesperus*, *L. lineolaris*, *L. pratensis*; *Maconellicoccus hirsutus*, *Marchalina hellenica*, *Macropes excavatus*, *Macrosiphum* spp., tales como *M. rosae*, *M. avenae*, *M. euphorbiae*; *Macrosteles quadrilineatus*, *Mahanarva fimbriolata*, *Megacopta cribraria*, *Megoura viciae*, *Melanaphis pyraeae*, *Melanaphis sacchari*, *Melanocallis* (= *Tinocallis*) *caryaefoliae*, *Metcalfeella* spp., *Metopolophium dirhodum*, *Monellia costalis*, *Monelliopsis pecanis*, *Myzocallis coryli*, *Murgantia* spp., *Myzus* spp., tales como *M. ascalonicus*, *M. cerasi*, *M. nicotianae*, *M. persicae*, *M. varians*; *Nasonovia ribis-nigri*, *Neotoxoptera formosana*, *Neomegalotomus* spp., *Nephotettix* spp., tales como *N. malayanus*, *N. nigropictus*, *N. parvus*, *N. virescens*; *Nezara* spp., tales como *N. viridula*; *Nilaparvata lugens*, *Nysius huttoni*, *Oebalus* spp., tales como *O. pugnax*; *Oncometopia* spp., *Orthezia praelonga*, *Oxycaraenus hyalinipennis*, *Parabemisia myricae*, *Parlatoria* spp., *Parthenolecanium* spp., tales como *P. corni*, *P. persicae*; *Pemphigus* spp., tales como *P. bursarius*, *P. populivivae*; *Peregrinus maidis*, *Perkinsiella saccharicida*, *Phenacoccus* spp., tales como *P. aceris*, *P. gossypii*; *Phloeomyzus passerinii*, *Phorodon humuli*, *Phylloxera* spp., tales como *P. devastatrix*, *Piesma quadrata*, *Piezodorus* spp., tales como *P. guildinii*; *Pinnaspis aspidistrae*, *Planococcus* spp., tales como *P. citri*, *P. ficus*; *Prosapia bicincta*, *Protopulvinaria pyriformis*, *Psallus seriatus*, *Pseudacysta perseae*, *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pseudococcus* spp., tales como *P. comstocki*; *Psylla* spp., tales como *P. mali*; *Pteromalus* spp., *Pulvinaria amygdali*, *Pyrilla* spp., *Quadrastipidiotus* spp., tales como *Q. perniciosus*; *Quesada gigas*, *Rastrococcus* spp., *Reduvius senilis*, *Rhizoecus americanus*, *Rhodnius* spp., *Rhopalomyzus ascalonicus*, *Rhopalosiphum* spp., tales como *R. pseudobrassicarum*, *R. insertum*, *R. maidis*, *R. padi*; *Sagatodes* spp., *Sahlbergella singularis*, *Saissetia* spp., *Sappaphis mala*, *Sappaphis mali*, *Scaptocoris* spp., *Scaphoides titanus*, *Schizaphis graminum*, *Schizoneura lanuginosa*, *Scotinophora* spp., *Selenaspidus articulatus*, *Sitobion avenae*, *Sogatella* spp., *Sogatella furcifera*, *Solubea insularis*, *Spissistilus festinus* (= *Stictocephala festina*), *Stephanitis nashi*, *Stephanitis pyrioides*, *Stephanitis takeyai*, *Tenalaphara*

malayensis, *Tetraleurodes perseae*, *Therioaphis maculate*, *Thyanta* spp., tales como *T. accerra*, *T. perditor*; *Tibraca* spp., *Tomaspis* spp., *Toxoptera* spp., tales como *T. aurantii*; *Trialeurodes* spp., tales como *T. abutilonea*, *T. ricini*, *T. vaporariorum*; *Triatoma* spp., *Trioza* spp., *Typhlocyba* spp., *Unaspis* spp., tales como *U. citri*, *U. yanonensis*; y *Viteus vitifolii*,

insectos del orden **Hymenoptera**, por ejemplo, *Acanthomyops interjectus*, *Athalia rosae*, *Atta* spp., tales como *A. capiguara*, *A. cephalotes*, *A. cephalotes*, *A. laevigata*, *A. robusta*, *A. sexdens*, *A. texana*, *Bombus* spp., *Brachymyrmex* spp., *Camponotus* spp., tales como *C. floridanus*, *C. pennsylvanicus*, *C. modoc*; *Cardiocondyla nuda*, *Chalibion* sp, *Crematogaster* spp., *Dasymutilla occidentalis*, *Diprion* spp., *Dolichovespula maculata*, *Dorymyrmex* spp., *Dryocosmus kuriphilus*, *Formica* spp., *Hoplocampa* spp., tales como *H. minuta*, *H. testudinea*; *Iridomyrmex humilis*, *Lasius* spp., tales como *L. niger*, *Linepithema humile*, *Liometopum* spp., *Leptocybe invasa*, *Monomorium* spp., tales como *M. pharaonis*, *Monomorium*, *Nylandria fulva*, *Pachycondyla chinensis*, *Paratrechina longicornis*, *Paravespula* spp., tales como *P. germanica*, *P. pennsylvanica*, *P. vulgaris*; *Pheidole* spp., tales como *P. megacephala*; *Pogonomyrmex* spp., tales como *P. barbatus*, *P. californicus*, *Polistes rubiginosa*, *Prenolepis impairs*, *Pseudomyrmex gracilis*, *Schelipron* spp., *Sirex cyaneus*, *Solenopsis* spp., tales como *S. geminata*, *S. invicta*, *S. molesta*, *S. richteri*, *S. xyloni*, *Sphecius speciosus*, *Sphex* spp., *Tapinoma* spp., tales como *T. melanocephalum*, *T. sessile*; *Tetramorium* spp., tales como *T. caespitum*, *T. bicarinatum*, *Vespa* spp., tales como *V. crabro*; *Vespula* spp., tales como *V. squamosal*; *Wasmannia auropunctata*, *Xylocopa* sp;

insectos del orden **Orthoptera**, por ejemplo, *Acheta domesticus*, *Calliptamus italicus*, *Chortoicetes terminifera*, *Ceuthophilus* spp., *Diastrammena asynamora*, *Dociostaurus maroccanus*, *Gryllotalpa* spp., tales como *G. africana*, *G. gryllotalpa*; *Gryllus* spp., *Hieroglyphus daganensis*, *Kraussaria angulifera*, *Locusta* spp., tales como *L. migratoria*, *L. pardalina*; *Melanoplus* spp., tales como *M. bivittatus*, *M. femurrubrum*, *M. mexicanus*, *M. sanguinipes*, *M. spretus*; *Nomadacris septemfasciata*, *Oedaleus senegalensis*, *Scapteriscus* spp., *Schistocerca* spp., tales como *S. americana*, *S. gregaria*, *Stemopelmatus* spp., *Tachycines asynamorus* y *Zonozerus variegatus*;

plagas de la clase **Arachnida**, por ejemplo, **Acari**, por ejemplo, de las familias Argasidae, Ixodidae y Sarcoptidae, tales como *Amblyomma* spp. (por ejemplo, *A. americanum*, *A. variegatum*, *A. maculatum*), *Argas* spp., tales como *A. persicu*),

Boophilus spp., tales como *B. annulatus*, *B. decoloratus*, *B. microplus*, *Dermacentor* spp., tales como *D. silvarum*, *D. andersoni*, *D. variabilis*, *Hyalomma* spp., tales como *H. truncatum*, *Ixodes* spp., tales como *I. ricinus*, *I. rubicundus*, *I. scapularis*, *I. holocyclus*, *I. pacificus*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Ornithodoros* spp., tales como *O. moubata*, *O. hermsi*, *O. turicata*, *Ornithonyssus bacoti*, *Otobius megnini*, *Dermanyssus gallinae*, *Psoroptes* spp., tales como *P. ovis*, *Rhipicephalus* spp., tales como *R. sanguineus*, *R. appendiculatus*, *Rhipicephalus evertsi*, *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., tales como *S. Scabiei*; y la familia **Eriophyidae**, que incluye *Aceria* spp., tales como *A. sheldoni*, *A. anthocoptes*, *Acallitus* spp., *Aculops* spp., tales como *A. lycopersici*, *A. pelekassi*; *Aculus* spp., tales como *A. schlechtendali*; *Colomerus vitis*, *Epitrimerus pyri*, *Phyllocoptruta oleivora*; *Eriophytes ribis* y *Eriophyes* spp., tales como *Eriophyes sheldoni*; familia **Tarsonemidae**, que incluye *Hemitarsonemus* spp., *Phytonemus pallidus* y *Polyphagotarsonemus latus*, *Stenotarsonemus* spp. *Steneotarsonemus spinki*; familia **Tenuipalpidae**, que incluye *Brevipalpus* spp., tales como *B. phoenicis*; familia **Tetranychidae**, que incluye *Eotetranychus* spp., *Eutetranychus* spp., *Oligonychus* spp., *Petrobia latens*, *Tetranychus* spp., tales como *T. cinnabarinus*, *T. evansi*, *T. kanzawai*, *T. pacificus*, *T. phaseolus*, *T. telarius* y *T. urticae*; *Bryobia praetiosa*; *Panonychus* spp., tales como *P. ulmi*, *P. citri*; *Metatetranychus* spp. y *Oligonychus* spp., tales como *O. pratensis*, *O. perseae*, *Vasates lycopersici*; *Raoiella indica*, familia **Carpoglyphidae**, que incluye *Carpoglyphus* spp.; *Penthaleidae* spp., tales como *Halotydeus destructor*; familia **Demodicidae** con especies tales como *Demodex* spp.; familia **Trombicidea**, que incluye *Trombicula* spp.; familia **Macronyssidae**, que incluye *Ornithonyssus* spp.; familia **Pyemotidae**, que incluye *Pyemotes tritici*; *Tyrophagus putrescentiae*; familia **Acaridae**, que incluye *Acarus siro*; familia **Araneida**, que incluye *Latrodectus mactans*, *Tegenaria agrestis*, *Chiracanthium* sp, *Lycosa* sp *Achaeearanea tepidariorum* y *Loxosceles reclusa*;

plagas del filo **Nematoda**, por ejemplo, nematodos parasitarios de plantas, tales como nematodos de nudos radiculares, *Meloidogyne* spp., tales como *M. hapla*, *M. incognita*, *M. javanica*; nematodos formadores de quistes, *Globodera* spp., tales como *G. rostochiensis*; *Heterodera* spp., tales como *H. avenae*, *H. glycines*, *H. schachtii*, *H. trifolii*; nematodos de agallas de semillas, *Anguina* spp.; nematodos de tallo y hoja, *Aphelenchoides* spp., tales como *A. besseyi*; nematodos de aguijón, *Belonolaimus* spp., tales como *B. longicaudatus*; nematodos de pino, *Bursaphelenchus* spp., tales como *B. lignicolus*, *B. xylophilus*; nematodos anulares, *Criconema* spp., *Criconemella* spp., tales como *C. xenoplax* y *C. ornata*; y *Criconemoides* spp., tales

como *Criconemoides informis*; *Mesocriconema* spp.; nematodos de tallo y bulbo, *Ditylenchus* spp., tales como *D. destructor*, *D. dipsaci*; nematodos de lezna, *Dolichodorus* spp.; nematodos espiralados, *Heliocotylenchus multicinctus*; nematodos de vaina y envainados, *Hemicyclophora* spp. y *Hemicriconemoides* spp.; *Hirshmanniella* spp.; nematodos lanciformes, *Hoploaimus* spp.; nematodos de nudo radicular falso, *Nacobbus* spp.; nematodos aciculares, *Longidorus* spp., tales como *L. elongatus*; nematodos lesivos, *Pratylenchus* spp., tales como *P. brachyurus*, *P. neglectus*, *P. penetrans*, *P. curvatus*, *P. goodeyi*; nematodos de cueva, *Radopholus* spp., tales como *R. similis*; *Rhadopholus* spp.; *Rhodopholus* spp.; nematodos reniformes, *Rotylenchus* spp., tales como *R. robustus*, *R. reniformis*; *Scutellonema* spp.; nematodos de raíces leñosas, *Trichodorus* spp., tales como *T. obtusus*, *T. primitivus*; *Paratrichodorus* spp., tales como *P. minor*; nematodos atrofiados, *Tylenchorhynchus* spp., tales como *T. claytoni*, *T. dubius*; nematodos de los cítricos, *Tylenchulus* spp., tales como *T. semipenetrans*; nematodos puñaliformes, *Xiphinema* spp.; y otras especies de nematodos parasitarios de plantas;

insectos del orden **Isoptera**, por ejemplo, *Calotermes flavicollis*, *Coptotermes* spp., tales como *C. formosanus*, *C. gestroi*, *C. acinaciformis*; *Cornitermes cumulans*, *Cryptotermes* spp., tales como *C. brevis*, *C. cavifrons*; *Globitermes sulfureus*, *Heterotermes* spp., tales como *H. aureus*, *H. longiceps*, *H. tenuis*; *Leucotermes flavipes*, *Odontotermes* spp., *Incisitermes* spp., tales como *I. minor*, *I. Snyder*, *Marginitermes hubbardi*, *Mastotermes* spp., tales como *M. darwiniensis*, *Neocapritermes* spp., tales como *N. opacus*, *N. parvus*; *Neotermes* spp., *Procornitermes* spp., *Zootermopsis* spp., tales como *Z. angusticollis*, *Z. nevadensis*, *Reticulitermes* spp., tales como *R. hesperus*, *R. tibialis*, *R. speratus*, *R. flavipes*, *R. grassei*, *R. lucifugus*, *R. santonensis*, *R. virginicus*; *Termes natalensis*,

insectos del orden **Blattaria**, por ejemplo, *Blatta* spp., tales como *B. orientalis*, *B. lateralis*; *Blattella* spp., tales como *B. asahinae*, *B. germanica*; *Leucophaea maderae*, *Panchlora nivea*, *Periplaneta* spp., tales como *P. americana*, *P. australasiae*, *P. brunnea*, *P. fuliginosa*, *P. japonica*; *Supella longipalpa*, *Parcoblatta pennsylvanica*, *Eurycotis floridana*, *Pycnoscelus surinamensis*,

insectos del orden **Siphonoptera**, por ejemplo, *Cediopsylla simplex*, *Ceratophyllus* spp., *Ctenocephalides* spp., tales como *C. felis*, *C. canis*, *Xenopsylla cheopis*, *Pulex irritans*, *Trichodectes canis*, *Tunga penetrans* y *Nosopsyllus fasciatus*,

insectos del orden **Thysanura**, por ejemplo, *Lepisma saccharina*, *Ctenolepisma urbana* y *Thermobia domestica*,

plagas de la clase **Chilopoda**, por ejemplo, *Geophilus* spp., *Scutigera* spp., tales como *Scutigera coleoptrata*;

plagas de la clase **Diplopoda**, por ejemplo, *Blaniulus guttulatus*, *Julus* spp., *Narceus* spp.,

plagas de la clase **Symphyla**, por ejemplo, *Scutigera immaculata*,

insectos del orden **Dermaptera**, por ejemplo, *Forficula auricularia*,

insectos del orden **Collembola**, por ejemplo, *Onychiurus* spp., tales como *Onychiurus armatus*,

plagas del orden **Isopoda**, por ejemplo, *Armadillidium vulgare*, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*,

insectos del orden **Phthiraptera**, por ejemplo, *Damalinia* spp., *Pediculus* spp., tales como *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pediculus humanus humanus*; *Pthirus pubis*, *Haematopinus* spp., tales como *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus suis*; *Linognathus* spp., tales como *Linognathus vituli*; *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*, *Menacanthus stramineus* y *Solenopotes capillatus*, *Trichodectes* spp.,

Algunos ejemplos de otras especies de plagas que se pueden controlar mediante compuestos de la Fórmula (I) incluyen: del filo **Mollusca**, clase **Bivalvia**, por ejemplo, *Dreissena* spp.; clase **Gastropoda**, por ejemplo, *Arion* spp., *Biomphalaria* spp., *Bulinus* spp., *Deroceras* spp., *Galba* spp., *Lymnaea* spp., *Oncomelania* spp., *Pomacea canaliculata*, *Succinea* spp.; de la clase de los **helminths**, por ejemplo, *Ancylostoma duodenale*, *Ancylostoma ceylanicum*, *Ancylostoma braziliensis*, *Ancylostoma* spp., *Ascaris lubricoides*, *Ascaris* spp., *Brugia malayi*, *Brugia timori*, *Bunostomum* spp., *Chabertia* spp., *Clonorchis* spp., *Cooperia* spp., *Dicrocoelium* spp., *Dictyocaulus filaria*, *Diphyllbothrium latum*, *Dracunculus medinensis*, *Echinococcus granulosus*, *Echinococcus multilocularis*, *Enterobius vermicularis*, *Faciola* spp., *Haemonchus* spp., tales como *Haemonchus contortus*; *Heterakis* spp., *Hymenolepis nana*, *Hyostrongylus* spp., *Loa Loa*, *Nematodirus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Opisthorchis* spp., *Onchocerca volvulus*, *Ostertagia* spp., *Paragonimus* spp., *Schistosomen* spp., *Strongyloides fuelleborni*, *Strongyloides stercoralis*, *Strongyloides* spp., *Taenia saginata*, *Taenia solium*, *Trichinella spiralis*, *Trichinella nativa*, *Trichinella britovi*, *Trichinella nelsoni*, *Trichinella pseudopsiralis*, *Trichostrongylus* spp., *Trichuris trichuria*, *Wuchereria bancrofti*.

Salud animal

Los compuestos de la presente invención son adecuados para tratar o proteger animales contra la infestación o la infección por parásitos. Por lo tanto, la presente invención también se refiere al uso de un compuesto de la presente invención para fabricar un medicamento para el tratamiento o la protección de animales contra infestación o infección por parásitos. Además, la presente invención se refiere a un método para tratar o proteger animales contra infestación e infección por parásitos, que comprende administrar o aplicar por vía oral, tópica o parenteral a los animales una cantidad eficaz como parasitocida de un compuesto de la presente invención.

La presente invención también se refiere al uso no terapéutico de los compuestos de la presente invención para tratar o proteger animales contra infestación e infección por parásitos. Además, la presente invención se refiere a un método no terapéutico para tratar o proteger animales contra infestación e infección por parásitos, que comprende aplicar a un locus una cantidad eficaz como parasitocida de un compuesto de la presente invención.

Los compuestos de la presente invención también son adecuados para combatir o controlar parásitos en animales. Además, la presente invención se refiere a un método para combatir o controlar parásitos en animales, que comprende poner en contacto los parásitos con una cantidad eficaz como parasitocida de un compuesto de la presente invención.

La presente invención también se refiere al uso no terapéutico de los compuestos de la presente invención para controlar o combatir parásitos. Además, la presente invención se refiere a un método no terapéutico para combatir o controlar parásitos, que comprende aplicar a un locus una cantidad eficaz como parasitocida de un compuesto de la presente invención.

Los compuestos de la presente invención pueden ser eficaces mediante contacto (a través del suelo, vidrio, pared, mosquitero, alfombra, frazadas o partes de animales) y mediante ingestión (por ejemplo, cebos). Además, los compuestos de la presente invención se pueden aplicar a todas las etapas de desarrollo.

Los compuestos de la presente invención se pueden aplicar como tales o en forma de composiciones que comprenden los compuestos de la presente invención.

Los compuestos de la presente invención también se pueden aplicar junto con un componente de mezcla, que actúa contra parásitos patógenos, por ejemplo, con compuestos sintéticos contra la coccidiosis, politerantibióticos, tales como Amprolium, Robenidin, Toltrazuril, Monensin, Salinomycin, Maduramicin, Lasalocid, Narasin o Semduramicin, o con otros componentes de mezcla como se definieron anteriormente,

o en forma de composiciones que comprenden estas mezclas.

Los compuestos de la presente invención y las composiciones que los comprenden se pueden aplicar por vía oral, parenteral o tópica, por ejemplo, de manera dérmica. Los compuestos de la presente invención pueden ser sistémicamente o no sistémicamente eficaces.

La aplicación se puede realizar de manera profiláctica, terapéutica o no terapéutica. Además, la aplicación se puede realizar de manera preventiva en lugares en donde puede preverse la existencia de parásitos.

Como se usa en la presente, la expresión “poner en contacto” incluye el contacto directo (aplicar los compuestos/composiciones directamente sobre el parásito, lo que incluye la aplicación directa sobre el animal o excluye la aplicación directa sobre el animal, por ejemplo, en el locus de este) y el contacto indirecto (aplicar los compuestos/composiciones al locus del parásito). El contacto del parásito mediante la aplicación en su locus es un ejemplo de uso no terapéutico de los compuestos de la presente invención.

