

## **DERIVADOS HETEROCÍCLICOS COMO PLAGUICIDAS**

La presente invención se refiere a derivados heterocíclicos de la Fórmula (I), a su uso como acaricidas y/o insecticidas para controlar plagas de animales, en especial de artrópodos y en particular de insectos y arácnidos y a métodos e intermediarios para su preparación.

Los derivados heterocíclicos con propiedades insecticidas se describen en la literatura, como por ejemplo en los documentos, WO2016/129684, WO 2016/142327, WO2016/162318, WO2017/001311, WO2017/061497, WO2017/093180, JP2018-024658, JP2018-024657, JP2018-70585, WO2017/155103, WO2018/050825 y EP17194731.0.

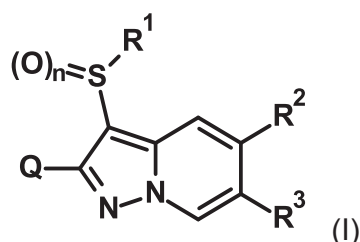
Los productos fitosanitarios modernos tienen que cumplir con muchos requisitos, por ejemplo, con respecto a la cantidad, duración y amplitud de su efecto y su posible uso. Hay problemas de toxicidad, de protección de insectos beneficiosos y polinizadores, propiedades ambientales, dosis de aplicación, la capacidad para combinarse con otras sustancias o auxiliares de formulación así como el esfuerzo necesario para sintetizar un ingrediente activo, además de resistencia, por solo nombrar algunos parámetros. Por todas estas razones, se puede considerar que la búsqueda de nuevos plaguicidas no es sencilla y hay una necesidad constante de nuevos compuestos con propiedades mejoradas en comparación con los compuestos conocidos, por lo menos en términos de aspectos individuales de sus propiedades.

El objeto la presente invención comprende proporcionar compuestos capaces de ampliar el espectro de los plaguicidas en diversos aspectos y/o de mejorar su actividad.

Se han encontrado nuevos derivados heterocíclicos, que ofrecen ventajas con respecto a los compuestos ya conocidos, por ejemplo, mejores propiedades biológicas o ecológicas, métodos de aplicación más amplios, una mejor actividad insecticida, acaricida, así como una buena compatibilidad con los cultivos mencionados. Los derivados heterocíclicos se pueden usar en combinación con otros

agentes para mejorar su eficacia, en particular en el caso de los insectos difíciles de controlar.

Por lo tanto, el objeto de la presente invención son nuevos compuestos de fórmula (I)



en donde (Forma de realización 1)

$R^1$  representa a  $(C_1-C_6)$ alquilo,  $(C_1-C_6)$ haloalcano,  $(C_2-C_6)$ alquenilo,  $(C_2-C_6)$ haloalqueno,  $(C_2-C_6)$ alquinilo,  $(C_2-C_6)$ haloalquino,  $(C_3-C_8)$ cicloalquilo, Halo $(C_3-C_8)$ cicloalquilo,  $(C_3-C_6)$ cicloalquil- $(C_1-C_6)$ alquilo,  $(C_3-C_6)$ cicloalquil- $(C_1-C_6)$ haloalcano,  $(C_1-C_6)$ alquil- $(C_3-C_8)$ cicloalquilo,  $(C_1-C_6)$ haloalquil- $(C_3-C_8)$ cicloalquilo,  $(C_3-C_8)$ cicloalquil- $(C_3-C_8)$ cicloalquilo, espiro- $(C_3-C_8)$ cicloalquil- $(C_3-C_8)$ cicloalquilo,  $(C_4-C_{12})$ bicicloalquilo,  $(C_1-C_6)$ cianoalquilo,  $(C_1-C_6)$ alcoxi- $(C_1-C_6)$ alquilo,  $(C_2-C_6)$ cianoalquenilo,  $(C_3-C_6)$ cicloalquil- $(C_2-C_6)$ alquenilo,  $(C_2-C_6)$ cianoalquinilo,  $(C_3-C_6)$ cicloalquil- $(C_2-C_6)$ alquinilo,  $(C_1-C_6)$ haloalcoxi- $(C_1-C_6)$ alquilo,  $(C_2-C_6)$ alqueniloxi- $(C_1-C_6)$ alquilo,  $(C_2-C_6)$ haloalqueniloxi- $(C_1-C_6)$ alquilo,  $(C_2-C_6)$ alquiniloxi- $(C_1-C_4)$ alquilo,  $(C_2-C_6)$ haloalquiniloxi- $(C_1-C_6)$ alquilo,  $(C_1-C_6)$ alquiltio- $(C_1-C_6)$ alquilo,  $(C_1-C_6)$ alquilsulfinil- $(C_1-C_6)$ alquilo,  $(C_1-C_6)$ alquilsulfonyl- $(C_1-C_6)$ alquilo,  $(C_1-C_6)$ haloalquiltio- $(C_1-C_6)$ alquilo,  $(C_1-C_6)$ haloalquilsulfinil- $(C_1-C_6)$ alquilo,  $(C_1-C_6)$ haloalquilsulfonyl- $(C_1-C_6)$ alquilo, o tri- $(C_1-C_6)$ alquilsililo,

$R^2$ ,  $R^3$  en forma independiente entre sí representan a hidrógeno, halógeno,  $(C_1-C_6)$ alquilo,  $(C_1-C_6)$ haloalcano,  $(C_1-C_6)$ alcoxilo,  $(C_1-C_6)$ haloalcoxilo,  $(C_1-C_6)$ haloalquiltio,  $(C_1-C_6)$ haloalquilsulfinilo,  $(C_1-C_6)$ haloalquilsulfonyl o

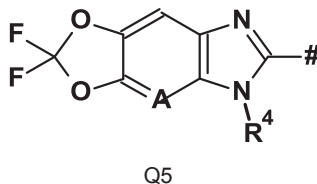
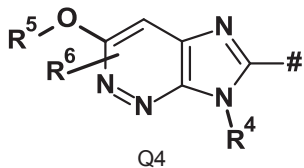
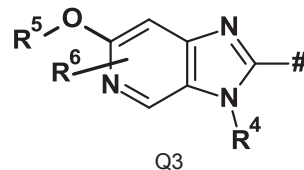
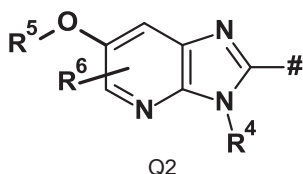
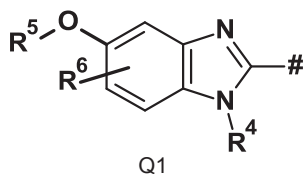
$(C_1-C_6)$ haloalquil- $(C_3-C_8)$ cicloalquilo,  $(C_1-C_6)$ cianoalquil- $(C_3-C_8)$ cicloalquilo,  $(C_1-C_6)$ haloalquil- $(C_3-C_8)$ cianocicloalquilo,  $(C_1-C_6)$ haloalquil- $(C_3-C_8)$ halocicloalquilo, ciano $(C_3-C_6)$ cicloalquilo opcionalmente sustituido una o más veces con  $(C_1-C_6)$ alquilo o halógeno, espiro- $(C_3-C_8)$ cicloalquil- $(C_3-C_8)$ cicloalquilo opcionalmente sustituido una o más veces con ciano o halógeno o  $(C_4-C_{12})$ bicicloalquilo opcionalmente sustituido

una o más veces con ciano o halógeno,

en donde uno de los radicales  $R^2$  o  $R^3$  se deben seleccionar entre (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalquil-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)cicloalquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)cianoalquil-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)cicloalquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalquil-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)cianocicloalquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalquil-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)halocicloalquilo, ciano(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cicloalquilo opcionalmente sustituido una o más veces con (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquilo o halógeno, espiro-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)cicloalquil-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)cicloalquilo opcionalmente sustituido una o más veces con ciano o halógeno o (C<sub>4</sub>-C<sub>12</sub>)bicicloalquilo opcionalmente sustituido una o más veces con ciano o halógeno,

n representa a 0, 1 o 2,

Q representa a un sistema anular heteroaromático bicíclico o tricíclico fusionado de 9 miembros o de 12 miembros de la Serie Q1 a Q5,



en donde

$R^4$  representa a (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalcano, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)cianoalquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Hidroxi alquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alquenilo, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alqueniloxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalqueniloxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalqueno, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)cianoalquenilo, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alquinilo, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alquiniloxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalquino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cicloalquilo, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cicloalquil-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cicloalquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquil-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cicloalquilo, Halo(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cicloalquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilsulfinil-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilsulfonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo o (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilcarbonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo,

R<sup>5</sup> representa a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquilo, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alquenilo, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alquinilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalcano, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalqueno, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalquino, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)cicloalquilo o Halo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)cicloalquilo,

R<sup>6</sup> representa a hidrógeno, ciano, halógeno, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalcano, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alquenilo, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalqueno, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alquinilo, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalquino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cicloalquilo, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cicloalquil-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cicloalquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquil-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cicloalquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alcoxilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalcoxilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)Alkoxyimino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquiltio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalquiltio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilsulfinilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalquilsulfinilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilsulfonilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalquilsulfonilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilsulfoniloxilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilcarbonilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalquilcarbonilo, aminocarbonilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilaminocarbonilo, di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquil-aminocarbonilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilsulfonilamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilamino, di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilamino, aminosulfonilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilaminosulfonilo o di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilaminosulfonilo y

A representa a N (nitrógeno) o C(H).

Además se ha encontrado que los compuestos de la Fórmula (I) presentan una muy buena actividad como plaguicidas, preferiblemente como insecticidas y/o acaricidas, asimismo, como regla general, son muy bien tolerados por las plantas, en particular por las plantas de cultivo.

Los compuestos de acuerdo con la invención en general se definen mediante la Fórmula (I). A continuación se describen los sustituyentes o rangos preferidos de los radicales enumerados en las Fórmulas mencionadas precedentemente y de aquí en adelante:

#### Forma de realización 2

R<sup>1</sup> representa preferiblemente a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalcano, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alquenilo, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalqueno, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alquinilo, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalquino, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)cicloalquilo, Halo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)cicloalquilo, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cicloalquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquilo, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cicloalquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalcano, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquil-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)cicloalquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalquil-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)cicloalquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)cianoalquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)Hidroxialquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquilsulfinil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquilo o (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquilsulfonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquilo,

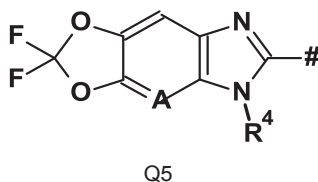
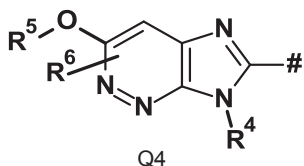
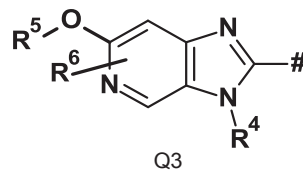
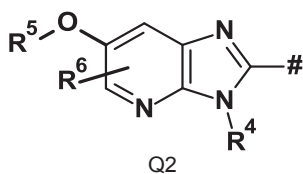
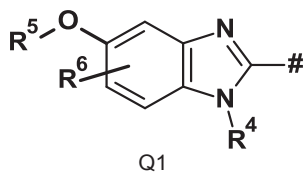
$R^2$ ,  $R^3$  representan preferiblemente en forma independiente entre sí a hidrógeno, halógeno,  $(C_1-C_6)$ alquilo,  $(C_1-C_6)$ haloalcano,  $(C_1-C_6)$ alcoxilo,  $(C_1-C_6)$ haloalcoxilo,  $(C_1-C_6)$ haloalquiltio,  $(C_1-C_6)$ haloalquilsulfinilo,  $(C_1-C_6)$ haloalquilsulfonilo o

$(C_1-C_6)$ haloalquil- $(C_3-C_8)$ cicloalquilo,  $(C_1-C_6)$ cianoalquil- $(C_3-C_8)$ cicloalquilo,  $(C_1-C_6)$ haloalquil- $(C_3-C_8)$ cianocicloalquilo,  $(C_1-C_6)$ haloalquil- $(C_3-C_8)$ halocicloalquilo, ciano $(C_3-C_6)$ cicloalquilo opcionalmente sustituido una o más veces con  $(C_1-C_4)$ alquilo o halógeno, espiro- $(C_3-C_8)$ cicloalquil- $(C_3-C_8)$ cicloalquilo opcionalmente sustituido una o más veces con ciano o halógeno o  $(C_4-C_{12})$ bicicloalquilo opcionalmente sustituido una o más veces con ciano o halógeno,

en donde uno de los radicales  $R^2$  o  $R^3$  se deben seleccionar entre  $(C_1-C_6)$ haloalquil- $(C_3-C_8)$ cicloalquilo,  $(C_1-C_6)$ cianoalquil- $(C_3-C_8)$ cicloalquilo,  $(C_1-C_6)$ haloalquil- $(C_3-C_8)$ cianocicloalquilo,  $(C_1-C_6)$ haloalquil- $(C_3-C_8)$ halocicloalquilo, ciano $(C_3-C_6)$ cicloalquilo opcionalmente sustituido una o más veces con  $(C_1-C_4)$ alquilo o halógeno, espiro- $(C_3-C_8)$ cicloalquil- $(C_3-C_8)$ cicloalquilo opcionalmente sustituido una o más veces con ciano o halógeno o  $(C_4-C_{12})$ bicicloalquilo opcionalmente sustituido una o más veces con ciano o halógeno,

n representa preferiblemente a 0, 1 o 2,

Q representa preferiblemente a un sistema anular heteroaromático bicíclico o tricíclico fusionado de 9 miembros o de 12 miembros de la Serie Q1 a Q5,



en donde

R<sup>4</sup> preferiblemente representa a (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalcano, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)cianoalquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)hidroxialquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alquenilo, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alqueniloxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalqueniloxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalqueno, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)cianoalquenilo, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alquinilo, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alquiniloxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalquino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cicloalquilo, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cicloalquil-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cicloalquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquil-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cicloalquilo, Halo(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cicloalquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilsulfinil-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilsulfonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo o (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilcarbonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo,

R<sup>5</sup> preferiblemente representa a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquilo, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alquenilo, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alquinilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalcano, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalqueno, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalquino, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)cicloalquilo o Halo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)cicloalquilo,

R<sup>6</sup> preferiblemente representa a hidrógeno, ciano, halógeno, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalcano, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alquenilo, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalqueno, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alquinilo, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalquino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cicloalquilo, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cicloalquil-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cicloalquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquil-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cicloalquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alcoxilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalcoxilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alcoxiimino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquiltio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalquiltio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilsulfinilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalquilsulfinilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilsulfonilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalquilsulfonilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilsulfoniloxilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilcarbonilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalquilcarbonilo, aminocarbonilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilaminocarbonilo, di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquil-aminocarbonilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilsulfonilamino, aminosulfonilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilaminosulfonilo o di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilaminosulfonilo y

A preferiblemente representa a N (nitrógeno) o C(H).

### Forma de realización 3

R<sup>1</sup> representa en forma particularmente preferida a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalquilo o (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)cicloalquilo,

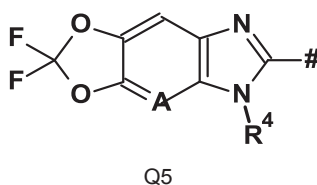
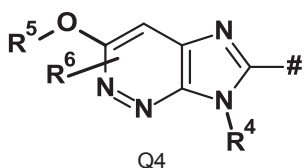
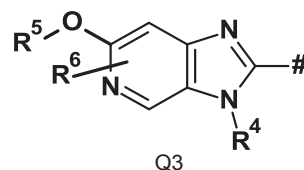
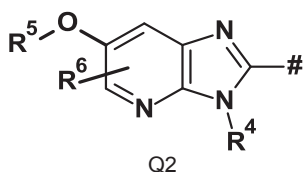
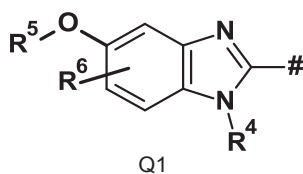
R<sup>2</sup> representa en forma particularmente preferida a hidrógeno, halógeno, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalcano, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alcoxilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalcoxilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalquiltio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalquilsulfinyl o (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalquilsulfonilo,

R<sup>3</sup> representa en forma particularmente preferida a (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalquil-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)cicloalquilo, espiro-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)cicloalquil-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)cicloalquilo, (C<sub>4</sub>-C<sub>12</sub>)bicicloalquilo o

ciano(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cicloalquilo opcionalmente sustituido una o dos veces con (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo o halógeno,

n representa en forma particularmente preferida a 0, 1 o 2,

Q representa en forma particularmente preferida a un sistema anular heteroaromático bicíclico o tricíclico fusionado de 9 miembros o de 12 miembros de la Serie Q1 a Q5,



en donde

R<sup>4</sup> representa en forma particularmente preferida a (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalcano, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)cianoalquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alquenilo, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alqueniloxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alquinilo, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alquiniloxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo o (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cicloalquilo,

R<sup>5</sup> representa en forma particularmente preferida a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalcano, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalqueno, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)haloalquinilo o Halo(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)cicloalquilo,

R<sup>6</sup> representa en forma particularmente preferida a hidrógeno, ciano, halógeno, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalcano, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cicloalquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alcoxilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalcoxilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquiltio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalquiltio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilsulfinilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalquilsulfinilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilsulfonilo o (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalquilsulfonilo y

A representa en forma particularmente preferida N (nitrógeno) o C(H).

#### Forma de realización 4

R<sup>1</sup> representa en forma particularmente más preferida a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquilo, (C<sub>1</sub>-

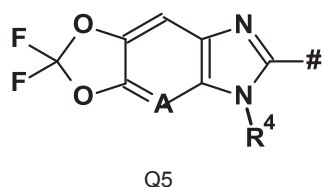
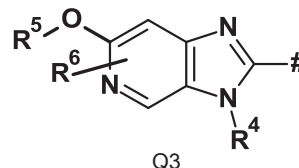
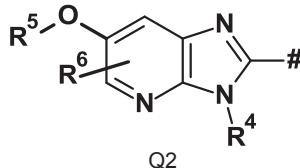
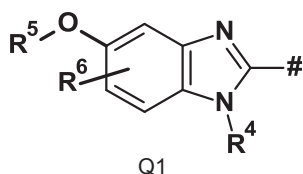
C<sub>6</sub>)haloalquilo o (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)cicloalquilo,

R<sup>2</sup> representa en forma particularmente más preferida a hidrógeno, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo o halógeno,

R<sup>3</sup> representa en forma particularmente más preferida a (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalquil-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)cicloalquilo, espiro-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)cicloalquil-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)cicloalquilo o ciano(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cicloalquilo,

n representa en forma particularmente más preferida a 0, 1 o 2,

Q representa en forma particularmente más preferida a un sistema anular heteroaromático bicíclico o tricíclico fusionado de 9 miembros o de 12 miembros de la Serie Q1, Q2, Q3 y Q5,



en donde

R<sup>4</sup> representa en forma particularmente más preferida a (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo o (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo,

R<sup>5</sup> representa en forma particularmente más preferida a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalquilo,

R<sup>6</sup> representa en forma particularmente más preferida a hidrógeno, metilo, etilo, metoxilo, ciano, halógeno o (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)haloalquilo y

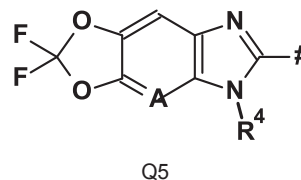
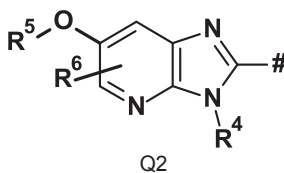
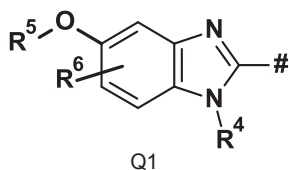
A representa en forma particularmente más preferida a N (nitrógeno) o C(H).

#### Forma de realización 5

R<sup>1</sup> representa principalmente a (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo,

R<sup>2</sup> representa principalmente a hidrógeno,

$R^3$  representa principalmente a cianociclopropilo o cianociclobutilo,  
 $n$  representa principalmente a 2,  
 $Q$  representa principalmente a un sistema anular heteroaromático bicíclico o tricíclico fusionado de 9 miembros o de 12 miembros de la Serie Q1, Q2 y Q5,

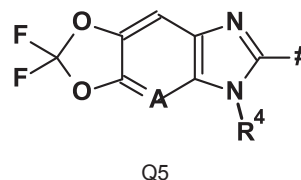
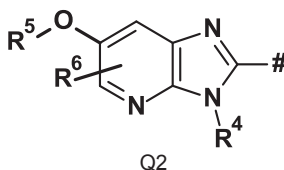
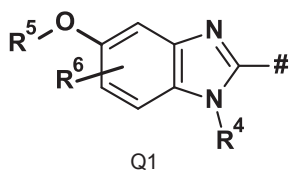


en donde

$R^4$  representa principalmente a  $(C_1-C_4)$ alquilo,  
 $R^5$  representa principalmente a  $(C_1-C_4)$ haloalquilo,  
 $R^6$  representa principalmente a hidrógeno y  
 $A$  representa principalmente a N (nitrógeno) o C(H).

Forma de realización 6-1

$R^1$  representa en forma especial a etilo,  
 $R^2$  representa en forma especial a hidrógeno,  
 $R^3$  representa en forma especial a 1-cianociclopropilo,  
 $n$  representa en forma especial a 2,  
 $Q$  representa en forma especial a un sistema anular heteroaromático bicíclico o tricíclico fusionado de 9 miembros o de 12 miembros de la Serie Q1, Q2 y Q5,



en donde

$R^4$  representa en forma especial a metilo,  
 $R^5$  representa en forma especial a trifluorometilo,

R<sup>6</sup> representa en forma especial a hidrógeno y

A representa en forma especial a N (nitrógeno) o C(H).

#### Forma de realización 6-2

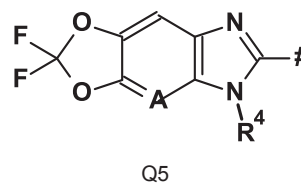
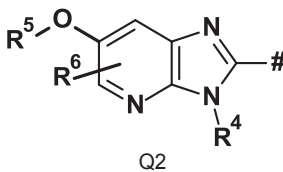
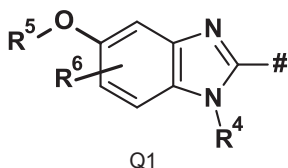
R<sup>1</sup> representa en forma especial a etilo,

R<sup>2</sup> representa en forma especial a hidrógeno,

R<sup>3</sup> representa en forma especial a 1-cianociclopropilo,

n representa en forma especial a 2,

Q representa en forma especial a un sistema anular heteroaromático bicíclico o tricíclico fusionado de 9 miembros o de 12 miembros de la Serie Q1, Q2 y Q5,



en donde

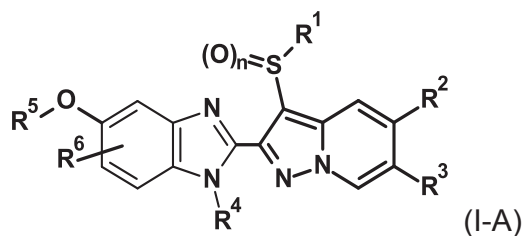
R<sup>4</sup> representa en forma especial a metilo,

R<sup>5</sup> representa en forma especial a trifluorometilo o pentafluoroetilo,

R<sup>6</sup> representa en forma especial a hidrógeno y

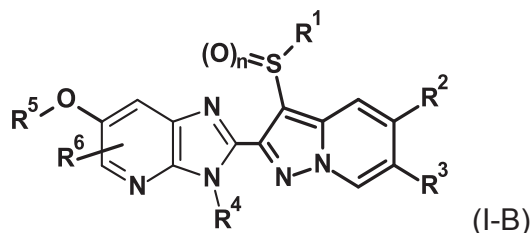
A representa en forma especial a N (nitrógeno) o C(H).

En particular, la invención comprende la siguiente estructura de fórmula (I-A)



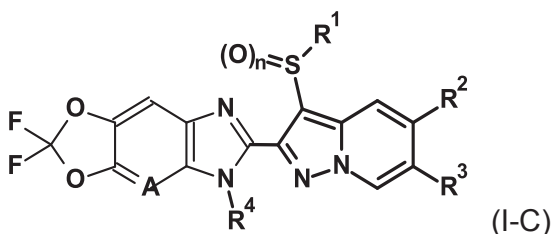
en donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> y n tienen los significados que se describen en la forma de realización (1) o en la forma de realización (2) o en la forma de realización (3) o en la forma de realización (4) o en la forma de realización (5) o en la forma de realización (6).

En particular, la presente invención comprende la siguiente estructura de fórmula (I-B)



en donde  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  y  $n$  tienen los significados que se describen en la forma de realización (1) o en la forma de realización (2) o en la forma de realización (3) o en la forma de realización (4) o en la forma de realización (5) o en la forma de realización (6).

En particular, la presente invención comprende la siguiente estructura de fórmula (I-C)



en donde  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $A$  y  $n$  tienen los significados que se describen en la forma de realización (1) o en la forma de realización (2) o en la forma de realización (3) o en la forma de realización (4) o en la forma de realización (5) o en la forma de realización (6).

El término *Fórmula (I)* comprende en adelante por supuesto también las *Fórmulas (I-A) a (I-C)* abarcadas por la *Fórmula (I)*.

En una forma de realización preferida adicional la invención se relaciona con los compuestos de fórmula (I), en donde,  $n$  representa a 2 y en donde  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $Q$ ,  $A$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  y  $R^6$  tienen los significados que se describen en la forma de realización (1) o en la forma de realización (2) o en la forma de realización (3) o en la forma de realización (4).

En una forma de realización preferida adicional la invención se relaciona con los compuestos de fórmula (I), en donde,

$R^1$  representa a  $(C_1-C_6)$ alquilo,  $(C_1-C_6)$ haloalquilo o  $(C_3-C_8)$ cicloalquilo

y  $R^2$ ,  $R^3$ , Q, A,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  y n tienen los significados que se describen en la forma de realización (1) o en la forma de realización (2) o en la forma de realización (5) o en la forma de realización (6).

En una forma de realización particularmente preferida la invención se relaciona con los compuestos de fórmula (I), en donde,

$R^1$  representa a  $(C_1-C_4)$ alquilo

y  $R^2$ ,  $R^3$ , Q, A,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  y n tienen los significados que se describen en la forma de realización (1) o en la forma de realización (2) o en la forma de realización (3) o en la forma de realización (4) o en la forma de realización (6).

En una forma de realización particularmente más preferida la invención se relaciona con los compuestos de fórmula (I), en donde,

$R^1$  representa a etilo

y  $R^2$ ,  $R^3$ , Q, A,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  y n tienen los significados que se describen en la forma de realización (1) o en la forma de realización (2) o en la forma de realización (3) o en la forma de realización (4) o en la forma de realización (5).

En una forma de realización preferida adicional la invención se relaciona con los compuestos de fórmula (I), en donde,

por lo menos uno de los radicales  $R^2$  o  $R^3$  representa a ciano $(C_3-C_6)$ cicloalquilo, preferiblemente representa a 1-cianociclopropilo y el correspondiente otro radical se selecciona entre hidrógeno,  $(C_1-C_4)$ alquilo o halógeno

y  $R^1$ , Q, A,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  y n tienen los significados que se describen en la forma de realización (1) o en la forma de realización (2) o en la forma de realización (3) o en la forma de realización (5) o en la forma de realización (6).