El término “locus” significa el hábitat, suministro alimenticio, lugar de reproducción, área, material o entorno en el cual el parásito crece o puede crecer fuera del animal.

Como se usa en la presente, el término “parásitos” incluye endoparásitos y ectoparásitos. En algunas formas de realización de la presente invención, se prefieren los endoparásitos. En otras formas de realización, se prefieren los ectoparásitos. Las infestaciones en animales de sangre caliente y peces incluyen, entre otras, piojos, piojos picadores, garrapatas, tábano nasal, melófago, moscas picadoras, moscas muscoides, moscas, larvas miásicas voladoras, niguas, culícidos, mosquitos y pulgas.

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

pulgas (Siphonaptera), por ejemplo, *Ctenocephalides felis*, *Ctenocephalides canis*, *Xenopsylla cheopis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans* y *Nosopsyllus fasciatus*; **cucarachas (Blattaria - Blattodea)**, por ejemplo, *Blattella germanica*, *Blattella asahinae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta japonica*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta australasiae* y *Blatta orientalis*; **moscas, mosquitos (Diptera)**, por ejemplo, *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Anopheles crucians*, *Anopheles albimanus*, *Anopheles gambiae*, *Anopheles freeborni*, *Anopheles leucosphyrus*, *Anopheles minimus*, *Anopheles quadrimaculatus*, *Calliphora vicina*, *Chrysomya*

bezziana, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Chrysops discalis*, *Chrysops silacea*, *Chrysops atlanticus*, *Cochliomyia hominivorax*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culicoides furens*, *Culex pipiens*, *Culex nigripalpus*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex tarsalis*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Dermatobia hominis*, *Fannia canicularis*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Glossina palpalis*, *Glossina fuscipes*, *Glossina tachinoides*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hippelates* spp., *Hypoderma lineata*, *Leptoconops torrens*, *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Lycoria pectoralis*, *Mansonia* spp., *Musca domestica*, *Muscina stabulans*, *Oestrus ovis*, *Phlebotomus argentipes*, *Psorophora columbiae*, *Psorophora discolor*, *Prosimulium mixtum*, *Sarcophaga haemorrhoidalis*, *Sarcophaga* sp., *Simulium vittatum*, *Stomoxys calcitrans*, *Tabanus bovinus*, *Tabanus atratus*, *Tabanus lineola* y *Tabanus similis*; **piojos (Phthiraptera)**, por ejemplo, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pthirus pubis*, *Haematopinus eurytetrus*, *Haematopinus suis*, *Linognathus vituli*, *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*, *Menacanthus stramineus* y *Solenopotes capillatus*; **garrapatas y ácaros parásitos (Parasitiformes): garrapatas (Ixodida)**, por ejemplo, *Ixodes scapularis*, *Ixodes holocyclus*, *Ixodes pacificus*, *Rhiphicephalus sanguineus*, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor variabilis*, *Amblyomma americanum*, *Amblyomma maculatum*, *Ornithodoros hermsi*, *Ornithodoros turicata* y **ácaros parásitos (Mesostigmata)**, por ejemplo, *Ornithonyssus bacoti* y *Dermanyssus gallinae*; **Actiniedida (Prostigmata) y Acaridida (Astigmata)**, por ejemplo, *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Ornithocheyletia* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Listrophorus* spp., *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp. y *Laminosioptes* spp.; **chinches (Heteropterida): Cimex lectularius**, *Cimex hemipterus*, *Reduvius senilis*, *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp. y *Arilus critatus*; **Anoplurida**, por ejemplo, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Pthirus* spp. y *Solenopotes* spp.; **Malofágidos (subórdenes Amblycerina e Ischnocerina)**, por ejemplo, *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Trichodectes* spp. y *Felicola* spp.; **nematodos redondos: tricocéfalo y triquinosis (Trichosyringida)**, por ejemplo, *Trichinellidae* (*Trichinella* spp.), (*Trichuridae*) *Trichuris* spp., *Capillaria* spp.; **Rhabditida**, por ejemplo, *Rhabditis* spp., *Strongyloides* spp., *Helicephalobus* spp.; **Strongylida**, por ejemplo, *Strongylus* spp., *Ancylostoma* spp., *Necator americanus*, *Bunostomum* spp. (Hookworm),

Trichostrongylus spp., *Haemonchus contortus*, *Ostertagia* spp., *Cooperia* spp., *Nematodirus* spp., *Dictyocaulus* spp., *Cyathostoma* spp., *Oesophagostomum* spp., *Stephanurus dentatus*, *Ollulanus* spp., *Chabertia* spp., *Stephanurus dentatus*, *Syngamus trachea*, *Ancylostoma* spp., *Uncinaria* spp., *Globocephalus* spp., *Necator* spp., *Metastrongylus* spp., *Muellerius capillaris*, *Protostrongylus* spp., *Angiostrongylus* spp., *Parelaphostrongylus* spp., *Aleurostrongylus abstrusus*, y *Dioctophyma renale*; **vermes intestinales (Ascaridida)**, por ejemplo, *Ascaris lumbricoides*, *Ascaris suum*, *Ascaridia galli*, *Parascaris equorum*, *Enterobius vermicularis* (Oxiuro), *Toxocara canis*, *Toxascaris leonine*, *Skrjabinema* spp. y *Oxyuris equi*; **Camallanida**, por ejemplo, *Dracunculus medinensis* (gusano de Guinea); **Spirurida**, por ejemplo, *Thelazia* spp., *Wuchereria* spp., *Brugia* spp., *Onchocerca* spp., *Dirofilari* spp.a, *Dipetalonema* spp., *Setaria* spp., *Elaeophora* spp., *Spirocerca lupi* y *Habronema* spp.; **gusanos de cabeza espinosa (Acanthocephala)**, por ejemplo, *Acanthocephalus* spp., *Macracanthorhynchus hirudinaceus* y *Oncicola* spp.; **planarias (Plathelminthes): trematodos (Trematoda)**, por ejemplo, *Faciola* spp., *Fascioloides magna*, *Paragonimus* spp., *Dicrocoelium* spp., *Fasciolopsis buski*, *Clonorchis sinensis*, *Schistosoma* spp., *Trichobilharzia* spp., *Alaria alata*, *Paragonimus* spp. y *Nanocyetes* spp.; **Cercomeromorpha**, en particular, **Cestoda (gusanos acintados)**, por ejemplo, *Diphyllobothrium* spp., *Tenia* spp., *Echinococcus* spp., *Dipylidium caninum*, *Multiceps* spp., *Hymenolepis* spp., *Mesocostoides* spp., *Vampirolepis* spp., *Moniezia* spp., *Anoplocephala* spp., *Sirometra* spp., *Anoplocephala* spp. y *Hymenolepis* spp.

Como se usa en la presente, el término "animal" incluye animales de sangre caliente (incluso seres humanos) y peces. Se prefieren mamíferos, tales como ganado bovino, ovejas, cerdos, camellos, ciervos, caballos, puercos, aves de corral, conejos, cabras, perros y gatos, búfalo de agua, burros, dama dama y reno, y también en animales con pelaje, tales como visones, chinchillas y mapaches, aves, tales como gallinas, gansos, pavos y patos, y peces, tales como peces de agua dulce y salada, tales como truchas, carpas y anguilas. En particular, se prefieren los animales domésticos, tales como perros o gatos.

En general, "cantidad eficaz como parasitocida" significa la cantidad de ingrediente activo necesario para lograr un efecto considerable sobre el crecimiento, incluso los efectos de necrosis, muerte, retraso, prevención y eliminación, destrucción o, de otro modo, reducir la aparición y actividad del organismo diana. La cantidad eficaz como parasitocida puede variar según los distintos compuestos/composiciones usados en la invención. Una cantidad eficaz como parasitocida de las composiciones

también variará de acuerdo con las condiciones predominantes, tales como el efecto y la duración parasitocida deseada, las especies diana, el modo de aplicación y similares.

Generalmente, es ventajoso aplicar los compuestos de la presente invención en cantidades totales de 0,5 mg/kg a 100 mg/kg por día, preferentemente, de 1 mg/kg a 50 mg/kg por día.

Para la administración oral a animales de sangre caliente, los compuestos de la Fórmula I se pueden formular como alimentos para animales, premezclas de alimentos para animales, concentrados de alimentos para animales, píldoras, soluciones, pastas, suspensiones, enjuagues, geles, comprimidos, bolos y cápsulas. Además, los compuestos de la Fórmula I se pueden administrar a los animales en su agua de beber. Para la administración oral, la forma de dosificación elegida debe proporcionarle al animal de 0,01 mg/kg a 100 mg/kg del peso corporal del animal por día del compuesto de la Fórmula I, preferentemente, de 0,5 mg/kg a 100 mg/kg del peso corporal del animal por día.

Alternativamente, los compuestos de la Fórmula I pueden ser administrados a los animales de manera parenteral, por ejemplo, mediante inyección intrarruminal, intramuscular, intravenosa o subcutánea. Los compuestos de la Fórmula (I) se pueden dispersar o disolver en un portador aceptable desde el punto de vista fisiológico para la inyección subcutánea. Alternativamente, los compuestos de la Fórmula I se pueden formular en un implante para la administración subcutánea. Además, los compuestos de la Fórmula I se pueden administrar de manera transdérmica a los animales. Para la administración parenteral, la forma de dosificación elegida debe proporcionar al animal 0,01 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal del animal por día del compuesto de la Fórmula I.

Los compuestos de la Fórmula I también se pueden aplicar de manera tópica a los animales en forma de inmersiones, polvos, polvillos, collares, medallones, pulverizaciones, champús, formulaciones para aplicar en el lugar o para verter y pomadas o emulsiones de agua en aceite o de aceite en agua. Para la aplicación tópica, las inmersiones y pulverizaciones contienen, generalmente, de 0,5 ppm a 5000 ppm y, con preferencia, de 1 ppm a 3000 ppm del compuesto de la Fórmula I. Además, los compuestos de la Fórmula I se pueden formular como caravanas para orejas de animales, en particular, cuadrúpedos, tales como ganado bovino y ovino.

Las preparaciones adecuadas son:

- soluciones, tales como soluciones orales, concentrados para la administración oral luego de la dilución, soluciones para usar sobre la piel o en cavidades corporales,

formulaciones para verter, geles;

- emulsiones y suspensiones para la administración oral o dérmica; preparaciones semisólidas;
- formulaciones en las cuales el compuesto activo se procesa en una base de pomada o en una base de emulsión de aceite en agua o de agua en aceite;
- preparaciones sólidas, tales como polvos, premezclas o concentrados, gránulos, pelets, comprimidos, bolos, cápsulas; aerosoles e inhaladores, y artículos de diferentes formas que contienen el compuesto activo.

Las composiciones adecuadas para la inyección se preparan disolviendo el ingrediente activo en un solvente adecuado y, opcionalmente, agregando otros auxiliares, tales como ácidos, bases, sales amortiguadoras, conservantes y solubilizantes. Los auxiliares adecuados para soluciones para inyección son conocidos en el estado de la técnica. Las soluciones se filtran y se rellenan estériles.

Las soluciones orales se administran directamente. Los concentrados se administran de manera oral luego de la dilución previa a la concentración de uso. Las soluciones orales y los concentrados se preparan de acuerdo con el estado de la técnica y como se describió anteriormente para las soluciones de inyección, sin que sea necesario utilizar procedimientos estériles.

Las soluciones para usar en la piel se aplican por goteo, por dispersión, por frotación, por esparcimiento o pulverización. Las soluciones para usar sobre la piel se preparan de acuerdo con el estado de la técnica y como se describió anteriormente para las soluciones inyectables, sin que sea necesario utilizar procedimientos estériles.

Los geles se aplican o se extienden sobre la piel o se introducen en cavidades del cuerpo. Los geles se preparan mediante el tratamiento de soluciones que fueron preparadas como se describe en el caso de las soluciones para inyección con una cantidad suficiente de espesante que hace que un material transparente tenga consistencia parecida a pomadas. Los espesantes adecuados son conocidos en el estado de la técnica.

Las formulaciones para verter se vierten o pulverizan en áreas limitadas de la piel, en donde el compuesto activo penetra en la piel y actúa sistémicamente. Las formulaciones para verter se preparan mediante la disolución, suspensión o emulsión del compuesto activo en solventes o mezclas de solventes adecuados, compatibles con la piel. Si es adecuado, se pueden agregar otros auxiliares, tales como colorantes, sustancias promotoras de la bioabsorción, antioxidantes, estabilizadores de luz, adhesivos. Dichos auxiliares adecuados son conocidos en el estado de la técnica.

Las emulsiones se pueden administrar de manera oral, dérmica o como inyecciones. Las emulsiones son de tipo agua en aceite o de aceite en agua. Se preparan al disolver el compuesto activo ya sea en la fase hidrófoba o hidrófila y homogeneizarlo con el solvente de la otra fase con la ayuda de emulgentes adecuados y, de ser adecuado, otros auxiliares, tales como colorantes, sustancias promotoras de la absorción, conservantes, antioxidantes, estabilizadores de luz, sustancias mejoradoras de la viscosidad. Las fases hidrófobas adecuadas (aceites), fases hidrófilas adecuadas, emulgentes adecuados y auxiliares adicionales adecuados para emulsiones son conocidos en el estado de la técnica.

Las suspensiones se pueden administrar de manera oral o tópica/dérmica. Se preparan suspendiendo el compuesto activo en un agente de suspensión, de ser adecuado, con adición de otros auxiliares, tales como agentes humectantes, colorantes, sustancias que promueven la bioabsorción, conservantes, antioxidantes, estabilizantes de luz. Los agentes de suspensión adecuados y auxiliares adicionales adecuados para suspensiones, que incluyen agentes humectantes, son conocidos en el estado de la técnica.

Las preparaciones semisólidas se pueden administrar de manera oral o tópica/dérmica. Se diferencian de las suspensiones y emulsiones antes descritas sólo por su más alta viscosidad.

Para la obtención de preparaciones sólidas, se mezcla el compuesto activo con excipientes adecuados, si es necesario con adición de auxiliares, y se los convierte en la forma deseada. Los auxiliares adecuados para este fin son conocidos en el estado de la técnica.

Las composiciones que se pueden usar en la invención pueden comprender, generalmente, de alrededor de 0,001 a 95 % del compuesto de la presente invención.

Las preparaciones listas para usar contienen los compuestos que actúan contra parásitos, preferentemente, ectoparásitos, en concentraciones de 10 ppm a 80 % en peso, preferentemente, de 0,1 a 65 % en peso, más preferentemente, de 1 a 50 % en peso, con máxima preferencia, de 5 a 40 % en peso.

Las preparaciones que se diluyen antes de usarlas contienen los compuestos que actúan contra ectoparásitos en concentraciones de 0,5 a 90 % en peso, preferentemente, de 1 a 50 % en peso.

Además, las preparaciones comprenden los compuestos de la Fórmula I contra endoparásitos en concentraciones de 10 ppm a 2 % en peso, preferentemente, de 0,05 a 0,9 % en peso, con muy particular preferencia, de 0,005 a 0,25 % en peso.

La aplicación tópica se puede realizar con artículos de diferentes formas que contienen el compuesto, tales como collares, medallones, caravanas para orejas, bandas para fijar a partes del cuerpo, y láminas y tiras adhesivas.

Generalmente, es ventajoso aplicar formulaciones sólidas que liberan los compuestos de la presente invención en cantidades totales de 10 mg/kg a 300 mg/kg, preferentemente, de 20 mg/kg a 200 mg/kg, con máxima preferencia, de 25 mg/kg a 160 mg/kg del peso corporal del animal tratado en el curso de tres semanas.

Formulaciones

La invención también se refiere a composiciones agroquímicas que comprenden un auxiliar y al menos un compuesto de la presente invención o una mezcla de estos.

Una composición agroquímica comprende una cantidad eficaz como plaguicida de un compuesto de la presente invención o una mezcla de estos. La expresión "cantidad eficaz como plaguicida" se define a continuación.

Los compuestos de la presente invención o las mezclas de estos se pueden convertir en los tipos habituales de composiciones agroquímicas, por ejemplo, soluciones, emulsiones, suspensiones, polvillo, polvos, pastas, gránulos, productos prensados, cápsulas y mezclas de estos. Los ejemplos de tipos de composiciones son suspensiones (por ejemplo, SC, OD, FS), concentrados emulsionables (por ejemplo, EC), emulsiones (por ejemplo, EW, EO, ES, ME), cápsulas (por ejemplo, CS, ZC), pastas, pastillas, polvos o polvillo humectables (por ejemplo, WP, SP, WS, DP, DS), productos prensados (por ejemplo, BR, TB, DT), gránulos (por ejemplo, WG, SG, GR, FG, GG, MG), artículos insecticidas (por ejemplo, LN), así como formulaciones en gel para el tratamiento de materiales de propagación vegetal, tales como semillas (por ejemplo, GF). Estos y otros tipos de composiciones se definen en "Catalogue of pesticide formulation types and international coding system", monografía técnica N.º 2, 6.ª edición, mayo de 2008, CropLife International.

Las composiciones se preparan de la manera conocida, como describen Mollet y Grubemann, *Formulation technology*, Wiley VCH, Weinheim, 2001; o Knowles, *New developments in crop protection product formulation*, Agrow Reports DS243, T&F Informa, Londres, 2005.

Los ejemplos de auxiliares adecuados son solventes, portadores líquidos, portadores sólidos o agentes de relleno, tensioactivos, dispersantes, emulgentes, hidratantes, adyuvantes, solubilizantes, mejoradores de la penetración, coloides

protectores, agentes de adhesión, espesantes, humectantes, repelentes, atrayentes, estimulantes alimenticios, compatibilizadores, bactericidas, agentes anticongelantes, agentes antiespuma, colorantes, mejoradores de la pegajosidad y aglutinantes.

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

Los portadores o agentes de relleno sólidos adecuados son tierras minerales, por ejemplo, silicatos, silicageles, talco, caolín, piedra caliza, cal viva, creta, arcilla, dolomita, tierra diatomácea, bentonita, sulfato de calcio, sulfato de magnesio, óxido de magnesio; polisacáridos en polvo, por ejemplo, celulosa, almidón; fertilizantes, por ejemplo, sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, ureas; productos de origen vegetal, por ejemplo, harina de cereal, harina de corteza de árbol, harina de madera, harina de cáscara de nuez y mezclas de estos.

Los tensioactivos adecuados son compuestos activos en la superficie, tales como tensioactivos aniónicos, catiónicos, no iónicos y anfóteros, polímeros en bloque, polielectrolitos y mezclas de estos. Dichos tensioactivos pueden usarse como emulgentes, dispersantes, solubilizantes, humectantes, mejoradores de la penetración, coloides protectores o adyuvantes. Los ejemplos de tensioactivos se enumeran en McCutcheon's, vol.1: Emulsifiers & Detergents, McCutcheon's Directories, Glen Rock, EE. UU., 2008 (Ed. internacional o ed. estadounidense).

Los tensioactivos aniónicos adecuados son sales alcalinas, alcalinotérreas o de amonio de sulfonatos, sulfatos, fosfatos, carboxilatos y mezclas de estos. Los ejemplos de sulfonatos son sulfonatos de alquilarilo, sulfonatos de difenilo, sulfonatos de alfa-olefina, sulfonatos de lignina, sulfonatos de ácidos grasos y aceites, sulfonatos de alquilfenoles etoxilados, sulfonatos de arilfenoles alcoxilados, sulfonatos de naftalenos condensados, sulfonatos de dodecilbencenos y tridecilbencenos, sulfonatos de naftalenos y alquilnaftalenos, sulfosuccinatos o sulfosuccinamatos. Los ejemplos de sulfatos son sulfatos de ácidos grasos y aceites, de alquilfenoles etoxilados, de alcoholes, de alcoholes etoxilados o de ésteres de ácidos grasos. Los ejemplos de

fosfatos son ésteres de fosfato. Los ejemplos de carboxilatos son alquilcarboxilatos, y alcohol carboxilado o etoxilados de alquilfenol.

Los tensioactivos no iónicos adecuados son alcoxilados, amidas de ácidos grasos sustituidos con N, óxidos de amina, ésteres, tensioactivos a base de azúcar, tensioactivos poliméricos y mezclas de estos. Los ejemplos de alcoxilados son compuestos, tales como alcoholes, alquilfenoles, aminas, amidas, arilfenoles, ácidos grasos o ésteres de ácidos grasos que se alcoxilaron con 1 a 50 equivalentes. El óxido de etileno y/o el óxido de propileno pueden emplearse para la alcoxilación, preferentemente, el óxido de etileno. Los ejemplos de aminas de ácidos grasos sustituidas con N son glucamidas de ácido graso o alcanolamidas de ácido graso. Los ejemplos de ésteres son ésteres de ácidos grasos, ésteres de glicerol o monoglicéridos. Los ejemplos de tensioactivos a base de azúcar son sorbitán, sorbitán etoxilado, ésteres de sacarosa y glucosa o alquilpoliglucósidos. Los ejemplos de tensioactivos poliméricos son homopolímeros o copolímeros de vinilpirrolidona, vinilalcoholes o vinilacetato.

Los tensioactivos catiónicos adecuados son tensioactivos cuaternarios, por ejemplo, compuestos de amonio cuaternario con 1 o 2 grupos hidrófobos o sales de aminas primarias de cadena larga. Los tensioactivos anfóteros adecuados son alquilbetaínas e imidazolininas. Los polímeros en bloque adecuados son polímeros en bloque de tipo A-B o A-B-A, que comprenden bloques de óxido de polietileno y óxido de polipropileno, o de tipo A-B-C, que comprenden alcohol, óxido de polietileno y óxido de polipropileno. Los polielectrolitos adecuados son poliácidos o polibases. Los ejemplos de poliácidos son sales alcalinas de ácido poliacrílico o polímeros poliácidos tipo peine. Los ejemplos de polibases son polivinilaminas o polietilenaminas.

Los adyuvantes adecuados son compuestos que tienen poca o incluso ninguna acción plaguicida y que mejoran el rendimiento biológico de los compuestos de la presente invención en la diana. Los ejemplos son tensioactivos, aceites minerales o vegetales, y otros auxiliares. Se enumeran otros ejemplos en Knowles, Adjuvants and additives, Agrow Reports DS256, T&F Informa Reino Unido, 2006, capítulo 5.

Los espesantes adecuados son polisacáridos (por ejemplo, goma xantana, carboximetilcelulosa), arcillas inorgánicas (modificadas en forma orgánica o no modificadas), policarboxilados y silicatos.

Los bactericidas adecuados son derivados de bronopol e isotiazolinona, tales como alquilisotiazolinonas y bencisotiazolinonas.

Los agentes anticongelantes adecuados son etilenglicol, propilenglicol, urea y

glicerina.

Los agentes antiespuma adecuados son siliconas, alcoholes de cadena larga y sales de ácidos grasos.

Los colorantes adecuados (por ejemplo, en rojo, azul o verde) son pigmentos de baja hidrosolubilidad y tinturas hidrosolubles. Los ejemplos son colorantes inorgánicos (por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, hexacianoferrato de hierro) y colorantes orgánicos (por ejemplo, colorantes de alizarina, azo y ftalocianina).

Los mejoradores de la pegajosidad o los aglutinantes adecuados son polivinilpirrolidonas, polivinilacetatos, alcoholes de polivinilo, poliacrilatos, ceras biológicas o sintéticas y éteres de celulosa.

Los ejemplos de tipos de composiciones y su preparación son:

i) Concentrados hidrosolubles (SL, LS)

Se disuelven 10-60 % en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención y 5-15 % en peso de agente humectante (por ejemplo, alcohol alcoxilado) en agua y/o en un solvente hidrosoluble (por ejemplo, alcoholes) hasta 100 % en peso. La sustancia activa se disuelve al ser diluida con agua.

ii) Concentrados dispersables (DC)

Se disuelven 5-25 % en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención y 1-10 % en peso de dispersante (por ejemplo, polivinilpirrolidona) en hasta 100 % en peso de solvente orgánico (por ejemplo, ciclohexanona). La dilución con agua produce una dispersión.

iii) Concentrados emulsionables (EC)

Se disuelven 15-70 % en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención y 5-10 % en peso de emulgentes (por ejemplo, dodecilbencensulfonato de calcio y aceite de ricino etoxilado) en hasta 100 % en peso de solvente orgánico no soluble en agua (por ejemplo, hidrocarburo aromático). La dilución con agua produce una emulsión.

iv) Emulsiones (EW, EO, ES)

Se disuelven 5-40 % en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención y 1-10 % en peso de emulgentes (por ejemplo, dodecilbencensulfonato de calcio y aceite de ricino etoxilado) en 20-40 % en peso de solvente orgánico no hidrosoluble (por ejemplo, hidrocarburo aromático). Esta mezcla se introduce en hasta 100% en peso de agua mediante una máquina emulsionante y se convierte en una emulsión homogénea. La dilución con agua produce una emulsión.

v) Suspensiones (SC, OD, FS)

En un molino de bolas en agitación, se desmenuzan 20-60 % en peso de un

compuesto I de acuerdo con la invención con la adición 2-10 % en peso de dispersantes y agentes humectantes (por ejemplo, lignosulfonato de sodio y alcohol etoxilado), 0,1-2 % en peso de espesante (por ejemplo, goma xantana) y hasta 100 % en peso de agua para obtener una suspensión fina de la sustancia activa. La dilución con agua produce una suspensión estable de la sustancia activa. Para la composición tipo FS, se agrega hasta 40 % en peso de aglutinante (por ejemplo, polivinilalcohol).

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

Se muelen finamente 50-80% en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención con la adición de hasta 100% en peso de dispersantes y agentes humectantes (por ejemplo, lignosulfonato de sodio y alcohol etoxilado) y se preparan como gránulos dispersables en agua o gránulos solubles en agua mediante artefactos técnicos (por ejemplo, extrusión, torre de pulverización, lecho fluidizado). La dilución con agua produce una dispersión o solución estable de la sustancia activa.

vii) Polvos dispersables en agua y polvos hidrosolubles (WP, SP, WS)

Se muelen 50-80 % en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención en un molino rotor-estator con la adición de 1-5 % en peso de dispersantes (por ejemplo, lignosulfonato de sodio), 1-3 % en peso de agentes humectantes (por ejemplo, alcohol etoxilado) y hasta 100 % en peso de portador sólido, por ejemplo, gel de sílice. La dilución con agua produce una dispersión o solución estable de la sustancia activa.

viii) Gel (GW, GF)

En un molino de bolas en agitación, se desmenuzan 5-25 % en peso del compuesto I de acuerdo con la invención con la adición 3-10 % en peso de dispersantes (por ejemplo, lignosulfonato de sodio), 1-5 % en peso de un espesante (por ejemplo, carboximetilcelulosa) y hasta 100 % en peso de agua para obtener una suspensión fina de la sustancia activa. La dilución con agua produce una suspensión estable de la sustancia activa.

ix) Microemulsión (ME)

Se agregan 5-20% en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención a 5-30% en peso de mezcla de solvente orgánico (por ejemplo, ciclohexanona y dimetilamida de ácido graso), 10-25% en peso de mezcla de tensioactivos (por ejemplo, alcohol etoxilado y arilfenol etoxilado) y agua hasta 100%. Esta mezcla se agita durante 1 h para producir de manera espontánea una microemulsión termodinámicamente estable.

x) Microcápsulas (CS)

Una fase oleosa que comprende 5-50 % en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención, 0-40 % en peso de solvente orgánico no hidrosoluble (por ejemplo,

hidrocarburo aromático), 2-15 % en peso de monómeros acrílicos (por ejemplo, metilmetacrilato, ácido metacrílico y un diacrilato o triacrilato) se dispersa en una solución acuosa de un coloide protector (por ejemplo, alcohol de polivinilo). La polimerización de radicales iniciada mediante un iniciador radical produce la formación de microcápsulas de poli(met)acrilato. De modo alternativo, una fase oleosa que comprende 5-50 % en peso del compuesto I de acuerdo con la invención, 0-40 % en peso de solvente orgánico no hidrosoluble (por ejemplo, hidrocarburo aromático) y un monómero de isocianato (por ejemplo, difenilmeten-4,4'-diisocianato) se dispersa en una solución acuosa de un coloide protector (por ejemplo, alcohol de polivinilo). La adición de una poliamina (por ejemplo, hexametilendiamina) provoca la formación de una microcápsula de poliurea. Los monómeros representan 1-10 % en peso. El porcentaje en peso se refiere a la composición CS total.

xi) Polvos que se pueden convertir en polvillos (DP, DS)

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

xii) Gránulos (GR, FG)

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

xiii) Líquidos de volumen ultrabajo (UL)

Se disuelven 1-50% en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención en hasta 100% en peso de solvente orgánico, por ejemplo, hidrocarburo aromático.

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

Las composiciones agroquímicas generalmente comprenden de 0,01 a 95 %, preferentemente, de 0,1 a 90 %, y con máxima preferencia, de 0,5 a 75 %, en peso de sustancia activa. Las sustancias activas se utilizan en una pureza de 90% a 100%, preferentemente de 95% a 100% (de acuerdo con el espectro RMN).

Se pueden agregar varios tipos de aceites, humectantes, adyuvantes, fertilizantes o micronutrientes y otros plaguicidas (por ejemplo, herbicidas, insecticidas, fungicidas, reguladores del crecimiento, protectores) a las sustancias activas o las

composiciones que los comprenden, como premezclas o, si correspondiese, solo inmediatamente antes de usar (mezcla en el tanque). Estos agentes se pueden mezclar con las composiciones de acuerdo con la invención en una relación en peso de 1:100 a 100:1, preferentemente, de 1:10 a 10:1.

En general, el usuario aplica la composición de acuerdo con la invención con un dispositivo de predosificación, un pulverizador de mochila, un tanque de pulverización, un avión de pulverización o un sistema de irrigación. Con frecuencia, la composición agroquímica está compuesta por agua, amortiguador y/u otros auxiliares en la concentración de aplicación deseada y, como resultado, se obtiene el licor de pulverización listo para usar o la composición agroquímica de acuerdo con la invención. Con frecuencia, se aplican de 20 a 2000 litros, preferentemente, de 50 a 400 litros, del licor de pulverización listo para usar por hectárea de área agrícola útil.

De acuerdo con una forma de realización, el usuario puede mezclar los componentes individuales de la composición de acuerdo con la invención, tales como partes de un kit o partes de una mezcla binaria o ternaria, en un tanque de pulverización, y se pueden agregar otros auxiliares, de ser adecuado.

En otra forma de realización, el usuario puede mezclar los componentes individuales de la composición de acuerdo con la invención o los componentes parcialmente mezclados en forma previa, por ejemplo, componentes que comprenden los compuestos de la presente invención y/o componentes de mezcla como se definieron anteriormente, en un tanque de pulverización, y se pueden agregar otros auxiliares y aditivos, de ser adecuado.

En otra forma de realización, los componentes individuales de la composición de acuerdo con la invención o los componentes parcialmente mezclados en forma previa, por ejemplo, componentes que comprenden compuestos de la presente invención y/o componentes de mezcla como se definieron anteriormente, se pueden aplicar en forma conjunta (por ejemplo, después de la mezcla en el tanque) o consecutiva.

Métodos de aplicación

Los compuestos de la presente invención son adecuados para proteger cultivos, plantas, materiales de propagación vegetal, tales como semillas, o suelo o agua, en donde las plantas crecen, del ataque o la infestación por plagas de animales. Por lo tanto, la presente invención también se refiere a un método para la protección de plantas, que comprende poner en contacto cultivos, plantas, materiales de

propagación vegetal, tales como semillas, o suelo o agua, en donde las plantas crecen, para protegerse del ataque o la infestación por plagas de animales, con una cantidad eficaz como plaguicida de un compuesto de la presente invención.

Los compuestos de la presente invención también son adecuados para combatir o controlar plagas de animales. Por lo tanto, la presente invención también se refiere a un método para combatir o controlar plagas de animales, que comprende poner en contacto las plagas de animales, su hábitat, lugar de reproducción o suministro alimenticio, o los cultivos, plantas, materiales de propagación vegetal, tales como semillas o suelo, o el área, material o entorno en donde las plagas de animales crecen o pueden crecer, con una cantidad eficaz como plaguicida de un compuesto de la presente invención.

Los compuestos de la presente invención son eficaces mediante contacto e ingestión. Además, los compuestos de la presente invención se pueden aplicar en todas las etapas de desarrollo, tales como huevo, larva, pupa y adulto.

Los compuestos de la presente invención se pueden aplicar como tales o en forma de composiciones que los comprenden como se definieron anteriormente. Además, los compuestos de la presente invención se pueden aplicar junto con un componente de mezcla como se definió anteriormente o en forma de composiciones que comprenden dichas mezclas como se definieron anteriormente. Los componentes de dicha mezcla se pueden aplicar simultáneamente, en forma conjunta o separada, o sucesivamente, es decir, inmediatamente uno después del otro, creando, de esta manera, la mezcla "*in situ*" en la ubicación deseada, por ejemplo, en la planta; en general, la secuencia, en el caso de la aplicación por separado, no tiene ningún efecto en el resultado de las mediciones de control.

La aplicación se puede llevar a cabo antes y después de que las plagas infesten los cultivos, las plantas, los materiales de propagación vegetal, tales como semillas, suelo, o el área, los materiales o el entorno.

Los métodos de aplicación adecuados incluyen, entre otros, tratamiento de suelo, tratamiento de semillas, aplicación en surco y aplicación foliar. Los métodos de tratamiento de suelo incluyen empapado del suelo, irrigación por goteo (aplicación por goteo al suelo), inmersión de raíces, tubérculos o bulbos, o inyección en el suelo. Las técnicas de tratamiento de semillas incluyen recubrimiento, revestimiento, espolvoreo, empapado y peleteo de semillas. En general, las aplicaciones en surco incluyen las etapas para hacer un surco en tierra cultivada, sembrar el surco con semillas, aplicar el compuesto activo como plaguicida al surco y cerrar el surco. La aplicación foliar se

refiere a la aplicación del compuesto activo como plaguicida al follaje, por ejemplo, mediante equipos de pulverización. Para aplicaciones foliares, puede ser ventajoso modificar el comportamiento de las plagas mediante el uso de feromonas en combinación con los compuestos de la presente invención. Las feromonas adecuadas para cultivos y plagas específicos son conocidas por la persona del oficio de nivel medio y están disponibles al público de bases de datos de feromonas y semioquímicos, tales como <http://www.pherobase.com>.

Como se usa en la presente, la expresión “poner en contacto” incluye el contacto directo (aplicación de compuestos/composiciones directamente en la plaga de animales o planta, generalmente en el follaje, tallo o raíces de la planta) y el contacto indirecto (aplicación de compuestos/composiciones en el locus, es decir, el hábitat, lugar de reproducción, planta, semilla, suelo, área, material o entorno en donde una plaga crece o puede crecer, de la plaga de animales o planta).

La expresión “plaga de animales” incluye artrópodos, gasterópodos y nematodos. Las plagas de animales preferidas de acuerdo con la invención son artrópodos, preferentemente, insectos y arácnidos, en particular, insectos. En general, los insectos, que son de particular importancia para los cultivos, se denominan plagas de insectos en cultivos.

El término “cultivo” se refiere tanto a cultivos en crecimiento como cosechados.

El término “planta” incluye cereales, por ejemplo, trigo duro y otros tipos de trigo, centeno, cebada, triticale, avena, arroz o maíz (maíz forrajero y maíz azucarero / maíz dulce y de campo); remolacha, por ejemplo, remolacha azucarera o remolacha forrajera; frutos, tales como frutos pomos, frutos con carozo o frutos blandos, por ejemplo, manzanas, peras, ciruelas, duraznos, pelones, almendras, cerezas, papayas, frutillas, frambuesas, moras o grosellas espinosas; plantas leguminosas, tales como porotos, lentejas, arvejas, alfalfa o soja; plantas oleaginosas, tales como colza (colza oleaginosa), canola, mostaza, aceitunas, girasoles, coco, granos de cacao, plantas de aceite de ricino, palma aceitera, maní o soja; cucurbitas, tales como calabazas, zapallos, pepino o melones; plantas fibrosas, tales como algodón, lino, cáñamo o yute; frutos cítricos, tales como naranjas, limones, pomelos o mandarinas; hortalizas, tales como berenjena, espinaca, lechuga (por ejemplo, lechuga iceberg), achicoria, repollo, espárrago, zanahoria, cebolla, ajo, puerros, tomates, papas, cucurbitas o pimientos; plantas lauráceas, tales como palta, canela o alcanfor; plantas de energía y materia prima, tales como maíz, soja, colza, caña de azúcar o palma aceitera; tabaco; frutos secos, por ejemplo nueces; pistachos; café; té; bananas; vides (uva de mesa y parras

para jugo de uva); lúpulo; hierba dulce (también denominada Stevia); plantas de caucho natural o plantas ornamentales y de silvicultura, tales como flores (por ejemplo, clavel, petunia, geranio/pelargonio, pensamientos e impatiens), arbustos, árboles de hojas anchas (por ejemplo, álamo) o perennes, por ejemplo, coníferas; eucalipto; turf; césped; pasto, tal como pasto para piensos o uso ornamental. Las plantas preferidas incluyen papa, remolacha azucarera, tabaco, trigo, centeno, cebada, avena, arroz, maíz, algodón, soja, colza, legumbres, girasol, café o caña de azúcar; frutos; vides; ornamentales; u hortalizas, tales como pepino, tomate, poroto o calabaza.

El término “planta” incluye plantas de tipo silvestre y plantas modificadas mediante reproducción convencional, mutagénesis o ingeniería genética, o mediante una combinación de estas.

Las plantas, que fueron modificadas mediante mutagénesis o ingeniería genética, y son de particular importancia comercial, incluyen alfalfa, colza (por ejemplo, colza oleaginosa), poroto, clavel, achicoria, algodón, berenjena, eucalipto, lino, lenteja, maíz, melón, papaya, petunia, ciruela, álamo, papa, arroz, soja, calabaza, remolacha azucarera, caña de azúcar, girasol, pimienta, tabaco, tomate y cereales (por ejemplo, trigo), en particular, maíz, soja, algodón, trigo y arroz. En las plantas, que fueron modificadas mediante mutagénesis o ingeniería genética, uno o más genes se mutagenizaron o integraron en el material genético de la planta. Uno o más genes mutagenizados o integrados se seleccionan preferentemente de pat, epsps, cry1Ab, bar, cry1Fa2, cry1Ac, cry34Ab1, cry35AB1, cry3A, cryF, cry1F, mcry3a, cry2Ab2, cry3Bb1, cry1A.105, dfr, barnase, vip3Aa20, barstar, als, bxn, bp40, asn1 y ppo5. La mutagénesis o integración de uno o más genes se llevan a cabo para mejorar determinadas propiedades de la planta. Tales propiedades, también conocidas como rasgos, incluyen tolerancia al estrés abiótico, crecimiento/rendimiento alterado, resistencia a la enfermedad, tolerancia a herbicidas, resistencia a insectos, calidad del producto modificada y control de la polinización. De estas propiedades, la tolerancia a herbicidas, por ejemplo, la tolerancia a imidazolinona, la tolerancia a glifosato o la tolerancia a glufosinato, es de particular importancia. Varias plantas se volvieron tolerantes a herbicidas mediante mutagénesis, por ejemplo, colza oleaginosa Clearfield® tolerante a imidazolinonas, por ejemplo, imazamox. De manera alternativa, se usaron métodos de ingeniería genética para hacer que las plantas, tales como soja, algodón, maíz, remolacha y colza, se volvieran tolerantes a herbicidas tales como glifosato y glufosinato, algunos de los cuales están disponibles en el comercio con los nombres comerciales RoundupReady® (glifosato) y LibertyLink® (glufosinato).

Asimismo, la resistencia a insectos es importante, en particular, la resistencia a insectos lepidópteros y la resistencia a insectos coleópteros. En general, la resistencia a insectos se logra mediante la modificación de plantas integrando genes cry y/o vip, que se aislaron de *Bacillus thuringiensis* (Bt), y el código para las toxinas Bt respectivas. Las plantas modificadas genéticamente con resistencia a insectos están disponibles en el comercio con nombres comerciales que incluyen WideStrike®, Bollgard®, Agrisure®, Herculex®, YieldGard®, Genuity® e Intacta®. Las plantas se pueden modificar mediante mutagénesis o ingeniería genética, en términos de una propiedad (rasgos singulares) o en términos de una combinación de propiedades (rasgos apilados). Los rasgos apilados, por ejemplo, la combinación de tolerancia a herbicidas y resistencia a insectos, son de creciente importancia. En general, todas las plantas modificadas relevantes con respecto a rasgos singulares o apilados, así como la información detallada sobre genes mutagenizados o integrados y los eventos respectivos están disponibles en sitios web de las organizaciones "Servicio Internacional para la Adquisición de Aplicaciones Agrobiotecnológicas (ISAAA)" (<http://www.isaaa.org/gmapprovaldatabase>) y "Centro para la Evaluación del Riesgo Ambiental (CERA)" (<http://cera-gmc.org/GMCropDatabase>).