En una forma de realización preferida adicional la invención se relaciona con los compuestos de fórmula (I), en donde,

$R^2$  representa a hidrógeno,  $(C_1-C_4)$ alquilo o halógeno

y  $R^1$ ,  $R^3$ , Q, A,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  y n tienen los significados que se describen en la forma de realización (1) o en la forma de realización (2) o en la forma de realización (3) o en la forma de realización (5) o en la forma de realización (6).

En una forma de realización particularmente preferida la invención se relaciona con los compuestos de fórmula (I), en donde,

$R^2$  representa a hidrógeno

y  $R^1$ ,  $R^3$ , Q, A,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  y n tienen los significados que se describen en la forma de realización (1) o en la forma de realización (2) o en la forma de realización (3) o en la forma de realización (4).

En una forma de realización preferida adicional la invención se relaciona con los compuestos de fórmula (I), en donde,

$R^3$  representa a  $(C_1-C_4)$ haloalquil- $(C_3-C_8)$ cicloalquilo, espiro- $(C_3-C_8)$ cicloalquil- $(C_3-C_8)$ cicloalquilo o ciano $(C_3-C_6)$ cicloalquilo,

y  $R^1$ ,  $R^2$ , Q, A,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  y n tienen los significados que se describen en la forma de realización (1) o en la forma de realización (2) o en la forma de realización (3) o en la forma de realización (5) o en la forma de realización (6).

En una forma de realización particularmente preferida la invención se relaciona con los compuestos de fórmula (I), en donde,

$R^3$  representa a ciano $(C_3-C_6)$ cicloalquilo

y  $R^1$ ,  $R^2$ , Q, A,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  y n tienen los significados que se describen en la forma de realización (1) o en la forma de realización (2) o en la forma de realización (3) o en la forma de realización (4) o en la forma de realización (6).

En una forma de realización particularmente más preferida la invención se relaciona con los compuestos de fórmula (I), en donde,

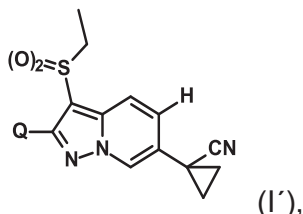
$R^3$  representa a 1-cianociclopropilo

y  $R^1$ ,  $R^2$ , Q, A,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  y n tienen los significados que se describen en la forma de realización (1) o en la forma de realización (2) o en la forma de realización (3) o en la forma de realización (4) o en la forma de realización (5).

En una forma de realización preferida adicional la invención se relaciona con los compuestos de fórmula (I), en donde,  $R^2$  representa a hidrógeno y  $R^3$  representa a 1-cianociclopropilo y  $R^1$ , Q, A,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  y n tienen los significados que se describen en la forma de realización (1) o en la forma de realización (2) o en la forma de

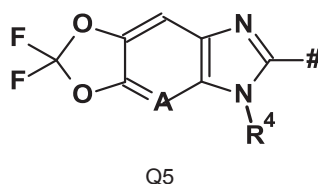
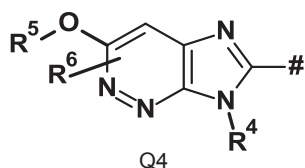
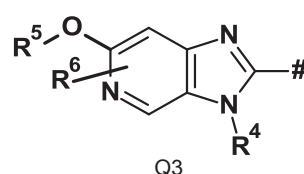
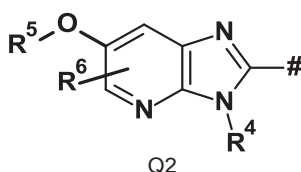
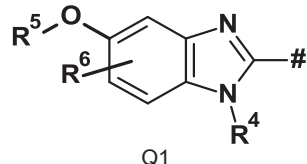
realización (3) o en la forma de realización (4) o en la forma de realización (5) o en la forma de realización (6).

De acuerdo a la invención, se da una preferencia particular a los compuestos de fórmula (I')



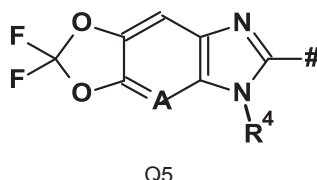
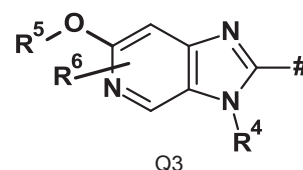
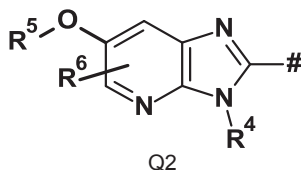
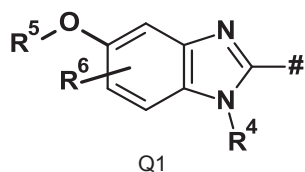
en donde Q, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> tienen los significados que se describen en la forma de realización (3) o en la forma de realización (4) o en la forma de realización (5) o en la forma de realización (6).

En una forma de realización preferida adicional la invención se relaciona con los compuestos de fórmula (I), en donde, Q representa a un sistema anular heteroaromático bicíclico o tricíclico fusionado de 9 miembros o de 12 miembros de la Serie Q1 a Q5,



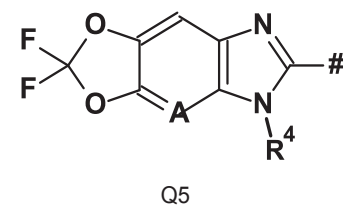
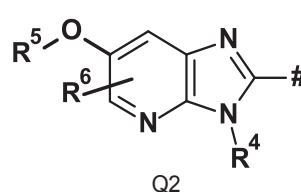
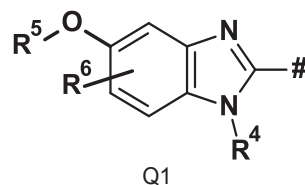
y R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, A, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> y n tienen los significados que se describen en la forma de realización (4) o en la forma de realización (5) o en la forma de realización (6).

En una forma de realización particularmente preferida la invención se relaciona con los compuestos de fórmula (I), en donde, Q representa a un sistema anular heteroaromático bicíclico o tricíclico fusionado de 9 miembros o de 12 miembros de la Serie Q1, Q2, Q3 y Q5,



y  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ , A,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  y n tienen los significados que se describen en la forma de realización (1) o en la forma de realización (2) o en la forma de realización (3) o en la forma de realización (5) o en la forma de realización (6).

En una forma de realización particularmente más preferida la invención se relaciona con los compuestos de fórmula (I), en donde, Q representa a un sistema anular heteroaromático bicíclico o tricíclico fusionado de 9 miembros o de 12 miembros de la Serie Q1, Q2 y Q5,



y  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ , A,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  y n tienen los significados que se describen en la forma de realización (1) o en la forma de realización (2) o en la forma de realización (3) o en la forma de realización (4).

En una forma de realización preferida adicional la invención se relaciona con los compuestos de fórmula (I), en donde

$R^5$  representa a  $(C_1-C_6)$ haloalcano,  $(C_2-C_6)$ haloalqueno,  $(C_2-C_6)$ haloalquinilo o Halo( $C_3-C_8$ )cicloalquilo,

y Q,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^6$ , A y n tienen los significados que se describen en la forma de realización (1) o en la forma de realización (2) o en la forma de realización (4) o en la forma de realización (5) o en la forma de realización (6).

En una forma de realización particularmente preferida la invención se relaciona con los compuestos de fórmula (I), en donde

$R^5$  representa a  $(C_1-C_6)$ haloalcano, preferiblemente representa a  $(C_1-C_4)$ haloalquilo,

y  $Q$ ,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^6$ ,  $A$  y  $n$  tienen los significados que se describen en la forma de realización (1) o en la forma de realización (2) o en la forma de realización (3) o en la forma de realización (4) o en la forma de realización (5) o en la forma de realización (6).

En una forma de realización preferida adicional la invención se relaciona con los compuestos de fórmula (I), en donde

$R^4$  representa a  $(C_1-C_4)$ alquilo o  $(C_1-C_4)$ alcoxi- $(C_1-C_4)$ alquilo,

$R^5$  representa a  $(C_1-C_6)$ haloalquilo,

$R^6$  representa a hidrógeno, metilo, etilo, metoxilo, ciano, halógeno o  $(C_1-C_2)$ haloalquilo y

$A$  representa a  $N$  (nitrógeno) o  $C(H)$ ,

y  $Q$ ,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  y  $n$  tienen los significados que se describen en la forma de realización (1) o en la forma de realización (2) o en la forma de realización (3) o en la forma de realización (5) o en la forma de realización (6).

En una forma de realización particularmente preferida la invención se relaciona con los compuestos de fórmula (I), en donde

$R^4$  representa a  $(C_1-C_4)$ alquilo,

$R^5$  representa a  $(C_1-C_4)$ haloalquilo,

$R^6$  representa a hidrógeno y

$A$  representa a  $N$  (nitrógeno) o  $C(H)$ ,

y  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  y  $n$  tienen los significados que se describen en la forma de realización (1) o en la forma de realización (2) o en la forma de realización (3) o en la forma de realización (4) o en la forma de realización (6).

En una forma de realización particularmente más preferida la invención se relaciona con los compuestos de fórmula (I), en donde,  $Q$  representa a un sistema

anular heteroaromático bicíclico o tricíclico fusionado de 9 miembros o de 12 miembros de la Serie Q1, Q2 y Q5,

en donde

R<sup>4</sup> representa a (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo o (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo,

R<sup>5</sup> representa a (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)haloalquilo,

R<sup>6</sup> representa a hidrógeno, metilo, etilo, metoxilo, ciano, halógeno o (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)haloalquilo y

A representa a N (nitrógeno) o C(H),

y R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> y n tienen los significados que se describen en la forma de realización (1) o en la forma de realización (2) o en la forma de realización (3) o en la forma de realización (5) o en la forma de realización (6).

En una forma de realización principalmente preferida la invención se relaciona con los compuestos de fórmula (I), en donde, Q representa a un sistema anular heteroaromático bicíclico o tricíclico fusionado de 9 miembros o de 12 miembros de la Serie Q1, Q2 y Q5,

en donde

R<sup>4</sup> representa a (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo,

R<sup>5</sup> representa a (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalquilo,

R<sup>6</sup> representa a hidrógeno y

A representa a N (nitrógeno) o C(H),

y R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> y n tienen los significados que se describen en la forma de realización (1) o en la forma de realización (2) o en la forma de realización (3) o en la forma de realización (4) o en la forma de realización (6).

En las definiciones preferidas, a menos que se indique lo contrario, en los rangos generales o preferidos de las definiciones, el halógeno se selecciona del grupo que comprende flúor, cloro, bromo e iodo, preferiblemente se selecciona entre flúor, cloro y bromo.

A menos que se defina de otra manera en otra parte, el término “alquilo”, ya sea solo o en combinación con otros grupos, como por ejemplo haloalquilo, en el contexto de la presente invención representa un radical de un grupo hidrocarbonado

alifático de 1 a 12 átomos de carbono, de cadena lineal o ramificada. Los ejemplos de radicales C1-C12-alquilo comprenden metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo, ter-butilo, n-pentilo, iso-pentilo, neopentilo, ter-pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 1-etilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, hexilo, n-heptilo, n-octilo, n-nonilo, n-decilo, n-undecilo y n-dodecilo. Entre estos radicales alquilo, los radicales C1-C6-alquilo son particularmente preferidos. Más particularmente preferidos son los radicales C1-C4-alquilo.

A menos que se defina de otra manera en otra parte, el término "alquenilo", ya sea solo o en combinación con otros grupos, comprende de acuerdo con la invención un radical C2-C12-alquenilo lineal o ramificado, que comprende por lo menos un enlace doble, por ejemplo, vinilo, alilo, 1-propenilo, isopropenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1,3-butadienilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1,3-pentadienilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo y 1,4-hexadienilo. Entre estos radicales, son particularmente preferidos los radicales C2-C6-alquenilo y más preferidos aún son los radicales C2-C4-alquenilo.

A menos que se defina de otra manera en otra parte, el término "alquinilo", ya sea solo o en combinación con otros grupos, comprende de acuerdo con la invención un radical C2-C12-alquinilo lineal o ramificado, que comprende por lo menos un enlace triple, por ejemplo, etinilo, 1-propinilo y propargilo. Entre estos radicales, son particularmente preferidos los radicales C3-C6-alquinilo y más preferidos aún son los radicales C3-C4-alquinilo. El radical alquilo también puede comprender por lo menos un enlace doble.

A menos que se defina de otra manera en otra parte, el término "cicloalquilo", ya sea solo o en combinación con otros grupos, comprende de acuerdo con la invención un radical C3-C8-cicloalquilo, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo y ciclooctilo. Los radicales más preferidos comprenden radicales C3-C6-cicloalquilo.

A menos que se defina lo contrario en algún otro lugar, el término "bicicloalquilo" ya sea solo o bien en combinación con otros términos, de acuerdo con la invención representa a un biciclo, cuyos dos anillos están provistos de un enlace

simple en común. Los dos ciclos pueden tener el mismo número o un número diferente de átomos de carbono. Por ejemplo, el mismo puede ser biciclo[1.1.0]butano o biciclo[2.1.0]pentano.

A menos que se defina lo contrario en algún otro lugar, el término “espiro-cicloalquil-cicloalquilo” ya sea solo o bien en combinación con otros términos, de acuerdo con la invención representa a un compuesto en donde dos anillos de cicloalquilo están conectados a través de un átomo de carbono en común. Los dos ciclos pueden tener el mismo número o un diferente número de átomos de carbono. Por ejemplo pueden ser espiro[2.2]pentano (espiro-(ciclopropil)-(ciclopropilo)) o espiro[2.3]hexano (espiro-(ciclopropil)-(ciclobutilo)).

El término “alcoxilo”, ya sea solo o en combinación con otros grupos, como por ejemplo haloalcoxi, significa en la presente un radical O-alquilo, en donde el término “alquilo” tiene el significado definido precedentemente.

Los radicales sustituidos con halógeno, por ejemplo haloalquilo (= haloalquilo), están monosustituidos o polisustituidos con el número máximo posible de sustituyentes halogenados. En el caso de una halogenación múltiple, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes. En este caso halógeno se refiere a flúor, cloro, bromo o iodo, en particular flúor, cloro o bromo.

A menos que se especifique lo contrario, los radicales opcionalmente sustituidos pueden estar monosustituidos o polisustituidos, en donde si se trata de múltiples sustituyentes los mismos pueden ser iguales o diferentes.

Las definiciones o descripciones de los radicales generales o preferidos indicadas precedentemente se aplican de manera correspondiente a los productos finales, así como a los materiales de partida e intermediarios. Estas definiciones de radicales se pueden combinar entre sí según se desee, es decir, también entre los rangos preferidos respectivos.

De acuerdo con la invención, se prefiere emplear los compuestos de la Fórmula (I) que comprenden una combinación de las definiciones enumeradas precedentemente como preferidas.

De acuerdo con la invención, se prefiere particularmente emplear los compuestos de la Fórmula (I) que comprenden una combinación de las definiciones enumeradas precedentemente como particularmente preferidas.

De acuerdo con la invención, se prefiere más particularmente emplear los compuestos de la Fórmula (I) que comprenden una combinación de las definiciones enumeradas precedentemente como más particularmente preferidas.

De acuerdo con la invención, se prefiere emplear especialmente los compuestos de la Fórmula (I) que comprenden una combinación de las definiciones enumeradas precedentemente como especialmente preferidas.

De acuerdo a la invención, se usan en particular los compuestos de fórmula (I) que contienen una combinación de los significados enumerados previamente como particulares.

Los compuestos de la Fórmula (I) pueden estar presentes, dependiendo de la naturaleza de los sustituyentes, como isómeros geométricos y/o como isómeros ópticamente activos o como mezclas de los isómeros correspondientes en diferentes composiciones. Estos estereoisómeros comprenden, por ejemplo, enantiómeros, diastereoisómeros, atropisómeros o isómeros geométricos. Por lo tanto, la invención incluye tanto los estereoisómeros puros como cualquier mezcla de los mismos.

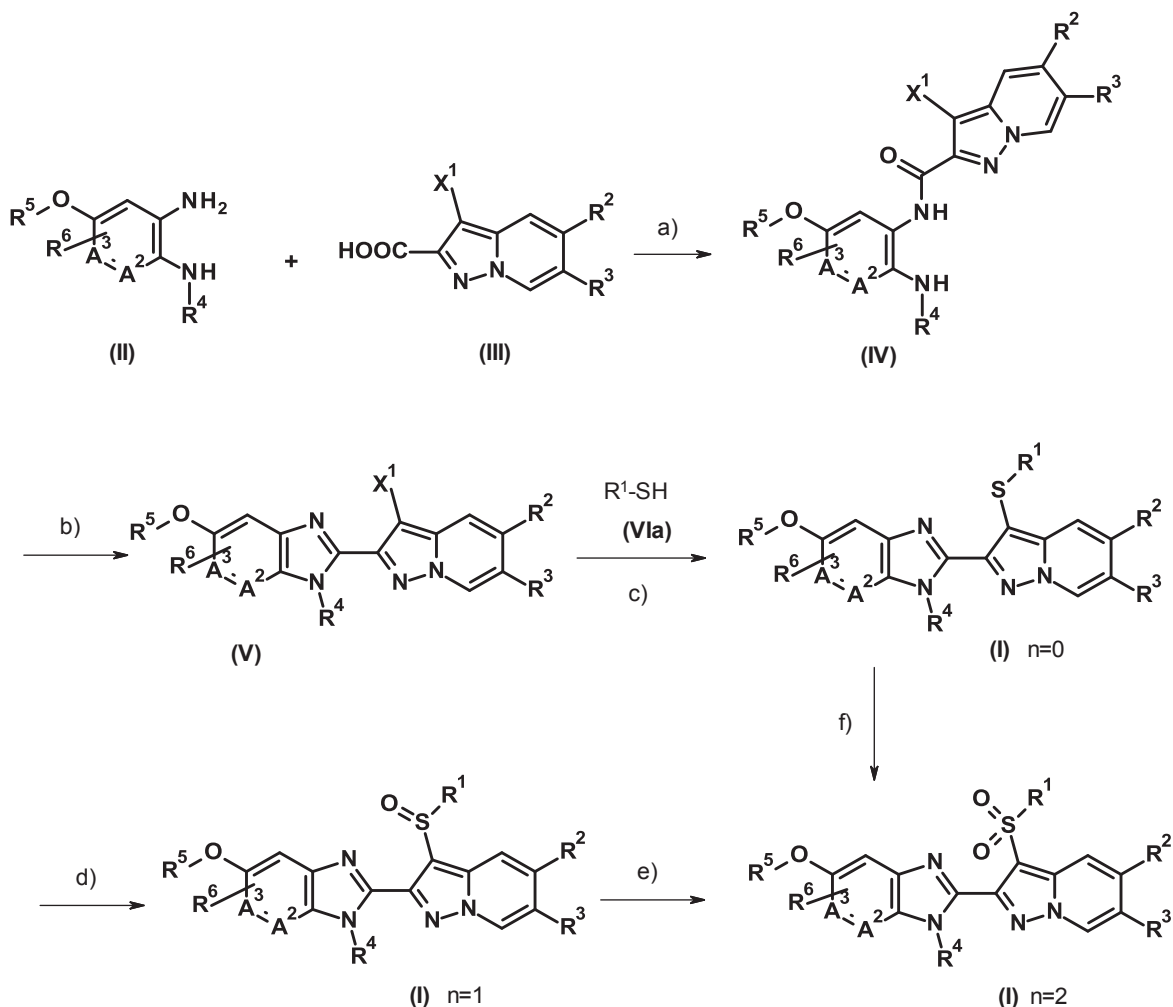
Los compuestos de fórmula (I) también pueden estar presentes como sales, en especial como sales de adición ácida y complejos de sales metálicas. Los compuestos de fórmula (I) y sus sales de adición ácida y complejos de sales metálicas poseen buena actividad, en especial para controlar plagas de animales.

Las sales adecuadas de los compuestos de fórmula general (I) pueden ser sales no tóxicas convencionales, o sea sales con correspondientes bases y sales con ácidos agregados. Preferiblemente son sales con bases inorgánicas, tales como sales de metales alcalinos, por ejemplo sales de sodio, potasio o cesio, sales de metales alcalino térreos, por ejemplo sales de calcio o magnesio, sales de amonio, sales con bases orgánicas así como también con aminas inorgánicas, por ejemplo sales de trietilamonio, dicitclohexilamonio, N,N'-dibenciletilendiamonio, piridina, picolina o etilamonio, sales con ácidos inorgánicos, por ejemplo clorhidrato, bromhidrato,

bisulfato, trisulfato, o fosfato, sales con ácidos carboxílicos orgánicos o ácidos sulfónicos orgánicos, por ejemplo formiato, acetato, trifluoracetato, malato, tartrato, metanosulfonato, bencenosulfonato o para-toluenosulfonato, sales con aminoácidos básicos, por ejemplo arginato, aspartato o glutamato y similares.

Los compuestos de la Fórmula (I) de acuerdo con la invención se pueden obtener mediante los métodos ilustrados en los siguientes Esquemas:

### **Método A**



Los radicales R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> y n tienen los significados descritos anteriormente, A<sup>2</sup> y A<sup>3</sup> representan a CH o N y X<sup>1</sup> representa a halógeno.

### **Paso a)**

Los compuestos de fórmula (IV) se pueden preparar en forma análoga al método que se describe en el documento US5576335 mediante la reacción de los

compuestos de fórmula (II) con ácidos carboxílicos de fórmula (III) en presencia de un agente de condensación o una base.

Los compuestos de fórmula (II) están comercialmente disponibles o bien se pueden preparar mediante métodos conocidos, por ejemplo en forma análoga a los métodos que se describen en los documentos WO2014/171528, Journal of Medicinal Chemistry, 54(24), 8541-8554; 2011, WO2012/057269, European Journal, 22(15), 5102-5106; 2016, Chemistry - A European Journal, 22(15), 5102-5106; 2016 u Organic Letters, 18(18), 4570-4573 2016.

Los ácidos carboxílicos de fórmula (III) están comercialmente disponibles o bien se pueden preparar mediante métodos conocidos. Las vías de preparación posibles se describen en los métodos D y E.

La reacción de los compuestos de fórmula (II) con ácidos carboxílicos de fórmula (III) se puede llevar a cabo en masa o en un solvente, preferiblemente la reacción se lleva a cabo en un solvente que se selecciona entre solventes convencionales que son inertes a las condiciones de reacción predominantes. Se da preferencia a los éteres como por ejemplo diisopropiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano; hidrocarburos halogenados como por ejemplo diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; nitrilos, como por ejemplo acetonitrilo o propionitrilo; hidrocarburos aromáticos como por ejemplo tolueno, o xilol; solventes polares apróticos como por ejemplo N,N-dimetilformamida o N-metilpirrolidona o compuestos que contienen nitrógeno como por ejemplo piridina.

Los agentes de condensación adecuados son, por ejemplo, carbodiimidas como clorhidrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (EDCI) o 1,3-diciclohexilcarbodiimida.

Las bases adecuadas son las bases inorgánicas que se usan habitualmente en dichas reacciones. Preferiblemente se usan bases que se seleccionan por ejemplo del grupo que consiste en acetatos, fosfatos, carbonatos y bicarbonatos de metales alcalinos y alcalinotérreos. Particularmente preferidos son acetato de sodio, fosfato de sodio, fosfato de potasio, carbonato de cesio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio.

La reacción se puede llevar a cabo al vacío, a presión normal o bajo un exceso de presión y a temperaturas entre 0 °C y 180 °C, preferiblemente la reacción se lleva a cabo a presión normal y temperaturas entre 20 y 140 °C.

#### **Paso b)**

Los compuestos de fórmula (V) se pueden preparar mediante la condensación de los compuestos de fórmula (IV) por ejemplo en forma análoga al método que se describe en los documentos WO2009/131237, WO2010/125985, WO2011/043404, WO2011/040629, WO2012/086848, WO2013/018928, WO2015/000715 o WO 2015/121136.

La reacción para obtener los compuestos de la Fórmula (V) se puede llevar a cabo en una sustancia o en un solvente, preferiblemente la reacción se lleva a cabo en un solvente que se selecciona entre solventes convencionales que son inertes en las condiciones de reacción prevalecientes. Se prefieren los éteres, por ejemplo, diisopropil éter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, ter-butil metil éter; hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; nitrilos, tales como acetonitrilo o propionitrilo; hidrocarburos aromáticos tales como tolueno o xileno; solventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida o N-metilpirrolidona o compuestos que contienen nitrógeno tales como piridina.

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

Los ejemplos de agentes de condensación adecuados son carbodiimidas tales como clorhidrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (EDCI) o 1,3-diciclohexilcarbodiimida; anhídridos tales como anhídrido acético, anhídrido trifluoroacético; una mezcla de trifenilfosfina, una base y tetracloruro de carbono o una mezcla de trifenilfosfina y un azo diéster tal como, por ejemplo, ácido dietilazodicarboxílico.

Los ejemplos de ácidos adecuados que se pueden usar en la reacción descrita son ácidos sulfónicos tales como ácido para-toluenosulfónico; ácidos carboxílicos tales como ácido acético o ácidos polifosfóricos.

Los ejemplos de bases adecuadas son heterociclos que contienen nitrógeno tales como piridina, picolina, 2,6-lutidina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undeceno (DBU); aminas terciarias tales como trietilamina y N, N-diisopropiletilamina; bases inorgánicas tales como fosfato de potasio, carbonato de potasio e hidruro de sodio.

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

La reacción se puede llevar a cabo al vacío, a presión normal o bajo un exceso de presión y a temperaturas entre 0 °C y 200 °C.

### **Paso c)**

Los compuestos de fórmula (I), en donde n representa a 0, se pueden preparar mediante la reacción de los compuestos de fórmula (V) con los compuestos de fórmula (VIa) en presencia de una base.

Los derivados de mercaptano de fórmula (VIa) como por ejemplo el metilmercaptano, el etilmercaptano o el isopropilmercaptano están comercialmente disponibles o bien se pueden preparar mediante métodos conocidos, por ejemplo en forma análoga a los métodos que se describe en los documentos US2006/25633, US2006/111591, US2820062, *Chemical Communications*, **13** (2000), 1163-1164 o *Journal of the American Chemical Society*, **44** (1922), 1329.

La reacción para dar el compuesto de fórmula (I), en donde n representa a 0, se puede llevar a cabo en masa o en un solvente, preferiblemente la reacción se lleva a cabo en un solvente que se selecciona entre los solventes habituales que son inertes a las condiciones de reacción predominantes. Se da preferencia a los éteres como por ejemplo diisopropiléter, dioxano, tetrahydrofurano, 1,2-dimetoxietano, tertbutilmetiléter; nitrilos, como por ejemplo acetonitrilo o propionitrilo; hidrocarburos aromáticos como por ejemplo tolueno o xilol; solventes polares apróticos como por ejemplo N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona o dimetilsulfóxido.

Los ejemplos de bases adecuadas son las bases inorgánicas del grupo que consiste en acetatos, fosfatos bicarbonatos y carbonatos de metales alcalinos o alcalinotérreos. Se da preferencia a carbonato de cesio, carbonato de sodio, carbonato de potasio y bicarbonato de sodio. Otras bases adecuadas son los hidruros de metales alcalinos como por ejemplo el hidruro de sodio.

La reacción se puede llevar a cabo al vacío, a presión normal o bajo un exceso de presión y a temperaturas entre 0 °C y 200 °C.

En la reacción descrita  $X^1$  preferiblemente representa a un átomo de flúor o de cloro.

Como alternativa, en el caso en que  $X^1$  represente a bromo, también se transmetaliza con una base de litio apropiada y subsiguientemente se hace reaccionar con el correspondiente disulfuro comercialmente disponible. Véase también *Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters*, **20** (2010), 2770 – 2775.

Las bases de litio adecuadas son por ejemplo el n-butililitio.

La reacción para dar el compuesto de fórmula (I), en donde n representa a 0, se puede llevar a cabo en masa o en un solvente, preferiblemente la reacción se lleva a cabo en un solvente que se selecciona entre los solventes habituales que son inertes a las condiciones de reacción predominantes. Se da preferencia a los éteres como por ejemplo diisopropiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, tert-butilmetiléter

La reacción se puede llevar a cabo al vacío, a presión normal o bajo un exceso de presión y a temperaturas entre 0 °C y 200 °C.

La reacción se puede llevar a cabo en microondas.

#### **Paso d)**

Los compuestos de fórmula (I), en donde n representa a 1, se pueden preparar mediante la oxidación de los compuestos de fórmula (I), en donde n representa a 0. La oxidación en general se lleva a cabo en un solvente que se selecciona entre los solventes habituales que son inertes a las condiciones de reacción predominantes. Se da preferencia a los hidrocarburos halogenados como por ejemplo diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; alcoholes tales como metanol o etanol; ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico o agua.

Los ejemplos de agentes oxidantes adecuados son el peróxido de hidrógeno, el ácido meta-cloroperbenzoico o el periodato de sodio.

La reacción se puede llevar a cabo al vacío, a presión normal o bajo un exceso de presión y a temperaturas entre -20°C °C y 120 °C.

### **Paso e)**

Los compuestos de fórmula (I), en donde n representa a 2, se pueden preparar mediante la oxidación de los compuestos de fórmula (I), en donde n representa a 1. La oxidación en general se puede llevar a cabo en un solvente. Se da preferencia a los hidrocarburos halogenados como por ejemplo diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; alcoholes tales como metanol o etanol; ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico o agua.

Los ejemplos de agentes oxidantes adecuados son el peróxido de hidrógeno y el ácido meta-cloroperbenzoico.

La reacción se puede llevar a cabo al vacío, a presión normal o bajo un exceso de presión y a temperaturas entre -20°C °C y 120 °C.

### **Paso f)**

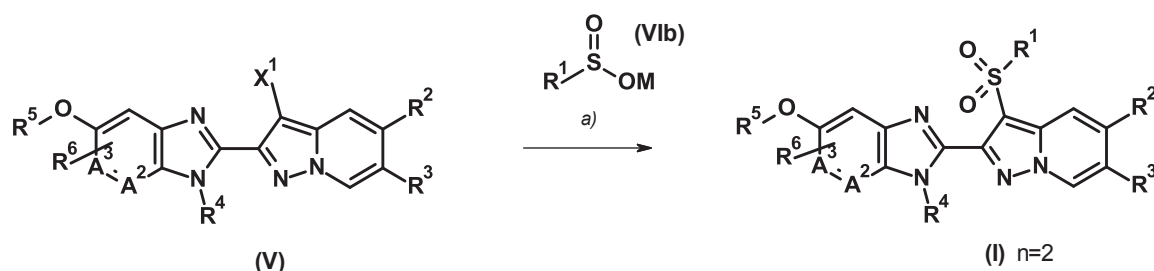
Los compuestos de fórmula (I), en donde n representa a 2, también se pueden preparar mediante un proceso de un solo paso a través de la oxidación de los compuestos de fórmula (I), en donde n representa a 0. La oxidación en general se lleva a cabo en un solvente. Se da preferencia a los hidrocarburos halogenados como por ejemplo diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; alcoholes tales como metanol o etanol; ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico o agua.

Los ejemplos de agentes oxidantes adecuados son el peróxido de hidrógeno y el ácido meta-cloroperbenzoico.

La reacción se puede llevar a cabo al vacío, a presión normal o bajo un exceso de presión y a temperaturas entre -20°C °C y 120 °C.

### **Método B**

Los compuestos de fórmula (I), en donde n representa a 2, como alternativa se pueden preparar en un proceso de un solo paso a partir de los compuestos de fórmula (V). El método se describe mediante la reacción de los compuestos de fórmula (V) para dar los compuestos de fórmula (I) mediante el método A.



Los radicales  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  y  $n$  tienen los significados descritos anteriormente,  $A^2$  y  $A^3$  representan a CH o N y  $X^1$  representa a halógeno (preferiblemente bromo o yodo). M representa a un metal alcalino (preferiblemente representa a sodio o potasio).

Los compuestos de fórmula (I), en donde  $n$  representa a 2, se pueden preparar en un proceso de un solo paso a partir de los compuestos de fórmula (V) por ejemplo en forma análoga al método que se describe en Journal of Organic Chemistry **70** (2005) 2696-2700, mediante un intercambio halógeno-sulfona con un compuesto de fórmula (VIb). El intercambio en general se lleva a cabo en un solvente. Se da preferencia a los solventes polares apróticos como por ejemplo el dimetilsulfóxido y la N,N-dimetilformamida.

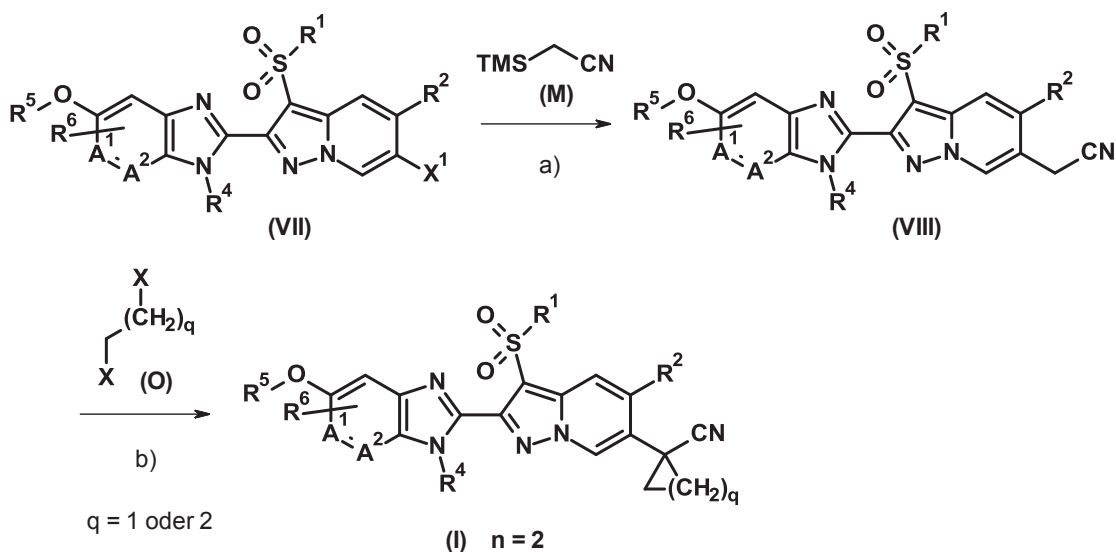
La reacción en general es catalizada mediante el agregado de una sal de cobre (I) como por ejemplo el ioduro de cobre (I).

Los compuestos de fórmula (VIb) están comercialmente disponibles o bien se pueden preparar mediante métodos conocidos, por ejemplo en forma análoga al método que se describe en Organic Synthesis **57** (1977) 88-92; Tetrahedron Letters **9** (1979) 821-824 así como también en el Bulletin de la Societe Chimique de France **4** (1958) 447-450.

Los ejemplos de reactivos azufrados adecuados son las sales del ácido sulfínico.

La reacción se puede llevar a cabo al vacío, a presión normal o bajo un exceso de presión y a temperaturas entre  $-20^{\circ}\text{C}$  y  $120^{\circ}\text{C}$ .

### **Método C**



Los radicales R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> y n tienen los significados descritos anteriormente, A<sup>2</sup> y A<sup>3</sup> representan a CH o N, q representa a 1 o 2, y X y X<sup>1</sup> representan a halógeno.

#### Paso a)

Los compuestos de fórmula (VIII) se pueden preparar mediante la cianometilación de los compuestos de fórmula (VII) con los compuestos de fórmula (M) en presencia de un catalizador, un ligando y una base, por ejemplo de acuerdo a los métodos que se describen en J. Am. Chem. Soc. (2002), 124, 9330, J. Am. Chem. Soc. (2005), 127, 15824 o WO2016/041819.

El compuesto de fórmula (M) está disponible comercialmente.

La reacción para dar los compuestos de fórmula (VIII) en general se lleva a cabo en un solvente. Se da preferencia a los solvente polares apróticos como por ejemplo la N,N-dimetilformamida, la N-metilpirrolidona, o el dimetilsulfóxido.

Como catalizadores se pueden utilizar complejos de paladio, como por ejemplo tris(dibenzilidenacetona)dipaladio(0) o [1,1'-bis(difenilfosfina)ferroceno]-dicloropaladio(II) y como ligandos en general se usan compuestos organofosforados, como por ejemplo bis(difenilfosfina)-9,9-dimetilxanteno (Xanthphos).

Una base adecuada es por ejemplo el fluoruro de zinc.

La reacción se puede llevar a cabo al vacío, a presión normal o bajo un exceso de presión y a temperaturas entre 0°C y 200 °C.

Como alternativa la cianometilación se puede llevar a cabo también con la ayuda de un acoplamiento de Suzuki, por ejemplo de acuerdo al método que se describe en J. Am. Chem. Soc. (2011), 133, 6948-6951.

#### **Paso b)**

Los compuestos de fórmula (I), en donde n representa a 2, se pueden preparar mediante la reacción de los compuestos de fórmula (VIII) con los compuestos de fórmula (O) en presencia de una base, por ejemplo como en el método que se describe en el documento WO2016/041819.

Los compuestos de fórmula (O) están disponibles comercialmente,

La reacción para dar los compuestos de fórmula (I), en donde n representa a 2, se llevan a cabo en general en un solvente. Se da preferencia a los hidrocarburos halogenados como por ejemplo diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno, solventes polares apróticos como por ejemplo acetona, N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, dimetilsulfóxido, nitrilos como por ejemplo acetonitrilo, o ésteres como por ejemplo ácido acetato de etilo.

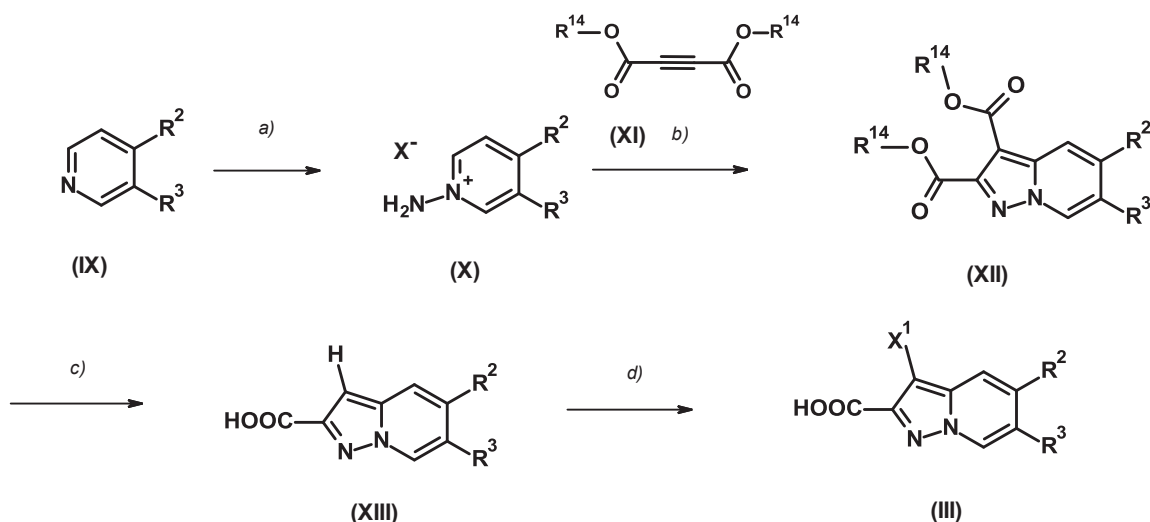
Los ejemplos de bases adecuadas son los heterociclos que contienen nitrógeno tales como la piridina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undeceno (DBU); aminas terciarias tales como trietilamina y N,N-diisopropiletilamina; bases inorgánicas tales como fosfato de potasio, carbonato de cesio, carbonato de potasio e hidruro de sodio.

La reacción se puede llevar a cabo al vacío, a presión normal o bajo un exceso de presión y a temperaturas entre 0°C y 200 °C.

Los correspondientes compuestos con n=0 o n=1, se pueden preparar en forma análoga.

#### **Método D**

Los ácidos carboxílicos de fórmula (III) están comercialmente disponibles o bien se pueden preparar mediante métodos conocidos, por ejemplo a partir de las piridinas de fórmula (IX) en forma análoga a los métodos que se describen en los documentos WO2011/15343, WO2014/14874 o WO2010/34738.



Los radicales  $R^2$  y  $R^3$  tienen los significados descritos anteriormente,  $X^-$  representa a un ion haluro preferiblemente ioduro,  $X^1$  representa a halógeno y  $R^{14}$  representa a  $(C_1-C_4)$ alquilo.

#### Paso a)

Los compuestos de fórmula (X) se pueden convertir en forma análoga a los métodos que se describen en los documentos WO2011/15343, WO2014/14874 o WO2010/34738 mediante la reacción de los compuestos de fórmula (IX) con ácido hidroxilamina-O-sulfónico en presencia de una base como por ejemplo carbonato de potasio, en un intermediario de N-iminopiridinio, el cual se convierte en un segundo paso en presencia de un ácido, como por ejemplo ácido yodhídrico (HI), en un solvente adecuado, como por ejemplo etanol, en el derivado de 1-amino-piridinio de fórmula (X). Los derivados de piridina de fórmula (IX) están disponibles comercialmente.

#### Pasos b) y c)

Los compuestos de fórmula (XII) se pueden preparar en forma análoga al método que se describe en los documentos WO2011/15343, WO2014/14874 o WO2010/34738 a partir de los compuestos de fórmula (X) en una cicloadición 1,3-dipolar con un alquino de fórmula (XI). En el caso de que ocurra la formación de isómeros, estos se pueden separar a los isómeros individuales mediante métodos cromatográficos. De esta manera se obtiene el diéster de fórmula (XII) isoméricamente puro. Mediante el calentamiento en un ácido adecuado como por

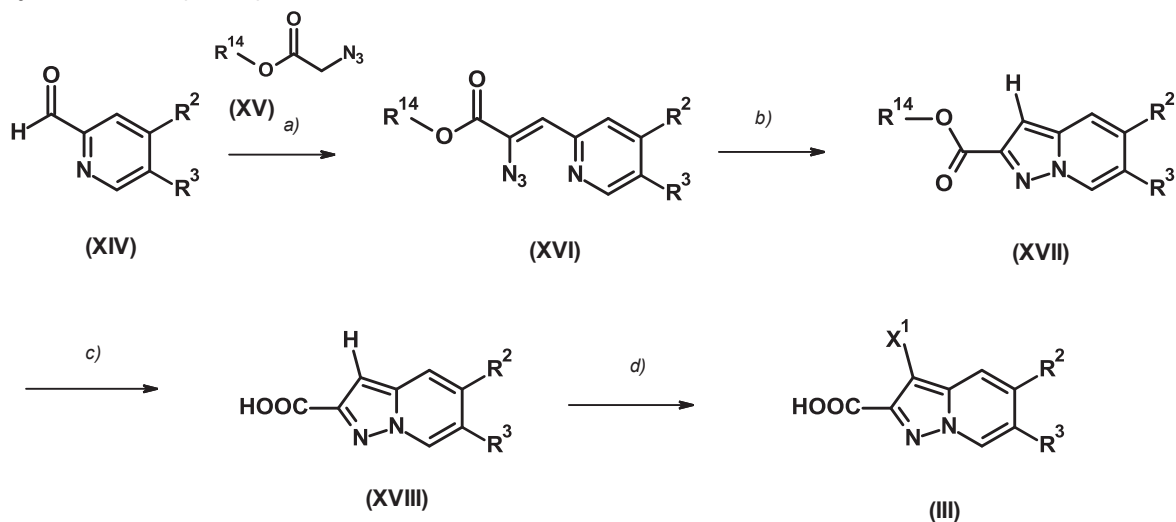
ejemplo ácido sulfúrico acuoso, se pueden convertir los compuestos de fórmula (XII) a los ácidos de fórmula (XIII) mediante la descarboxilación y la saponificación simultánea de la función éster.

#### Paso d)

Los compuestos de fórmula (III) se pueden preparar de acuerdo a métodos estándares mediante una halogenación por ejemplo en forma análoga al método que se describe en los documentos WO2011/50284 o WO2016/12896, por ejemplo con N-clorosuccinimida o N-bromsuccinimida como agente de halogenación en un solvente adecuado como por ejemplo diclorometano o 1,2-dicloreto.

#### Método E

En un método adicional los ácidos carboxílicos de fórmula (III) se pueden preparar a partir de derivados de 2-formilpiridina de fórmula (XIV) en forma análoga al método que se describe en Journal of Medicinal Chemistry **56** (2013), 9635-9645, Synthesis **16** (2005), 2751-2757 o WO2009/29625.



Los radicales  $R^2$  y  $R^3$  tienen los significados descritos anteriormente,  $X^1$  representa a halógeno y  $R^{14}$  representa a  $(C_1-C_4)$ alquilo.

#### Paso a)

Los compuestos de fórmula (XVI) se pueden preparar en forma análoga al método que se describe en Journal of Medicinal Chemistry **56** (2013), 9635-9645, Synthesis **16** (2005), 2751-2757 o en el documento WO2009/29625, a través de la reacción de los compuestos de fórmula (XIV) con un derivado de éster de alquilo de

ácido azidoacético de fórmula (XV) en presencia de una base adecuada como por ejemplo metóxido de sodio en un solvente adecuado como por ejemplo metanol. Los compuestos de fórmula (XIV) están disponibles comercialmente o se pueden preparar de acuerdo a métodos estándares.

**Paso b)**

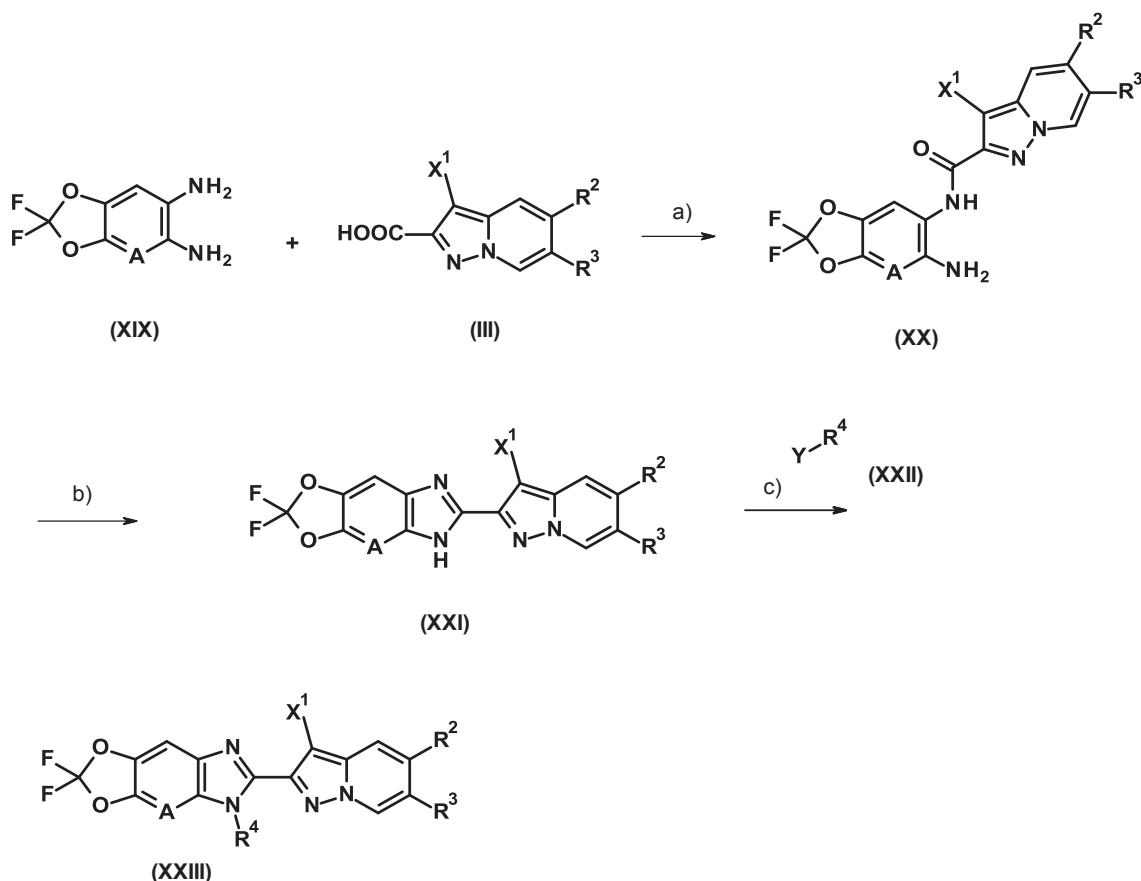
Los compuestos de fórmula (XVII) se pueden preparar en forma análoga al método que se describe en Journal of Medicinal Chemistry **56** (2013), 9635-9645, Synthesis **16** (2005), 2751-2757 o WO2009/29625 mediante la ciclación de los compuestos de fórmula (XVI) en un solvente adecuado como por ejemplo xilol. La reacción se puede llevar a cabo al vacío, a presión normal o bajo un exceso de presión y a temperaturas elevadas. Preferiblemente a una temperatura mayor que 100°C.

**Pasos c y d)**

El éster de fórmula (XVII) se puede convertir al ácido de fórmula (XVIII) por ejemplo mediante el uso de métodos estándares con un hidróxido de metal alcalino como base, tal como hidróxido de sodio o hidróxido de litio en un alcohol como solvente, como por ejemplo etanol o una mezcla de tetrahidrofurano y agua.

La reacción adicional para dar los compuestos de fórmula (III) se lleva a cabo de acuerdo a métodos estándares mediante una halogenación en forma análoga a la que se describió en el Método D.

**Método F**



Los radicales R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> tienen los significados descritos anteriormente, A representa a CH o N, Y representa a un grupo saliente como por ejemplo cloro, bromo, iodo, O-triflato u O-mesilo y X<sup>1</sup> representa a halógeno.

### Paso a)

Los compuestos de fórmula (XX) se pueden preparar en forma análoga al método que se describe en el documento US5576335 mediante la reacción de los compuestos de fórmula (XIX) con ácidos carboxílicos de fórmula (III) en presencia de un agente de condensación o una base.

Los compuestos de fórmula (XIX) están comercialmente disponibles o bien se pueden preparar mediante métodos conocidos, por ejemplo en forma análoga al método que se describe en Journal of Medicinal Chemistry, 57(19), 7933-7946; 2014 o WO2014/001464.

Los ácidos carboxílicos de fórmula (III) están comercialmente disponibles o bien se pueden preparar mediante métodos conocidos. Las vías de preparación posibles se describen en los Métodos D y E.

La reacción de los compuestos de fórmula (XIX) con ácidos carboxílicos de fórmula (III) se puede realizar en masa o en un solvente, preferiblemente la reacción se lleva a cabo en un solvente que se selecciona entre los solventes habituales que son inertes a las condiciones de reacción predominantes. Se da preferencia a los éteres como por ejemplo diisopropiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano; los hidrocarburos halogenados como por ejemplo diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; los nitrilos, como por ejemplo acetonitrilo o propionitrilo; hidrocarburos aromáticos como por ejemplo tolueno, o xilol; solventes polares apróticos como por ejemplo N,N-dimetilformamida o N-metilpirrolidona o compuestos que contienen nitrógeno como por ejemplo piridina.

Los agentes de condensación adecuados son por ejemplo las carbodiimidas tales como el clorhidrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (EDCI) o la 1,3-diciclohexilcarbodiimida.

Las bases adecuadas son las bases inorgánicas tales como las que se usan habitualmente en dichas reacciones. Preferiblemente las bases que se utilizan se seleccionan por ejemplo del grupo que consiste en acetatos, fosfatos, carbonatos y bicarbonatos de metales alcalinos o alcalinotérreos. Particularmente preferidos son el acetato de sodio, el fosfato de sodio, el fosfato de potasio, el carbonato de cesio, el carbonato de sodio, el carbonato de potasio, el bicarbonato de sodio, el bicarbonato de potasio.

La reacción se puede llevar a cabo al vacío, a presión normal o bajo un exceso de presión y a temperaturas entre 0 °C y 180 °C, preferiblemente la reacción se lleva a cabo a presión normal y temperaturas entre 20 y 140 °C.

#### **Paso b)**

Los compuestos de fórmula (XXI) se pueden preparar mediante condensación de los compuestos de fórmula (XX) por ejemplo en forma análoga al método que se describe en los documentos WO2009/131237, WO2010/125985, WO2011/043404, WO2011/040629, WO2012/086848, WO2013/018928, WO2015/000715 o WO 2015/121136.

La reacción para dar los compuestos de fórmula (XXI) se puede llevar a cabo

en masa o en un solvente, preferiblemente la reacción se lleva a cabo en un solvente que se selecciona entre los solventes habituales que son inertes a las condiciones de reacción predominantes. Se da preferencia a los éteres como por ejemplo diisopropiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, ter-butilmetiléter; los hidrocarburos halogenados como por ejemplo diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; los nitrilos, como por ejemplo acetonitrilo o propionitrilo; los hidrocarburos aromáticos como por ejemplo tolueno o xilol; los solventes polares apróticos como por ejemplo N,N-dimetilformamida o N-metilpirrolidona o los compuestos nitrogenados tales como por ejemplo la piridina.

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

Los ejemplos de agentes de condensación adecuados con las carbodiimidas tales como el clorhidrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (EDCI) o la 1,3-diciclohexilcarbodiimida; los anhídridos tales como el anhídrido de ácido acético, anhídrido de ácido trifluoroacético; una mezcla de trifenilfosfina, una base y tetracloruro de carbono o una mezcla de trifenilfosfina y un azodiéster como por ejemplo el ácido dietilazodicarboxílico.

Los ejemplos de ácidos adecuados que se pueden usar en la reacción descrita son los ácidos sulfónicos tales como ácido para-toluenosulfónico; los ácidos carboxílicos tales como ácido acético o los ácidos polifosfóricos.

Los ejemplos de bases adecuadas son los heterociclos que contienen nitrógeno tales como piridina, picolina, 2,6-lutidina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undeceno (DBU); aminas terciarias tales como trietilamina y N,N-diisopropiletilamina; las bases inorgánicas tales como fosfato de potasio, carbonato de potasio e hidruro de sodio.

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

La reacción se puede llevar a cabo al vacío, a presión normal o bajo un exceso de presión y a temperaturas entre 0 °C y 200 °C.