Se descubrió sorprendentemente que la acción plaguicida de los compuestos de la presente invención se puede mejorar mediante el rasgo insecticida de una planta modificada. Además, se descubrió que los compuestos de la presente invención son adecuados para evitar que los insectos se vuelvan resistentes al rasgo insecticida, o para combatir plagas que ya se volvieron resistentes al rasgo insecticida de una planta modificada. Asimismo, los compuestos de la presente invención son adecuados para combatir plagas, contra las cuales el rasgo insecticida no es eficaz, de manera que una acción insecticida complementaria se puede usar ventajosamente.

La expresión "material de propagación vegetal" se refiere a todas las partes generativas de la planta, tales como semillas y material vegetativo de la planta, tal como esquejes y tubérculos (por ejemplo, papas), que se pueden usar para la multiplicación de la planta. Esto incluye semillas, raíces, frutas, tubérculos, bulbos, rizomas, brotes, yemas y otras partes de las plantas. También se pueden incluir plántulas y plantas jóvenes que se trasplantarán luego de la germinación o luego del surgimiento del suelo. Estos materiales de propagación vegetal se pueden tratar de manera profiláctica con un compuesto de protección para plantas, ya sea antes o al momento de la siembra o del trasplante.

El término "semilla" abarca todo tipo de semillas y propágulos de plantas, que

incluyen, entre otros, semillas verdaderas, partes de semillas, chupones, cormos, bulbos, frutas, tubérculos, granos, esquejes, brotes cortados y similares, y en una forma de realización preferida, significa semillas verdaderas.

En general, "cantidad eficaz como plaguicida" significa la cantidad de ingrediente activo necesario para lograr un efecto considerable sobre el crecimiento, incluso los efectos de necrosis, muerte, retraso, prevención y eliminación, destrucción o, de otro modo, reducir la aparición y actividad del organismo diana. La cantidad eficaz como plaguicida puede variar según los distintos compuestos/composiciones usados en la invención. Una cantidad eficaz como plaguicida de las composiciones también variará de acuerdo con las condiciones predominantes, tales como el efecto y la duración plaguicida deseada, el clima, las especies diana, el locus, el modo de aplicación y similares.

En el caso del tratamiento del suelo, la aplicación en surco o la aplicación a los lugares o nidos donde habitan las plagas, la cantidad de ingrediente activo varía de 0,0001 a 500 g por 100 m², preferentemente, de 0,001 a 20 g por 100 m².

Para usar en el tratamiento de plantas de cultivo, por ejemplo, mediante aplicación foliar, la tasa de aplicación de los ingredientes activos de la presente invención puede variar de 0,0001 g a 4000 g por hectárea, por ejemplo, de 1 g a 2 kg por hectárea o de 1 g a 750 g por hectárea, preferentemente, de 1 g a 100 g por hectárea, con mayor preferencia, de 10 g a 50 g por hectárea, por ejemplo, 10 a 20 g por hectárea, 20 a 30 g por hectárea, 30 a 40 g por hectárea o 40 a 50 g por hectárea.

Los compuestos de la presente invención son particularmente adecuados para el tratamiento de semillas, a fin de proteger las semillas de plagas de insectos, en particular, de plagas de insectos que viven en el suelo, y las raíces y los brotes resultantes de la plántula, de las plagas que viven en el suelo y de los insectos foliares. Por lo tanto, la presente invención también se refiere a un método para proteger las semillas de insectos, en particular, de insectos que habitan en el suelo, y para proteger las raíces y los brotes de la plántula contra insectos, en particular, insectos foliares y que habitan en el suelo, en donde dicho método comprende tratar las semillas antes de la siembra y/o después de la pregerminación con un compuesto de la presente invención. Se prefiere la protección de las raíces y de los brotes de la plántula. Es de mayor preferencia la protección de brotes de la plántula contra insectos incisivos y chupadores, insectos picadores y nematodos.

La expresión "tratamiento de semillas" comprende todas las técnicas adecuadas conocidas en el estado de la técnica para el tratamiento de semillas, tales

como revestimiento, recubrimiento, espolvoreo, empapado, peleteo de semillas y métodos de aplicación en surco. Preferentemente, la aplicación del tratamiento para semillas del compuesto activo se realiza mediante la pulverización o el espolvoreo de las semillas antes de la siembra de las plantas y antes del surgimiento de las plantas.

La presente invención también comprende semillas recubiertas con el compuesto activo o que contienen el compuesto activo. En general, el término "recubierto y/o que contiene" significa que el ingrediente activo se encuentra, principalmente, en la superficie del producto de propagación al momento de la aplicación, aunque una parte mayor o menor del ingrediente puede penetrar en el producto de propagación, según el método de aplicación. Cuando el producto de propagación se (re)planta, puede absorber el ingrediente activo.

Las semillas adecuadas son, por ejemplo, semillas de cereales, cultivos de raíz, cultivos oleaginosos, hortalizas, especias, ornamentales, por ejemplo, semilla de trigo duro y otro tipo de trigo, cebada, avena, centeno, maíz (maíz forrajero y maíz azucarero / maíz dulce y de campo), soja, cultivos oleaginosos, crucíferas, algodón, girasol, banana, arroz, colza oleaginosa, nabo, remolacha azucarera, remolacha forrajera, berenjena, papa, pasto, césped, turf, pasto forrajero, tomate, puerro, zapallo/calabaza, repollo, lechuga iceberg, pimienta, pepino, melón, especies de *Brassica*, melón, poroto, arveja, ajo, cebolla, zanahoria, plantas tuberosas tales como papa, caña de azúcar, tabaco, vid, petunia, geranio/pelargonio, pensamientos e *Impatiens*.

Además, el compuesto activo también se puede usar para el tratamiento de semillas de plantas, que se modificaron mediante mutagénesis o ingeniería genética, y que, por ejemplo, toleran la acción de herbicidas, fungicidas o insecticidas. Las plantas modificadas se describieron en detalle anteriormente.

Las formulaciones convencionales para el tratamiento de semillas incluyen, por ejemplo, concentrados fluidizables FS, soluciones LS, suspoemulsiones (SE), polvos para tratamiento en seco DS, polvos dispersables en agua para tratamiento en suspensión WS, polvos hidrosolubles SS, emulsiones ES y EC, y formulaciones en gel GF. Estas formulaciones se pueden aplicar diluidas o no diluidas a la semilla. La aplicación a las semillas se realiza antes de la siembra, ya sea en forma directa sobre las semillas o después de la pregerminación de estas. Preferentemente, las formulaciones se aplican de manera que la germinación no se incluya.

Las concentraciones de sustancias activas en formulaciones listas para usar, que se pueden obtener después de una dilución de dos a diez veces, son,

preferentemente, de 0,01 a 60 % en peso, con mayor preferencia, de 0,1 a 40 % en peso.

En una forma de realización preferida, se usa una formulación FS para el tratamiento de semillas. Generalmente, una formulación FS puede comprender 1-800 g/l de ingrediente activo, 1-200 g/l de tensioactivo, de 0 a 200 g/l de agente anticongelante, de 0 a 400 g/l de aglutinante, de 0 a 200 g/l de un pigmento y hasta 1 litro de un solvente, preferentemente agua.

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

Para el tratamiento de semillas, las tasas de aplicación de los compuestos de la invención generalmente varían de 0,1 g a 10 kg por 100 kg de semillas, preferentemente, de 1 g a 5 kg por 100 kg de semillas, con mayor preferencia, de 1 g a 1000 g por 100 kg de semillas y, en particular, de 1 g a 200 g por 100 kg de semillas, por ejemplo, de 1 g a 100 g o de 5 g a 100 g por 100 kg de semillas.

Por lo tanto, la invención también se refiere a semillas que comprenden un compuesto de la presente invención, o una sal de esta útil en la agricultura, como se define en la presente. En general, la cantidad del compuesto de la presente invención o la sal de este útil en la agricultura varía de 0,1 g a 10 kg por 100 kg de semillas, preferentemente, de 1 g a 5 kg por 100 kg de semillas, en particular, de 1 g a 1000 g por 100 kg de semillas. Para cultivos específicos, tales como la lechuga, la tasa puede ser mayor.

Los compuestos de la presente invención también se pueden usar para mejorar la fitosanidad de una planta. Por lo tanto, la presente invención también se refiere a un método para mejorar la fitosanidad tratando una planta, el material de propagación vegetal y/o el locus donde la planta crece o se prevé que crezca, con una cantidad

eficaz y no fitotóxica de un compuesto de la presente invención.

Como se usa en la presente, “una cantidad eficaz y no fitotóxica” significa que el compuesto se usa en una cantidad que permite obtener el efecto deseado, pero que no causa ningún síntoma fitotóxico en la planta tratada o en la planta que crece del propágulo tratado o suelo tratado.

Las expresiones “planta” y “material de propagación vegetal” se definieron anteriormente.

El término “fitosanidad” se define como la condición de la planta y/o sus productos que se determina mediante varios aspectos, solos o combinados entre sí, tales como rendimiento (por ejemplo, aumento en la biomasa y/o aumento en el contenido de ingredientes valiosos), calidad (por ejemplo, mejor contenido o composición de determinados ingredientes o vida útil), vigor de la planta (por ejemplo, mejor crecimiento de la planta y/u hojas más verdes (“efecto de mayor verdor”), tolerancia al estrés abiótico (por ejemplo, sequía) y/o estrés biótico (por ejemplo, enfermedad) y eficacia de la producción (por ejemplo, eficacia y procesabilidad de la cosecha).

Los indicadores antes identificados para la condición de fitosanidad pueden ser interdependientes y pueden ser el resultado el uno del otro. Cada indicador se define en el estado de la técnica y se puede determinar mediante métodos conocidos por una persona del oficio de nivel medio.

Los compuestos de la invención también son adecuados para usar contra plagas de insectos que no son de cultivo. Se pueden usar los compuestos de la presente invención contra plagas que no son de cultivo como composición de cebo, gel, pulverizador contra insectos de uso general, aerosol, como aplicación a volumen ultrabajo y mosquitero (impregnado o aplicado en la superficie). Asimismo, se pueden usar métodos de empapado y drenaje.

Como se usa en la presente, la expresión “plaga de insectos que no es de cultivo” se refiere a plagas, que son de particular importancia para dianas que no son de cultivo, tales como hormigas, termitas, avispas, moscas, garrapatas, mosquitos, grillos o cucarachas.

El cebo puede ser una preparación líquida, sólida o semisólida (por ejemplo, un gel). El cebo utilizado en la composición es un producto lo suficientemente atractivo como para incitar insectos, tales como hormigas, termitas, avispas, moscas, mosquitos, grillos, etc. o cucarachas a que lo coman. El atractivo también se puede manipular usando estimulantes alimenticios o feromonas sexuales. Los estimulantes

alimenticios se eligen, por ejemplo, pero no exclusivamente, de proteínas animales y/o vegetales (harina de carne, de pescado o de sangre, partes de insectos, yema de huevo), de grasas y aceites de origen animal y/o vegetal, o de mono, oligo o poliorganosacáridos, en especial de sacarosa, lactosa, fructosa, dextrosa, glucosa, almidón, pectina o incluso melazas o miel. Las partes de frutas frescas o en descomposición, los cultivos, las plantas, los animales, los insectos o sus partes específicas también pueden servir como estimulante alimenticio. Se sabe que las feromonas sexuales son más específicas de insectos. Las feromonas específicas se describen en la literatura (por ejemplo, en <http://www.pherobase.com>) y son conocidas por las personas del oficio de nivel medio.

Para usar en las composiciones de cebo, el contenido típico de ingrediente activo es de 0,001 % en peso a 15 % en peso, preferentemente, de 0,001 % en peso a 5 % en peso del compuesto activo.

Las formulaciones de los compuestos de la presente invención como aerosoles (por ejemplo, en latas pulverizadoras), pulverizaciones oleosas o pulverizaciones por bombo, son muy adecuadas para que el usuario no profesional pueda controlar plagas, tales como moscas, pulgas, garrapatas, mosquitos o cucarachas. Preferentemente, las recetas de aerosol están compuestas por el compuesto activo, solventes, además de auxiliares, tales como emulgentes, aceites perfumados, si correspondiese, estabilizantes y, de ser necesario, propulsores.

Las formulaciones de pulverización oleosa difieren de las recetas de aerosol en que no se usan propulsores.

Para usar en composiciones de pulverización, el contenido del ingrediente activo es de 0,001 a 80 % en peso, preferentemente, de 0,01 a 50 % en peso y, con mayor preferencia, de 0,01 a 15 % en peso.

Los compuestos de la presente invención y sus respectivas composiciones también se pueden usar en espirales contra mosquitos y de fumigación, cartuchos de humo, placas vaporizadoras o vaporizadores a largo plazo y también en papeles contra polillas, almohadillas contra polillas u otros sistemas vaporizadores independientes del calor.

Los métodos para controlar enfermedades infecciosas transmitidas por insectos (por ejemplo, malaria, dengue y fiebre amarilla, filariasis linfática y leishmaniasis) con compuestos de la presente invención y sus respectivas composiciones también comprenden el tratamiento de superficies de cabañas y casas, la pulverización de aire y la impregnación de cortinas, tiendas, vestimenta, mosquiteros, trampas para mosca

tse-tsé o similares. Las composiciones insecticidas para la aplicación a fibras, telas, tejidos, tramados, material de tejido o láminas y lonas comprenden, preferentemente, una mezcla que incluye el insecticida, opcionalmente un repelente y al menos un aglutinante.

Los compuestos de la presente invención y sus composiciones se pueden usar para proteger materiales de madera tales como árboles, cercas, durmientes, marcos, artefactos artísticos, etc. y construcciones, y también materiales de construcción, muebles, cueros, fibras, artículos de vinilo, cableados y alambres eléctricos, etc. contra hormigas y/o termitas, y para evitar que las hormigas y termitas dañen cultivos o a humanos (por ejemplo, cuando las plagas invaden casas e instalaciones públicas).

Las tasas de aplicación habituales para la protección de materiales son, por ejemplo, de 0,001 g a 2000 g o de 0,01 g a 1000 g de compuesto activo por m² de material tratado, preferentemente, de 0,1 g a 50 g por m².

Por lo general, las composiciones insecticidas para usar en la impregnación de materiales contienen de 0,001 a 95 % en peso, preferentemente, de 0,1 a 45 % en peso, y con mayor preferencia, de 1 a 25 % en peso de al menos un repelente y/o insecticida.

Mezclas

La presente invención también se refiere a una mezcla de al menos un compuesto de la presente invención con al menos un componente de mezcla definido a continuación. Se prefieren mezclas binarias de un compuesto de la presente invención como componente I con un componente de mezcla definido continuación como componente II. Las relaciones en peso preferidas para tales mezclas binarias son de 5000:1 a 1:5000, preferentemente, de 1000:1 a 1:1000, con mayor preferencia, de 100:1 a 1:100, con particular preferencia, de 10:1 a 1:10. En tales mezclas binarias, los componentes I y II se pueden usar en cantidades iguales, o se puede usar un exceso de componente I, o un exceso de componente II.

Los componentes de mezcla se pueden seleccionar de plaguicidas, en particular, insecticidas, nematocidas, y acaricidas, fungicidas, herbicidas, reguladores del crecimiento de la planta, fertilizantes y similares. Los componentes de mezcla preferidos son insecticidas, nematocidas y fungicidas.

La siguiente lista M de plaguicidas, agrupados y numerados de acuerdo con la Clasificación del Modo de Acción del Comité de Acción contra la Resistencia a los Plaguicidas (IRAC), con los cuales se pueden usar los compuestos de la presente

invención y con los cuales se pueden producir efectos sinérgicos potenciales, pretende ilustrar las posibles combinaciones, pero sin imponer limitación alguna:

M.1 Inhibidores de acetilcolina esterasa (AChE) de la clase de: M.1A carbamatos, por ejemplo, aldicarb, alanycarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxycarboxim, carbaryl, carbofuran, carbosulfan, ethiofencarb, fenobucarb, formetanate, furathiocarb, isoprocab, methiocarb, methomyl, metolcarb, oxamyl, pirimicarb, propoxur, thiodicarb, thiofanox, trimethacarb, XMC, xylylcarb y triazamate; o de la clase de M.1B organofosfatos, por ejemplo, acephate, azamethiphos, azinphos-etilo, azinphosmetilo, cadusafos, chlorethoxyfos, chlorfenvinphos, chlormephos, chlorpyrifos, chlorpyrifosmetilo, coumaphos, cianophos, demeton-S-metilo, diazinon, dichlorvos/ DDVP, dicrotophos, dimethoate, dimethylvinphos, disulfoton, EPN, ethion, ethoprophos, famphur, fenamiphos, fenitrothion, fenthion, fosthiazate, heptenophos, imicyafos, isofenphos, isopropil O- (metoxiaminotio-fosforilo) salicilato, isoxathion, malathion, mecarbam, methamidophos, methidathion, mevinphos, monocrotophos, naled, omethoate, oxydemeton-metilo, parathion, parathion-metilo, phenthoate, phorate, phosalone, phosmet, phosphamidon, phoxim, pirimiphos- metilo, profenofos, propetamphos, prothiofos, pyraclofos, pyridaphenthion, quinalphos, sulfotep, tebupirimfos, temephos, terbufos, tetrachlorvinphos, thiometon, triazophos, trichlorfon y vamidothion;

M.2. Antagonistas del canal de cloruro regulado por GABA, por ejemplo: M.2A compuestos de ciclodieno organoclorado, por ejemplo, endosulfan o chlordane; o M.2B fiproles (fenilpirazoles), por ejemplo, ethiprole, fipronil, flufiprole, pyrafluprole y pyriprole;

M.3 Moduladores del canal de sodio de la clase de M.3A piretroides, por ejemplo, acrinathrin, allethrin, d-cis-trans allethrin, d-trans allethrin, bifenthrin, bioallethrin, bioallethrin S-cyclopentenyl, bioresmethrin, cycloprothrin, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, gamma-cyhalothrin, cypermethrin, alfa-cypermethrin, beta-cypermethrin, teta-cypermethrin, zeta-cypermethrin, cyphenothrin, deltamethrin, empenthrin, esfenvalerate, etofenprox, fenpropathrin, fenvalerate, flucythrinate, flumethrin, tau-fluvalinate, halfenprox, heptafluthrin, imiprothrin, meperfluthrin, metofluthrin, momfluorothrin, permethrin, phenothrin, prallethrin, profluthrin, pyrethrin (pyrethrum), resmethrin, silafluofen, tefluthrin, tetramethylfluthrin, tetramethrin, tralomethrin y transfluthrin; o M.3B moduladores del canal de sodio, tales como DDT o methoxychlor;

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

neonicotinoides, por ejemplo, acetamiprid, clothianidin, cycloxyaprid, dinotefuran, imidacloprid, nitenpyram, thiacloprid y thiamethoxam; o los compuestos M.4A.2: (2E)-1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]-N'-nitro-2-pentilidenhidrazincaboximidamida; o M.4A.3: 1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]-7-metil-8-nitro-5-propoxi-1,2,3,5,6,7-hexahidroimidazo[1,2-a]piridina; o de la clase M.4B nicotina;

M.5 Activadores alostéricos del receptor de acetilcolina nicotínico de la clase de spinosyn, por ejemplo, spinosad o spinetoram;

M.6 Activadores del canal de cloruro de la clase de avermectins y milbemycins, por ejemplo, abamectin, emamectin benzoato, ivermectin, lepimectin o milbemectin;

M.7 Imitadores de la hormona juvenil, tales como M.7A análogos de la hormona juvenil, como hydroprene, kinoprene y methoprene; u otros, tales como M.7B fenoxycarb o M.7C pyriproxyfen;

M.8 Inhibidores (de múltiples sitios) no específicos misceláneos, por ejemplo, M.8A haluros de alquilo, como bromuro de metilo y otros haluros de alquilo, M.8B chloropicrin, M.8C fluoruro de sulfurilo, M.8D bórax o M.8E tártaro emético;

M.9 Bloqueadores selectivos de la alimentación de homópteros, por ejemplo, M.9B pymetrozine o M.9C flonicamid;

M.10 Inhibidores del crecimiento de los ácaros, por ejemplo, M.10A clofentezine, hexythiazox y diflovidazin, o M.10B etoxazole;

M.11 Disruptores microbianos de las membranas del intestino medio de los insectos, por ejemplo, *bacillus thuringiensis* o *bacillus sphaericus* y las proteínas insecticidas que producen, tales como *bacillus thuringiensis* subsp. *israelensis*, *bacillus sphaericus*, *bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*, *bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki* y *bacillus thuringiensis* subsp. *tenebrionis*, o las proteínas de cultivo de Bt: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry2Ab, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb y Cry34/35Ab1;