### **Paso c)**

Los compuestos de fórmula (XXI) se pueden convertir a los derivados de imidazol N-sustituídos de fórmula (XXIII) mediante el uso de métodos estándares

(véase por ejemplo Heterocycles 1999, 50, 1081-1090; WO2009/70045 o Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters 2007, 17, 1369-1375) mediante la reacción con compuestos electrofílicos que contienen un grupo saliente (Y = cloro, bromo, yodo, O-triflato, O-mesilo), por ejemplo con un carbonato como base, tal como carbonato de potasio, en una cetona como solvente, como por ejemplo acetona.

La reacción adicional para dar los compuestos de fórmula (I) se puede llevar a cabo en forma análoga a los métodos que se describen en los Métodos A y B.

### **Método y usos**

La invención también se refiere a métodos para controlar plagas de animales, en los cuales los compuestos de la Fórmula (I) pueden actuar sobre las plagas de animales y/o sobre su hábitat. Se da preferencia al control de plagas de animales en la agricultura y la silvicultura y en la protección de materiales. Por lo tanto, se excluyen los métodos para el tratamiento quirúrgico o terapéutico del cuerpo humano o animal y los métodos de diagnóstico que se realizan en el cuerpo humano o animal.

La invención se refiere además al uso de los compuestos de la Fórmula (I) como agentes fitosanitarios, en particular plaguicidas.

En el contexto de la presente solicitud, el término control fitosanitario siempre incluye el término plaguicida..

Los compuestos de la Fórmula (I) son adecuados para la protección de plantas, con una toxicidad aceptable para animales de sangre caliente y una buena compatibilidad con el medio ambiente, para la protección de plantas y órganos vegetales ante factores de estrés bióticos y abióticos, para aumentar el rendimiento de los cultivos, mejorar la calidad del cultivo y controlar las plagas de animales, en particular insectos, arácnidos, helmintos, en particular nematodos y moluscos que se encuentran en la agricultura, horticultura, ganadería, acuicultura, bosques, jardines e instalaciones recreativas, en la protección de suministros y materiales y en el sector de la higiene.

En el contexto de la presente solicitud de patente, el término “higiene” se interpretará en el sentido de las medidas, normas y procedimientos cuyo propósito sea prevenir enfermedades, en particular enfermedades infecciosas, y que sirven para

proteger la salud humana, y para proteger a los animales y/o proteger el medio ambiente, y/o para conservar la limpieza. De acuerdo con la invención, esto incluye particularmente medidas para limpiar, desinfectar y esterilizar, por ejemplo, textiles o superficies duras, en particular superficies de vidrio, madera, cemento, porcelana, cerámica, plástico o metal para garantizar que estén libres de plagas, y/o sus excreciones que pudieran afectar la higiene. Preferiblemente, en este sentido se excluyen del alcance de la invención los regímenes de tratamiento quirúrgico o terapéutico que se pudieran aplicar al cuerpo humano o de animales y las disposiciones de diagnóstico hechas sobre el cuerpo humano o de animales.

El término "sector de la higiene" abarca todas las áreas, campos técnicos y aplicaciones industriales en las cuales estas medidas, regulaciones y procedimientos de higiene pudieran ser importantes, por ejemplo, en lo que se refiere a la higiene en cocinas, panaderías, aeropuertos, baños, piscinas, grandes almacenes, hoteles, hospitales, establos, ganadería etc.

Por lo tanto, el término "perjudicial para la higiene" se interpretará como una referencia a una o más plagas de animales cuya presencia en el sector de la higiene resulta problemática, en especial por motivos de salud. Por lo tanto, es un objetivo importante evitar o minimizar la presencia de plagas para la higiene y/o la exposición a las mismas en el sector sanitario. Esto se puede lograr, en particular, mediante el uso de un plaguicida que se puede utilizar tanto para prevenir una infestación como para controlar una infestación ya existente. También es posible utilizar preparaciones que permitan prevenir o reducir la exposición a plagas. Las plagas para la higiene incluyen, por ejemplo, los organismos que se mencionarán a continuación.

El término "protección de la higiene" abarca entonces todas las actividades que permitan mantener y/o mejorar las medidas, las normas y los procedimientos de higiene.

Los compuestos de la Fórmula (I) preferiblemente se pueden utilizar como plaguicidas. Son activos para las especies habitualmente sensibles y resistentes, así como contra todos o algunos estadios de su desarrollo. Las plagas mencionadas precedentemente pertenecen a:

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

de la clase de los quilópodos, por ejemplo, *Geophilus* spp, *Scutigera* spp;

del orden o la clase de los colémbolos, por ejemplo, *Onychiurus armatus*;  
*Sminthurus viridis*;

de la clase de los diplópodos, por ejemplo *Blaniulus guttulatus*;

de la clase Insecta, por ejemplo, del orden de la Blattodea, por ejemplo, *Blatta orientalis*, *Blattella asahinai*, *Blattella germanica*, *Leucophaea maderae*, *Loboptera decipiens*, *Neostilopyga rhombifolia*, *Panclorua* spp, *Parcoblatta* spp, *Periplaneta* spp,

por ejemplo *Periplaneta americana*, *Periplaneta australasiae*, *Pycnoscelus surinamensis*, *Supella longipalpa*;

del orden de los coleópteros, por ejemplo, *Acalymma vittatum*, *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus* spp, *Aethina tumida*, *Agelastica alni*, *Agrilus* spp, por ejemplo *Agrilus planipennis*, *Agrilus coxalis*, *Agrilus bilineatus*, *Agrilus anxius*, *Agriotes* spp, por ejemplo *Agriotes linneatus*, *Agriotes mancus*, *Alphitobius diaperinus*, *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora* spp, por ejemplo *Anoplophora glabripennis*, *Anthonomus* spp, por ejemplo *Anthonomus grandis*, *Anthrenus* spp, *Apion* spp, *Apogonia* spp, *Atomaria* spp, por ejemplo *Atomaria linearis*, *Attagenus* spp, *Baris caerulescens*, *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp, por ejemplo *Bruchus pisorum*, *Bruchus rufimanus*, *Cassida* spp, *Cerotoma trifurcata*, *Ceutorrhynchus* spp, por ejemplo *Ceutorrhynchus assimilis*, *Ceutorrhynchus quadridens*, *Ceutorrhynchus rapae*, *Chaetocnema* spp, por ejemplo *Chaetocnema confinis*, *Chaetocnema denticulata*, *Chaetocnema ectypa*, *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp, *Cosmopolites* spp, por ejemplo *Cosmopolites sordidus*, *Costelytra zealandica*, *Ctenicera* spp, *Curculio* spp, por ejemplo *Curculio caryae*, *Curculio caryatrypes*, *Curculio obtusus*, *Curculio sayi*, *Cryptolestes ferrugineus*, *Cryptolestes pusillus*, *Cryptorhynchus lapathi*, *Cryptorhynchus mangiferae*, *Cilindrocopturus* spp, *Cilindrocopturus adspersus*, *Cilindrocopturus furnissi*, *Dendroctonus* spp, por ejemplo *Dendroctonus ponderosae*, *Dermestes* spp, *Diabrotica* spp, por ejemplo *Diabrotica balteata*, *Diabrotica barberi*, *Diabrotica undecimpunctata howardi*, *Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata*, *Diabrotica virgifera virgifera*, *Diabrotica virgifera zea*, *Dichocrocis* spp, *Dicladispa armigera*, *Diloboderus* spp, *Epicaerus* spp, *Epilachna* spp, por ejemplo *Epilachna borealis*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix* spp, por ejemplo *Epitrix cucumeris*, *Epitrix fuscula*, *Epitrix hirtipennis*, *Epitrix subcrinita*, *Epitrix tuberis*, *Faustinus* spp, *Gibbium psylloides*, *Gnathocerus cornutus*, *Hellula undalis*, *Heteronychus arator*, *Heteronyx* spp, *Hilamorpha elegans*, *Hilotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypomeces squamosus*, *Hypothenemus* spp, por ejemplo *Hypothenemus hampei*, *Hypothenemus obscurus*, *Hypothenemus pubescens*, *Lachnosterna consanguinea*, *Lasioderma serricorne*, *Latheticus oryzae*, *Lathridius* spp, *Lema* spp, *Leptinotarsa decemlineata*, *Leucoptera*

spp, por ejemplo *Leucoptera coffeella*, *Limonius ectypus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Listronotus* (= *Hyperodes*) spp, *Lixus* spp, *Luperodes* spp, *Luperomorpha xanthodera*, *Lyctus* spp, *Megacyllene* spp, por ejemplo *Megacyllene robiniae*, *Megascelis* spp, *Melanotus* spp, por ejemplo *Melanotus longulus oregonensis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha* spp, por ejemplo *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp, *Monochamus* spp, *Naupactus xanthographus*, *Necrobia* spp, *Neogalerucella* spp, *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Oryzaphagus oryzae*, *Otiorhynchus* spp, por ejemplo *Otiorhynchus cribricollis*, *Otiorhynchus ligustici*, *Otiorhynchus ovatus*, *Otiorhynchus rugosostriatus*, *Otiorhynchus sulcatus*, *Oulema* spp, por ejemplo *Oulema melanopus*, *Oulema oryzae*, *Oxicetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllophaga* spp, *Phyllophaga helleri*, *Phyllotreta* spp, por ejemplo *Phyllotreta armoraciae*, *Phyllotreta pusilla*, *Phyllotreta ramosa*, *Phyllotreta striolata*, *Popillia japonica*, *Premnotrypes* spp, *Prostephanus truncatus*, *Psylliodes* spp, por ejemplo *Psylliodes affinis*, *Psylliodes chrysocephala*, *Psylliodes punctulata*, *Ptinus* spp, *Rhizobius ventralis*, *Rhizopertha dominica*, *Rhynchophorus* spp, *Rhynchophorus ferrugineus*, *Rhynchophorus palmarum*, *Scolytus* spp, por ejemplo *Scolytus multistriatus*, *Sinoxilon perforans*, *Sitophilus* spp, por ejemplo *Sitophilus granarius*, *Sitophilus linearis*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Sphenophorus* spp, *Stegobium paniceum*, *Sternechus* spp, por ejemplo *Sternechus paludatus*, *Symphyletes* spp, *Tanymecus* spp, por ejemplo *Tanymecus dilaticollis*, *Tanymecus indicus*, *Tanymecus palliatus*, *Tenebrio molitor*, *Tenebrioides mauretanicus*, *tribolium* spp, por ejemplo *Tribolium audax*, *tribolium castaneum*, *tribolium confusum*, *Trogoderma* spp, *Tychius* spp, *Xilotrechus* spp, *Zabrus* spp, por ejemplo *Zabrus tenebrioides*;

del orden de los dermápteros, por ejemplo, *Anisolabis maritime*, *Forficula auricularia*, *Labidura riparia*;

del orden de los dípteros, por ejemplo, *Aedes* spp, por ejemplo *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes sticticus*, *Aedes vexans*, *Agromyza* spp, por ejemplo *Agromyza frontella*, *Agromyza parvicornis*, *Anastrepha* spp, *Anopheles* spp, por ejemplo *Anopheles quadrimaculatus*, *Anopheles gambiae*, *Asphondilia* spp,

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

del orden de los hemípteros, por ejemplo, *Acizzia acaciaebaileyanae*, *Acizzia dodonaeae*, *Acizzia uncatoides*, *Acrida turrita*, *Acyrtosiphon* spp, por ejemplo *Acyrtosiphon pisum*, *Acrogonia* spp, *Aeneolamia* spp, *Agonosцена* spp, *Aleurocanthus* spp, *Aleyrodes proletella*, *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus floccosus*, *Allocaridara malayensis*, *Amrasca* spp, por ejemplo *Amrasca bigutulla*, *Amrasca devastans*, *Anuraphis cardui*, *Aonidiella* spp, por ejemplo, *Aonidiella aurantii*, *Aonidiella citrina*, *Aonidiella inornata*, *Aphanostigma piri*, *Aphis* spp, por ejemplo *Aphis*

*citricola*, *Aphis craccivora*, *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis glycines*, *Aphis gossypii*,  
*Aphis hederæ*, *Aphis illinoisensis*, *Aphis middletoni*, *Aphis nasturtii*, *Aphis nerii*, *Aphis*  
*pomi*, *Aphis spiræcola*, *Aphis viburniphila*, *Arboridia apicalis*, *Arytainilla* spp, *Aspidiella*  
spp, *Aspidiotus* spp, por ejemplo *Aspidiotus nerii*, *Atanus* spp, *Aulacorthum solani*,  
*Bemisia tabaci*, *Blastopsylla occidentalis*, *Boreioglycaspis melaleucae*, *Brachycaudus*  
*helichrysi*, *Brachycolus* spp, *Brevicoryne brassicae*, *Cacopsylla* spp, por ejemplo,  
*Cacopsylla pyricola*, *Calligypona marginata*, *Capulinia* spp, *Carneocephala fulgida*,  
*Ceratovacuna lanigera*, *Cercopidae*, *Ceroplastes* spp, *Chaetosiphon fragaefolii*,  
*Chionaspis tegalensis*, *Chlorita onukii*, *Chondracris rosea*, *Chromaphis juglandicola*,  
*Chrysomphalus aonidum*, *Chrysomphalus ficus*, *Cicadulina mbila*, *Cocomytilus halli*,  
*Coccus* spp, por ejemplo *Coccus hesperidum*, *Coccus longulus*, *Coccus*  
*pseudomagnoliarum*, *Coccus viridis*, *Cryptomyzus ribis*, *Cryptoneossa* spp,  
*Ctenarytaina* spp, *Dalbulus* spp, *Dialeurodes chittendeni*, *Dialeurodes citri*, *Diaphorina*  
*citri*, *Diaspis* spp, *Diuraphis* spp, *Doralis* spp, *Drosicha* spp, *Dysaphis* spp, por ejemplo  
*Dysaphis apiifolia*, *Dysaphis plantaginea*, *Dysaphis tulipae*, *Dysmicoccus* spp,  
*Empoasca* spp, por ejemplo *Empoasca abrupta*, *Empoasca fabae*, *Empoasca*  
*maligna*, *Empoasca solana*, *Empoasca stevensi*, *Eriosoma* spp, por ejemplo *Eriosoma*  
*americanum*, *Eriosoma lanigerum*, *Eriosoma pyricola*, *Erythroneura* spp,  
*Eucalyptolyma* spp, *Euphyllura* spp, *Euscelis bilobatus*, *Ferrisia* spp, *Fiorinia* spp,  
*Furcaspis oceanica*, *Geococcus coffeae*, *Glycaspis* spp, *Heteropsylla cubana*,  
*Heteropsylla spinulosa*, *Homalodisca coagulata*, *Hyalopterus arundinis*, *Hyalopterus*  
*pruni*, *Icerya* spp, por ejemplo *Icerya purchasi*, *Idiocerus* spp, *Idioscopus* spp,  
*Laodelphax striatellus*, *Lecanium* spp, por ejemplo *Lecanium corni* (= *Parthenolecanium corni*),  
*Lepidosaphes* spp, por ejemplo *Lepidosaphes ulmi*, *Lipaphis*  
*erysimi*, *Lopholeucaspis japonica*, *Lycorma delicatula*, *Macrosiphum* spp, por ejemplo  
*Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphum lillii*, *Macrosiphum rosae*, *Macrosteles*  
*facifrons*, *Mahanarva* spp, *Melanaphis sacchari*, *Metcalfiella* spp, *Metcalfa pruinosa*,  
*Metopolophium dirhodum*, *Monellia costalis*, *Monelliopsis pecanis*, *Myzus* spp, por  
ejemplo *Myzus ascalonicus*, *Myzus cerasi*, *Myzus ligustri*, *Myzus ornatus*, *Myzus*  
*persicae*, *Myzus nicotianae*, *Nasonovia ribisnigri*, *Neomaskellia* spp, *Nephotettix* spp,

por ejemplo *Nephotettix cincticeps*, *Nephotettix nigropictus*, *Nettigniclla spectra*, *Nilaparvata lugens*, *Oncometopia* spp, *Orthezia praelonga*, *Oxia chinensis*, *Pachypsylla* spp, *Parabemisia myricae*, *Paratrioza* spp, por ejemplo *Paratrioza cockerelli*, *Parlatoria* spp, *Pemphigus* spp, por ejemplo, *Pemphigus bursarius*, *Pemphigus populivenae*, *Peregrinus maidis*, *Perkinsiella* spp, *Phenacoccus* spp, por ejemplo *Phenacoccus madeirensis*, *Phloeomyzus passerinii*, *Phorodon humuli*, *Phylloxera* spp, por ejemplo *Phylloxera devastatrix*, *Phylloxera notabilis*, *Pinnaspis aspidistrae*, *Planococcus* spp, por ejemplo *Planococcus citri*, *Prosopidopsylla flava*, *Protopulvinaria pyrifomis*, *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pseudococcus* spp, por ejemplo *Pseudococcus calceolariae*, *Pseudococcus comstocki*, *Pseudococcus longispinus*, *Pseudococcus maritimus*, *Pseudococcus viburni*, *Psyllopsis* spp, *Psylla* spp, por ejemplo *Psylla buxi*, *Psylla mali*, *Psylla pyri*, *Pteromalus* spp, *Pulvinaria* spp, *Pyrilla* spp, *Quadraspidotus* spp, por ejemplo *Quadraspidotus juglansregiae*, *Quadraspidotus ostreaeformis*, *Quadraspidotus perniciosus*, *Quesada gigas*, *Rastrococcus* spp, *Rhopalosiphum* spp, por ejemplo *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum oxiacanthae*, *Rhopalosiphum padi*, *Rhopalosiphum rufiabdominale*, *Saissetia* spp, por ejemplo *Saissetia coffeae*, *Saissetia miranda*, *Saissetia neglecta*, *Saissetia oleae*, *Scaphoideus titanus*, *Schizaphis graminum*, *Selenaspidus articulatus*, *Sipha flava*, *Sitobion avenae*, *Sogata* spp, *Sogatella furcifera*, *Sogatodes* spp, *Stictocephala festina*, *Siphoninus phillyreae*, *Tenalaphara malayensis*, *Tetragonocephala* spp, *Tinocallis caryaefoliae*, *Tomaspis* spp, *Toxoptera* spp, por ejemplo *Toxoptera aurantii*, *Toxoptera citricidus*, *trialeurodes vaporariorum*, *Trioza* spp, por ejemplo *Trioza diospyri*, *Typhlocyba* spp, *Unaspis* spp, *Viteus vitifolii*, *Zygina* spp;

de la suborden de los heterópteros, por ejemplo, *Aelia* spp, *Anasa tristis*, *Antestiopsis* spp, *Boisea* spp, *Blissus* spp, *Calocoris* spp, *Campilomma livida*, *Cavelerius* spp, *Cimex* spp, por ejemplo *Cimex adjunctus*, *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Cimex pilosellus*, *Collaria* spp, *Creontiades dilutus*, *Dasynus piperis*, *Dichelops furcatus*, *Diconocoris hewetti*, *Dysdercus* spp, *Euschistus* spp, por ejemplo *Euschistus heros*, *Euschistus servus*, *Euschistus tristigma*, *Euschistus variolarius*,

Eurydema spp, Eurygaster spp, Halyomorpha halys, Heliopeltis spp, Horcias nobilellus, Leptocorisa spp, Leptocorisa varicornis, Leptoglossus occidentalis, Leptoglossus phyllopus, Lygocoris spp, por ejemplo Lygocoris pabulinus, Lygus spp, por ejemplo Lygus elisus, Lygus hesperus, Lygus lineolaris, Macropes excavatus, Megacopta cribraria, Miridae, Monalonion atratum, Nezara spp, por ejemplo Nezara viridula, Nysius spp, Oebalus spp, Pentomidae, Piesma quadrata, Piezodorus spp, por ejemplo Piezodorus guildinii, Psallus spp, Pseudacysta perseae, Rhodnius spp, Sahlbergella singularis, Scaptocoris castanea, Scotinophora spp, Stephanitis nashi, Tibraca spp, Triatoma spp;

del orden de los himenópteros, por ejemplo, Acromyrmex spp, Athalia spp, por ejemplo Athalia rosae, Atta spp, Camponotus spp, Dolichovespula spp, Diprion spp, por ejemplo Diprion similis, Hoplocampa spp, por ejemplo Hoplocampa cookei, Hoplocampa testudinea, Lasius spp, Linepithema (Iridomyrmex) humile, Monomorium pharaonis, Paratrechina spp, Paravespula spp, Plagiolepis spp, Sirex spp, por ejemplo Sirex noctilio, Solenopsis invicta, Tapinoma spp, Technomyrmex albipes, Urocerus spp, Vespa spp, por ejemplo Vespa crabro, Wasmannia auropunctata, Xeris spp;

del orden de los isópodos, por ejemplo, Armadillidium vulgare, Oniscus asellus, Porcellio scaber;

del orden de los isópteros, por ejemplo, Coptotermes spp, por ejemplo, Coptotermes formosanus, Cornitermes cumulans, Cryptotermes spp, Incisitermes spp, Kaloterms spp, Microtermes obesi, Nasutitermis spp, Odontotermes spp, Porotermes spp, Reticulitermes spp, por ejemplo Reticulitermes flavipes, Reticulitermes hesperus;

del orden de los lepidópteros, por ejemplo, Achroia grisella, Acronicta major, Adoxophyes spp, por ejemplo Adoxophyes orana, Aedia leucomelas, Agrotis spp, por ejemplo Agrotis segetum, Agrotis ipsilon, Alabama spp, por ejemplo Alabama argillacea, Amyelois transitella, Anarsia spp, Anticarsia spp, por ejemplo Anticarsia gemmatilis, Argyroproctis spp, Autographa spp, Barathra brassicae, Blastodacna atra, Borbo cinnara, Bucculatrix thurberiella, Bupalus piniarius, Busseola spp, Cacoecia spp, Caloptilia theivora, Capua reticulana, Carpocapsa pomonella, Carposina niponensis, Cheimatobia brumata, Chilo spp, por ejemplo Chilo plejadellus, Chilo

*suppressalis*, *Choreutis pariana*, *Choristoneura* spp, *Chrysodeixis chalcites*, *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocerus* spp, *Cnaphalocrocis medinalis*, *Cnephasia* spp, *Conopomorpha* spp, *Conotrachelus* spp, *Copitarsia* spp, *Cydia* spp, por ejemplo *Cydia nigricana*, *Cydia pomonella*, *Dalaca* noctuides, *Diaphania* spp, *Diparopsis* spp, *Diatraea saccharalis*, *Dioryctria* spp, por ejemplo *Dioryctria zimmermani*, *Earias* spp, *Ecdytolopha aurantium*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Eldana saccharina*, *Ephestia* spp, por ejemplo *Ephestia elutella*, *Ephestia kuehniella*, *Epinotia* spp, *Epiphyas postvittana*, *Erannis* spp, *Erschoviella musculana*, *Etiella* spp, *Eudocima* spp, *Eulia* spp, *Eupoecilia ambiguella*, *Euproctis* spp, por ejemplo *Euproctis chrysorrhoea*, *Euxoa* spp, *Feltia* spp, *Galleria mellonella*, *Gracillaria* spp, *Grapholitha* spp, por ejemplo *Grapholita molesta*, *Grapholita prunivora*, *Hedilepta* spp, *Helicoverpa* spp, por ejemplo *Helicoverpa armigera*, *Helicoverpa zea*, *Heliothis* spp, por ejemplo *Heliothis virescens* , *Hofmannophila pseudospretella*, *Homoeosoma* spp, *Homona* spp, *Hyponomeuta padella*, *Kakivoria flavofasciata*, *Lampides* spp, *Laphygma* spp, *Laspeyresia molesta*, *Leucinodes orbonalis*, *Leucoptera* spp, por ejemplo *Leucoptera coffeella*, *Lithocolletis* spp, por ejemplo *Lithocolletis blancardella*, *Lithophane antennata*, *Lobesia* spp, por ejemplo *Lobesia botrana*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria* spp, por ejemplo *Lymantria dispar*, *Lyonetia* spp, por ejemplo *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*, *Maruca testulalis*, *Mamestra brassicae*, *Melanitis leda*, *Mocis* spp, *Monopis obviella*, *Mythimna separata*, *Nemapogon cloacellus*, *Nymphula* spp, *Oiketicus* spp, *Omphis* spp, *Operophtera* spp, *Oria* spp, *Orthaga* spp, *Ostrinia* spp, por ejemplo *Ostrinia nubilalis*, *Panolis flammea*, *Parnara* spp, *Pectinophora* spp, por ejemplo *Pectinophora gossypiella*, *Perileucoptera* spp, *Phthorimaea* spp, por ejemplo *Phthorimaea operculella*, *Phyllocnistis citrella*, *Phyllonorycter* spp, por ejemplo *Phyllonorycter blancardella*, *Phyllonorycter crataegella*, *Pieris* spp, por ejemplo *Pieris rapae*, *Platynota stultana*, *Plodia interpunctella*, *Plusia* spp, *Plutella xilostella* (= *Plutella maculipennis*), *Podesia* spp, por ejemplo *Podesia syringae*, *Prays* spp, *Prodenia* spp, *Protoparce* spp, *Pseudaletia* spp, por ejemplo *Pseudaletia unipuncta*, *Pseudoplusia includens*, *Pyrausta nubilalis*, *Rachiplusia* nu, *Schoenobius* spp, por ejemplo *Schoenobius bipunctifer*, *Scirpophaga* spp, por ejemplo *Scirpophaga innotata*, *Scotia*

segetum, *Sesamia* spp, por ejemplo *Sesamia inferens*, *Sparganothis* spp, *Spodoptera* spp, por ejemplo *Spodoptera eradiana*, *Spodoptera exigua*, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera praefica*, *Stathmopoda* spp, *Stenoma* spp, *Stomopteryx subsecivella*, *Synanthedon* spp, *Tecia solanivora*, *Thaumetopoea* spp, *Thermesia gemmatalis*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*, *Tortrix* spp, *Trichophaga tapetzella*, *Trichoplusia* spp, por ejemplo *Trichoplusia ni*, *Tryporyza incertulas*, *Tuta absoluta*, *Virachola* spp;

del orden de los ortópteros o Saltatoria, por ejemplo, *Acheta domesticus*, *Dichroplus* spp, *Gryllotalpa* spp, por ejemplo *Gryllotalpa gryllotalpa*, *Hieroglyphus* spp, *Locusta* spp, por ejemplo *Locusta migratoria*, *Melanoplus* spp, por ejemplo *Melanoplus devastator*, *Paratlanticus ussuriensis*, *Schistocerca gregaria*;

del orden Phthiraptera por ejemplo *Damalinia* spp, *Haematopinus* spp, *Linognathus* spp, *Pediculus* spp, *Phylloxera vastatrix*, *Phthirus pubis*, *Trichodectes* spp;

del orden de Psocoptera, por ejemplo, *Lepinotus* spp, *Liposcelis* spp;

del orden de Siphonaptera, por ejemplo, *Ceratophyllus* spp, *Ctenocephalides* spp, por ejemplo *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopis*;

del orden de los tisanópteros, por ejemplo, *Anaphothrips obscurus*, *Baliothrips biformis*, *Chaetanaphothrips leeuweni*, *Drepanothrips reuteri*, *Enneothrips flavens*, *Frankliniella* spp, por ejemplo *Frankliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella schultzei*, *Frankliniella tritici*, *Frankliniella vaccinii*, *Frankliniella williamsi*, *Haplothrips* spp, *Heliothrips* spp, *Hercinothrips femoralis*, *Kakothrips* spp, *Rhipiphorothrips cruentatus*, *Scirtothrips* spp, *Taeniothrips cardamomi*, *Thrips* spp, por ejemplo *Thrips palmi*, *Thrips tabaci*;

del orden de Zygentoma (= Thysanura), por ejemplo *Ctenolepisma* spp, *Lepisma saccharina*, *Lepismodes inquilinus*, *Thermobia domestica*;

de la clase Symphyla, por ejemplo, *Scutigerella* spp, por ejemplo *Scutigerella immaculata*;

Plagas del grupo de los moluscos, por ejemplo de la clase de Bivalvia, por ejemplo *Dreissena* spp;

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

Plagas del grupo de los nematodos, es decir, nematodos parásitos de plantas, en particular *Aglenchus* spp, por ejemplo *Aglenchus agricola*, *Anguina* spp, por ejemplo *Anguina tritici*, *Aphelenchoides* spp, por ejemplo *Aphelenchoides arachidis*, *Aphelenchoides fragariae*, *Belonolaimus* spp, por ejemplo *Belonolaimus gracilis*, *Belonolaimus longicaudatus*, *Belonolaimus nortoni*, *Bursaphelenchus* spp, por ejemplo *Bursaphelenchus cocophilus*, *Bursaphelenchus eremus*, *Bursaphelenchus xilophilus*, *Cacopaurus* spp, por ejemplo *Cacopaurus pestis*, *Criconemella* spp, por ejemplo *Criconemella curvata*, *Criconemella onoensis*, *Criconemella ornata*, *Criconemella rusium*, *Criconemella xenoplax* (= *Mesocriconema xenoplax*), *Criconemoides* spp, por ejemplo *Criconemoides ferniae*, *Criconemoides onoense*, *Criconemoides ornatum*, *Ditilenchus* spp, por ejemplo *Ditilenchus dipsaci*, *Dolichodorus* spp, *Globodera* spp, por ejemplo *Globodera pallida*, *Globodera rostochiensis*, *Helicotilenchus* spp, por ejemplo *Helicotilenchus dihystra*, *Hemicriconemoides* spp, *Hemicicliophora* spp, *Heterodera* spp, por ejemplo *Heterodera avenae*, *Heterodera glycines*, *Heterodera schachtii*, *Hirschmaniella* spp, *Hoplolaimus* spp, *Longidorus* spp, por ejemplo *Longidorus africanus*, *Meloidogyne* spp, por ejemplo *Meloidogyne chitwoodi*, *Meloidogyne fallax*, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloinema* spp, *Nacobbus* spp, *Neotilenchus* spp, *Paralongidorus* spp, *Paraphelenchus* spp, *Paratrichodorus* spp, por ejemplo *Paratrichodorus minor*, *Paratilenchus* spp, *Pratilenchus* spp, por ejemplo *Pratilenchus penetrans*, *Pseudohalenchus* spp, *Psilenchus* spp, *Punctodera* spp, *Quinisulcius* spp, *Radopholus* spp, por ejemplo *Radopholus citrophilus*, *Radopholus similis*, *Rotilenchulus* spp, *Rotilenchus* spp, *Scutellonema* spp, *Subanguina* spp, *Trichodorus* spp, por ejemplo *Trichodorus obtusus*, *Trichodorus primitivus*, *Tilenchorhynchus* spp, por ejemplo *Tilenchorhynchus*

annulatus, *Tilenchulus* spp, por ejemplo *Tilenchulus semipenetrans*, *Xiphinema* spp, por ejemplo *Xiphinema index*.