M.12 Inhibidores de ATP sintasa mitocondrial, por ejemplo, M.12A diafenthiuron, o M.12B acaricidas de organoestaño, tales como azocyclotin, cyhexatin u óxido de fenbutatin, M.12C propargite o M.12D tetradifon;

M.13 Desacopladores de la fosforilación oxidativa mediante la alteración del gradiente protónico, por ejemplo, chlorfenapyr, DNOC o sulfluramid;

M.14 Bloqueadores del canal del receptor de acetilcolina nicotínico (nAChR), por ejemplo, análogos de nereistoxina, tales como bensultap, cartap clorhidrato, thiocyclam o thiosultap sodio;

M.15 Inhibidores de la biosíntesis de quitina tipo 0, tales como benzoilureas, por ejemplo, bistrifluron, chlorfluazuron, diflubenzuron, flucycloxuron, flufenoxuron,

hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron o triflumuron;

M.16 Inhibidores de la biosíntesis de quitina tipo 1, por ejemplo, buprofezin;

M.17 Disruptores de la muda, Diptera, por ejemplo, cyromazine;

M.18 Agonistas del receptor de ecdyson, tales como diacilhidrazinas, por ejemplo, methoxyfenozide, tebufenozide, halofenozide, fufenozide o chromafenozide;

M.19 Agonistas del receptor de octopamina, por ejemplo, amitraz;

M.20 Inhibidores del transporte de electrones del complejo mitocondrial III, por ejemplo, M.20A hydramethylnon, o M.20B acequinocyl o M.20C fluacrypyrim;

M.21 Inhibidores del transporte de electrones del complejo mitocondrial I, por ejemplo, M.21A insecticidas y acaricidas METI, tales como fenazaquin, fenpyroximate, pyrimidifen, pyridaben, tebufenpyrad o tolfenpyrad, o M.21B rotenone;

M.22 Bloqueadores del canal de sodio dependiente del voltaje, por ejemplo, M.22A indoxacarb, M.22B metaflumizone o M.22B.1: 2-[2-(4-cianofenil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]-etiliden]-N-[4-(difluorometoxi)fenil]-hidrazincarboxamida o M.22B.2: N-(3-cloro-2-metilfenil)-2-[(4-clorofenil)[4-[metil(metilsulfonil)amino]fenil]-metilen]-hidrazincarboxamida;

M.23 Inhibidores de acetil CoA carboxilasa, tales como derivados del ácido tetrónico y tetrámico, por ejemplo, spiroadiclofen, spiromesifen o spirotetramat; o un compuesto seleccionado de los siguientes compuestos M.23.1a etiléster del ácido [3-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-8-metoxi-1-metil-2-oxo-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-4-il]carbónico, M.23.1b etiléster del ácido [3-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-4-il]carbónico; M.23.2a etiléster del ácido [3-(4-cloro-2,6-dimetil-fenil)-1,8-dimetoxi-2-oxo-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-4-il]carbónico, M.23.2b etiléster del ácido [3-(4-cloro-2,6-dimetil-fenil)-1-etoxi-8-metoxi-2-oxo-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-4-il]carbónico, M.23.2c etiléster del ácido [1-etoxi-8-metoxi-2-oxo-3-(2,4,6-trimetilfenil)-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-4-il]carbónico, M.23.2d etiléster del ácido [1,8-dimetoxi-2-oxo-3-(2,4,6-trimetilfenil)-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-4-il]carbónico, M.23.2e etiléster del ácido [8-metoxi-1-metil-2-oxo-3-(2,4,6-trimetilfenil)-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-4-il]carbónico, M.23.2f etiléster del ácido [8-metoxi-2-oxo-3-(2,4,6-trimetilfenil)-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-4-il]carbónico;

M.24 Inhibidores del transporte de electrones del complejo mitocondrial IV, por ejemplo, M.24A fosfina, tal como fosfuro de aluminio, fosfuro de calcio, fosfina o fosfuro de zinc, o M.24B cianuro;

M.25 Inhibidores del transporte de electrones del complejo mitocondrial II, tales como derivados de beta-cetonitrilo, por ejemplo, cyenopyrafen o cyflumetofen;

M.28 Moduladores del receptor de rianodina de la clase de diamidas, por ejemplo, flubendiamide, chlorantraniliprole (rynaxypyr®), cyantraniliprole (cyazypyr®), tetraniliprole o los compuestos de ftalamida M.28.1: (R)-3-clor-N1-{2-metil-4-[1,2,2,2-tetrafluor-1-(trifluormetil)etil]fenil}-N2-(1-metil-2-metilsulfoniletil)ftalamida y M.28.2: (S)-3-clor-N1-{2-metil-4-[1,2,2,2-tetrafluor-1-(trifluormetil)etil]fenil}-N2-(1-metil-2-metilsulfoniletil)ftalamida o el compuesto M.28.3: 3-bromo-N-{2-bromo-4-cloro-6-[(1-ciclopropyletil)carbamoil]fenil}-1-(3-clorpiridin-2-il)-1H-pirazol-5-carboxamida (nombre ISO propuesto: cyclaniliprole), o el compuesto M.28.4: metil-2-[3,5-dibromo-2-({[3-bromo-1-(3-clorpiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil}-amino)benzoil]-1,2-dimetilhidrazincarboxilato; o un compuesto seleccionado de M.28.5a) a M.28.5d) y M.28.5h) a M.28.5l): M.28.5a) N-[4,6-dicloro-2-[(dietil-lambda-4-sulfaniliden)-carbamoil]-fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil)pirazol-3-carboxamida; M.28.5b) N-[4-cloro-2-[(dietil-lambda-4-sulfaniliden)carbamoil]-6-metil-fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil)pirazol-3-carboxamida; M.28.5c) N-[4-cloro-2-[(di-2-propil-lambda-4-sulfaniliden)carbamoil]-6-metil-fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil)pirazol-3-carboxamida; M.28.5d) N-[4,6-dicloro-2-[(di-2-propil-lambda-4-sulfaniliden)carbamoil]-fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil)pirazol-3-carboxamida; M.28.5h) N-[4,6-dibromo-2-[(dietil-lambda-4-sulfaniliden)carbamoil]-fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil)pirazol-3-carboxamida; M.28.5i) N-[2-(5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-il)-4-cloro-6-metilfenil]-3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-carboxamida; M.28.5j) 3-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[2,4-dicloro-6-[(1-ciano-1-metiletil)amino]carbonil]fenil]-1H-pirazol-5-carboxamida; M.28.5k) 3-bromo-N-[2,4-dicloro-6-(metilcarbamoil)fenil]-1-(3,5-dicloro-2-piridil)-1H-pirazol-5-carboxamida; M.28.5l) N-[4-cloro-2-[(1,1-dimetiletil)amino]carbonil]-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(fluorometoxi)-1H-pirazol-5-carboxamida; o M.28.6: cyhalodiamide; o;

M.29. Compuestos activos insecticidas con modo de acción desconocido o incierto, por ejemplo, afidopyropen, afoxolaner, azadirachtin, amidoflumet, benzoximate, bifenazate, broflanilide, bromopropylate, chinomethionat, cryolite, dicloromezotiaz, dicofol, flufenerim, flometoquin, fluensulfone, fluhexafon, fluopyram, flupyradifurone, fluralaner, metoxadiazona, piperonyl butóxido, pyflubumide, pyridalyl, pyrifluquinazon, sulfoxaflor, tioxazafen, triflumezopyrim, o los compuestos M.29.3: 11-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-12-hidroxi-1,4-dioxa-9-azadispiro[4.2.4.2]-tetradec-11-en-10-ona, o el compuesto M.29.4: 3-(4'-fluoro-2,4-dimetilbifenil-3-il)-4-hidroxi-8-oxa-1-azaspiro[4.5]dec-3-en-2-

ona; o el compuesto

M.29.5: 1-[2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil]-3-(trifluorometil)-1H-1,2,4-triazol-5-amina, o activos a base de *bacillus firmus* (Votivo, I-1582); o

un compuesto seleccionado del grupo de M.29.6, en donde el compuesto se selecciona de M.29.6a) a M.29.6k): M.29.6a) (E/Z)-N-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-2,2,2-trifluoro-acetamida; M.29.6b) (E/Z)-N-[1-[(6-cloro-5-fluoro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-2,2,2-trifluoro-acetamida; M.29.6c) (E/Z)-2,2,2-trifluoro-N-[1-[(6-fluoro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]acetamida; M.29.6d) (E/Z)-N-[1-[(6-bromo-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-2,2,2-trifluoro-acetamida; M.29.6e) (E/Z)-N-[1-[1-(6-cloro-3-piridil)etil]-2-piridiliden]-2,2,2-trifluoro-acetamida; M.29.6f) (E/Z)-N-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-2,2-difluoro-acetamida; M.29.6g) (E/Z)-2-cloro-N-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-2,2-difluoro-acetamida; M.29.6h) (E/Z)-N-[1-[(2-cloropirimidin-5-il)metil]-2-piridiliden]-2,2,2-trifluoro-acetamida; M.29.6i) (E/Z)-N-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-2,2,3,3,3-pentafluoro-propanamida.); M.29.6j) N-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-2,2,2-trifluoro-tioacetamida; o M.29.6k) N-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-2,2,2-trifluoro-N'-isopropil-acetamidina; o los compuestos

M.29.8: fluazaindolizine; o los compuestos

M.29.9.a): 4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il]-2-metil-N-(1-oxotietan-3-il)benzamida; o M.29.9.b): fluxametamide; o

M.29.10: 5-[3-[2,6-dicloro-4-(3,3-dicloroaliloxi)fenoxi]propoxi]-1H-pirazol; o

un compuesto seleccionado del grupo de M.29.11, en donde el compuesto se selecciona de M.29.11b) a M.29.11p): M.29.11.b) 3-(benzoilmetilamino)-N-[2-bromo-4-[1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-(trifluorometil)propil]-6-(trifluorometil)fenil]-2-fluoro-benzamida; M.29.11.c) 3-(benzoilmetilamino)-2-fluoro-N-[2-iodo-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]-6-(trifluorometil)fenil]-benzamida; M.29.11.d) N-[3-[[[2-iodo-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]-6-(trifluorometil)fenil]amino]carbonil]fenil]-N-metil-benzamida; M.29.11.e) N-[3-[[[2-bromo-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]-6-(trifluorometil)fenil]amino]carbonil]-2-fluorofenil]-4-fluoro-N-metil-benzamida; M.29.11.f) 4-fluoro-N-[2-fluoro-3-[[[2-iodo-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]-6-(trifluorometil)fenil]amino]carbonil]fenil]-N-metil-benzamida; M.29.11.g) 3-fluoro-N-[2-fluoro-3-[[[2-iodo-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]-6-(trifluorometil)fenil]amino]carbonil]fenil]-N-metil-benzamida; M.29.11.h) 2-cloro-N-[3-[[[2-iodo-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]-6-(trifluorometil)fenil]amino]carbonil]fenil]-3-piridincarboxamida; M.29.11.i) 4-ciano-N-[2-

ciano-5-[[2,6-dibromo-4-[1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-(trifluorometil)-propil]fenil]carbamoil]fenil]-2-metil-benzamida; M.29.11.j) 4-ciano-3-[(4-ciano-2-metil-benzoil)amino]-N-[2,6-dicloro-4-[1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-(trifluorometil)-propil]fenil]-2-fluoro-benzamida; M.29.11.k) N-[5-[[2-cloro-6-ciano-4-[1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-(trifluorometil)propil]fenil]carbamoil]-2-ciano-fenil]-4-ciano-2-metil-benzamida; M.29.11.l) N-[5-[[2-bromo-6-cloro-4-[2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-(trifluorometil)etil]fenil]carbamoil]-2-ciano-fenil]-4-ciano-2-metil-benzamida; M.29.11.m) N-[5-[[2-bromo-6-cloro-4-[1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-(trifluorometil)-propil]fenil]carbamoil]-2-ciano-fenil]-4-ciano-2-metil-benzamida; M.29.11.n) 4-ciano-N-[2-ciano-5-[[2,6-dicloro-4-[1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-(trifluorometil)-propil]fenil]carbamoil]fenil]-2-metil-benzamida; M.29.11.o) 4-ciano-N-[2-ciano-5-[[2,6-dicloro-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil]carbamoil]fenil]-2-metil-benzamida; M.29.11.p) N-[5-[[2-bromo-6-cloro-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil]carbamoil]-2-ciano-fenil]-4-ciano-2-metil-benzamida; o

un compuesto seleccionado del grupo de M.29.12, en donde el compuesto se selecciona de M.29.12a) a M.29.12m): M.29.12.a) 2-(1,3-dioxan-2-il)-6-[2-(3-piridinil)-5-tiazolil]-piridina; M.29.12.b) 2-[6-[2-(5-fluoro-3-piridinil)-5-tiazolil]-2-piridinil]-pirimidina; M.29.12.c) 2-[6-[2-(3-piridinil)-5-tiazolil]-2-piridinil]-pirimidina; M.29.12.d) N-metilsulfonil-6-[2-(3-piridil)tiazol-5-il]piridin-2-carboxamida; M.29.12.e) N-metilsulfonil-6-[2-(3-piridil)tiazol-5-il]piridin-2-carboxamida; M.29.12.f) N-etil-N-[4-metil-2-(3-piridil)tiazol-5-il]-3-metiltio-propanamida; M.29.12.g) N-metil-N-[4-metil-2-(3-piridil)tiazol-5-il]-3-metiltio-propanamida; M.29.12.h) N,2-dimetil-N-[4-metil-2-(3-piridil)tiazol-5-il]-3-metiltio-propanamida; M.29.12.i) N-etil-2-metil-N-[4-metil-2-(3-piridil)tiazol-5-il]-3-metiltio-propanamida; M.29.12.j) N-[4-cloro-2-(3-piridil)tiazol-5-il]-N-etil-2-metil-3-metiltio-propanamida; M.29.12.k) N-[4-cloro-2-(3-piridil)tiazol-5-il]-N,2-dimetil-3-metiltio-propanamida; M.29.12.l) N-[4-cloro-2-(3-piridil)tiazol-5-il]-N-metil-3-metiltio-propanamida; M.29.12.m) N-[4-cloro-2-(3-piridil)tiazol-5-il]-N-etil-3-metiltio-propanamida; o los compuestos

M.29.14a) 1-[(6-cloro-3-piridinil)metil]-1,2,3,5,6,7-hexahidro-5-metoxi-7-metil-8-nitroimidazo[1,2-a]piridina; o M.29.14b) 1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]-7-metil-8-nitro-1,2,3,5,6,7-hexahidroimidazo[1,2-a]piridin-5-ol; o los compuestos

M.29.16a) 1-isopropil-N,5-dimetil-N-piridazin-4-il-pirazol-4-carboxamida; o M.29.16b) 1-(1,2-dimetilpropil)-N-etil-5-metil-N-piridazin-4-il-pirazol-4-carboxamida; M.29.16c) N,5-dimetil-N-piridazin-4-il-1-(2,2,2-trifluoro-1-metil-etil)pirazol-4-carboxamida; M.29.16d) 1-[1-(1-cianociclopropil)etil]-N-etil-5-metil-N-piridazin-4-il-pirazol-4-carboxamida;

M.29.16e) N-etil-1-(2-fluoro-1-metil-propil)-5-metil-N-piridazin-4-il-pirazol-4-carboxamida; M.29.16f) 1-(1,2-dimetilpropil)-N,5-dimetil-N-piridazin-4-il-pirazol-4-carboxamida; M.29.16g) 1-[1-(1-cianociclopropil)etil]-N,5-dimetil-N-piridazin-4-il-pirazol-4-carboxamida; M.29.16h) N-metil-1-(2-fluoro-1-metil-propil)-5-metil-N-piridazin-4-il-pirazol-4-carboxamida; M.29.16i) 1-(4,4-difluorociclohexil)-N-etil-5-metil-N-piridazin-4-il-pirazol-4-carboxamida; o M.29.16j) 1-(4,4-difluorociclohexil)-N,5-dimetil-N-piridazin-4-il-pirazol-4-carboxamida, o

M.29.17 un compuesto seleccionado de los compuestos M.29.17a) a M.29.17j):

M.29.17a) N-(1-metiletil)-2-(3-piridinil)-2H-indazol-4-carboxamida; M.29.17b) N-ciclopropil-2-(3-piridinil)-2H-indazol-4-carboxamida; M.29.17c) N-ciclohexil-2-(3-piridinil)-2H-indazol-4-carboxamida; M.29.17d) 2-(3-piridinil)-N-(2,2,2-trifluoroetil)-2H-indazol-4-carboxamida; M.29.17e) 2-(3-piridinil)-N-[(tetrahidro-2-furanil)metil]-2H-indazol-5-carboxamida; M.29.17f) 2-[[2-(3-piridinil)-2H-indazol-5-il]carbonil]hidrazincarboxilato de metilo; M.29.17g) N-[(2,2-difluorociclopropil)metil]-2-(3-piridinil)-2H-indazol-5-carboxamida; M.29.17h) N-(2,2-difluoropropil)-2-(3-piridinil)-2H-indazol-5-carboxamida; M.29.17i) 2-(3-piridinil)-N-(2-pirimidinilmetil)-2H-indazol-5-carboxamida; M.29.17j) N-[(5-metil-2-pirazinil)metil]-2-(3-piridinil)-2H-indazol-5-carboxamida, o

M.29.18 un compuesto seleccionado de los compuestos M.29.18a) a M.29.18d):

M.29.18a) N-[3-cloro-1-(3-piridil)pirazol-4-il]-N-etil-3-(3,3,3-trifluoropropilsulfanil)propanamida; M.29.18b) N-[3-cloro-1-(3-piridil)pirazol-4-il]-N-etil-3-(3,3,3-trifluoropropilsulfinil)propanamida; M.29.18c) N-[3-cloro-1-(3-piridil)pirazol-4-il]-3-[(2,2-difluorociclopropil)metilsulfanil]-N-etil-propanamida; M.29.18d) N-[3-cloro-1-(3-piridil)pirazol-4-il]-3-[(2,2-difluorociclopropil)metilsulfinil]-N-etil-propanamida; o el compuesto

M.29.19 sarolaner, o el compuesto

M.29.20 lotilaner.

M.29.21 N-[4-cloro-3-[(fenilmetil)amino]carbonil]fenil]-1-metil-3-(1,1,2,2,2-pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboxamida;

M.29.22 un compuesto seleccionado de M.29.22a 2-(3-etilsulfonil-2-piridil)-3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-b]piridina, M.29.22b 2-[3-etilsulfonil-5-(trifluorometil)-2-piridil]-3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-b]piridina;

M.29.23 un compuesto seleccionado de M.29.23a 4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il]-N-[(4R)-2-etil-3-oxo-isoxazolidin-4-il]-2-metil-benzamida, M.29.23b 4-[5-(3,5-dicloro-4-fluoro-fenil)-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il]-

N-[(4R)-2-etil-3-oxo-isoxazolidin-4-il]-2-metil-benzamida.

Los compuestos disponibles en el comercio del grupo M enumerados anteriormente se pueden encontrar en The Pesticide Manual, 16.^a edición, C. MacBean, British Crop Protection Council (2013), entre otras publicaciones. El Pesticide Manual en línea se actualiza regularmente y se puede acceder a él a través de <http://bcpdata.com/pesticide-manual.html>.

Otra base de datos en línea sobre plaguicidas que proporciona los nombres comunes ISO es <http://www.alanwood.net/pesticides>.