Si fuera apropiado, los compuestos de la Fórmula (I) también se pueden usar a determinadas concentraciones o dosis de aplicación como herbicidas, protectores del crecimiento o agentes para mejorar las propiedades de las plantas, tales como microbiocidas o gametocidas, por ejemplo como fungicidas, antimicóticos, bactericidas, viricidas (que incluyen los agentes antivirales) o como agentes contra MLO (organismos tipo *Mycoplasma*) y RLO (organismo tipo *Rickettsia*). Si fuera apropiado, también se pueden usar como intermediarios o precursores de la síntesis de otros ingredientes activos.

### **Formulaciones**

La presente invención se refiere además a formulaciones y a formas de aplicación preparadas con ellas como plaguicida tales como, por ejemplo, mezclas para inmersión, goteo y pulverización, que comprenden por lo menos un compuesto de la Fórmula (I). Opcionalmente, los usos incluyen otros plaguicidas y/o adyuvantes que mejoran la actividad, tales como mejoradores de la penetración, por ejemplo, aceites vegetales tales como aceite de colza, aceite de girasol, aceites minerales tales como aceites de parafina, ésteres alquílicos de ácidos grasos vegetales tales como aceite de colza o ésteres metílicos de aceite de soja o alcóxilatos de alcohol y/o agentes de dispersión tales como alquilsiloxanos y/o sales, por ejemplo, sales orgánicas o inorgánicas de amonio o fosfonio tales como sulfato de amonio o fosfato ácido de diamonio y/o agentes promotores de retención tales como, por ejemplo, polímeros de sulfosuccinato de dioctilo o hidroxipropil guar y/o humectantes, por ejemplo, glicerol y/o fertilizantes tales como fertilizantes que contienen amonio, potasio o fósforo.

Las formulaciones típicas comprenden, por ejemplo, líquidos solubles en agua (SL), emulsiones concentradas (EC), emulsiones en agua (SE), concentrados en suspensión (SC, SE, FS, OD), gránulos dispersables en agua (WG), gránulos (GR) y concentrados en cápsulas (CS); estos y otros posibles tipos de formulaciones se describen, por ejemplo, en Crop Life International y en Pesticide Specifications,

Manual on development and use of FAO and WHO specifications for pesticides, FAO Plant Production and Protection Papers – 173, preparadas por FAO/OMS Joint Meeting on Pesticide Specifications, 2004, ISBN: 9251048576. Si fuera apropiado, las formulaciones contienen, además de uno o más compuestos de la Fórmula (I), agentes agroquímicos activos adicionales.

Preferiblemente comprenden formulaciones o formas de aplicación que contienen agentes auxiliares, tales como rellenos, solventes, promotores instantáneos, vehículos, emulsionantes, dispersantes, agentes anticongelantes, biocidas, espesantes y/o auxiliares adicionales, por ejemplo adyuvantes. En este contexto un adyuvante es un componente que mejora el efecto biológico de la formulación aún si el propio componente no tiene un efecto biológico. Los ejemplos de adyuvantes son agentes que promueven la retención, el comportamiento de propagación, la adherencia a la superficie foliar o la penetración.

Estas formulaciones se preparan de una manera conocida, por ejemplo, mezclando los compuestos de la Fórmula (I) con excipientes tales como rellenos, solventes y/o vehículos sólidos y/u otros excipientes tales como agentes tensioactivos. La preparación de las formulaciones se realiza en sistemas adecuados, o antes o durante el uso.

Los excipientes que se pueden usar son aquellos que son adecuados para impartir propiedades especiales a la formulación de los compuestos de la Fórmula (I) o las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones (tales como, por ejemplo, plaguicidas utilizables como mezclas de rociado o recubrimientos para semillas), tal como para impartir algunas propiedades físicas, técnicas y/o para conferir propiedades biológicas.

Los rellenos adecuados comprenden, por ejemplo, agua, líquidos químicos polares y no polares tales como, por ejemplo, de las clases de hidrocarburos aromáticos y no aromáticos (tales como parafinas, alquilbencenos, alquilnaftalenos, clorobencenos), alcoholes y polioles (que también pueden estar sustituidos, eterificados y/o esterificados), cetonas (tales como acetona, ciclohexanona), ésteres (también grasas y aceites) y (poli)éteres, aminas simples y sustituidas, amidas,

lactamas (tales como N-alquilpirrolidonas) y lactonas, sulfonas y sulfóxidos (tal como dimetilsulfóxido).

En el caso de utilizar agua como relleno, también se pueden utilizar solventes orgánicos como solventes auxiliares. Los solventes líquidos son esencialmente: compuestos aromáticos, tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, compuestos de hidrocarburos aromáticos clorados o alifáticos clorados, tales como clorobencenos, cloroetileno o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano o parafinas, por ejemplo, fracciones de petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoholes tales como butanol o glicol y sus éteres y ésteres, cetonas tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona o ciclohexanona, solventes fuertemente polares tales como dimetilformamida y dimetilsulfóxido y agua.

En principio, se puede utilizar cualquier solvente adecuado. Los solventes adecuados comprenden, por ejemplo, hidrocarburos aromáticos tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, hidrocarburos alifáticos o aromáticos clorados tales como clorobenceno, cloroetileno o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos tales como ciclohexano, parafinas, fracciones de petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoholes tales como metanol, etanol, isopropanol, butanol o glicol y sus éteres y ésteres, cetonas tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona o ciclohexanona, solventes fuertemente polares, tales como dimetilsulfóxido, y agua.

En principio se puede utilizar cualquier transportador adecuado. En particular los vehículos comprenden: por ejemplo, sales de amonio y minerales naturales molidos, tal como caolita, arcillas, talco, tiza, cuarzo, atapulgita, montmorillonita o tierra de diatomeas, y minerales sintéticos molidos, tales como ácido silícico altamente dispersado, óxido de aluminio y silicatos naturales o sintéticos, resinas, ceras y/o fertilizantes sólidos. También se pueden usar mezclas de dichos vehículos. Los vehículos adecuados para gránulos comprenden: por ejemplo, minerales naturales molidos y fraccionados, tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita y dolomita, y gránulos sintéticos de polvos inorgánicos y orgánicos y granulados de materiales orgánicos tales como aserrín, papel, cáscaras de coco, mazorcas de maíz y tallos de tabaco.

Además, se pueden usar diluyentes o solventes gaseosos licuados. En particular, son aquellos rellenos o vehículos que son gaseosos a temperatura normal y bajo presión atmosférica, por ejemplo, como propulsores en aerosol, tales como hidrocarburos halogenados y butano, propano, nitrógeno y dióxido de carbono.

Los ejemplos de agentes emulsionantes y/o de formadores de espuma, agentes dispersantes o humectantes con propiedades iónicas o no iónicas, o mezclas de agentes tensioactivos comprenden sales de ácido poliacrílico, sales de ácidos lignosulfónicos, sales de ácido fenolsulfónico o ácido naftalensulfónico, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o con ácidos grasos o con aminas grasas, fenoles sustituidos (preferiblemente alquilfenoles o arilfenoles), sales de ésteres del ácido sulfosuccínico, derivados de taurina sustituida (preferiblemente tauratos de alquilo), organofosfatos de alcoholes polietoxilados o fenoles, éster de ácido graso de polioles y derivados de los compuestos que contienen sulfatos, sulfonatos y fosfatos, tales como alquilaril éteres de poliglicol, alquilsulfonatos, alquilsulfatos, arilsulfonatos, hidrolizados de proteínas, licores de lignosulfato y metilcelulosa. La presencia de un agente tensioactivo es ventajosa cuando uno de los compuestos de la Fórmula (I) y/o uno de los vehículos inertes no es soluble en agua y cuando se aplica en agua.

Los agentes auxiliares adicionales presentes en las formulaciones y las formas de aplicación derivadas de las mismas pueden comprender colorantes con pigmentos inorgánicos, por ejemplo óxido de hierro, óxido de titanio, azul de Prusia y colorantes orgánicos, tales como colorantes de alizarina, colorantes azoicos y nutrientes metálicos y nutrientes en trazas, tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y zinc.

También pueden comprender estabilizantes tales como estabilizantes del frío, conservantes, antioxidantes, estabilizantes de la luz u otros agentes químicos y/o físicos que mejoran la estabilidad. Además pueden contener agentes formadores de espuma o desespumantes.

Además, las formulaciones y las formas de aplicación derivadas de los mismos también pueden contener como adyuvantes adicionales, adhesivos tales como

carboximetilcelulosa y polvos naturales y sintéticos, granulados o polímeros de látex tales como goma arábica, alcohol polivinílico, acetato de polivinilo y fosfolípidos naturales, tales como cefalinas y lecitinas y fosfolípidos sintéticos. Otros auxiliares pueden comprender aceites minerales y vegetales.

Opcionalmente, las formulaciones y las formas de aplicación derivadas de las mismas pueden comprender otros auxiliares adicionales. Dichos aditivos comprenden, por ejemplo, fragancias, coloides protectores, agentes aglutinantes, adhesivos, espesantes, agentes tixotrópicos, promotores de la penetración, retención, estabilizantes, agentes secuestrantes, agentes formadores de complejos, humectantes, agentes de dispersión. En general, los compuestos de la Fórmula (I) se pueden combinar con cualquier aditivo sólido o líquido utilizado comúnmente con el fin de obtener una formulación.

Los promotores de retención comprenden todas aquellas sustancias que reducen la tensión superficial dinámica, tal como dioctilsulfosuccinato, o aumentan la visco-elasticidad, tales como los polímeros de hidroxipropilguar.

En el presente contexto, todas las sustancias que se utilizan habitualmente para mejorar la penetración de sustancias agroquímicas activas en las plantas se consideran como promotores de la penetración. Los agentes de penetración se definen en este contexto por el hecho que penetran a partir de un líquido de aplicación (en general acuoso) y/o a partir del revestimiento mediante pulverización sobre la cutícula de la planta y de esta manera pueden aumentar la movilidad de los ingredientes activos por la cutícula. Se puede usar el método descrito en la literatura (Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152) para determinar esta propiedad. A modo de ejemplo se pueden mencionar alcoxilatos de alcoholes, tales como etoxilatos de aceite de coco (10) o etoxilato de isotridecilo (12), ésteres de ácido grasos tales como metiléster de aceite de canola o de soja, alcoxilatos de aminas grasas, tales como amina de sebo etoxilado (15) o sales de amonio y/o de fosfonio tales como sulfato de amonio o fosfato ácido de diamonio.

Las formulaciones preferiblemente contienen entre 0,00000001 y 98% en peso del compuesto de la Fórmula (I), más preferiblemente entre 0,01 y 95% en peso del

compuesto de la Fórmula (I), más preferiblemente aún entre 0,5 y 90% en peso del compuesto de la Fórmula (I), basado en el peso de la formulación.

El contenido del compuesto de la Fórmula (I) en las formas de aplicación preparadas a partir de las formulaciones (en particular plaguicidas) puede variar dentro de amplios rangos. En general, la concentración del compuesto de la Fórmula (I) en las formas de aplicación puede comprender entre 0,00000001 y 95% en peso del compuesto de la Fórmula (I), preferiblemente entre 0,00001 y 1% en peso, basado en el peso de la forma de aplicación. La aplicación se realiza en formas de aplicación personalizadas adaptadas a las formulaciones de la solicitud.

### **Mezclas**

Los compuestos de la Fórmula (I) también se pueden emplear en mezclas con uno o más agentes fungicidas, bactericidas, acaricidas, molusquicidas, nematocidas, insecticidas, microbiológicos, beneficiosos, herbicidas, fertilizantes, repelentes de aves, fitotónicos, esterilizantes, protectores, semioquímicos y/o reguladores del crecimiento vegetal adecuados, por ejemplo, para ampliar el espectro de actividad, extender la duración de la actividad, aumentar la velocidad de acción, prevenir la repelencia o prevenir el desarrollo de resistencia. Además, dichas combinaciones pueden comprender ingredientes activos para el crecimiento de plantas y/o la tolerancia a factores abióticos tales como, por ejemplo, mayor tolerancia a las temperaturas altas o bajas, contra la sequía o contra un aumento de agua o de la salinidad del suelo. Además, se puede mejorar el comportamiento de floración y fructificación, se pueden facilitar los beneficios de germinación y enraizamiento, se puede aumentar la cosecha y el rendimiento de los cultivos, la madurez, la calidad y/o el valor nutricional de los cultivos, prolongar la vida útil y/o mejorar la productividad de los cultivos.

Además, los compuestos de la Fórmula (I) pueden estar presentes en una mezcla con otros compuestos o productos semioquímicos activos, tales como feromonas y/o repelentes de aves, y/o activadores de plantas y/o reguladores del crecimiento vegetal y/o fertilizantes. Asimismo, los compuestos de la Fórmula (I) se

pueden usar para mejorar las propiedades de las plantas, tales como el crecimiento, rendimiento y la calidad del cultivo.

En una forma de realización particular de acuerdo con la invención, los compuestos de la Fórmula (I) en las formulaciones o en las formas de aplicación preparadas con las formulaciones se mezclan con otros compuestos, preferiblemente las que se describirán a continuación.

Si uno de los compuestos que se describen a continuación se encuentra en diferentes formas tautoméricas, estas formas también están incluidas, incluso si no se mencionaron explícitamente en cada caso. Además, todos los miembros de mezclado mencionados precedentemente opcionalmente pueden formar sales con bases o ácidos adecuados, sobre la base de sus grupos funcionales.

#### Insecticidas/acaricidas/nematicidas

Los compuestos activos especificados en la presente por sus “nombres comunes” son conocidos y se describen, por ejemplo, en el manual de plaguicidas (“The Pesticide Manual” 16ª edición, British Crop Protection Council 2012) o en Internet (por ejemplo en <http://www.alanwood.net/pesticides>). La clasificación se basa en el Esquema de Clasificación de Modo de Acción IRAC válido al momento de presentar esta solicitud de patente.

(1) Inhibidores de acetilcolinesterasa (AChE), como por ejemplo carbamatos por ejemplo alanicarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbarilo, carbofurano, carbosulfano, etiofencarb, fenobucarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, triazamato, trimetacarb, XMC y xililcarb o organofosfatos, por ejemplo acefato, azametifos, azinfos-etilo, azinfos-metilo, cadusafos, cloretoxifos, clorfenvinfos, clormefos, clorpirifos, clorpirifos-metilo, coumafos, cianofos, demetón-S-metilo, diazinona, diclorvos/DDVP, dicrotofos, dimetoato, dimetilvinfos, disulfotón, EPN, etión, etoprofos, famfur, fenamifos, fenitrotión, fentión, fostiazato, heptenofos, imiciafos, isofenfos, O-(metoxiaminotiofosforil)salicilato de isopropilo, isoxatión, malatión, mecarbam, metamidofos, metidatión, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemetón-metilo, paratión,

paratión-metilo, fentoato, forato, fosalona, fosmet, fosfamidón, foxim, pirimifos-metilo, profenofos, propetamfos, protiofos, piraclofos, piridafentión, quinalfos, sulfotep, tebupirimfos, temefos, terbufos, tetraclorvinfos, tiometón, triazofos, triclorfona y vamidotión.

(2) Bloqueantes de los canales de cloro regulados por GABA, como por ejemplo organoclorados ciclodieno, por ejemplo clorodán y endosulfán, o fenilpirazol (Fiprole), por ejemplo etiprol y fipronilo.

(3) Moduladores de los canales de sodio, como por ejemplo piretroides, por ejemplo entre acrinatrina, aletrina, d-cis-trans aletrina, d-trans aletrina, bifentrina, bioaletrina, isómero S-ciclopentenilo de bioaletrina, bioresmetrina, cicloprotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, gamma-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, beta-cipermetrina, theta-cipermetrina, zeta-cipermetrina, cifenotrina [isómeros (1R)-trans], deltametrina, empentrina [isómeros (EZ)-(1R)], esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flumetrina, tau-fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, kadetrina, permetrina, fenotrina [isómero (1R)-trans], praletrina, piretrinae (piretrum), resmetrina, silafluofeno, teflutrina, tetrametrina, tetrametrina [isómeros (1R)], tralometrina y transflutrina o DDT o metoxiclor.

(4) Moduladores competitivos de receptores nicotínicos de acetilcolina (nAChR), tales como neonicotinoides, por ejemplo acetamiprida, clotianidina, dinotefurano, imidacloprid, nitenpiram, tiacloprid y tiametoxam, o nicotina, o sulfoxaflor, o flupiradifurona.

(5) Moduladores alostéricos del receptor de acetilcolina nicotínico (nAChR), como por ejemplo espinosinas, por ejemplo espinetoram y espinosad.

(6) Moduladores alostéricos de los canales de cloro dependientes de glutamato (GluCl), como por ejemplo avermectinas/milbemicinas, por ejemplo abamectina, emamectina-benzoato, lepimectina y milbemectina.

(7) Miméticos de la hormona juvenil, como por ejemplo análogos de la hormona juvenil, por ejemplo hidropreno, kinopreno y metopreno, o fenoxicarb o piriproxifeno.

(8) Diversos inhibidores no específicos (de múltiples sitios), como por ejemplo halogenuros de alquilo, por ejemplo bromuro de metilo y otros halogenuros de alquilo, o cloropirrina o fluoruro de sulfurilo o bórax o tartar emético o productos de metilisocianato, por ejemplo diazomet y metam.

(9) Moduladores de los órganos cordotomales, por ejemplo pimetrozina o flonicamida.

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

(11) Interruptores microbianos de la membrana intestinal de insectos como por ejemplo *Bacillus thuringiensis* subespecie israelensis, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* subespecie aizawai, *Bacillus thuringiensis* subespecie kurstaki, *Bacillus thuringiensis* subespecie tenebrionis y proteínas vegetales B.t.: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry1A.105, Cry2Ab, VIP3A, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34Ab1/35Ab1.

(12) Inhibidores de la ATP sintasa mitocondrial, como interruptores de ATP, como por ejemplo diafenthiurón o compuestos orgánicos de estaño, por ejemplo azociclotina, cihexatina y óxido de fenbutatina, o propargita o tetradifón.

(13) Desacoplantes de la fosforilación oxidativa por interrupción del gradiente de protones como por ejemplo clorfenapir, DNOC y sulfluramida.

(14) Bloqueante de los canales del receptor de acetilcolina nicotínico como por ejemplo bensultap, clorhidrato de cartap, tiociclam y tiosultap-sodio.

(15) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 0, como por ejemplo bistriflurón, clorfluazurón, diflubenzurón, flucicloxurón, flufenoxurón, hexaflumurón, lufenurón, novalurón, noviflumurón, teflubenzurón y triflumurón.

(16) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 1, como por ejemplo buprofezina.

(17) Interruptores de la muda (en particular de dípteros, es decir, del orden Diptera) como por ejemplo ciromazina.

(18) Agonistas del receptor de ecdisona, como por ejemplo cromafenoizida, halofenoizida, metoxifenoizida y tebufenoizida.

(19) Agonistas del receptor de octopamina, como por ejemplo amitraz.

(20) Inhibidores del transporte de electrones del complejo III mitocondrial, como por ejemplo hidrametilnona o acequinocilo o fluacripirim.

(21) Inhibidores del transporte de electrones del complejo I mitocondrial, como por ejemplo acaricidas METI, por ejemplo fenazaquina, fenpiroximat, pirimidifeno, piridaben, tebufenpirad y tolfenpirad, o rotenona (Derris).

(22) Bloqueantes de los canales de sodio dependientes de voltaje, como por ejemplo indoxacarb o metaflumizona.

(23) Inhibidores de la acetil-CoA carboxilasa, como por ejemplo derivados del ácido tetrónico y tetrámico, por ejemplo espiroclorfen, espiromesifeno y espirotetramat.

(24) Inhibidores del transporte de electrones del Complejo IV mitocondrial, como por ejemplo fosfinas, por ejemplo fosfuro de aluminio, fosfuro de calcio, fosfina y fosfuro de zinc, o cianuros, por ejemplo cianuro de calcio, cianuro de potasio y cianuro de sodio.

(25) Inhibidores del transporte de electrones del Complejo II mitocondrial, como por ejemplo derivados beta-cetonitrilo, por ejemplo cienopirafeno y ciflumetofeno, y carboxanilidas, como por ejemplo piflubumida.