El M.4 cycloxyprid neonicotinoide se conoce de WO2010/069266 y WO2011/069456, el neonicotinoide M.4A.2, en ocasiones también denominado guadipyr, se conoce de WO2013/003977, y el neonicotinoide M.4A.3 (aprobado como paichongding en China) se conoce de WO2007/101369. El análogo de metaflumizone M.22B.1 se describe en CN10171577, y el análogo M.22B.2, en CN102126994. Los compuestos M.23.1a y M.23.1b se conocen de WO 2014/191271. Los compuestos M.23.2a a M.23.2f se conocen de WO 2014/191271. Ambas ftalamidas M.28.1 y M.28.2 se conocen de WO2007/101540. La antranilamida M.28.3 se describe en WO2005/077934. El compuesto de hidrazida M.28.4 se describe en WO2007/043677. Las antranilamidas M.28.5a) a M.28.5d) y M.28.5h) se describen en WO 2007/006670, WO2013/024009 y WO2013/024010, la antranilamida M.28.5i) se describe en WO2011/085575, M.28.5j) en WO2008/134969, M.28.5k) en US2011/046186 y M.28.5l) en WO2012/034403. El compuesto de diamida M.28.6 se puede encontrar en WO2012/034472. El derivado de cetoenol cíclico sustituido con espirocetal M.29.3 se conoce de WO2006/089633 y el derivado de cetoenol espirocíclico sustituido con bifenilo M.29.4 de WO2008/067911. Triazoilfenilsulfuro M.29.5 se describe en WO2006/043635, y los agentes de control biológicos en función de *bacillus firmus* se describen en WO2009/124707. Los compuestos M.29.6a) a M.29.6i) enumerados en M.29.6 se describen en WO2012/029672, y M.29.6j) y M.29.6k), en WO2013/129688. El nematicida M.29.8 se conoce de WO2013/055584. La isoxazolina M.29.9.a) se describe en WO2013/050317. La isoxazolina M.29.9.b) se describe en WO2014/126208. El análogo tipo piridililo M.29.10 se conoce de WO2010/060379. Las carboxamidas broflanilide y M.29.11.b) a M.29.11.h) se describen en WO2010/018714, y las carboxamidas M.29.11.i) a M.29.11.p), en WO2010/127926. Los piridiltiazoles M.29.12.a) a M.29.12.c) se conocen de WO2010/006713, M.29.12.d) y M.29.12.e) se conocen de WO2012/000896, y M.29.12.f) a M.29.12.m), de WO2010/129497. Los compuestos M.29.14a) y M.29.14b) se conocen de

WO2007/101369. Los pirazoles M.29.16.a) a M.29.16.h) se describen en WO2010/034737, WO2012/084670 y WO2012/143317, respectivamente, y los pirazoles M.29.16.i) y M.29.16.j) se describen en US 61/891437. Los piridinilindazoles M.29.17.a) a M.29.17.j) se describen en WO2015/038503. Los piridilpirazoles M.29.18.a) a M.29.18.d) se describen en US2014/0213448. La isoxazolina M.29.19 se describe en WO2014/036056. La isoxazolina M.29.20 se conoce de WO2014/090918. El compuesto M.29.21 se conoce de EP2910126. Los compuestos M.29.22.a y M.29.22.b se conocen de WO2015/059039 y WO2015/190316. Los compuestos M.29.23.a y M.29.23.b se conocen de WO2013/050302.

La siguiente lista de fungicidas, junto con los cuales se pueden usar los compuestos de la presente invención, pretende ilustrar las posibles combinaciones, pero no las limita:

A) Inhibidores de la respiración

- inhibidores del complejo III en el sitio Qo (por ejemplo, estrobilurinas): azoxystrobin (A.1.1), coumethoxystrobin (A.1.2), coumoxystrobin (A.1.3), dimoxystrobin (A.1.4), enestroburin (A.1.5), fenaminstrobin (A.1.6), fenoxystrobin/flufenoxystrobin (A.1.7), fluoxastrobin (A.1.8), kresoxim-metilo (A.1.9), mandestrobin (A.1.10), metominostrobin (A.1.11), orysastrobin (A.1.12), picoxy.strobin (A.1.13), pyraclostrobin (A.1.14), pyrametostrobin (A.1.15), pyraoxystrobin (A.1.16), trifloxystrobin (A.1.17), 2 (2-(3-(2,6-diclorofenil)-1-metil-alilidenaminooximetil)-fenil)-2-metoxiimino-Nmetil-acetamida (A.1.18), pyribencarb (A.1.19), triclopyricarb/chlorodincarb (A.1.20), famoxadone (A.1.21), fenamidone (A.1.21), metil-N-[2-[(1,4-dimetil-5-fenil-pirazol-3-il)oximetil]fenil]-N-metoxi-carbamato (A.1.22), 1-[3-cloro-2-[[1-(4-clorofenil)-1H-pirazol-3-il]oximetil]fenil]-4-metil-tetrazol-5-ona (A.1.23), 1-[3-bromo-2-[[1-(4-clorofenil)pirazol-3-il]oximetil]fenil]-4-metil-tetrazol-5-ona (A.1.24), 1-[2-[[1-(4-clorofenil)pirazol-3-il]oximetil]-3-metil-fenil]-4-metil-tetrazol-5-ona (A.1.25), 1-[2-[[1-(4-clorofenil)pirazol-3-il]oximetil]-3-fluoro-fenil]-4-metil-tetrazol-5-ona (A.1.26), 1-[2-[[1-(2,4-diclorofenil)pirazol-3-il]oximetil]-3-fluoro-fenil]-4-metil-tetrazol-5-ona (A.1.27), 1-[2-[[4-(4-clorofenil)tiazol-2-il]oximetil]-3-metil-fenil]-4-metil-tetrazol-5-ona (A.1.28), 1-[3-cloro-2-[[4-(p-tolil)tiazol-2-il]oximetil]fenil]-4-metil-tetrazol-5-ona (A.1.29), 1-[3-ciclopropil-2-[[2-metil-4-(1-metilpirazol-3-il)fenoxi]metil]fenil]-4-metil-tetrazol-5-ona (A.1.30), 1-[3-(difluorometoxi)-2-[[2-metil-4-(1-metilpirazol-3-il)fenoxi]metil]fenil]-4-metil-tetrazol-5-ona (A.1.31), 1-metil-4-[3-metil-2[[2-metil-4-(1-metilpirazol-3-il)fenoxi]metil]fenil]tetrazol-5-ona (A.1.32), 1-metil-4-[3-metil-2-[[1-[3-(trifluorometil)fenil]-etilidenamino]oximetil]fenil]tetrazol-5-ona (A.1.33), (Z,E)-5-[1-(2,4-

diclorofenil)pirazol-3-il]oxi-2-metoxiimino-N,3-dimetil-pent-3-enamida (A.1.34), (Z,2E)-5-[1-(4-clorofenil)pirazol-3-il]oxi-2-metoxiimino-N,3-dimetil-pent-3-enamida (A.1.35), (Z,2E)-5-[1-(4-cloro-2-fluoro-fenil)pirazol-3-il]oxi-2-metoxiimino-N,3-dimetil-pent-3-enamida (A.1.36),

- inhibidores del complejo III en el sitio Qi: cyazofamid (A.2.1), amisulbrom (A.2.2), 2metilpropanoato de [(3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[(3-acetoxi-4metoxi-piridin-2-carbonil)amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-ilo] (A.2.3), 2metilpropanoato de [(3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[[3-(acetoximetoxi)-4-metoxi-piridin-2carbonil]amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-ilo] (A.2.4), 2-metilpropanoato de [(3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[(3-isobutoxicarboniloxi-4-metoxi-piridin-2carbonil)amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-ilo] (A.2.5), 2-metilpropanoato de [(3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[[3-(1,3-benzodioxol-5-ilmetoxi)-4-metoxi-piridin-2-carbonil]amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-ilo] (A.2.6); 2-metilpropanoato de (3S,6S,7R,8R)-3-[[3-(hidroxi-4-metoxi-2-piridinil)carbonil]amino]-6 metil-4,9-dioxo-8 (fenilmetil)-1,5-dioxonan-7-ilo (A.2.7), isobutirato de (3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3[3[(isobutiriloxi)metoxi]-4-metoxipicolinamido]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-ilo (A.2.8);

- inhibidores del complejo II (por ejemplo, carboxamidas): benodanil (A.3.1), benzovindiflupyr (A.3.2), bixafen (A.3.3), boscalid (A.3.4), carboxin (A.3.5), fenfuram (A.3.6), fluopyram (A.3.7), flutolanil (A.3.8), fluxapyroxad (A.3.9), furametpyr (A.3.10), isofetamid (A.3.11), isopyrazam (A.3.12), mepronil (A.3.13), oxycarboxin (A.3.14), penflufen (A.3.14), penthiopyrad (A.3.15), sedaxane (A.3.16), tecloftalam (A.3.17), thifluzamide (A.3.18), N-(4'-trifluorometiltiobifenil-2-il)-3difluorometil-1-metil-1Hpirazol-4-carboxamida (A.3.19), N-(2-(1,3,3-trimetil-butil)-fenil)-1,3-dimetil-5fluoro-1H-pirazol-4carboxamida (A.3.20), 3(difluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida (A.3.21), 3(trifluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida (A.3.22), 1,3-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida (A.3.23), 3-(trifluorometil)-1,5-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida (A.3.24), 1,3,5-trimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida (A.3.25), N-(7-fluoro-1,1,3-trimetil-indan-4-il)-1,3-dimetil-pirazol-4-carboxamida (A.3.26), N-[2-(2,4-diclorofenil)-2-metoxi-1-metil-etil]-3-(difluorometil)-1-metil-pirazol-4-carboxamida (A.3.27);

- otros inhibidores de la respiración (por ejemplo, complejo I, desacopladores): diflumetorim (A.4.1), (5,8-difluoroquinazolin-4-il)-{2-[2-fluoro-4-(4-trifluorometilpiridin-2-iloxi)-fenil]-etil}-amina (A.4.2); derivados de nitrofenilo: binapacryl (A.4.3), dinobuton (A.4.4), dinocap (A.4.5), fluazinam (A.4.6); ferimzone (A.4.7); compuestos de

organometal: sales de fentín, tales como fentín-acetato (A.4.8), cloruro de fentín (A.4.9) o hidróxido de fentín (A.4.10); ametotradin (A.4.11); y silthiofam (A.4.12);

B) Inhibidores de la biosíntesis del esteroles (fungicidas de SBI)

- inhibidores de C14 desmetilasa (fungicidas DMI): triazoles: azaconazole (B.1.1), bitertanol (B.1.2), bromuconazole (B.1.3), cyproconazole (B.1.4), difenoconazole (B.1.5), diniconazole (B.1.6), diniconazole-M (B.1.7), epoxiconazole (B.1.8), fenbuconazole (B.1.9), fluquinconazole (B.1.10), flusilazole (B.1.11), flutriafol (B.1.12), hexaconazole (B.1.13), imibenconazole (B.1.14), ipconazole (B.1.15), metconazole (B.1.17), myclobutanil (B.1.18), oxpoconazole (B.1.19), paclobutrazole (B.1.20), penconazole (B.1.21), propiconazole (B.1.22), prothioconazole (B.1.23), simeconazole (B.1.24), tebuconazole (B.1.25), tetraconazole (B.1.26), triadimefon (B.1.27), triadimenol (B.1.28), triticonazole (B.1.29), uniconazole (B.1.30), 1-[rel-(2S;3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)-oxiranilmetil]-5tiocianato-1H-[1,2,4]triazolo (B.1.31), 2-[rel-(2S;3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)-oxiranilmetil]-2H[1,2,4]triazol-3-tiol (B.1.32), 2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-1(1,2,4-triazol-1-il)pentan-2-ol (B.1.33), 1-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1ciclopropil-2-(1,2,4-triazol-1-il)etanol (B.1.34), 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol (B.1.35), 2[2cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-1-(1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol (B.1.36), 2[4(4clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-3-metil-1-(1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol (B.1.37), 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol (B.1.38), 2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-3-metil-1-(1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol (B.1.39), 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1,2,4-triazol-1-il)pentan-2-ol (B.1.40), 2-[4-(4-fluorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol (B.1.41), 2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-1-(1,2,4-triazol-1-il)pent-3-in-2-ol (B.1.51); imidazoles: imazalil (B.1.42), pefurazoate (B.1.43), prochloraz (B.1.44), triflumizol (B.1.45); pirimidinas, piridinas y piperazinas: fenarimol (B.1.46), nuarimol (B.1.47), pyrifenox (B.1.48), triforine (B.1.49), [3-(4-cloro-2-fluoro-fenil)-5-(2,4-difluorofenil)isoxazol-4-il]-(3-piridil)metanol (B.1.50);

- inhibidores de delta14-reductasa: aldimorph (B.2.1), dodemorph (B.2.2), dodemorph-acetato (B.2.3), fenpropimorph (B.2.4), tridemorph (B.2.5), fenpropidin (B.2.6), piperalin (B.2.7), spiroxamine (B.2.8);

- inhibidores de 3-ceto reductasa: fenhexamid (B.3.1);

C) Inhibidores de la síntesis de ácidos nucleicos

- fungicidas de ácido acilamino o fenilamidas: benalaxyl (C.1.1), benalaxyl-M (C.1.2), kiralaxyl (C.1.3), metalaxyl (C.1.4), metalaxyl-M (mefenoxam, C.1.5), ofurace

(C.1.6), oxadixyl (C.1.7);

- otros: hymexazole (C.2.1), octhilinone (C.2.2), ácido oxolínico (C.2.3), bupirimate (C.2.4), 5-fluorocitosina (C.2.5), 5-fluoro-2-(p-tolilmetoxi)pirimidin-4-amina (C.2.6), 5-fluoro-2-(4-fluorofenilmetoxi)pirimidin-4 amina (C.2.7);

D) Inhibidores de la división celular y citoesqueleto

- inhibidores de tubulina, tales como bencimidazoles, tiofanatos: benomyl (D1.1), carbendazim (D1.2), fuberidazole (D1.3), thiabendazole (D1.4), thiophanate-metilo (D1.5); triazolopirimidinas: 5-cloro-7 (4metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)-[1,2,4]triazolo[1,5 a]pirimidina (D1.6);

- otros inhibidores de la división celular: diethofencarb (D2.1), ethaboxam (D2.2), pencycuron (D2.3), fluopicolide (D2.4), zoxamide (D2.5), metrafenone (D2.6), pyriofenone (D2.7);

E) Inhibidores de la síntesis de aminoácidos y proteínas

- inhibidores de la síntesis de metionina (anilino-pirimidinas): cyprodinil (E.1.1), mepanipyrim (E.1.2), pyrimethanil (E.1.3);

- inhibidores de la síntesis de proteínas: blasticidin-S (E.2.1), kasugamycin (E.2.2), kasugamycin clorhidrato-hidrato (E.2.3), mildiomyacin (E.2.4), streptomycin (E.2.5), oxytetracyclin (E.2.6), polyoxine (E.2.7), validamycin A (E.2.8);

F) Inhibidores de la transducción de señal

- inhibidores de MAP / histidina quinasa: fluoroimid (F.1.1), iprodione (F.1.2), procymidone (F.1.3), vinclozolin (F.1.4), fenpiclonil (F.1.5), fludioxonil (F.1.6);

- inhibidores de la proteína G: quinoxyfen (F.2.1);

G) Inhibidores de la síntesis de lípidos y membrana

- inhibidores de la biosíntesis de fosfolípidos: edifenphos (G.1.1), iprobenfos (G.1.2), pyrazophos (G.1.3), isoprothiolane (G.1.4);

- peroxidación de lípidos: dicloran (G.2.1), quintozone (G.2.2), tecnazene (G.2.3), tolclofos-metilo (G.2.4), bifenilo (G.2.5), cloroneb (G.2.6), etridiazol (G.2.7);

- biosíntesis de los fosfolípidos y depósito de la pared celular: dimethomorph (G.3.1), flumorph (G.3.2), mandipropamid (G.3.3), pyrimorph (G.3.4), benthiavalicarb (G.3.5), iprovalicarb (G.3.6), valifenalate (G.3.7) y (4-fluorofenil) éster del ácido N-(1-(1-(4-ciano-fenil)etansulfonil)-but-2-il)carbámico (G.3.8);

- compuestos que afectan la permeabilidad de la membrana celular y ácidos grasos: propamocarb (G.4.1);

- inhibidores de la amida hidrolasa del ácido graso: oxathiapiprolin (G.5.1), metansulfonato de 2-{3-[2-(1-{[3,5-bis(difluorometil-1H-pirazol-1-il)]acetil}piperidin-4-il)-

1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]fenilo (G.5.2), metansulfonato de 2-{3-[2-(1-{[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il) 1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]-3-clorofenilo (G.5.3);

H) Inhibidores con acción en múltiples sitios

- sustancias activas inorgánicas: caldo bordelés (H.1.1), acetato de cobre (H.1.2), hidróxido de cobre (H.1.3), oxiclورو de cobre (H.1.4), sulfato de cobre básico (H.1.5), azufre (H.1.6);

- tio- y ditiocarbamatos: ferbam (H.2.1), mancozeb (H.2.2), maneb (H.2.3), metam (H.2.4), metiram (H.2.5), propineb (H.2.6), thiram (H.2.7), zineb (H.2.8), ziram (H.2.9);

- compuestos de organocloro (por ejemplo: ftalimidas, sulfamidas, cloronitrilos): anilazine (H.3.1), chlorothalonil (H.3.2), captafol (H.3.3), captan (H.3.4), folpet (H.3.5), dichlofluanid (H.3.6), diclorophen (H.3.7), hexaclorobenceno (H.3.8), pentachlorophenole (H.3.9) y sus sales, phthalide (H.3.10), tolylfluanid (H.3.11), N (4-cloro-2-nitro-fenil)-N-etil-4-metil-bencensulfonamida (H.3.12);

- guanidinas y otros: guanidina (H.4.1), dodina (H.4.2), base libre de dodina (H.4.3), guazatine (H.4.4), guazatine-acetato (H.4.5), iminoctadine (H.4.6), iminoctadine-triacetato (H.4.7), iminoctadine-tris(albesilate) (H.4.8), dithianon (H.4.9), 2,6-dimetil-1H,5H-[1,4]ditiino[2,3-c:5,6-c']dipirrol-1,3,5,7(2H,6H)-tetraona (H.4.10).

I) Inhibidores de la síntesis de la pared celular

- inhibidores de la síntesis de glucano: validamycin (I.1.1), polyoxin B (I.1.2);

- inhibidores de la síntesis de melanina: pyroquilon (I.2.1), tricyclazole (I.2.2), carpropamid (I.2.3), dicyclomet (I.2.4), fenoxanil (I.2.5);

J) Inductores de la defensa de la planta

- acibenzolar-S-metilo (J.1.1), probenazole (J.1.2), isotianil (J.1.3), tiadinil (J.1.4), prohexadione-calcio (J.1.5); fosfonatos: fosetyl (J.1.6), fosetyl-aluminio (J.1.7), ácido fosforoso y sus sales (J.1.8), bicarbonato de potasio o sodio (J.1.9);

K) Modo de acción desconocido:

- bronopol (K.1.1), chinomethionat (K.1.2), cyflufenamid (K.1.3), cymoxanil (K.1.4), dazomet (K.1.5), debacarb (K.1.6), diclomezine (K.1.7), difenzoquat (K.1.8), difenzoquat-metilsulfato (K.1.9), difenilamina (K.1.10), fenpyrazamine (K.1.11), flumetover (K.1.12), flusulfamide (K.1.13), flutianil (K.1.14), methasulfocarb (K.1.15), nitrapirina (K.1.16), nitrothal-isopropilo (K.1.18), oxathiapiprolin (K.1.19), tolprocarb (K.1.20), oxin-cobre (K.1.21), proquinazid (K.1.22), tebufloquin (K.1.23), tecloftalam (K.1.24), triazoxide (K.1.25), 2 butoxi-6-iodo-3 propilcromen-4-ona (K.1.26), 2-[3,5-

bis(difluorometil)-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 (K.1.27), 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-fluoro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona (K.1.28), 2[3,5-bis(difluorometil)-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 (K.1.29), N-(ciclopropilmetoxiimino-(6-difluoro-metoxi-2,3 difluoro-fenil)-metil)-2-fenil acetamida (K.1.30), N'-(4-(4-cloro-3-trifluorometil-fenoxi)-2,5-dimetil-fenil)-N-etil-N metil formamidina (K.1.31), N'-(4-(4-fluoro-3-trifluorometil-fenoxi)-2,5-dimetil-fenil)-N-etil-N-metil formamidina (K.1.32), N'-(2-metil-5-trifluorometil-4-(3-trimetilsilanil-propoxi)-fenil)-N-etil-N-metil formamidina (K.1.33), N'-(5-difluorometil-2 metil-4-(3-trimetilsilanil-propoxi)-fenil)-N-etil-N-metil formamidina (K.1.34), 6-ter-butil-8-fluoro-2,3-dimetil-quinolin-4-iléster del ácido metoxiacético (K.1.35), 3-[5-(4-metilfenil)-2,3-dimetil-isoxazolidin-3 il]-piridina (K.1.36), 3[5-(4-cloro-fenil)-2,3-dimetil-isoxazolidin-3-il]-piridina (pyrisoxazole) (K.1.37), amida del ácido N-(6-metoxi-piridin-3-il) ciclopropanocarboxílico (K.1.38), 5-cloro-1 (4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)-2-metil-1H-benzoimidazol (K.1.39), 2-(4-cloro-fenil)-N-[4-(3,4-dimetoxi-fenil)-isoxazol-5-il]-2-prop-2-iniloxi-acetamida, etil (Z) 3 amino-2-ciano-3-fenil-prop-2-enoato (K.1.40), picarbutrazox (K.1.41), pentil N-[6-[(Z)-[(1-metiltetrazol-5-il)-fenil-metilen]amino]oximetil]-2-piridil]carbamato (K.1.42), 2-[2-[(7,8-difluoro-2-metil-3-quinolil)oxi]-6-fluoro-fenil]propan-2-ol (K.1.43), 2-[2-fluoro-6-[(8-fluoro-2-metil-3-quinolil)oxi]fen-il]propan-2-ol (K.1.44), 3-(5-fluoro-3,3,4,4-tetrametil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina (K.1.45), 3-(4,4-difluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina (K.1.46), 3-(4,4,5-trifluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina (K.1.47), 9-fluoro-2,2-dimetil-5-(3-quinolil)-3H 1,4-benzoxazepina (K.1.48).

Se conocen los fungicidas descritos mediante nombres comunes, su preparación y su acción contra hongos dañinos (cf.: <http://www.alanwood.net/pesticides/>); estas sustancias están disponibles en el comercio.

También se conocen los fungicidas descritos por la nomenclatura IUPAC, su preparación y su acción plaguicida (cf. Can. J. Plant Sci. 48(6), 587-94, 1968; EP A 141 317; EP-A 152 031; EP-A 226 917; EP A 243 970; EP A 256 503; EP-A 428 941; EP-A 532 022; EP-A 1 028 125; EP-A 1 035 122; EP A 1 201 648; EP A 1 122 244, JP 2002316902; DE 19650197; DE 10021412; DE 102005009458; US 3,296,272; US 3,325,503; WO 98/46608; WO 99/14187; WO 99/24413; WO 99/27783; WO 00/29404; WO 00/46148; WO 00/65913; WO 01/54501; WO 01/56358; WO 02/22583; WO

02/40431; WO 03/10149; WO 03/11853; WO 03/14103; WO 03/16286; WO 03/53145; WO 03/61388; WO 03/66609; WO 03/74491; WO 04/49804; WO 04/83193; WO 05/120234; WO 05/123689; WO 05/123690; WO 05/63721; WO 05/87772; WO 05/87773; WO 06/15866; WO 06/87325; WO 06/87343; WO 07/82098; WO 07/90624, WO 11/028657, WO2012/168188, WO 2007/006670, WO 2011/77514; WO13/047749, WO 10/069882, WO 13/047441, WO 03/16303, WO 09/90181, WO 13/007767, WO 13/010862, WO 13/127704, WO 13/024009, WO 13/024010 y WO 13/047441, WO 13/162072, WO 13/092224, WO 11/135833).

La presente invención se ilustra en mayor detalle mediante los siguientes ejemplos sin limitarla.

Ejemplos

Por lo general, los compuestos se caracterizaron, por ejemplo, mediante cromatografía de líquidos de alta resolución / espectroscopía de masa combinadas (HPLC/MS), mediante ¹H-RMN y/o mediante sus puntos de fusión.

HPLC analítica:

Método 1: Phenomenex Kinetex 1,7µm XB-C18 100A; 50 x 2,1 mm. Elución: acetonitrilo + 0.1% ácido trifluoroacético (TFA) / agua + 0.1% ácido trifluoroacético (TFA) en una relación de 5:95 a 95:5 en 1,5 minutos a 50°C.

Método 2: BEH C18 1.7µm; 50 x 2,1 mm. Elución: acetonitrilo + 0,1% de ácido fórmico (FA) / agua + 0,1% 0,1% de ácido fórmico (FA) en una relación de 5:95 a 95:5 en 5 minutos a 40 °C.

Método 3: Agilent Eclipse Plus C18, 50 X 4,6 mm, ID 5µm; Elución: A=10 mM de formiato de amonio (0,1 % de ácido fórmico), B= acetonitrilo (0,1 % de ácido fórmico), flujo = 1,2 ml/min a 30 °C; gradiente:= 10 % de B a 100 % de B - 3 min, mantenimiento durante 1 min, 1 min - 10 % de B. Tiempo de corrida = 5,01 min.

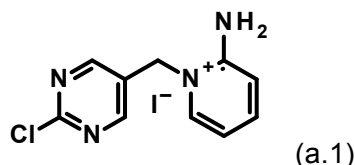
Las abreviaturas usadas son:

d	día(s)
h	hora(s)
min	minuto(s)
r.t.	temperatura ambiente (20-25 °C)
Rt	tiempo de retención
DMF	dimetilformamida
MeCN	acetonitrilo

A Ejemplos de preparación

a) Preparación de compuestos intermediarios

a.1) Síntesis de sal de amina a.1



A una mezcla de 2-cloro-5-metil-pirimidina (100 g, 780 mmol) en 450 ml de CCl_4 , se agregó azobisisobutironitrilo (AIBN) (6,386 g, 39 mmol), y la mezcla se calentó hasta 60 °C. Luego, una solución de SO_2Cl_2 en 50 ml de CCl_4 se agregó por goteo. Después de que se inició la evolución de gas, la velocidad de adición de la solución de SO_2Cl_2 se ajustó para permitir una mínima evolución de gas, la adición de la solución requirió 40 minutos de adición. El calentamiento luego continuó durante 30 min más a 70 °C.

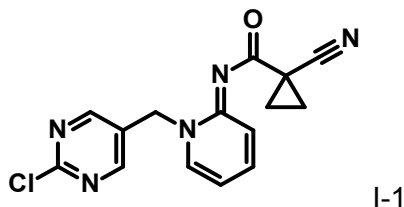
La mezcla de reacción se enfrió hasta temperatura ambiente, y se vertió lentamente en agua y hielo (aproximadamente 200 ml), y el pH se ajustó a 6 mediante la adición de NaHCO_3 . Las capas se separaron, y la capa acuosa se extrajo con [omisión en el texto fuente] (200 ml). Las capas orgánicas combinadas se lavaron con agua (4x 100 ml) y se secaron en Na_2SO_4 , se filtraron y se concentraron al vacío para obtener un residuo. El residuo se analizó mediante ^1H -RMN, y se descubrió que la mezcla consistía en 65 % p/p de producto, 18 % p/p de pirimidina diclorinada y 17 % p/p de material de inicio. El producto se usó en la siguiente etapa sin purificación (rendimiento total de la mezcla: 124 g).

Varias de las reacciones de clorinación cruda mencionadas anteriormente se combinaron para la siguiente reacción: 2-cloro-5-clorometil pirimidina (410 g, pureza de 65 % p/p de la reacción anterior sin purificación, 1,63 mol) se disolvió en acetona (750 ml), y yoduro de potasio (339 g, 2,04 mol) se agregó en pequeñas porciones. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 4,5 h para completar la reacción. Los sólidos se retiraron mediante filtración, y al filtrado se agregó MeCN (250 ml) y 2-amino piridina (153 g, 1,63 mol). La reacción luego se calentó a reflujo durante 3,5 h, y luego se enfrió hasta 10 °C. El precipitado resultante se recolectó mediante filtración y se lavó con acetona fría (500 ml). El secado al vacío (10 mbar, 40 °C) durante 18 h produjo el compuesto del título como un sólido beige (288 g, 50 % de rendimiento).

LC-MS: masa calculada para $\text{C}_{10}\text{H}_{10}\text{N}_4\text{I}$ [M] 221.1, encontrado 221.1; t_R = 0,455 min.

b) Preparación de compuestos finales

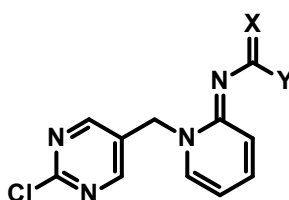
b.1) N-[1-[(2-cloropirimidin-5-il)metil]-2-piridiliden]-1-ciano-ciclopropancarboxamida de la Fórmula I-1



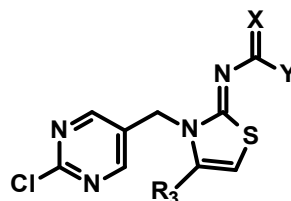
A una suspensión de una sal de amina a.1 (10,0 g, 37,3 mmol) en DMF (20 ml) a 0 °C, se agregó trimetilamina (11,6 g, 114 mmol) y ácido 1-cianociclopropancarboxílico (4,14 g, 37,3 mmol). Luego, se agregó por goteo anhídrido propil fosfórico (31,0 g, 48,8 mmol, 50 % en peso de solución en DMF), manteniendo una temperatura interna de 0 a 5 °C. La reacción se calentó hasta temperatura ambiente y se agitó durante 18 h. La reacción luego se vertió en 1 l de agua y hielo y se agitó durante 30 min. El precipitado se filtró, se lavó con agua y pentano, luego se secó durante la noche al vacío para obtener el producto del título como un sólido beige (6,75 g, 75 % de rendimiento).

LC-MS: masa calculada para C₁₅H₁₃N₅OCl [M] 314.1, encontrado 314.3; t_R= 0,779 min.

Los siguientes compuestos se sintetizan de manera análoga.



N.º	X	Y	Rt [min]	m/z [M+H] ⁺
I-2	O	metoxiiminometilo	0,668	306,0
I-3	S	metoxiiminometilo	0,792	322,0
I-4	O	CH ₂ CN	0,640	288,0
I-5	O	CH ₂ NO ₂	0,700	308,0



N.º	X	Y	R ³	Rt [min]	m/z [M+H] ⁺
I-6	O	1-cianociclopropilo	CH ₃	0,916	334,1

B Ejemplos biológicos

Condiciones generales de prueba

A menos que se especifique lo contrario, la mayoría de las soluciones de prueba se prepararon del siguiente modo:

El compuesto activo se disolvió en la concentración deseada en una mezcla 1:1 (vol:vol) de agua destilada:acetona. La solución de prueba se preparó el día de uso.

En general, las soluciones de prueba se prepararon a concentraciones de 1000 ppm, 500 ppm, 300 ppm, 100 ppm y 30 ppm (p/vol).

B.1 Picudo del algodnero (*Anthonomus grandis*)

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

Los compuestos se formularon con una solución que contenía 75 % v/v de agua y 25 % v/v de DMSO. Sobre la dieta para insectos, se pulverizaron diferentes concentraciones de los compuestos formulados a 5 µl, usando un microatomizador hecho a medida, con dos réplicas.

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

En esta prueba, los compuestos I-3 y I-6 a 2500 ppm mostraron más del 75 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar.

B.2 Escarabajo de la papa de Colorado (*Leptinotarsa decemlineata*)

Los compuestos activos se formularon mediante un distribuidor de líquidos Tecan en ciclohexanona al 100 % como una solución de 10.000 ppm suministrada en

tubos. La solución de 10.000 ppm se diluyó en forma serial en ciclohexanona al 100 % para obtener soluciones provisionales. Esto sirvió como soluciones de reserva para las cuales se obtuvieron diluciones finales mediante el Tecan en 50% acetona: 50 % de agua (v/v) en viales de vidrio de 10 o 20 ml. Se incluyó un tensioactivo no iónico (Kinetic®) en la solución a un volumen de 0,01% (v/v). Los viales se insertaron en un pulverizador electrostático equipado con una boquilla atomizadora para la aplicación en plantas/insectos.

Se cultivaron 2 plantas de berenjenas en una maceta y se seleccionaron para el tratamiento en la etapa de la primera hoja verdadera. Las soluciones de prueba se pulverizaron sobre el follaje con un pulverizador electrostático automatizado para plantas, equipado con una boquilla de pulverización atomizadora. Las plantas se secaron en la campana de humos del pulverizador y luego se retiraron de este. El follaje tratado luego se cortó y se retiró de la maceta, y se colocó en una placa de Petri revestida con papel de filtro humedecido. Se introdujeron cinco larvas de escarabajo en cada placa de Petri, y la placa se cubrió con una tapa para placa de Petri. Las placas de Petri se mantuvieron en una cámara de crecimiento a alrededor de 25 °C y a alrededor de 20-40 % de humedad relativa durante 4 días, para así evitar la exposición directa a la luz fluorescente (fotoperíodo de 24 horas) e impedir la acumulación de calor en las placas. La mortalidad y la reducción en la alimentación se evaluaron 4 días después del tratamiento, en comparación con plantas de control sin tratar.

B.3 Áfido del algodón (*Aphis gossypii*)

Los compuestos activos se formularon mediante un distribuidor de líquidos Tecan en ciclohexanona al 100 % como una solución de 10.000 ppm suministrada en tubos. La solución de 10.000 ppm se diluyó en forma serial en ciclohexanona al 100 % para obtener soluciones provisionales. Esto sirvió como soluciones de reserva para las cuales se obtuvieron diluciones finales mediante el Tecan en 50% acetona:50% agua (v/v) en viales de vidrio de 10 o 20ml. Se incluyó un tensioactivo no iónico (Kinetic®) en la solución a un volumen de 0,01% (v/v). Los viales se insertaron en un pulverizador electrostático equipado con una boquilla atomizadora para la aplicación en plantas/insectos.

Las plantas de algodón en la etapa cotiledónea se infestaron con áfidos antes del tratamiento, colocando una hoja con un alto grado de infestación de la colonia de áfidos principal en la parte superior de cada cotiledón. Los áfidos se transfirieron durante la noche para lograr una infestación de 80-100 áfidos por planta, y se retiró la

hoja huésped. Las plantas infestadas luego se pulverizaron con un pulverizador electrostático automatizado para plantas, equipado con una boquilla de pulverización atomizadora. Las plantas se secaron en la campana de humos del pulverizador, se retiraron de esta y luego se mantuvieron en una cámara de crecimiento con luz fluorescente durante un fotoperíodo de 24 horas a 25 °C y 20-40% de humedad relativa. Después de 5 días, se determinó la mortalidad de los áfidos en las plantas tratadas, con respecto a la mortalidad en las plantas de control sin tratar.

En esta prueba, los compuestos I-1, I-2, I-3, I-4, I-5 y I-6 a 300 ppm mostraron más del 75 % de mortalidad en comparación con los controles sin tratar.

B.4 Áfido del algodón (*Aphis gossypii*)

Los compuestos activos se prepararon y se formularon en 50 % de acetona: 50 % de agua (vol:vol) en viales de vidrio.

Las semillas de algodón se colocaron en los viales de vidrio y se mezclaron con los compuestos formulados. Las semillas de control de blanco de solvente se trataron con 50 % de acetona: 50 % de agua (vol:vol). Las semillas tratadas se secaron al aire. Las semillas de algodón se plantaron en mezcla para macetas Metro Mix® en macetas, 2 semillas por maceta, y se mantuvieron en el invernadero.

Las plántulas se redujeron a una planta por maceta. En la etapa cotiledónea, seis plantas se infestaron con *Aphis gossypii* mediante la transferencia manual de áfidos circa 25 a cada planta en una porción del tejido foliar cortado de una planta donante infestada con áfidos. Las plantas infestadas se mantuvieron en carros transportadores. Cuatro días después de la infestación, se contaron los áfidos vivos en cada planta.

B.5 Áfido del caupí (*Aphis craccivora*)

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

Las plantas de caupí en macetas se colonizaron con aproximadamente 30 - 50 áfidos de varias etapas transfiriendo manualmente un corte de tejido foliar de plantas infestadas 24 horas antes de la aplicación. Las plantas se rociaron con las soluciones de prueba usando un atomizador manual DeVilbiss® a 20- 30 psi ($\approx$ 1,38 a 2,07 bar) después de que se revisó la población de las plagas. Las plantas tratadas se mantuvieron en carros transportadores a alrededor de 26°C. El porcentaje de

mortalidad se determinó después de 72 horas.

En esta prueba, los compuestos I-1, I-2, I-3, I-4, I-5 y I-6 a 300 ppm mostraron más del 75 % de mortalidad en comparación con los controles sin tratar.

B.6 Polilla de la col (*Plutella xylostella*)

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

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

En esta prueba, el compuesto I-2 a 300 ppm mostró más del 75 % de mortalidad en comparación con los controles sin tratar.

B.7 Áfido verde del durazno (*Myzus persicae*)

Los compuestos activos se formularon mediante un distribuidor de líquidos Tecan en ciclohexanona al 100 % como una solución de 10.000 ppm suministrada en tubos. La solución de 10.000 ppm se diluyó en forma serial en ciclohexanona al 100 % para obtener soluciones provisionales. Esto sirvió como soluciones de reserva para las cuales se obtuvieron diluciones finales mediante el Tecan en 50% acetona:50% agua (v/v) en viales de vidrio de 10 o 20 ml. Se incluyó un tensioactivo no iónico (Kinetic®) en la solución a un volumen de 0,01% (v/v). Los viales se insertaron en un pulverizador electrostático equipado con una boquilla atomizadora para la aplicación en plantas/insectos.

Las plantas de pimiento en la etapa de primera hoja verdadera se infestaron antes del tratamiento al colocar hojas intensamente infestadas con la principal colonia en la parte superior de las plantas de tratamiento. Los áfidos se transfirieron durante la noche para lograr una infestación de 30-50 áfidos por planta, y se retiraron las hojas huéspedes. Las plantas infestadas luego se pulverizaron con un pulverizador electrostático automatizado para plantas, equipado con una boquilla de pulverización atomizadora. Las plantas se secaron en la campana de humos del pulverizador, se retiraron y luego se mantuvieron en una cámara de crecimiento con luz fluorescente durante un fotoperíodo de 24 horas a alrededor de 25 °C y alrededor de 20-40 % de

humedad relativa. Después de 5 días, se determinó la mortalidad de los áfidos en las plantas tratadas, con respecto a la mortalidad en las plantas de control sin tratar.

En esta prueba, los compuestos I-1, I-3, I-4, I-5 y I-6 a 2500 ppm mostraron más del 75 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar.

B.8 Chinche verde hedionda (*Nezara viridula*)

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

Las vainas de soja se colocaron en placas de Petri de vidrio de 90 x 50 mm recubiertas con papel de filtro húmedo y se inocularon con 10 *N. viridula* tardías de tercer estadio. Con un atomizador manual, se pulverizó en cada placa de Petri una solución de aproximadamente 2 ml. Las tazas tratadas se mantuvieron a alrededor de 25-26°C y con una humedad relativa de alrededor de 65-70%. El porcentaje de mortalidad se registró luego de 5 días.

En este ensayo, los compuestos I-1, I-2 y I-3 a 300 ppm mostraron más de 75 % de mortalidad en comparación con los controles sin tratar.

B.9 Mosca mediterránea (*Ceratitis capitata*)

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

Los compuestos se formularon con una solución que contenía 75 % v/v de agua y 25 % v/v de DMSO. Sobre la dieta para insectos, se pulverizaron diferentes concentraciones de los compuestos formulados a 5 µl, usando un microatomizador hecho a medida, con dos réplicas.

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

En este ensayo, los compuestos I-3, I-5 y I-6 a 2500 ppm mostraron al menos 75 % de mortalidad en comparación con los controles sin tratar.

B.10 Tisanópteros de la orquídea (*dichromothrips corbetti*)

Los *Dichromothrips corbetti* adultos usados para el bioensayo se obtuvieron de una colonia mantenida continuamente en condiciones de laboratorio. Para los fines de

la prueba, el compuesto de la prueba se diluye en una mezcla 1:1 de acetona:agua (vol:vol) y Kinetic® HV a una tasa de 0,01% v/v.

La potencia de cada compuesto contra los tisanópteros se evaluó con una técnica de inmersión floral. Todos los pétalos de cada flor de orquídea intacta se sumergieron en solución de tratamiento y se secaron en placas de Petri. Los pétalos tratados se colocaron en un plástico resellable junto con 20 tisanópteros adultos. Todas las arenas de prueba se mantuvieron en condiciones de luz continua y a una temperatura de alrededor de 28 °C mientras duró el ensayo. Luego de 3 días, se contó la cantidad de tisanópteros vivos en cada pétalo. El porcentaje de mortalidad se registró 72 horas después del tratamiento.

En esta prueba, los compuestos I-1, I-2, I-3, I-4 y I-6 a 300 ppm mostraron más del 75 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar.

B.11 Arañuela roja común (*Tetranychus kanzawai*)

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

Los porotos de caupí de 4-5 días colocados en macetas se lavaron con agua corriente y se pulverizaron con 1-2 ml de la solución de prueba con un atomizador manual DeVilbiss® impulsado por aire a 20- 30 psi ($\approx$ 1,38 a 2,07 bar). Las plantas tratadas se secaron al aire, y luego se las inoculó con 30 o más ácaros cortando una sección de hoja de mandioca con una población trasera. Las plantas tratadas se colocaron en un cuarto de contención a alrededor de 25-26°C y alrededor de 65-70% de humedad relativa. El porcentaje de mortalidad se evaluó 72 horas después del tratamiento.