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

otros compuestos activos como por ejemplo acinonapir, afidopiropeno, afoxolaner, azadiractina, benclotiaz, benzoximato, benzpirimoxano, bifenazato, broflanilida, bromopropilato, quinometionat, cloropraetrina, criolita, ciclaniliprol, cicloxaprid, cihalodiamida, dicloromezotiaz, dicofol, épsilon-metoflutrina, épsilon-momflutrina, flometoquina, fluazaindolizina, fluensulfona, flufenerim, flufenoxistrobina, flufiprol, fluhexafona, fluopiram, fluralaner, fluxametamida, fufenozida, guadipir, heptaflutrina, imidacloprid, iprodiona, kappa-bifentrina, kappa-teflutrina, lotilaner, meperflutrina, paichongding, piridalilo, pirifluquinazón, piriminostrobin, espiroclorfen, tetrametilflutrina, tetraniliprol, tetraclorantraniliprol, tigolaner, tioflumetoxato, triflumezopirim y iodometano; preparaciones basadas en *Bacillus firmus* (I-1582, BioNeem, Votivo); así como los siguientes compuestos: 1-{2-fluoro-4-metil-5-

[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil}-3-(trifluorometil)-1H-1,2,4-triazol-5-amina (conocida de WO 2006/043635) (CAS 885026-50-6), {1'-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]-5-fluorespiro[indol-3,4'-piperidin]-1(2H)-il}(2-cloropiridin-4-il)metanona (conocida de WO 2003/106457) (CAS 637360-23-7), 2-cloro-N-[2-{1'-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]piperidin-4-il}-4-(trifluorometil)fenil]isonicotinamida (conocida de WO 2006/003494) (CAS 872999-66-1), 3-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-4-hidroxi-8-metoxi-1,8-diazaespiro[4.5]dec-3-en-2-ona (conocida de WO 2010052161) (CAS 1225292-17-0), 3-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1,8-diazaespiro[4.5]dec-3-en-4-il-etilcarbonato (conocido de EP 2647626) (CAS-1440516-42-6), 4-(but-2-en-1-iloxi)-6-(3,5-dimetilpiperidin-1-il)-5-fluoropirimidina (conocida de WO 2004/099160) (CAS 792914-58-0), PF1364 (conocido de JP2010/018586) (Nº Reg. CAS 1204776-60-2), N-[(2E)-1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]piridin-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoracetamida (conocida de WO2012/029672) (CAS 1363400-41-2), (3E)-3-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-1,1,1-trifluorpropan-2-ona (conocida de WO2013/144213) (CAS 1461743-15-6), N-[3-(bencilcarbamoil)-4-clorofenil]-1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocida de WO2010/051926) (CAS 1226889-14-0), 5-bromo-4-cloro-N-[4-cloro-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)pirazol-3-carboxamida (conocida de CN103232431) (CAS 1449220-44-3), 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-metil-N-(cis-1-oxido-3-tietanil)benzamida, 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-metil-N-(trans-1-oxido-3-tietanil)benzamida y 4-[(5S)-5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-metil-N-(cis-1-oxido-3-tietanil)benzamida (conocida de WO 2013/050317 A1) (CAS 1332628-83-7), N-[3-cloro-1-(3-piridinil)-1H-pirazol-4-il]-N-etil-3-[(3,3,3-trifluoropropil)sulfinil]propanamida, (+)-N-[3-cloro-1-(3-piridinil)-1H-pirazol-4-il]-N-etil-3-[(3,3,3-trifluoropropil)sulfinil]propanamida y (-)-N-[3-cloro-1-(3-piridinil)-1H-pirazol-4-il]-N-etil-3-[(3,3,3-trifluoropropil)sulfinil]propanamida (conocida de WO 2013/162715 A2, WO 2013/162716 A2, US 2014/0213448 A1) (CAS 1477923-37-7), 5-[[[(2E)-3-cloro-2-propen-1-il]amino]-1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-4-[(trifluorometil)sulfinil]-1H-pirazol-3-carbonitrilo (conocido de CN 101337937 A) (CAS 1105672-77-2), 3-bromo-N-[4-cloro-2-metil-6-[(metilamino)tioxometil]fenil]-1-(3-cloro-2-

piridinil)-1H-pirazol-5-carboxamida, (Liudaibenjiaxuanan, conocido de CN 103109816 A) (CAS 1232543-85-9); N-[4-cloro-2-[(1,1-dimetiletil)amino]carbonil]-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(fluorometoxi)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocida de WO 2012/034403 A1) (CAS 1268277-22-0), 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 (conocida de WO 2011/085575 A1) (CAS 1233882-22-8), 4-[3-[2,6-dicloro-4-[(3,3-dicloro-2-propen-1-il)oxi]fenoxi]propoxi]-2-metoxi-6-(trifluorometil)pirimidina (conocida de CN 101337940 A) (CAS 1108184-52-6); (2E)- y 2(Z)-2-[2-(4-cianofenil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etiliden]-N-[4-(difluorometoxi)fenil]hidrazincarboxamida (conocida de CN 101715774 A) (CAS 1232543-85-9); feniléster del ácido 3-(2,2-dicloroetenil)-2,2-dimetil-4-(1H-benzimidazol-2-il)-ciclopropancarboxílico (conocido de CN 103524422 A) (CAS 1542271-46-4); metiléster del ácido (4aS)-7-cloro-2,5-dihidro-2-[[[metoxycarbonil]4-[(trifluorometil)tio]fenil]amino]carbonil]indeno[1,2-e][1,3,4]oxadiazin-4a(3H)-carboxílico (conocido de CN 102391261 A) (CAS 1370358-69-2); 6-desoxi-3-O-etil-2,4-di-O-metil-1-[N-[4-[1-[4-(1,1,2,2,2-pentafluoroetoxi)fenil]-1H-1,2,4-triazol-3-il]fenil]carbamato]- $\alpha$ -L-manopiranososa (conocida de US 2014/0275503 A1) (CAS 1181213-14-8); 8-(2-ciclopropilmetoxi-4-trifluorometilfenoxi)-3-(6-trifluorometilpiridazin-3-il)-3-azabicyclo[3.2.1]octano (CAS 1253850-56-4), (8-anti)-8-(2-ciclopropilmetoxi-4-trifluorometilfenoxi)-3-(6-trifluorometilpiridazin-3-il)-3-azabicyclo[3.2.1]octano (CAS 933798-27-7), (8-syn)-8-(2-ciclopropilmetoxi-4-trifluorometilfenoxi)-3-(6-trifluorometilpiridazin-3-il)-3-azabicyclo[3.2.1]octano (conocido de WO 2007040280 A1, WO 2007040282 A1) (CAS 934001-66-8), N-[3-cloro-1-(3-piridinil)-1H-pirazol-4-il]-N-etil-3-[(3,3,3-trifluoropropil)tio]-propanamida (conocida de WO 2015/058021 A1, WO 2015/058028 A1) (CAS 1477919-27-9) y N-[4-(aminotioxometil)-2-metil-6-[(metilamino)carbonil]fenil]-3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocida de CN 103265527 A) (CAS 1452877-50-7), 5-(1,3-dioxan-2-il)-4-[[4-(trifluorometil)fenil]metoxi]-pirimidina (conocida de WO 2013/115391 A1) (CAS 1449021-97-9), 3-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-4-hidroxi-8-metoxi-1-metil-1,8-diazaespiro[4.5]dec-3-en-2-ona (conocida de WO 2010/066780 A1, WO 2011/151146 A1) (CAS 1229023-34-0), 3-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-8-metoxi-1-metil-

1,8-diazaespiro[4.5]decano-2,4-diona (conocida de WO 2014/187846 A1) (CAS 1638765-58-8), éster etílico de ácido 3-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-8-metoxi-1-metil-2-oxo-1,8-diazaespiro[4.5]dec-3-en-4-il-carboxílico (conocido de WO 2010/066780 A1, WO 2011151146 A1) (CAS 1229023-00-0), N-[1-[(6-cloro-3-piridinil)metil]-2(1*H*)-piridiniliden]-2,2,2-trifluoro-acetamida (conocida de DE 3639877 A1, WO 2012029672 A1) (CAS 1363400-41-2), [N(*E*)]-N-[1-[(6-cloro-3-piridinil)metil]-2(1*H*)-piridiniliden]-2,2,2-trifluoro-acetamida (conocida de WO 2016005276 A1) (CAS 1689566-03-7), [N(*Z*)]-N-[1-[(6-cloro-3-piridinil)metil]-2(1*H*)-piridiniliden]-2,2,2-trifluoro-acetamida (CAS 1702305-40-5), 3-*endo*-3-[2-propoxi-4-(trifluormetil)fenoxi]-9-[[5-(trifluormetil)-2-piridinil]oxi]-9-azabicyclo[3.3.1]nonano (conocido de WO 2011/105506 A1, WO 2016/133011 A1) (CAS 1332838-17-1).

### **Fungicidas**

Los compuestos activos especificados en la presente por sus “nombres comunes” son conocidos y se describen, por ejemplo, en “Pesticide Manual” (16ª edición, British Crop Protection Council 2012) o en Internet (por ejemplo en <http://www.alanwood.net/pesticides>).

Además, todos los miembros de mezclado de las Clases (1) a (15) opcionalmente pueden formar sales con bases o ácidos adecuados, sobre la base de sus grupos funcionales. Todos los miembros de mezclado fungicidas mencionados de las clases (1) a (15) pueden incluir opcionalmente sus formas tautoméricas.

1) Inhibidores de la biosíntesis de ergosterol, por ejemplo (1.001) ciproconazol, (1.002) difenoconazol, (1.003) epoxiconazol, (1.004) fenhexamida, (1.005) fenpropidina, (1.006) fenpropimorf, (1.007) fenpirazamina, (1.008) fluquinconazol, (1.009) flutriafol, (1.010) imazalilo, (1.011) sulfato de imazalilo, (1.012) ipconazol, (1.013) metconazol, (1.014) miclobutanilo, (1.015) paclobutrazol, (1.016) procloroaz, (1.017) propiconazol, (1.018) protioconazol, (1.019)pirisoxazol, (1.020) espiroxamina, (1.021) tebuconazol, (1.022) tetraconazol, (1.023) triadimenol, (1.024) tridemorf, (1.025) triticonazol, (1.026) (1*R*,2*S*,5*S*)-5-(4-clorobencil)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1*H*-1,2,4-triazol-1-ilmetil)ciclopentanol, (1.027) (1*S*,2*R*,5*R*)-5-(4-clorobencil)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1*H*-1,2,4-triazol-1-ilmetil)ciclopentanol, (1.028) (2*R*)-2-(1-clorociclopropil)-4-

[(1R)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol (1.029) (2R)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1S)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.030) (2R)-2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1.031) (2S)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1R)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.032) (2S)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1S)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.033) (2S)-2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1.034) (R)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (1.035) (S)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (1.036) [3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (1.037) 1-((2R,4S)-2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-4-metil-1,3-dioxolan-2-il)metil)-1H-1,2,4-triazol, (1.038) 1-((2S,4S)-2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-4-metil-1,3-dioxolan-2-il)metil)-1H-1,2,4-triazol, (1.039) 1-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-il-tiocianato, (1.040) 1-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-il-tiocianato, (1.041) 1-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-il-tiocianato, (1.042) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.043) 2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.044) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.045) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.046) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.047) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.048) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.049) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.050) 2-[1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.051) 2-[2-cloro-4-(2,4-diclorofenoxi)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1.052) 2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.053) 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-

triazol-1-il)butan-2-ol, (1.054) 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)pentan-2-ol, (1.055) 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1.056) 2-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.057) 2-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.058) 2-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.059) 5-(4-clorobencil)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetil)ciclopentanol, (1.060) 5-(alilsulfanil)-1-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (1.061) 5-(alilsulfanil)-1-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (1.062) 5-(alilsulfanil)-1-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (1.063) N'-(2,5-dimetil-4-[[3-(1,1,2,2-tetrafluoroetoksi)fenil]sulfanil]fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.064) N'-(2,5-dimetil-4-[[3-(2,2,2-trifluoroetoksi)fenil]sulfanil]fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.065) N'-(2,5-dimetil-4-[[3-(2,2,3,3-tetrafluoropropoksi)fenil]sulfanil]fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.066) N'-(2,5-dimetil-4-[[3-(pentafluoroetoksi)fenil]sulfanil]fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.067) N'-(2,5-dimetil-4-{3-[(1,1,2,2-tetrafluoroetil)sulfanil]fenoksi}fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.068) N'-(2,5-dimetil-4-{3-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenoksi}fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.069) N'-(2,5-dimetil-4-{3-[(2,2,3,3-tetrafluoropropil)sulfanil]fenoksi}fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.070) N'-(2,5-dimetil-4-{3-[(pentafluoroetil)sulfanil]fenoksi}fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.071) N'-(2,5-dimetil-4-fenoxifenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.072) N'-(4-{3-(difluorometoksi)fenil]sulfanil}-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.073) N'-(4-{3-[(difluorometil)sulfanil]fenoksi}-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.074) N'-[5-bromo-6-(2,3-dihidro-1H-inden-2-iloxi)-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.075) N'-(4-{4-(4,5-dicloro-1,3-tiazol-2-il)oxi}-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.076) N'-(5-bromo-6-[(1R)-1-(3,5-difluorofenil)etoksi]-2-metilpiridin-3-il)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.077) N'-(5-bromo-6-[(1S)-1-(3,5-difluorofenil)etoksi]-2-metilpiridin-3-il)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.078) N'-(5-bromo-6-[(cis-4-isopropilciclohexil)oxi]-2-metilpiridin-3-il)-N-etil-N-metilimidoformamida,

(1.079) N'-{5-bromo-6-[(trans-4-isopropilciclohexil)oxi]-2-metilpiridin-3-il}-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.080) N'-{5-Bromo-6-[1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il}-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.081) mefentrifluconazol, (1.082) ipfentrifluconazol.

2) Inhibidores de la cadena respiratoria en el complejo I o II como por ejemplo (2.001) benzovindiflupir, (2.002) Bixafeno, (2.003) boscalida, (2.004) carboxina, (2.005) fluopiram, (2.006) flutolanilo, (2.007) fluxapiroxad, (2.008) furametpir, (2.009) isofetamida, (2.010) isopirazam (enantiómeros antiepipiméricos 1R,4S,9S), (2.011) isopirazam (enantiómeros antiepipiméricos 1S,4R,9R), (2.012) isopirazam (racemato antiepipimérico 1RS,4SR,9SR), (2.013) isopirazam (mezcla de racematos syn-epiméricos 1RS,4SR,9RS y racematos antiepipiméricos 1RS,4SR,9SR), (2.014) isopirazam (enantiómeros syn-epiméricos 1R,4S,9R), (2.015) isopirazam (enantiómeros syn-epiméricos 1S,4R,9S), (2.016) Isopirazam (racematos syn-epiméricos 1RS,4SR,9RS), (2.017) penflufeno, (2.018) pentiopirad, (2.019) pidiflumetofeno, (2.020) piraziflumida, (2.021) sedaxano, (2.022) 1,3-dimetil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.023) 1,3-dimetil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.024) 1,3-dimetil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.025) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[2'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.026) 2-fluoro-6-(trifluorometil)-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)benzamida, (2.027) 3-(difluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.028) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.029) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.030) 3-(difluorometil)-N-(7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.031) 3-(difluorometil)-N-[(3R)-7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.032) 3-(difluorometil)-N-[(3S)-7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.033) 5,8-difluoro-N-[2-(2-fluoro-4-{[4-(trifluorometil)piridin-2-il]oxi}fenil)etil]quinazolin-4-amina, (2.034) N-(2-ciclopentil-5-fluorobencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.035) N-(2-ter-butil-5-metilbencil)-N-ciclopropil-3-

(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.036) N-(2-ter-butilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.037) N-(5-cloro-2-etilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.038) N-(5-cloro-2-isopropilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.039) N-[(1R,4S)-9-(diclorometilen)-1,2,3,4-tetrahydro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.040) N-[(1S,4R)-9-(diclorometilen)-1,2,3,4-tetrahydro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.041) N-[1-(2,4-diclorofenil)-1-metoxipropan-2-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.042) N-[2-cloro-6-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.043) N-[3-cloro-2-fluoro-6-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.044) N-[5-cloro-2-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.045) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-N-[5-metil-2-(trifluorometil)bencil]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.046) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-fluoro-6-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.047) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropil-5-metilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.048) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.049) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.050) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(5-fluoro-2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.051) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-4,5-dimetilbencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.052) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-5-fluorobencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.053) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-5-metilbencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.054) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropil-5-fluorobencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.055) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropil-5-metilbencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.056) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropilbencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida.

3) Inhibidores de la cadena respiratoria en el complejo III, por ejemplo (3.001)

ametoctradina, (3.002) amisulbrom, (3.003) azoxistrobina, (3.004) coumetoxistrobina, (3.005) coumoxistrobina, (3.006) ciazofamida, (3.007) dimoxistrobina, (3.008) enoxastrobina, (3.009) famoxadona, (3.010) fenamidona, (3.011) flufenoxistrobina, (3.012) fluoxastrobina, (3.013) kresoxim-metilo, (3.014) metominostrobin, (3.015) orisastrobina, (3.016) picoxistrobina, (3.017) piraclostrobina, (3.018) pirametostrobina, (3.019) piraxistrobina, (3.020) trifloxistrobina (3.021) (2E)-2-{2-[[[(1E)-1-(3-[[[(E)-1-fluoro-2-fenilvinil]oxi]fenil)etiliden]amino]oxi]metil]fenil]-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida, (3.022) (2E,3Z)-5-{[1-(4-clorofenil)-1H-pirazol-3-il]oxi}-2-(metoxiimino)-N,3-dimetilpent-3-enamida, (3.023) (2R)-2-{2-[(2,5-dimetilfenoxi)metil]fenil}-2-metoxi-N-metilacetamida, (3.024) (2S)-2-{2-[(2,5-dimetilfenoxi)metil]fenil}-2-metoxi-N-metilacetamida, (3.025) (3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[[3-[(isobutiriloxi)metoxi]-4-metoxipiridin-2-il]carbonil]amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-il-2-metilpropanoato, (3.026) 2-{2-[(2,5-dimetilfenoxi)metil]fenil}-2-metoxi-N-metilacetamida, (3.027) N-(3-etil-3,5,5-trimetilciclohexil)-3-formamido-2-hidroxibenzamida, (3.028) (2E,3Z)-5-{[1-(4-cloro-2-fluorofenil)-1H-pirazol-3-il]oxi}-2-(metoxiimino)-N,3-dimetilpent-3-enamida, (3.029) {5-[3-(2,4-dimetilfenil)-1H-pirazol-1-il]-2-metilbencil}carbamato de metilo.

4) Inhibidores de la mitosis y la división celular, por ejemplo (4.001) carbendazim, (4.002) dietofencarb, (4.003) etaboxam, (4.004) fluopicolida, (4.005) pencicurón, (4.006) tiabendazol, (4.007) tiofanato-metilo, (4.008) zoxamida, (4.009) 3-cloro-4-(2,6-difluorofenil)-6-metil-5-fenilpiridazina, (4.010) 3-cloro-5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-metilpiridazina, (4.011) 3-cloro-5-(6-cloropiridin-3-il)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)piridazina, (4.012) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.013) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-bromo-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.014) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-bromofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.015) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-cloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.016) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-clorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.017) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.018) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.019) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2-

cloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.020) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2-clorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.021) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.022) 4-(4-clorofenil)-5-(2,6-difluorofenil)-3,6-dimetilpiridazin, (4.023) N-(2-bromo-6-fluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.024) N-(2-bromofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.025) N-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina.

5) Compuestos con capacidad de actividad en múltiples sitios, por ejemplo (5.001) mezcla de Bordeaux, (5.002) captafol, (5.003) captán, (5.004) clorotalonilo, (5.005) hidróxido de cobre, (5.006) naftenato de cobre, (5.007) óxido de cobre, (5.008) oxiclورو de cobre, (5.009) sulfato de cobre(2+), (5.010) ditianona, (5.011) dodina, (5.012) folpet, (5.013) mancozeb, (5.014) maneb, (5.015) metiram, (5.016) metiram-zinc, (5.017) oxina-cobre, (5.018) propineb, (5.019) azufre y preparaciones de azufre incluyendo polisulfuro de calcio, (5.020) tiram, (5.021) zineb, (5.022) ziram, (5.023) 6-etil-5,7-dioxo-6,7-dihidro-5H-pirrol[3',4':5,6][1,4]ditiino[2,3-c][1,2]tiazol-3-carbonitrilo.

6) Compuestos con capacidad para generar defensa en el huésped, por ejemplo (6.001) acibenzolar-S-metilo, (6.002) isotianilo, (6.003) probenazol, (6.004) tiadinilo.

7) Inhibidores de la biosíntesis de aminoácidos y/o proteínas, por ejemplo (7.001) ciprodinilo, (7.002) kasugamicina, (7.003) clorhidrato de kasugamicina hidratado, (7.004) oxitetraciclina (7.005) pirimetanilo, (7.006) 3-(5-fluoro-3,3,4,4-tetrametil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina.

(8) Inhibidores de la producción de ATP, por ejemplo (8.001) siltiofam.

9) Inhibidores de la síntesis de la pared celular, por ejemplo (9.001) bentiavalicarb, (9.002) dimetomorf, (9.003) flumorf, (9.004) iprovalicarb, (9.005) mandipropamid, (9.006) pirimorf, (9.007) valifenalato, , (9.008) (2E)-3-(4-ter-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona, (9.009) (2Z)-3-(4-ter-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona.

10) Inhibidores de la síntesis de lípidos y membranas, por ejemplo (10.001) propamocarb, (10.002) clorhidrato de propamocarb, (10.003) tolclofos-metilo.

11) Inhibidores de la biosíntesis de melanina, por ejemplo (11.001) triciclazol, (11.002) 2,2,2-trifluoroetil-{3-metil-1-[(4-metilbenzoil)amino]butan-2-il}carbamato.

12) Inhibidores de la síntesis de ácidos nucleicos, por ejemplo (12.001) benalaxilo, (12.002) benalaxil-M (kiralaxilo), (12.003) metalaxilo, (12.004) metalaxil-M (mefenoxam).

13) Inhibidores de la transducción de señales, por ejemplo (13.001) fludioxonilo, (13.002) iprodiona, (13.003) procimidona, (13.004) proquinazid, (13.005) quinoxifeno, (13.006) vinclozolina.

14) Compuestos capaces de actuar como desacoplantes, por ejemplo (14.001) fluazinam, (14.002) meptildinocap.

15) Otros compuestos, por ejemplo (15.001) ácido abscísico, (15.002) bentiazol, (15.003) betoxazina, (15.004) capsimicina, (15.005) carvona, (15.006) quinometionato, (15.007) cufraneb, (15.008) ciflufenamida, (15.009) cimoxanilo, (15.010) ciprosulfamida, (15.011) flutianilo, (15.012) fosetil-aluminio, (15.013) fosetil-calcio, (15.014) fosetil-sodio, (15.015) metilisotiocianato, (15.016) metrafenona, (15.017) mildiomicina, (15.018) natamicina, (15.019) dimetilditiocarbamato de níquel, (15.020) nitrotal-isopropilo, (15.021) oxamocarb, (15.022) oxatiapirolina, (15.023) oxifentiina, (15.024) pentaclorofenol y sus sales, (15.025) ácido fosfónico y sus sales, (15.026) propamocarb-fosetilato, (15.027) piriofenona (clazafenona) (15.028) tebufloquina, (15.029) tecloftalam, (15.030) tolifenida, (15.031) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, (15.032) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, (15.033) 2-(6-bencilpiridin-2-il)quinazolina, (15.034) 2,6-dimetil-1H,5H-[1,4]ditiino[2,3-c:5,6-c']dipirrol-1,3,5,7(2H,6H)-tetrona, (15.035) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-(prop-2-en-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona, (15.036) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-cloro-6-(prop-2-en-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona, (15.037) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-fluoro-6-(prop-2-en-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-

il)piperidin-1-il]etanona, (15.038) 2-[6-(3-fluoro-4-metoxifenil)-5-metilpiridin-2-il]quinazolina, (15.039) metansulfonato de 2-[(5R)-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, (15.040) metansulfonato de 2-[(5S)-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, (15.041) 2-{2-[(7,8-difluoro-2-metilquinolin-3-il)oxi]-6-fluorofenil}propan-2-ol, (15.042) 2-{2-fluoro-6-[(8-fluoro-2-metilquinolin-3-il)oxi]fenil}propan-2-ol, (15.043) 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, (15.044) 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, (15.045) 2-fenilfenol y sus sales, (15.046) 3-(4,4,5-trifluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina, (15.047) 3-(4,4-difluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina, (15.048) 4-amino-5-fluoropirimidin-2-ol (Forma tautomérica: 4-amino-5-fluoropirimidin-2(1H)-ona), (15.049) ácido 4-oxo-4-[(2-feniletil)amino]butírico, (15.050) 5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-tiol, (15.051) 5-cloro-N'-fenil-N'-(prop-2-in-1-il)tiofen-2-sulfonhidrazida, (15.052) 5-fluoro-2-[(4-fluorobencil)oxi]pirimidin-4-amina, (15.053) 5-fluoro-2-[(4-metilbencil)oxi]pirimidin-4-amina, (15.054) 9-fluoro-2,2-dimetil-5-(quinolin-3-il)-2,3-dihidro-1,4-benzoxazepina, (15.055) but-3-in-1-ilo {6-[[[(Z)-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]amino}oxi]metil]piridin-2-il}carbamato, (15.056) (2Z)-3-amino-2-ciano-3-fenilacrilato de etilo, (15.057) ácido fenazina-1-carboxílico, (15.058) 3,4,5-trihidroxibenzoato de propilo, (15.059) quinolin-8-ol, (15.060) sulfato de quinolin-8-ol (2:1), (15.061) {6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]amino}oxi]metil]piridin-2-il}carbamato de ter-butilo, (15.062) 5-fluoro-4-imino-3-metil-1-[(4-metilfenil)sulfonil]-3,4-dihidropirimidin-2(1H)-ona.

### **Plaguicidas biológicos como componentes de mezclas**

Los compuestos de la Fórmula (I) se pueden combinar con plaguicidas biológicos.

Los plaguicidas biológicos incluyen, en particular, bacterias, hongos, levaduras, extractos de plantas y los productos formados por microorganismos, incluidas

proteínas y metabolitos secundarios.

Los plaguicidas biológicos incluyen bacterias tales como bacterias formadoras de esporas, bacterias colonizadoras de raíces y bacterias que actúan como insecticidas biológicos, fungicidas o nematocidas.

Los ejemplos de bacterias que se pueden usar como plaguicidas biológicos son:

*Bacillus amiloliquefaciens*, cepa FZB42 (DSM 231179), o *Bacillus cereus*, en particular la cepa CNCM I-1562 de *B. cereus* o la cepa I-1582 de *Bacillus firmus* (Nº Acceso CNCM I-1582) o *Bacillus pumilus*, en particular la cepa GB34 (Nº Acceso ATCC 700814) y la cepa QST2808 (Nº Acceso NRRL B-30087) o *Bacillus subtilis*, en particular la cepa GB03 (Nº Acceso ATCC SD-1397) o la cepa QST713 de *Bacillus subtilis* (Nº Acceso NRRL B-21661) o la cepa OST 30002 de *Bacillus subtilis* (Nº Acceso NRRL B-50421), *Bacillus thuringiensis*, en particular *B. thuringiensis*, subespecie *israelensis* (serotipo H-14), cepa AM65-52 (Nº Acceso ATCC 1276), o *B. thuringiensis* subsp. *aizawai*, en particular la cepa ABTS-1857 (SD-1372), o *B. thuringiensis* subsp. *Kurstaki*, cepa HD-1, o *B. thuringiensis* subsp. *Tenebrionis*, cepa NB 176 (SD-5428), *Pasteuria penetrans*, *Pasteuria spp* (nematodo *Rotilenchulus reniformie*)-PR3 (Nº Acceso ATCC SD-5834), *Streptomyces microflavus*, cepa AQ6121 (= QRD 31.013, NRRL B-50550), *Streptomyces galbus*, cepa AQ 6047 (Nº Acceso NRRL 30232).

Los ejemplos de hongos y levaduras que se pueden usar como plaguicidas biológicos son:

*Beauveria bassiana*, en particular la cepa ATCC 74040, *Coniothirium minitans*, en particular la cepa CON/M/91-8 (Nº Acceso DSM-9660), *Lecanicillium spp*, en particular la cepa HRO LEC 12, *Lecanicillium lecanii* (antes conocido como *Verticillium lecanii*), en particular la cepa KV01, *Metarhizium anisopliae*, en particular la cepa F52 (DSM3884/ ATCC 90448), *Metschnikowia fructicola*, en particular la cepa NRRL Y-30752, *Paecilomyces fumosoroseus* (ahora: *Isaria fumosorosea*), en particular la cepa IFPC 200613 o la cepa Apopka 97 (Nº Acceso ATCC 20874), *Paecilomyces lilacinus*, en particular la cepa 251 de *P. lilacinus* (AGAL 89/030550), *Talaromyces flavus*, en

particular la cepa V117b, *Trichoderma atroviride*, en particular la cepa SC1 (Nº Acceso CBS 122089), *Trichoderma harzianum*, en particular *T. harzianum rifai T39* (Nº Acceso CNCM I-952).

Los ejemplos de virus que se pueden usar como plaguicidas biológicos son:

*Adoxophyes orana* (enrollador de la cáscara de manzana), granulovirus (GV), *Cydia pomonella* (enrollador del manzano) granulovirus (GV), *Helicoverpa armigera* (gusano del capullo del algodón) virus de polihedrosis nuclear (NPV), *Spodoptera exigua* (gusano de la remolacha) mNPV, *Spodoptera frugiperda* (gusano cogollero) mNPV, *Spodoptera littoralis* (gusano del algodón africano) NPV.

También incluyen bacterias y hongos, que se añaden como ‘inoculantes’ de plantas o partes de plantas u órganos vegetales y promueven el crecimiento vegetal y la salud de las plantas por sus propiedades especiales. Los ejemplos se pueden mencionar:

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

Los ejemplos de extractos de plantas y de los productos formados por microorganismos, incluyendo proteínas y metabolitos secundarios, que se pueden usar como plaguicidas biológicos son:

*Allium sativum*, *Artemisia absinthium*, Azadiractina, Biokeeper WP, *Cassia nigricans*, *Celastrus angulatus*, *Chenopodium anthelminticum*, quitina, Armour-Zen, *Dryopteris filix-mas*, *Equisetum arvense*, Fortune Aza, Fungastop, Heads Up (extracto de saponina de *Chenopodium quinoa*), piretro/piretrina, *Quassia amara*, Quercus, Quillaja, Regalia, “Requiem™ Insecticide”, rotenona, riania/rianodina, *Symphytum officinale*, *Tanacetum vulgare*, timol, Triact 70, triCon, *Tropaeolum majus*, *Urtica dioica*, veratrina, *Viscum album*, extracto de Brassica, en particular colza o mostaza en polvo.