B.12 Cigarra verde del arroz (*Nephotettix virescens*)

Las plántulas de arroz de cuatro a cinco semanas de vida con la porción de hoja superior cortada se limpiaron y se lavaron 24 horas antes de la pulverización. Los compuestos activos se formularon en 1:1 de acetona:agua (vol:vol), y se agregó 0,01 % vol/vol de tensioactivo (Kinetic® HV). Las plántulas de arroz en macetas se pulverizaron con 5-6 ml de solución de prueba, se secaron al aire, se cubrieron con cajas Mylar y se inocularon con 10 adultos. Las plantas de arroz tratadas se mantuvieron a alrededor de 28-29 °C y con una humedad relativa de alrededor de 50-60%. El porcentaje de mortalidad se registró luego de 72 horas.

En esta prueba, los compuestos I-1, I-2, I-3, I-4, I-5 y I-6 a 300 ppm mostraron más del 75 % de mortalidad en comparación con los controles sin tratar.

B.13 Saltamontes marrón del arroz (*Nilaparvata lugens*)

Las plántulas de arroz de cuatro a cinco semanas de vida se limpiaron y se lavaron 24 horas antes de la pulverización. Los compuestos activos se formularon en 1:1 de acetona:agua (vol:vol), y se agregó 0,01 % vol/vol de tensioactivo (Kinetic® HV). Las plántulas de arroz en macetas se pulverizaron con 5-6 ml de solución de prueba, se secaron al aire, se cubrieron con cajas Mylar y se inocularon con 10 adultos. Las plantas de arroz tratadas se mantuvieron a alrededor de 28-29 °C y con una humedad relativa de alrededor de 50-60%. El porcentaje de mortalidad se registró luego de 72 horas.

En esta prueba, los compuestos I-1, I-2, I-3, I-4 y I-5 a 300 ppm mostraron más del 75 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar.

B.14 Mosca blanca de la hoja plateada (*Bemisia argentifolii*)

Los compuestos activos se formularon mediante un distribuidor de líquidos Tecan en ciclohexanona al 100 % como una solución de 10.000 ppm suministrada en tubos. La solución de 10.000 ppm se diluyó en forma serial en ciclohexanona al 100 % para obtener soluciones provisionales. Esto sirvió como soluciones de reserva para las cuales se obtuvieron diluciones finales mediante el Tecan en 50% acetona:50% agua (v/v) en viales de vidrio de 5 o 10 ml. Se incluyó un tensioactivo no iónico (Kinetic®) en la solución a un volumen de 0,01% (v/v). Los viales se insertaron en un pulverizador electroestático equipado con una boquilla atomizadora para la aplicación en plantas/insectos.

Las plantas de algodón en la etapa cotiledónea (una planta por maceta) se pulverizaron con un pulverizador electrostático automatizado para plantas, equipado con una boquilla de pulverización atomizadora. Las plantas se secaron en la campana de humos del pulverizador y luego se retiraron de este. Cada maceta se colocó en una taza de plástico, y se introdujeron alrededor de 10 a 12 moscas blancas adultas (de aproximadamente 3-5 días). Los insectos se recolectaron con una aspiradora y un tubo Tygon® no tóxico conectado a la punta de una pipeta de barrera. La punta, que contenía los insectos recolectados, se insertó suavemente en el suelo que contenía la planta tratada, lo que permitió que los insectos se arrastraran fuera de la punta y alcanzaran el follaje para alimentarse. Las tazas se cubrieron con una tapa reutilizable

con pantalla. Las plantas de prueba se mantuvieron en una cámara de crecimiento a alrededor de 25 °C y con alrededor de 20-40 % de humedad relativa durante 3 días, para así evitar la exposición directa a la luz fluorescente (fotoperíodo de 24 horas) e impedir la acumulación de calor en la taza. La mortalidad se evaluó 3 días después del tratamiento, en comparación con plantas de control sin tratar.

En esta prueba, los compuestos I-2, I-3 a 300 ppm mostraron más del 75 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar.

B.15 Gusano cogollero del sur (*Spodoptera eridania*)

Los compuestos activos se formularon mediante un distribuidor de líquidos Tecan en ciclohexanona al 100 % como una solución de 10.000 ppm suministrada en tubos. La solución de 10.000 ppm se diluyó en forma serial en ciclohexanona al 100 % para obtener soluciones provisionales. Esto sirvió como soluciones de reserva para las cuales se obtuvieron diluciones finales mediante el Tecan en 50% acetona:50% agua (v/v) en viales de vidrio de 10 o 20ml. Se incluyó un tensioactivo no iónico (Kinetic®) en la solución a un volumen de 0,01% (v/v). Los viales se insertaron en un pulverizador electrostático equipado con una boquilla atomizadora para la aplicación en plantas/insectos.

Se cultivaron 2 plantas de frijoles de lima (variedad Sieva) en una maceta y se seleccionaron para el tratamiento en la etapa de la primera hoja verdadera. Las soluciones de prueba se pulverizaron sobre el follaje con un pulverizador electrostático automatizado para plantas, equipado con una boquilla de pulverización atomizadora. Las plantas se secaron en la campana de humos del pulverizador y luego se retiraron de este. Cada maceta se colocó en bolsas de plástico perforadas con un cierre zip. Aproximadamente de 10 a 11 larvas de gusanos cogolleros se colocaron en las bolsas, que se cerraron con cierre zip. Las plantas de prueba se mantuvieron en una cámara de crecimiento a alrededor de 25 °C y con alrededor de 20-40% de humedad relativa durante 4 días, para así evitar la exposición directa a la luz fluorescente (fotoperíodo de 24 horas) e impedir la acumulación de calor en las bolsas. La mortalidad y la reducción en la alimentación se evaluaron 4 días después del tratamiento, en comparación con plantas de control sin tratar.

En esta prueba, los compuestos I-1, I-2, I-3 a 300 ppm mostraron más del 75 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar.

B.16 Barrenador del arroz (*Chilo suppressalis*)

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

Efecto ovicida:

Grupos de huevos de días de edad en una sección de la hoja del arroz de 0,5-1 pulgada ($\approx$ 1,27 a 2,54 cm) empapada con la solución de prueba. Los grupos de huevos tratados se transfirieron en placas de Petri recubiertas con papel de filtro húmedo. El porcentaje de nacimiento y porcentaje de mortalidad de larvas se registraron después de 120 horas.

Acción de contacto:

Diez larvas de primera etapa se desplazaron en placas de Petri pulverizadas durante 1 minuto y luego se colocó una paja de arroz recién cortada por placa. Después de 10 minutos cuando todas las larvas estaban dentro de la paja se tapó con la tapa de Petri. El porcentaje de mortalidad se registró 72 horas después del tratamiento.

B.17 Gusano del tabaco (*Heliothis virescens*)

Para evaluar el control del gusano del tabaco (*Heliothis virescens*), la unidad de prueba consistió en placas de microtitulación de 96 cavidades que contenían una dieta para insectos y 15-25 huevos de *H. virescens*.

Los compuestos se formularon con una solución que contenía 75 % v/v de agua y 25 % v/v de DMSO. Sobre la dieta para insectos, se pulverizaron diferentes concentraciones de los compuestos formulados a 10 μ l, usando un microatomizador hecho a medida, con dos réplicas.

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

En esta prueba, los compuestos i-3 y I-6 a 2500 ppm mostraron más del 75 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar.

B.18 Gusano del tabaco (*Heliothis virescens*)

Los compuestos activos se formularon mediante un distribuidor de líquidos Tecan en ciclohexanona al 100 % como una solución de 10.000 ppm suministrada en tubos. La solución de 10.000 ppm se diluyó en forma serial en ciclohexanona al 100 % para obtener soluciones provisionales. Esto sirvió como soluciones de reserva para las

cuales se obtuvieron diluciones finales mediante el Tecan en 50% acetona:50% agua (v/v) en viales de vidrio de 10 o 20 ml. Se incluyó un tensioactivo no iónico (Kinetic®) en la solución a un volumen de 0,01% (v/v). Los viales se insertaron en un pulverizador electrostático equipado con una boquilla atomizadora para la aplicación en plantas/insectos.

Se dejaron crecer 2 plantas de algodón por maceta y se seleccionaron para el tratamiento en la etapa de cotiledón. Las soluciones de prueba se pulverizaron sobre el follaje con un pulverizador electrostático automatizado para plantas, equipado con una boquilla de pulverización atomizadora. Las plantas se secaron en la campana de humos del pulverizador y luego se retiraron de este. Cada maceta se colocó en bolsas de plástico perforadas con un cierre zip. Aproximadamente de 10 a 11 larvas de gusanos del tabaco se colocaron en las bolsas, que se cerraron con cierre zip. Las plantas de prueba se mantuvieron en una cámara de crecimiento a alrededor de 25 °C y con alrededor de 20-40% de humedad relativa durante 4 días, para así evitar la exposición directa a la luz fluorescente (fotoperíodo de 24 horas) e impedir la acumulación de calor en las bolsas. La mortalidad y la reducción en la alimentación se evaluaron 4 días después del tratamiento, en comparación con plantas de control sin tratar.

B.19 Áfido de la arveja (*Megoura viciae*)

Para evaluar el control del áfido de la arveja (*Megoura viciae*) mediante el contacto o con medios sistémicos, la unidad de prueba consistió en placas de microtitulación de 24 cavidades que contenían discos de hojas de habas.

Los compuestos se formularon con una solución que contenía 75 % v/v de agua y 25 % v/v de DMSO. Sobre los discos de hoja se pulverizaron diferentes concentraciones de los compuestos formulados a 2,5 µl, usando un microatomizador hecho a medida, con dos réplicas.

Después de la aplicación, los discos de hoja se secaron al aire, y se colocaron 5 - 8 áfidos adultos en los discos de hoja dentro de las cavidades de las placas de microtitulación. Luego, se permitió que los áfidos succionaran los discos de hojas tratadas y se incubaron a alrededor de 23 ± 1 °C y a alrededor de 50 ± 5 % de humedad relativa durante 5 días. Luego, se evaluaron visualmente la mortalidad y la fecundidad de los áfidos.

En esta prueba, los compuestos I-1, I-3, I-4, I-5 y I-6 a 2500 ppm mostraron más del 75 % de mortalidad en comparación con controles sin tratar.

B.20 Ensayo del gusano de la raíz del maíz occidental (*Diabrotica virgifera virgifera*)
Incorporación en el suelo en comparación con el gusano de la raíz del maíz occidental

El compuesto activo se aplicó en acetona en proporciones de 5 y 50 ppm a.i./suelo (p/p). Los tratamientos se aplicaron en solución a arena arcillosa tamizada de Carolina del Norte (Sandhill soil) en una bolsa de plástico. Los tratamientos se incorporaron intensamente sellando y agitando cada bolsa a mano, lo que permitió que la solución penetre a través de la masa de suelo durante al menos 10 minutos antes de abrirlas. Luego, las bolsas se dejaron abiertas en una campana de humo durante la noche para evaporar el solvente del suelo.

Un día después del tratamiento (DAT) se agregaron agua destilada para humectación y una semilla de mijo empapada en agua (*Panicum miliaceum* 'mijo común') como una fuente de alimento a cada bolsa y se incorporaron intensamente. Se incorporaron 11 cm³ de mezcla de mijo y tierra en una taza de plástico de 1 oz. Cada taza se infestó con 10 larvas de gusanos de la raíz del maíz occidental de segunda etapa. Cada taza o grupo de cuatro celdas fue una réplica, y la replicación se realizó 3x. La prueba se mantuvo en incubadoras a 26 °C en la oscuridad. La mortalidad se evaluó 3 días después de la infestación (DAI), y se calculó el porcentaje de mortalidad media.

B.21 Tisanópteros occidentales de las flores (*Frankliniella occidentalis*)

Las diluciones en serie de cada grado técnico AI se realizaron en acetona pura. Se depositaron 0,5 ml de la solución de tratamiento en el fondo de un vial de vidrio (vial de centelleo). La tapa se volvió a enroscar en el vial y se invirtió durante alrededor de cinco segundos. La tapa se retiró posteriormente, y el vial se mantuvo sobre su lado y se hizo girar constantemente, en un rodillo giratorio para salchichas, hasta que toda la acetona se secó rápidamente, y la superficie interna del vial estaba seca.

Los discos de hojas de algodón también se sumergieron simultáneamente en las soluciones de tratamiento y se secaron. Después de que los viales se secaron, los discos de hojas se colocaron en los viales para servir como una fuente de alimento/agua para los tisanópteros. Cada tratamiento se replicó 5 veces.

Los tisanópteros occidentales de las flores se aspiraron en los viales, aproximadamente 5 larvas o adultos / vial. Después de la aplicación del tratamiento, los viales se mantuvieron en una cámara de contención bajo luz fluorescente y a 26 °C de manera constante.

La mortalidad de los tisanópteros se evaluaron a 2 DAT (días después del tratamiento), contando todos los tisanópteros muertos y vivos.

B.22 Mosquito de la fiebre amarilla (*Aedes aegypti*)

Para evaluar el control del mosquito de la fiebre amarilla (*Aedes aegypti*), la unidad de prueba consistió en placas de microtitulación de 96 cavidades que contenían 200 µl de agua corriente por cavidad y 5-15 larvas recién nacidas de *A. aegypti*.

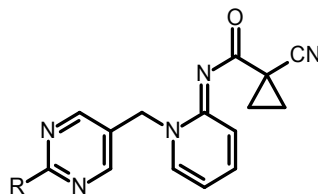
Los compuestos activos se formularon con una solución que contenía 75 % (v/v) de agua y 25 % (v/v) de DMSO. Sobre la dieta para insectos, se pulverizaron diferentes concentraciones de las mezclas o los compuestos formulados a 2,5 µl, usando un microatomizador hecho a medida, con dos réplicas.

Después de la aplicación, se incubaron placas de microtitulación a $28 \pm 1^\circ\text{C}$, 80 ± 5 % de humedad relativa durante 2 días. Luego, se evaluó visualmente la mortalidad de las larvas.

En este ensayo, los compuestos I-3, I-5 y I-6 a 2500 ppm mostraron más de 75 % de mortalidad en comparación con los controles sin tratar.

Experimentos comparativos

El compuesto del Ejemplo I-1 se comparó con el compuesto del Ejemplo I.B-4 de WO 2015/040116 que tiene un anillo de pirimidin-5-ilo no sustituido en lugar del anillo de 2-cloropirimidin-5-ilo de la presente con respecto a la acción insecticida. Los ensayos se llevaron a cabo como se describió anteriormente para la respectiva plaga (el ensayo del áfido del algodón de acuerdo con B.3).

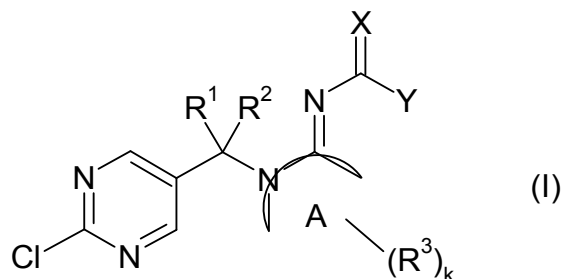


Especie de insecto	ppm	Acción en %	
		R = H	R = Cl
Tisanópteros de la orquídea (<i>dichromothrips corbetti</i>)	10	0	100
Áfido de caupí (<i>Aphis craccivora</i>)	100	0	50

Cigarra verde del arroz (<i>Nephotettix virescens</i>)	10	50	90
Áfido del algodón (<i>Aphis gossypii</i>)	300	0	90
Áfido verde del durazno (<i>Myzus persicae</i>)	300	50	100
Gusano cogollero del sur (<i>Spodoptera eridania</i>)	300	0	100

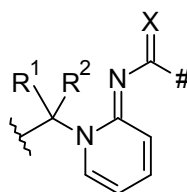
REIVINDICACIONES:

1. Un compuesto de imino de la Fórmula (I):



en donde

A es A.13



A.13

X es O o S;

Y se selecciona de

C₃-C₆-cicloalquilo que tiene un sustituyente R⁴, C₁-C₄-alquilo que tiene un sustituyente R⁵; en donde

R⁴ es ciano;

R⁵ es ciano;

R¹ y R², independientemente entre sí, se seleccionan del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₂-C₄-alquenoilo, C₂-C₄-haloalquenoilo, C₂-C₄-alquiniilo, C₂-C₄-haloalquiniilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, fenilo, y un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados de N, O, S, NO, SO y SO₂ como miembros del anillo;

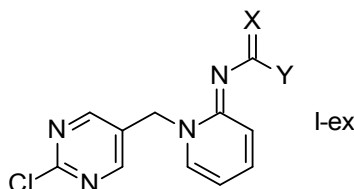
o

R¹ y R² forman, junto con el átomo de carbono al que están unidos, un anillo heterocíclico o carbocíclico saturado o parcialmente insaturado de 3, 4, 5 o 6 miembros, en donde el anillo heterocíclico contiene 1, 2 o 3 heteroátomos o grupos de heteroátomos seleccionados de N, O, S, NO,

SO y SO₂ como miembros del anillo;

y los estereoisómeros, los tautómeros y las sales de aquel aceptables en la agricultura o veterinaria.

2. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde Y es 1-cianociclopropilo.
3. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde Y es CH₂CN.
4. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en donde
R¹ y R², independientemente entre sí, se seleccionan del grupo que consiste en
hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-
cicloalquilo y C₃-C₆-halocicloalquilo; o
R¹ y R² forman, junto con el átomo de carbono al que están unidos, un anillo
carbocíclico saturado de 3, 4 o 5 miembros.
5. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 4, en donde R¹ y R² son
hidrógeno.
6. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, que se selecciona de los
compuestos I-1 y I-4, que son compuestos de la Fórmula I-ex:



en donde los sustituyentes X e Y se definen de la siguiente manera:

N.º	X	Y
I-1	O	cianociclopropilo
I-4	O	CH ₂ CN

7. Una mezcla que comprende al menos un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6 y al menos un plaguicida adicional.
8. Una composición agrícola o veterinaria que comprende al menos un compuesto como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, un estereoisómero, un tautómero y/o al menos una sal de aquel aceptable en la agricultura y veterinaria, o una mezcla de acuerdo con la reivindicación 7, y al menos un portador líquido y/o sólido inerte aceptable en la agricultura y veterinaria.
9. Un método para combatir o controlar plagas de invertebrados, que comprende

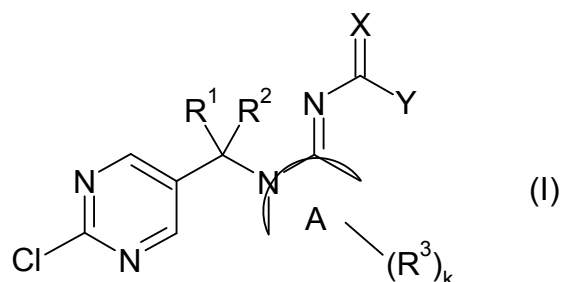
poner en contacto la plaga o su suministro alimenticio, hábitat o lugar de reproducción con una cantidad eficaz como plaguicida de al menos un compuesto como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, o un estereoisómero, un tautómero y/o sal de aquel aceptable en la agricultura o veterinaria, o una mezcla de acuerdo con la reivindicación 7.

10. Un método para proteger plantas en crecimiento contra el ataque o la infestación por plagas de invertebrados, que comprende poner en contacto una planta, o el suelo o el agua donde la planta crece, con una cantidad eficaz como plaguicida de al menos un compuesto como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, o un estereoisómero, un tautómero y/o una sal de aquel aceptable en la agricultura o veterinaria, una mezcla de acuerdo con la reivindicación 7.
11. Un método para proteger el material de propagación vegetal, en especial, las semillas, contra los insectos del suelo, y las raíces y los brotes de las plántulas contra los insectos del suelo y foliares, que comprende poner en contacto el material de propagación vegetal antes de la siembra y/o después de la pregerminación con al menos un compuesto como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, un estereoisómero, un tautómero y/o una sal de aquel aceptable en la agricultura y veterinaria, o una mezcla de acuerdo con la reivindicación 7.

**COMPUESTOS DE IMINO CON UN SUSTITUYENTE DE 2-CLOROPIRIMIDIN-5-IL
COMO AGENTES DE CONTROL DE PLAGAS**

RESUMEN DE LA INVENCION

La presente invención se refiere a compuestos de imino de la Fórmula (I);



en donde las variables son como se define en las reivindicaciones y la descripción, y sus estereoisómeros, tautómeros y sales. La invención también se refiere a composiciones agrícolas o veterinarias que comprenden tales compuestos. La invención también se refiere al uso de estos compuestos, sus estereoisómeros, tautómeros y/o sales, para combatir plagas de invertebrados. Además, la invención se refiere a métodos para combatir plagas de invertebrados, que comprenden la aplicación de dichos compuestos.