### **Protectores como componentes de mezclas**

Los compuestos de la Fórmula (I) se pueden combinar con protectores, tales como, por ejemplo, benoxacor, cloquintocet (-mexilo), ciometrinilo, ciprosulfamida, dicloromida, fencloroazol (-etilo), fenclorim, flurazol, fluxofenim, furilazol, isoxadifeno (-etilo), mefenpir (-dietilo), anhídrido naftálico, oxabetrinilo, 2-metoxi-N-({4-[(metilcarbamoil)amino]fenil}sulfonil)benzamida (CAS 129531-12-0), 4-(dicloroacetil)-1-oxa-4-azaespiro[4.5]decano (CAS 71526-07-3), 2,2,5-trimetil-3-(dicloroacetil)-1,3-oxazolidina (CAS 52836-31-4).

### **Plantas y partes de plantas**

Todas las plantas y partes de plantas pueden ser tratadas de acuerdo con los métodos de la invención. Las plantas se interpretan aquí como todas las plantas y poblaciones de plantas, tales como plantas salvajes deseadas e indeseadas o plantas de cultivo (que incluyen plantas de cultivo naturales), por ejemplo por ejemplo cereales (trigo, arroz, triticale, cebada, centeno, avena), maíz, soja, papas, remolacha azucarera, caña de azúcar, tomates, pimientos, pepino, melón, zanahoria, sandía, cebolla, lechuga, espinaca, puerro, frijol, *Brassica oleracea* (por ejemplo, col) y otras hortalizas, algodón, tabaco, colza, así como plantas frutales (con las frutas manzanas, peras, cítricos y uvas). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que se pueden obtener por medio de métodos de cría y optimización convencionales o mediante métodos biotecnológicos y de ingeniería genética o mediante combinaciones de estos métodos, incluyendo las plantas transgénicas y que también incluyen los cultivares de plantas que pueden estar protegidos, o no, por derechos de obtentores. Se debe entender que las plantas comprenden todas las etapas de desarrollo, como semillas, esquejes, plantas jóvenes (no maduras) y plantas maduras. Las partes de plantas comprenderán todas las partes y los órganos vegetales aéreos y subterráneos de las plantas, tales como brotes, hojas, flores y raíces, y como ejemplos se pueden incluir hojas, agujas, ramas, tallos, flores, cuerpos de fructificación, frutos y semillas, raíces, tubérculos y rizomas. Las partes de plantas también incluyen material de cultivo cosechado y material de propagación vegetativa y generativa, por ejemplo, estacas, tubérculos, rizomas, esquejes y semillas.

El tratamiento de acuerdo con la invención de las plantas y partes de plantas con los compuestos de la Fórmula (I) se lleva a cabo directamente o por la acción de los compuestos sobre el medio ambiente, el hábitat o el espacio de almacenamiento de acuerdo con los métodos de tratamiento habituales, por ejemplo, mediante inmersión, pulverización, evaporación, nebulización, esparcido, dispersión, inyección y material de propagación, en particular con semillas, además de revestimientos con una o múltiples capas.

Como ya se mencionó precedentemente, de acuerdo con la invención pueden ser tratadas todas las plantas y sus partes. En una forma de realización preferida, se tratan especies de plantas comunes o de tipo salvaje y variedades de plantas obtenidas mediante métodos de reproducción biológica convencionales tales como el cruzamiento o la fusión de protoplastos y partes de los mismos. En una forma de realización preferida adicional, se tratan plantas transgénicas o cultivares de plantas obtenidas mediante ingeniería genética en combinación con métodos convencionales (organismos genéticamente modificados) y partes de las mismas. Los términos "plantas" o "partes de plantas" ya se describieron precedentemente. De acuerdo con la invención, se prefiere particularmente tratar plantas de cultivares de plantas comercialmente disponibles o en uso respectivos. Las variedades de plantas significan plantas con nuevas propiedades ("rasgos"), que se obtuvieron mediante reproducción convencional, mediante mutagénesis o mediante técnicas de ADN recombinante. Pueden comprender variedades, razas, biotipos y genotipos.

#### **Plantas transgénicas, tratamiento de semillas y eventos de integración**

Las plantas o cultivares de plantas preferidas a tratar de acuerdo con la invención incluyen todas las plantas que, como resultado de una modificación genética, obtuvieron un material genético que les otorga a estas plantas propiedades ("rasgos") valiosas particularmente ventajosas. Los ejemplos de dichas propiedades comprenden un mejor crecimiento de las plantas, mayor tolerancia a temperaturas altas o bajas, mayor tolerancia a sequía o al contenido de agua o sales en el suelo, mayor eficacia de floración, cosecha más fácil, aceleración de la madurez, mayores rendimientos de cultivos, mayor calidad y/o mayor valor nutricional de los productos

cosechados, mayor vida útil y/o manejabilidad de los productos cosechados. Los ejemplos adicionales y particularmente preferidos de dichas propiedades comprenden un aumento de la resistencia de las plantas al ataque de plagas animales y microorganismos, tales como insectos, arácnidos, nematodos, ácaros, caracoles, causada, por ejemplo, por las toxinas producidas en las plantas, en particular las producidas por el material genético de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo, por los genes CryIA (a), CryIA (b), CryIA (c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF y combinaciones de los mismos) que se producen en las plantas, también una resistencia aumentada de las plantas a los hongos patógenos de plantas, bacterias y/o virus, causada, por ejemplo, por una resistencia sistémica adquirida (SAR), sistemina, fitoalexinas, inductores y genes de resistencia y proteínas y toxinas expresadas de manera correspondiente, así como una mayor tolerancia de las plantas a determinados compuestos herbicidas activos, por ejemplo imidazolinonas, sulfonilureas, glifosato o fosfinotricina (por ejemplo, el gen "PAT"). Los genes que confieren las propiedades ("rasgos") deseadas también se pueden combinar entre sí en las plantas transgénicas. Los ejemplos de plantas transgénicas comprenden cultivos importantes tales como de cereales (trigo, arroz, triticale, cebada, centeno, avena), maíz, soja, papa, remolacha azucarera, caña de azúcar, tomates, arvejas y otras verduras, algodón, tabaco, colza oleaginosa y frutales (que incluyen manzanas, peras, cítricos y uvas), preferiblemente maíz, soja, trigo, arroz, papa, algodón, caña de azúcar, tabaco y colza. Las propiedades ("rasgos") especialmente preferidas son el aumento de la resistencia de las plantas a insectos, arácnidos, nematodos y caracoles.

### **Protección de las plantas: tipos de tratamiento**

El tratamiento de las plantas y partes de plantas con los compuestos de la Fórmula (I) se lleva a cabo directamente o actuando en su entorno, hábitat o espacio de almacenamiento de acuerdo con los métodos de tratamiento habituales, por ejemplo, mediante inmersión, aspersión, rociado, espolvoreo, vaporización, pulverización, atomización, dispersión, formación de espuma, propagación, escurrimiento, inyección, derrame (empapamiento), irrigación por goteo y propagación

en un material, especialmente en semillas, además mediante revestimiento en seco, revestimiento en húmedo, revestimiento de lodo, incrustación, u recubrimientos de múltiples capas, etc. También es posible aplicar los compuestos de la Fórmula (I) mediante el método de volumen ultra bajo o de inyección de la forma de aplicación o del compuesto de la Fórmula (I) en el suelo.

Un tratamiento directo preferido de las plantas es la aplicación foliar, es decir, los compuestos de la Fórmula (I) se aplican al follaje, en donde la frecuencia de tratamiento y la dosis de aplicación deben coincidir con la presión de la infestación por la plaga respectiva.

En el caso de sustancias sistémicamente activas, los compuestos de la Fórmula (I) también pueden ingresar a las plantas a través del sistema radicular. El tratamiento de las plantas se lleva a cabo luego por acción de los compuestos de la Fórmula (I) en el hábitat de la planta. Esto se puede realizar, por ejemplo, mediante empapado, mezclado con la tierra o una solución nutritiva, es decir, la ubicación de la planta (por ejemplo, en el suelo o con sistemas hidropónicos) está impregnada con una forma líquida de los compuestos de la Fórmula (I), o por la aplicación al suelo, es decir, los compuestos de la Fórmula (I) de acuerdo con la invención se incorporan en forma sólida (por ejemplo, en la forma de gránulos) en la ubicación de las plantas. En los cultivos de arroz en agua, esto también se puede realizar mediante una adición medida del compuesto de la Fórmula (I) en una forma sólida (por ejemplo, como gránulos) en un campo de arroz inundado.

### **Tratamiento de semillas**

El control de las plagas animales mediante tratamiento de las semillas de las plantas es conocida desde hace mucho tiempo y es objeto de mejoras constantes. Sin embargo, hay una serie de problemas con el tratamiento de semillas que no siempre se pueden resolver satisfactoriamente. Por lo tanto, resulta deseable desarrollar métodos para proteger a las semillas y a las plantas en germinación que eliminen o al menos reduzcan significativamente una aplicación adicional de plaguicidas durante el almacenamiento, después de la siembra o después de la emergencia de las plantas. Además resulta deseable optimizar la cantidad del ingrediente activo usado de

manera tal que las semillas y las plantas en germinación estén mejor protegidas contra el ataque por plagas animales, pero sin dañar a la propia planta con el ingrediente activo usado. En particular, los métodos de tratamiento de semillas también deben incorporar las propiedades insecticidas o nematocidas intrínsecas de las plantas transgénicas resistentes a las plagas para lograr una protección óptima de las semillas y también de las plantas en germinación con un costo mínimo de plaguicidas.

Por lo tanto, la presente invención se refiere más particularmente a un método para proteger a las semillas y a las plantas en germinación contra el ataque por plagas mediante el tratamiento de las semillas con uno de los compuestos de la Fórmula (I). El método de acuerdo con la invención para proteger a las semillas y a las plantas en germinación contra una infestación por plagas comprende además un método, en el cual las semillas se tratan simultáneamente en una operación o sucesivamente con un compuesto de la Fórmula (I) y un componente de la mezcla. También comprende un proceso en el cual las semillas se tratan en momentos diferentes con un compuesto de la Fórmula (I) y un componente de la mezcla.

La invención también se refiere al uso de los compuestos de la Fórmula (I) en el tratamiento de semillas para proteger a las semillas y a las plantas resultantes contra plagas animales.

Además, la invención se refiere a semillas que fueron tratadas para lograr una protección contra plagas animales con un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la invención. La invención también se refiere a semillas tratadas al mismo tiempo con un compuesto de la Fórmula (I) y un componente de la mezcla. La invención se refiere además a semillas que fueron tratadas en diferentes momentos con un compuesto de la Fórmula (I) y un componente de la mezcla. En el caso de semillas que han sido tratadas en diferentes momentos con un compuesto de la Fórmula (I) y un componente de la mezcla, las sustancias individuales pueden estar presentes en diferentes capas sobre la semilla. En este caso, las capas que comprenden un compuesto de la Fórmula (I) y los componentes de la mezcla pueden estar separadas opcionalmente por una capa intermedia. La invención también se refiere a semillas a

las cuales se aplica un compuesto de la Fórmula (I) y un componente de mezcla como parte de un recubrimiento o como una capa adicional o como capas adicionales además de un recubrimiento.

Además, la invención se refiere a semillas que, después del tratamiento con un compuesto de la Fórmula (I), son sometidas a un proceso de recubrimiento con película para evitar la abrasión por polvos en la semilla.

Una de las ventajas que se obtiene cuando un compuesto de la Fórmula (I) actúa de forma sistémica es que el tratamiento de las semillas no solo protege a las propias semillas, sino también a las plantas resultantes después de la emergencia contra plagas animales. De esta manera, se puede omitir el tratamiento inmediato del cultivo en el momento de la siembra o poco después.

Otra ventaja es el hecho que al tratar las semillas con un compuesto de la Fórmula (I) se puede promover la germinación y la emergencia de las semillas tratadas.

Asimismo, se considera ventajoso que los compuestos de la Fórmula (I) también se puedan utilizar particularmente en el caso de semillas transgénicas.

Los compuestos de la Fórmula (I) también se pueden usar en combinación con agentes de transducción de señales, por lo cual se produce una mejor colonización con simbiosis tales como rizobios, micorrizas y/o bacterias u hongos endofíticos y/o se produce una fijación de nitrógeno optimizada.

Los compuestos de la Fórmula (I) son adecuados para la protección de semillas de cualquier variedad de plantas utilizadas en la agricultura, en invernadero, en bosques o en la horticultura. En particular, comprenden semillas de cereales (por ejemplo, trigo, cebada, centeno, mijo y avena), maíz, algodón, soja, arroz, papas, girasol, café, tabaco, canola, colza, nabo (por ejemplo, remolacha azucarera y remolacha forrajera), maní, verduras (por ejemplo, tomate, pepino, haba, col, cebolla y lechuga), plantas frutales, césped y plantas ornamentales. De particular importancia es el tratamiento de semillas de cereales (tales como trigo, cebada, centeno y avena), maíz, soja, algodón, canola, colza, verduras y arroz.

Como ya se mencionó precedentemente, el tratamiento de semillas

transgénicas con un compuesto de la Fórmula (I) también es de particular importancia. Estas son las semillas de plantas que por regla general contienen por lo menos un gen heterólogo que controla la expresión de un polipéptido que tiene propiedades insecticidas o nematocidas particulares. Los genes heterólogos en las semillas transgénicas pueden provenir de microorganismos tales como *Bacillus*, *Rhizobium*, *Pseudomonas*, *Serratia*, *Trichoderma*, *Clavibacter*, *Glomus* o *Gliocladium*. La presente invención es de particular utilidad para el tratamiento de semillas transgénicas que contienen por lo menos un gen heterólogo derivado de *Bacillus* sp. Más preferiblemente, se trata de un gen heterólogo derivado de *Bacillus thuringiensis*.

En el contexto de la presente invención el compuesto de la Fórmula (I) se aplica a las semillas. Preferiblemente, la semilla se trata en un estado en el cual es tan estable que no se produce daño durante el tratamiento.. En general, el tratamiento de las semillas se puede efectuar en cualquier momento entre la siembra y la cosecha. Habitualmente, se usan semillas que han sido separadas de las plantas y liberadas de mazorcas, cáscaras, tallos, tegumentos, lana o pulpa. Por ejemplo, se pueden usar semillas que cosechadas, limpias y secas hasta un contenido de humedad que permita su almacenamiento. Como alternativa, se pueden utilizar semillas, que después del secado, por ejemplo, se tratan con agua y luego se secan nuevamente, por ejemplo, por imprimación. En el caso de las semillas de arroz, también es posible utilizar semillas que fueron empapadas, por ejemplo, en agua hasta una determinada etapa del embrión de arroz ("Etapa de paloma de paloma"), que estimula una germinación y una emergencia más uniformes.

Al tratar la semilla, generalmente se debe tener cuidado de que la cantidad del compuesto de la fórmula (I) aplicado a la semilla y/o la cantidad de aditivos adicionales se elija de forma tal que la germinación de la semilla no se vea afectada de forma adversa, o que no se dañe la planta resultante. Eso se debe asegurar particularmente en el caso de compuestos activos que pudieran presentar efectos fitotóxicos a determinadas dosis de aplicación.

En general, los compuestos de la Fórmula (I) se aplican a la semilla en una formulación adecuada. Las formulaciones y los métodos adecuados para el

tratamiento de semillas son conocidos por los especialistas en el arte.

Los compuestos de la Fórmula (I) se pueden convertir en las formulaciones de recubrimiento de semillas habituales, tales como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, espumas, lechadas u otras composiciones de recubrimiento para semillas, y también formulaciones de ULV.

Estas formulaciones se preparan de manera conocida mezclando los compuestos de la Fórmula (I) con aditivos convencionales tales como, por ejemplo, diluyentes y solventes o diluyentes convencionales, colorantes, agentes humectantes, dispersantes, emulsionantes, antiespumantes, conservantes, espesantes secundarios, adhesivos, giberelinas y también el agua.

Los colorantes que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención son todos los colorantes que son comunes para tales efectos. Se pueden utilizar pigmentos, que sean bastante solubles en agua o tinturas que sean solubles en agua. Los ejemplos de los mismos incluyen los colorantes conocidos por los nombres Rodamina B, pigmento rojo 112 C.I. y solvente rojo 1 C.I..

Los agentes humectantes adecuados que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención son todas las sustancias promotoras de humectación convencionales para la formulación de compuestos agroquímicos activos. Preferiblemente se usan alquilnaftalensulfonatos tales como diisopropil o diisobutilnaftalensulfonatos.

Los agentes dispersantes y/o emulsionantes útiles que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semilla que se pueden usar de acuerdo con la invención son todos los dispersantes no iónicos, aniónico y catiónicos que se emplean convencionalmente para la formulación de compuestos agroquímicamente activos. Se prefiere utilizar dispersantes no iónicos o aniónicos o mezclas de dispersantes no iónicos o aniónicos. Los dispersantes no iónicos particularmente adecuados son los polímeros de bloques de óxido de etileno-óxido de propileno, los éteres de alquilfenol poliglicol y los éteres de triestirilfenol poliglicol y sus derivados fosfatados o sulfatados. Los dispersantes aniónicos adecuados comprenden, en

particular, lignosulfonatos, sales de ácido poliacrílico y condensados de arilsulfonato-formaldehído.

Los antiespumantes que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención son todas sustancias inhibidoras de espuma usados convencionalmente para la formulación de compuestos agroquímicos activos. Preferiblemente se pueden usar desespumantes de siliconas y estearato de magnesio.

Los conservantes que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención son todas las sustancias que se pueden usar para tales fines en composiciones agroquímicas. Los ejemplos incluyen diclorfeno y alcohol bencílico hemiformal.

Los espesantes secundarios adecuados que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención son todas las sustancias que se pueden usar para tales fines en composiciones agroquímicas. Preferiblemente, comprenden derivados de celulosa, derivados del ácido acrílico, xantano, arcillas modificadas y sílice finamente dividida.

Los adhesivos que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semilla útiles de acuerdo con la invención son todos los aglutinantes útiles en los productos de recubrimiento de semilla. Preferiblemente comprenden polivinilpirrolidona, acetato de polivinilo, alcohol polivinílico y tisola.

Las giberelinas que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención son preferiblemente las giberelinas A1, A3 (= ácido giberélico), A4 y A7, y se usa particularmente el ácido giberélico. Las giberelinas son conocidas (véase, R. Wegler "Chemie der Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmittel", Bd. 2, Springer Verlag, 1970, páginas 401-412).

Las formulaciones de recubrimiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención se pueden usar directamente o después de una dilución previa con agua para el tratamiento de semillas de diversos tipos. Por ejemplo, los concentrados o las preparaciones que se pueden obtener a partir de las mismas por

dilución con agua se pueden usar para recubrir semillas de cereales, tales como trigo, cebada, centeno, avena y triticale y también semillas de maíz, arroz, colza, arvejas, frijoles, algodón, girasol, semillas de soja y remolachas o una amplia variedad de diferentes semillas vegetales. Las formulaciones de recubrimiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención o sus formas de aplicación diluidas también se pueden usar para recubrir semillas de plantas transgénicas.

Para el tratamiento de semillas con las formulaciones de recubrimiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención o las formas de aplicación preparadas a partir de ellas mediante la adición de agua, se pueden considerar todos los dispositivos de mezclado que normalmente se pueden usar para un recubrimiento. Específicamente, en un procedimiento de recubrimiento de semillas, se debe colocar la semilla en un mezclador, que funciona por lotes o de manera continua, agregar la cantidad deseada particular de las formulaciones de recubrimiento de semilla, sea como tales o después de una dilución previa con agua y mezclar todo hasta que la formulación se distribuya homogéneamente por la semilla. Opcionalmente, le sigue un proceso de secado.

La dosis de aplicación de las formulaciones de recubrimiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención puede variar dentro de un rango relativamente amplio. Depende del contenido particular de los compuestos de la Fórmula (I) en las formulaciones y de las semillas. Las dosis de aplicación del compuesto de la Fórmula (I) generalmente comprenden entre 0,001 y 50 g por kilogramo de semillas, preferiblemente entre 0,01 y 15 g por kilogramo de semillas.

### **Salud animal**

En el campo de la salud animal, es decir, en el campo de la medicina veterinaria, los compuestos de la Fórmula (I) son activos contra parásitos animales, en particular ectoparásitos o endoparásitos. El término endoparásito incluye en particular helmintos y protozoarios, tales como coccidios. Los ectoparásitos son típica y preferentemente artrópodos, en particular insectos y ácaros.

En el campo de la medicina veterinaria, los compuestos de la fórmula (I) son adecuados, con una toxicidad de homeotermia favorable, para controlar parásitos que

se reproducen en animales y en la cría de animal en ganado, animales de zoológicos, de laboratorio, experimentales o mascotas. Son eficaces contra todas las etapas o de desarrollo individual de parásitos.

El ganado agrícola incluye, por ejemplo, mamíferos, tales como ovejas, cabras, caballos, burros, camellos, búfalos, conejos, renos, ciervos y, en particular, ganado y cerdos; o aves de corral tales como pavos, patos, gansos y, en particular, gallinas; peces y crustáceos, por ejemplo, en cultivos acuáticos; y también insectos tales como abejas.

Los animales domésticos incluyen, por ejemplo, mamíferos, tales como hámsteres, cobayos, ratas, ratones, chinchillas, hurones y, en particular, perros, gatos, aves enjauladas, reptiles, anfibios y peces de acuario.

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

De acuerdo con otra forma de realización preferida, los compuestos de la Fórmula (I) se administran a aves, a saber, aves de jaulas y en particular aves de corral.

Al usar los compuestos de la fórmula (I) para controlar parásitos de animales, se pretende reducir o evitar enfermedades, casos de muerte y reducciones del rendimiento (en el caso de carne, leche, lana, pieles, huevos, miel y semejantes), a fin de permitir un mantenimiento más económico y simple y lograr un mejor bienestar para el animal.

El término "control" o "controlar" según se usa en la presente respecto del campo de la salud animal, significa que los compuestos de la fórmula (I) son eficaces para reducir la incidencia del parásito respectivo en un animal infectado con tales parásitos hasta niveles inocuos. Más específicamente, "controlar", según se usa en la presente, significa que el compuesto de la fórmula (I) es eficaz para matar el parásito respectivo, inhibir su crecimiento o inhibir su proliferación.

Los artrópodos incluyen, por ejemplo, en un sentido no taxativo, los siguientes:

el orden Anoplurida, por ejemplo, *Haematopinus* spp, *Linognathus* spp, *Pediculus* spp, *Phtirus* spp, *Solenopotes* spp;

el orden Mallophagida y los subórdenes Amblycerina y Ischnocerina, por ejemplo, *Bovicola* spp, *Damalina* spp, *Felicola* spp; *Lepikentron* spp, *Menopon* spp, *Trichodectes* spp, *Trimenopon* spp, *Trinoton* spp, *Werneckiella* spp;

el orden Diptera y los subórdenes Nematocerina y Brachycerina, por ejemplo, *Aedes* spp, *Anopheles* spp, *Atilotus* spp, *Braula* spp, *Calliphora* spp, *Chrysomyia* spp, *Chrysops* spp, *Culex* spp, *Culicoides* spp, *Eusimulium* spp, *Fannia* spp, *Gasterophilus* spp, *Glossina* spp, *Haematobia* spp, *Haematopota* spp, *Hippobosca* spp, *Hybomitra* spp, *Hydrotaea* spp, *Hypoderma* spp, *Lipoptena* spp, *Lucilia* spp, *Lutzomyia* spp, *Melophagus* spp, *Morellia* spp, *Musca* spp, *Odagmia* spp, *Oestrus* spp, *Philipomyia* spp, *Phlebotomus* spp, *Rhinoestrus* spp, *Sarcophaga* spp, *Simulium* spp, *Stomoxys* spp, *Tabanus* spp, *Tipula* spp, *Wilhelmia* spp, *Wohlfahrtia* spp;

el orden Siphonaptera, por ejemplo *Ceratophyllus* spp, *Ctenocephalides* spp, *Pulex* spp, *Tunga* spp, *Xenopsylla* spp;

el orden Heteroptera, por ejemplo, *Cimex* spp, *Panstrongylus* spp, *Rhodnius* spp, *Triatoma* spp; así como plagas problemáticas o de higiene del orden Blattaria.

Además los artrópodos incluyen, en un sentido no taxativo, los siguientes ácaros:

la subclase Akari (Acarina) y el orden Metastigmata, por ejemplo de la familia Argasidae, tales como *Argas* spp, *Ornithodoros* spp, *Otobius* spp, de la familia Ixodidae, tales como *Amblyomma* spp, *Dermacentor* spp, *Haemaphysalis* spp, *Hyalomma* spp, *Ixodes* spp, *Rhipicephalus* (*Boophilus*) spp, *Rhipicephalus* spp (el género original de garrapatas de múltiples huéspedes); el orden Mesostigmata, tal como *Dermanyssus* spp, *Ornithonyssus* spp, *Pneumonyssus* spp, *Raillietia* spp, *Sternostoma* spp, *Tropilaelaps* spp, *Varroa* spp; el orden Actiniedida (Prostigmata), por ejemplo *Acarapis* spp, *Cheiletiella* spp, *Demodex* spp, *Listrophorus* spp, *Myobia* spp, *Neotrombicula* spp, *Ornithocheiletiella* spp, *Psorergates* spp, *Trombicula* spp; y el orden de Acaridida (Astigmata), por ejemplo *Acarus* spp, *Caloglyphus* spp, *Chorioptes* spp, *Cytodites* spp, *Hypodectes* spp, *Knemidocoptes* spp, *Laminosioptes* spp, *Notoedres* spp, *Otodectes* spp, *Psoroptes* spp, *Pterolichus* spp, *Sarcoptes* spp, *trixacarus* spp, *Tyrophagus* spp

Los ejemplos de protozoos parásitos comprenden, pero en un sentido no taxativo:

Mastigophora (Flagellata), tales como:

Metamonada: el orden Diplomonadida, por ejemplo, Giardia spp, Spironucleus spp

Parabasala: el orden Trichomonadida por ejemplo Histomonas spp, Pentatrichomonas spp, Tetratrichomonas spp, Trichomonas spp, Tritrichomonas spp

Euglenozoa: el orden Trypanosomatida, por ejemplo, Leishmania spp, Trypanosoma spp

Sarcomastigophora (Rhizopoda), tal como Entamoebidae, por ejemplo, Entamoeba spp, Centramoebidae, por ejemplo, Acanthamoeba sp., Euamoebidae, por ejemplo, Hartmanella sp.

Alveolata, tal como, Apicomplexa (Sporozoa): por ejemplo Cryptosporidium spp; el orden Eimeriida, por ejemplo, Besnoitia spp, Cystoisospora spp, Eimeria spp, Hammondia spp, Isospora spp, Neospora spp, Sarcocystis spp, Toxoplasma spp; el orden Adeleida, por ejemplo, Hepatozoon spp, Klossiella spp; el orden Haemosporida, por ejemplo, Leucocytozoon spp, Plasmodium spp; el orden Piroplasmida. por ejemplo. Babesia spp, Ciliophora spp, Echinozoon spp, Theileria spp; el orden Vesiculiferida, por ejemplo, Balantidium spp, Buxtonella spp

Microspora tal como Encephalitozoon spp, Enterocytozoon spp, Globidium spp, Nosema spp, y außerdem, por ejemplo, Myxozoa spp

Los endoparásitos patógenos para humanos o animales, que comprenden Helminths incluyen Helminths, por ejemplo, Acanthocephala, Nematoden, Pentastoma y Platyhelminths (por ejemplo, Monogenea, Cestodes y Trematodes).

Los ejemplos de Helminths incluyen, pero en un sentido no taxativo:

Monogenea: por ejemplo: Dactilogyrus spp, Gyrodactylus spp, Microbothrium spp, Polystoma spp, Troglocephalus spp;

Cestodes: el orden Pseudophyllidea, por ejemplo: Bothridium spp, Diphylobothrium spp, Diplogonoporus spp Ichthyobothrium spp, Ligula spp, Schistocephalus spp, Spirometra spp

El orden Cyclophyllida, por ejemplo: *Andrya* spp, *Anoplocephala* spp, *Avitellina* spp, *Bertiella* spp, *Cittotaenia* spp, *Davainea* spp, *Diorchis* spp, *Diplopilidium* spp, *Dipilidium* spp, *Echinococcus* spp, *Echinocotile* spp, *Echinolepis* spp, *Hydatigera* spp, *Hymenolepis* spp, *Joyeuxiella* spp, *Mesocetoides* spp, *Moniezia* spp, *Paranoplocephala* spp, *Raillietina* spp, *Stilesia* spp, *Taenia* spp, *Thysaniezia* spp, *Thysanosoma* spp

Trematodes: la clase Digenea, por ejemplo: *Austrobilharzia* spp, *Brachylaima* spp, *Calicophoron* spp, *Catantropis* spp, *Clonorchis* spp, *Collyriclum* spp, *Cotilophoron* spp, *Cyclocoelum* spp, *Dicrocoelium* spp, *Diplostomum* spp, *Echinochasmus* spp, *Echinoparyphium* spp, *Echinostoma* spp, *Eurytrema* spp, *Fasciola* spp, *Fasciolides* spp, *Fasciolopsis* spp, *Fischkoederius* spp, *Gastrothylacus* spp, *Gigantobilharzia* spp, *Gigantocotile* spp, *Heterophyes* spp, *Hypoderaeum* spp, *Leucochloridium* spp, *Metagonimus* spp, *Metorchis* spp, *Nanophyetus* spp, *Notocotylus* spp, *Opisthorchis* spp, *Ornithobilharzia* spp, *Paragonimus* spp, *Paramphistomum* spp, *Plagiorchis* spp, *Posthodiplostomum* spp, *Prosthogonimus* spp, *Schistosoma* spp, *Trichobilharzia* spp, *Trogloremia* spp, *Typhlocoelum* spp

Nematodos: el orden Trichinellida, por ejemplo: *Capillaria* spp, *Trichinella* spp, *Trichomosoides* spp, *Trichuris* spp

El orden Tilenchida, por ejemplo: *Micronema* spp, *Parastrangiloides* spp, *Strongiloides* spp

El orden Rhabditina por ejemplo: *Aelurostrongylus* spp, *Amidostomum* spp, *Ancilostoma* spp, *Angiostrongylus* spp, *Bronchonema* spp, *Bunostomum* spp, *Chabertia* spp, *Cooperia* spp, *Cooperioides* spp, *Crenosoma* spp, *Cyathostomum* spp, *Cyclococercus* spp, *Cyclodontostomum* spp, *Cilicocycclus* spp, *Cilicostephanus* spp, *Cilindropharynx* spp, *Cystocaulus* spp, *Dictyocaulus* spp, *Elaphostrongylus* spp, *Filaroides* spp, *Globocephalus* spp, *Graphidium* spp, *Gyallocephalus* spp, *Haemonchus* spp, *Heligmosomoides* spp, *Hyostrongylus* spp, *Marshallagia* spp, *Metastrongylus* spp, *Muellerius* spp, *Necator* spp, *Nematodirus* spp, *Neostrongylus* spp, *Nippostrongylus* spp, *Obeliscoides* spp, *Oesophagodontus* spp, *Oesophagostomum* spp, *Ollulanus* spp; *Ornithostrongylus* spp, *Oslerus* spp, *Ostertagia* spp, *Paracooperia* spp,

Paracrenosoma spp, Parafilaroides spp, Parelaphostrongylus spp, Pneumocaulus spp, Pneumostongylus spp, Poterostomum spp, Protostrongylus spp, Spicocaulus spp, Stephanurus spp, Strongylus spp, Syngamus spp, Teladorsagia spp, Trichonema spp, Trichostrongylus spp, Triodontophorus spp, Troglotstrongylus spp, Uncinaria spp

El orden Spirurida, por ejemplo: Acanthocheilonema spp, Anisakis spp, Ascaridia spp; Ascaris spp, Ascarops spp, Aspiculuris spp, Bailisascaris spp, Brugia spp, Cercopithifilaria spp, Crassicauda spp, Dipetalonema spp, Dirofilaria spp, Dracunculus spp; Draschia spp, Enterobius spp, Filaria spp, Gnathostoma spp, Gongylonema spp, Habronema spp, Heterakis spp; Litomosoides spp, Loa spp, Onchocerca spp, Oxiuris spp, Parabronema spp, Parafilaria spp, Parascaris spp, Passalurus spp, Physaloptera spp, Probstmayria spp, Pseudofilaria spp, Setaria spp, Skjrabinema spp, Spirocerca spp, Stephanofilaria spp, Strongyluris spp, Syphacia spp, Thelazia spp, Toxascaris spp, Toxocara spp, Wuchereria spp

Acanthocephala: el orden Oligacanthorhynchida, tales como: Macracanthorhynchus spp, Prosthenorchis spp; el orden Moniliformida, por ejemplo: Moniliformis spp,

El orden Polymorphida, por ejemplo: Filicollis spp; el orden Echinorhynchida, por ejemplo, Acanthocephalus spp, Echinorhynchus spp, Leptorhynchoides spp

Pentastoma: el orden Porocephalida, por ejemplo, Linguatula spp

En el campo veterinario y para el mantenimiento de animales, la administración de los compuestos de la fórmula (I) se lleva a cabo mediante procedimientos conocidos en general en el arte, tales como de forma entérica, parenteral, dérmica o nasal en la forma de preparaciones adecuadas. La administración se puede llevar a cabo profiláctica, metafiláctica o terapéuticamente.

Por lo tanto, una Forma de realización de la presente invención se refiere a los compuestos de la Fórmula (I) para su uso como un medicamento.

Un aspecto adicional se refiere al uso de un compuesto de la fórmula (I) como un agente antiendoparasitario.

Otro aspecto específico de la invención se refiere a los compuestos de la fórmula (I) para usar como agentes antihelmínticos, en particular para usar como

nematicida, platihelminticidas, acantocefalidas o pentastomicidas.

Otro aspecto específico de la invención se refiere a los compuestos de fórmula (I) para uso como antiprotozoarios.

Otro aspecto se refiere a los compuestos de fórmula (I) para usar como antiectoparásitos, en particular un artropodocida, más particularmente un insecticida o un acaricida.

Otros aspectos de la invención comprenden formulaciones veterinarias que incluyen una cantidad eficaz de por lo menos un compuesto de fórmula (I) y por lo menos uno de los siguientes: un excipiente farmacéuticamente aceptable (por ejemplo, diluyentes sólidos o líquidos), un adyuvante farmacéuticamente aceptable (por ejemplo, agentes tensioactivos), en especial un excipiente farmacéuticamente aceptable utilizado convencionalmente en las formulaciones veterinarias, y/o un adyuvante farmacéuticamente aceptable utilizado convencionalmente en las formulaciones veterinarias.

Un aspecto relacionado de la invención es un método para preparar una formulación veterinaria descrita en la presente que comprende el paso de mezclar por lo menos un compuesto de fórmula (I) con excipientes y/o adyuvantes farmacéuticamente aceptables, en especial los excipientes farmacéuticamente aceptables usados convencionalmente en las formulaciones veterinarias; o utilizados convencionalmente en las formulaciones fitoveterinarias.

Otro aspecto especial de las formulaciones veterinarias de la invención seleccionados del grupo de formulaciones ectoparasitocidas y endoparasitocidas, en particular seleccionados del grupo de formulaciones antihelmínticos, antiprotozoarios y artropodocidas, especialmente seleccionados del grupo de formulaciones nematicidas, platihelminticidas, acantocefalidas, pentastomicidas, insecticidas y acaricidas de acuerdo los aspectos mencionados, así como métodos para su elaboración.

Otro aspecto se refiere a un método para el tratamiento de una infección parasitaria, en particular una infección por un parásito seleccionado del grupo de ectoparásitos y endoparásitos mencionados en la presente, mediante la aplicación de una cantidad eficaz de un compuesto de la Fórmula (I) en un animal, en particular un

animal no humano, que lo necesita.

Otro aspecto se refiere a un método para el tratamiento de una infección parasitaria, en particular una infección por un parásito seleccionado del grupo de ectoparásitos y endoparásitos mencionados en la presente, mediante la aplicación de una composición definida como una formulación veterinaria en un animal, particularmente un animal no humano, que lo necesita.

Otro aspecto se refiere al uso de los compuestos de la Fórmula (I) en el tratamiento de infecciones parasitarias, en especial una infección por un parásito seleccionado del grupo de ectoparásitos y endoparásitos mencionados en la presente, en un animal, en particular un animal no humano.

En el presente contexto de salud veterinaria o medicina veterinaria, el término "tratamiento" incluye un tratamiento profiláctico, metafiláctico y terapéutico.

En una forma de realización particular, se proveen mezclas de por lo menos un compuesto de la Fórmula (I) con otros ingredientes activos, en especialmente endo y ectoparasitocidas, para el campo veterinario.

En el campo de la salud animal, una "mezcla" no solo significa que dos (o más) ingredientes activos diferentes se formulan en una única formulación y se usan juntos, sino que también se refiere a productos que comprenden formulaciones separadas para cada ingrediente activo. Por consiguiente, si se van a usar más de dos medicamentos, todos los medicamentos se pueden formular en una única formulación o todos los medicamentos se pueden formular en formulaciones separadas; también se conciben formas mixtas en las cuales algunos de los ingredientes activos se formulan juntos y algunos de los ingredientes activos se formulan por separado. Las formulaciones separadas permiten el uso separado o sucesivo de los compuestos activos en cuestión.

Los compuestos activos especificados en la presente por sus "nombres comunes" son conocidos y se describen, por ejemplo, en "Pesticide Manual" (véase antes) o se pueden buscar en Internet (por ejemplo en <http://www.alanwood.net/pesticides>).

Los ejemplos de agentes del grupo de ectoparasitocidas como componentes de

la composición incluyen, pero en un sentido no taxativo, los insecticidas y los acaricidas descritos precedentemente. A continuación se enumeran otros agentes útiles de acuerdo con la clasificación mencionada precedentemente basada en el esquema actual de clasificación de modo de acción de IRAC: (1) inhibidores de acetilcolinesterasa (AChE); (2) bloqueantes de los canales de cloruro controlados por GABA; (3) moduladores de los canales de sodio; (4) moduladores competitivos del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR); (5) moduladores alostéricos del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR); (6) moduladores alostéricos del canal de cloruro dependiente de glutamato (GluCl); (7) miméticos de hormonas juveniles; (8) diversos inhibidores no específicos (sitios múltiples); (9) moduladores de órganos cordotonaes; (10) inhibidores del crecimiento de ácaros; (12) inhibidores de la ATP sintasa mitocondrial, como los interruptores de ATP; (13) desacoplamiento de la fosforilación oxidativa mediante interrupción del gradiente de protones; (14) bloqueante del canal del receptor nicotínico de acetilcolina; (15) inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 0; (16) inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 1; (17) interruptor de la muda (en especial en dípteros, es decir, Diptera); (18) agonistas del receptor de ecdisona; (19) agonistas del receptor de octopamina; (21) inhibidores del transporte de electrones del complejo mitocondrial I; (25) inhibidores del transporte de electrones del complejo mitocondrial II; (20) inhibidores del transporte de electrones del complejo mitocondrial III; (22) bloqueante del canal de sodio dependiente de voltaje; (23) inhibidores de la acetil-CoA carboxilasa; (28) moduladores del receptor de rianodina;

Los compuestos activos con mecanismos desconocidos o no específicos tales como fentrifanilo, fenoxacrim, ciclopreno, clorobencilato, clordimeform, flubenzimina, diciclanilo, amidoflumet, quinometionat, triarateno, clotiazoben, tetrasul, oleato de potasio, petróleo, metoxadiazona, gossiplure, flutenzina, bromopropilato, criolita;

Los compuestos de las otras clases, por ejemplo, butacarb, dimetilán, cloetocarb, fosfocarb, pirimifos (etilo), paratión (-etilo), metacrifos, o-salicilato de isopropilo, triclorfón, tigolaner, sulprofos, propafos, sebufos, piridatión, protoato, diclofentión, demetón-S-metilsulfona, isazofos, cianofenfos, dialifor, carbofenotión, autatíofos, aromfenvinfos (-metilo), azinfos (etilo), clorpirifos (etilo), fosmetilán,

iodofenfos, dioxabenzofos, formotión, fonofos, flupirazofos, fensulfotión, etrimfos;

Los compuestos organoclorados, por ejemplo, canfecloro, lindano, heptacloro; o fenilpirazol, por ejemplo acetoprol, oirafluprol, piriprol, vaniliprol, sisapronilo; o isoxazolina, por ejemplo sarolaner, afoxolaner, lotilaner, fluralaner;

Los piretroides tales como, por ejemplo, (cis, trans) metoflutrina, proflutrina, flufenprox, flubrocitrinat, fubfenprox, fenflutrina, protrifenbut, piresmetrina, RU15525, teraletrina, cis-resmetrina, heptaflutrina, bioetanmetrina, biopermetrina, fenpiritrina, cis-cipermetrina, cis-permetrina, clocitrina, cihalotrina ( $\lambda$ ), clovaportrina o compuestos de hidrocarburos halogenados (HCH),

Neonicotinoides, por ejemplo nitiazina

dicloromezotiaz, triflumezopirim

lactonas macrocíclicas, por ejemplo, nemadectina, ivermectina, latidectina, moxidectina, selamectina, eprinomectina, doramectina, benzoato de emamectina; milbemicina-oxima

triprén, epofenonano, diofenolano;

Productos biológicos, hormonas o feromonas, por ejemplo, productos naturales, por ejemplo, turingiensina, codlemona o componentes de Neem

dinitrofenoles, por ejemplo dinocap, dinobutón, binapacrilo;

Bencilureas, por ejemplo fluazurón, penflurón,

Derivados de amidina, por ejemplo, cloromebuform, cimiazol, demiditraz

Acaricidas para ácaros Varroa, por ejemplo ácidos orgánicos, por ejemplo ácido fórmico, ácido oxálico.

Los ejemplos de ingredientes activos del grupo de los endoparasiticidas, como componentes de mezcla incluyen, pero en un sentido no taxativo, agentes antihelmínticos y agentes antiprotozoarios.

Los agentes antihelmínticos incluyen, pero en un sentido no taxativo, los siguientes ingredientes activos nematocidas, trematocidas y/o cestocidas:

de la clase de las lactonas macrocíclicas, por ejemplo: eprinomectina, abamectina, nemadectina, moxidectina, doramectina, selamectina, lepimectina, latidectina, milbemectina, ivermectina, emamectina, milbemicina;

de la clase de los benzimidazoles y probenzimidazoles, por ejemplo: oxibendazol, mebendazol, triclabendazol, tiofanat, parbendazol, oxfendazol, netobimina, fenbendazol, febantel, tiabendazol, ciclobendazol, cambendazol, albendazol-sulfóxido, albendazol, flubendazol;

de la clase de los depsipéptidos, preferiblemente depsipéptidos cíclicos, en particular los depsipéptidos cíclicos de 24 miembros, por ejemplo: emodepsida, PF1022A;

de la clase de tetrahidropirimidina, por ejemplo: morantel, pirantel, oxantel;

de la clase de imidazotiazoles, por ejemplo: butamisol, levamisol, tetramisol;

de la clase de las aminofenilamidinas, por ejemplo: amidantel, amidantel desacilado (dAMD), tribendimidina;

de la clase de los aminoacetonitrilos, por ejemplo: Monepantel;

de la clase de parahercuamidas, por ejemplo: parahercuamida, derquantel;

de la clase de las salicilanilidas, por ejemplo: tribromsalán, bromoxanida, brotiana, clioxanida, closantel, niclosamida, oxiclozanida, rafoxanida;

de la clase de los fenoles sustituidos, por ejemplo: nitroxinilo, bitionol, disofenol, hexaclorofeno, niclofolán, meniclofolán;

de la clase de los organofosfatos, por ejemplo: triclorofona, naftalofos, diclorovos/DDVP, crufomat, coumafos, haloxona;

de la clase de piperazinona/quinolina, por ejemplo: praziquantel, epsiprantel;

de la clase de las piperazinas, por ejemplo: piperazina, hidroxizina;

de la clase de tetraciclinas, por ejemplo: tetraciclina, clorotetraciclina, doxiciclina, oxitetraciclina, rolitetraciclina;

de varias otras clases, por ejemplo: bunamidina, niridazol, resorantel, omfalotina, oltipraz, nitroscanato, nitroxinilo, oxamniquina, mirasán, miracilo, lucantona, hicantón, hetolina, emetina, dietilcarbamazina, diclorofeno, diamfenetida, clonazepam, befenio, amoscanat, clorsulón.

Los agentes antiprotozoarios, incluyen, pero no limitado a, los siguientes ingredientes activos:

de la clase de triazinas por ejemplo: diclazurilo, ponazurilo, letrazurilo,

toltrazurilo;

la clase de los polileterionóforos, por ejemplo: monensina, salinomicina, maduramicina, narasina;

de la clase de las lactonas macrocíclicas que incluyen, por ejemplo: milbemicina, eritromicina;

de la clase de las quinolonas, por ejemplo: enrofloxacin, pradofloxacin;

de la clase de las quininas, por ejemplo: cloroquina;

de la clase de las pirimidinas, por ejemplo: pirimetamina;

de la clase de las sulfonamidas, por ejemplo: sulfaquinoxalina, trimetoprim, sulfaclozina;

de la clase de las tiaminas, por ejemplo: amprolio;

de la clase de las lincosamidas, por ejemplo: clindamicina;

de la clase de las carbanilidas, por ejemplo: imidocarb;

de la clase de los nitrofuranos, por ejemplo: nifurtimox;

de la clase de los alcaloides quinazolinona, por ejemplo: halofuginona;

de varias otras clases, por ejemplo: oxamniquina, paromomicina;

de la clase de las vakzinas o antígenos de microorganismos, por ejemplo: Babesia canis rossi, Eimeria tenella, Eimeria praecox, Eimeria necatrix, Eimeria mitis, Eimeria maxima, Eimeria brunetti, Eimeria acervulina, Babesia canis vogeli, Leishmania infantum, Babesia canis canis, Dictyocaulus viviparus.

Además, si se puede basado en sus grupos funcionales, todos dichos componentes de mezcla opcionalmente pueden formar sales con bases o ácidos adecuados.

### **Control de vectores**

Los compuestos de la Fórmula (I) también se pueden utilizar en el control de vectores. A efectos de la presente invención, un vector es un artrópodo, en particular un insecto o un arácnido, capaz de transmitir patógenos tales como, por ejemplo, virus, gusanos, organismos unicelulares y bacterias desde un depósito (planta, animal, humano, etc.) a un huésped. Los patógenos se pueden transmitir mecánicamente (por ejemplo, tracoma causada por moscas que no pican) a un huésped o mediante

inyección (por ejemplo, parásitos de la malaria transmitidos por mosquitos) en un huésped.

Los ejemplos de vectores y las enfermedades o patógenos que transmiten son:

1) Mosquitos

- Anopheles: malaria, filariasis;

- Culex: encefalitis japonesa, filariasis, otras enfermedades virales, transmisión de otros gusanos;

- Aedes: fiebre amarilla, fiebre del dengue, otras enfermedades virales, filariasis;

- Simulien: transmisión de gusanos, en particular de *Onchocerca volvulus*;

- Psychodidae: transmisión de la leishmaniasis

2) Piojos: infecciones de piel, tifus epidémica;

3) Pulgas: peste, tifus endémico, tenias;

4) Moscas: enfermedad del sueño (trypanosomiasis); cólera, otras enfermedades bacterianas;

5) Ácaros: acariosis, tifus epidémica, rickettsiosis, tularemia, encefalitis de San Luis, encefalitis transmitida por garrapatas (TBE), fiebre hemorrágica de Crimea-Congo, borreliosis;

6) Garrapatas: borreliosis tales como por *Borrelia duttoni*, *Borrelia duttoni*, meningoencefalitis transmitida por garrapatas, fiebre Q (*Coxiella burnetii*), babesiosis (*Babesia canis canis*), erliquiosis.

Los ejemplos de vectores a los efectos de la presente invención comprenden insectos, por ejemplo áfidos, moscas, cigarras o trips, que pueden transmitir virus de plantas a plantas. Otros vectores que pueden transmitir virus de plantas son ácaros araña, piojos, escarabajos y nematodos.

Los ejemplos adicionales de vectores a efectos de la presente invención comprenden insectos y arácnidos tales como mosquitos, en particular del género *Aedes*, *Anopheles*, por ejemplo *A. gambiae*, *A. arabiensis*, *A. funestus*, *A. dirus* (malaria) y *Culex*, piojos, polillas, moscas, ácaros y garrapatas que pueden transmitir patógenos a animales y/o a humanos.

El control de vectores también es posible si los compuestos de la fórmula (I) logran vencer la resistencia.

Los compuestos de la Fórmula (I) son adecuados para usar en la prevención de enfermedades y/o de patógenos que son transmitidos por vectores. Por lo tanto, un aspecto adicional de la presente invención comprende el uso de los compuestos de la fórmula (I) para el control de vectores, por ejemplo en la agricultura, horticultura, en jardines e instalaciones de recreación y también en la protección de materiales y de productos almacenados.

### **Protección de materiales industriales**

Los compuestos de la fórmula (I) son adecuados para proteger materiales industriales contra un ataque o destrucción por insectos, por ejemplo, del orden Coleoptera, Hymenoptera, Isoptera, Lepidoptera, Psocoptera y Zygentoma.

Los materiales industriales se refieren, en el contexto de la presente, a materiales inertes, preferiblemente tales como plásticos, adhesivos, pegamentos, papeles y cartones, cuero, madera, productos del procesamiento de maderas y pinturas. Se prefiere particularmente el uso de la invención en la protección de maderas.

En una forma de realización adicional, los compuestos de la Fórmula (I) se usan juntos con por lo menos un insecticida adicional y/o por lo menos un fungicida adicional.

En una forma de realización adicional, los compuestos de la Fórmula (I) están presentes como un agente de control de plagas listo para usar, es decir, se pueden aplicar al material de interés sin modificaciones adicionales. Los insecticidas o fungicidas adicionales adecuados comprenden, en particular, los que se mencionaron precedentemente.

Sorprendentemente, también se encontró que los compuestos de la fórmula (I) se pueden utilizar para proteger contra contaminaciones a los objetos que pueden estar en contacto con agua salada o agua salobre, en particular, cascos, pantallas, redes, estructuras edilicias, amarraderos y sistemas de señalización. Asimismo, los compuestos de la fórmula (I), solos o en combinaciones con otros compuestos activos,

se pueden usar como agentes anticontaminantes.

### **Control de plagas animales en el sector de la higiene**

Los compuestos de la Fórmula (I) son adecuados para controlar plagas de animales en el sector de la higiene. En particular, la invención se puede utilizar en la protección del sector doméstico, en el sector de la higiene y en la protección de productos almacenados, en especial para controlar los insectos, arácnidos y ácaros que se pueden encontrar en espacios cerrados tales como viviendas, fábricas, oficinas, cabinas de vehículos. Para controlar las plagas de animales, los compuestos de la fórmula (I) se usan solos o en combinación con otros compuestos activos y/o agentes auxiliares. Preferiblemente, se usan en productos insecticidas para el hogar. Los compuestos de la fórmula (I) son eficaces contra especies sensibles y resistentes, y contra todas las etapas del desarrollo.

Estas plagas incluyen, por ejemplo, plagas de la clase Arachnida, de las órdenes Scorpiones, Araneae y Opiliones, de las clases Chilopoda y Diplopoda, de la clase Insecta del orden Blattodea, del orden Coleoptera, Dermaptera, Diptera, Heteroptera, Hymenoptera, Isoptera, Lepidoptera, Phthiraptera, Psocoptera, Saltatoria u Orthoptera, Siphonaptera y Zygentoma y de la clase Malacostraca del orden Isopoda.

Se aplican, por ejemplo, en aerosoles, productos de pulverización no presurizados, por ejemplo, pulverizadores de bomba o atomizadores, sistemas de niebla automáticos, nebulizadores, espumas, geles, productos para evaporadores con tabletas de evaporación que son de celulosa o plástico, evaporadores líquidos, evaporadores de gel y de membrana, evaporadores impulsados por propulsores, sistemas de evaporación libres de energía o pasivos, papel contra polillas, bolsas contra polillas y geles contra polillas, así como gránulos o polvos, en cebos para esparcir o en estaciones de cebos.

### **Ejemplos de preparación:**

#### Determinaciones analíticas

La ejecución de las determinaciones analíticas que se describen a continuación se refiere a la descripción completa de todo el documento, a menos que la realización de dicha determinación analítica en el respectivo pasaje del texto se describa por separado.

#### Espectrometría de masas

La determinación de  $[M+H]^+$  o  $M^-$  por LC-MS en condiciones cromatográficas ácidas se realizó con 1 ml de ácido fórmico por litro de acetonitrilo y 0,9 ml de ácido fórmico por litro de agua Millipore como eluyente. Se usó una columna Zorbax Eclipse Plus C18 de 50 mm \* 2,1 mm, 1,8  $\mu$ m, a una temperatura de horno de 55 °C.

#### Instrumentos:

LC-MS3: Equipo Waters UPLC con espectrómetro de masa SQD2 y muestreador automático SampleManager. Gradiente lineal de 0,0 a 1,70 minutos de 10% de acetonitrilo a 95% de acetonitrilo, de 1,70 a 2,40 minutos de flujo constante de 95% de acetonitrilo, velocidad de flujo de 0,85 ml/min.

LC-MS6 y LC-MS7: Equipo Agilent 1290 LC, Espectrómetro de masa Agilent MSD, muestreador automático HTS PAL. Gradiente lineal de 0,0 a 1,80 minutos de 10% de acetonitrilo a 95% de acetonitrilo, de 1,80 a 2,50 minutos de flujo constante de 95% de acetonitrilo, velocidad de flujo de 1,0 ml/min.

La determinación de  $[M+H]^+$  por LC-MS en condiciones cromatográficas neutras se llevó a cabo con acetonitrilo y agua Millipore con carbonato de amonio 79 mg/l como eluyente.

#### Instrumentos:

LC-MS4: Equipo Waters IClass Acquity con espectrómetro de masa QDA y muestreador automático FTN (columna Waters Acquity, 1,7  $\mu$ m, 50 mm \* 2,1 mm, temperatura del horno de la columna de 45 °C). Gradiente lineal de 0,0 a 2,10 minutos de 10% de acetonitrilo a 95% de acetonitrilo, de 2,10 a 3,00 minutos de flujo constante de 95% de acetonitrilo, velocidad de flujo de 0,7 ml/min.

LC-MS5: Sistema Agilent 1100 LC con espectrómetro de masa MSD y muestreador automático HTS PAL (columna: Zorbax XDB C18, 1,8  $\mu\text{m}$ , 50 mm \* 4,6 mm, temperatura del horno de la columna de 55 °C). Gradiente lineal de 0,0 a 4,25 minutos de 10% de acetonitrilo a 95% de acetonitrilo, de 1,70 a 4,25 minutos de flujo constante de 95% de acetonitrilo, velocidad de flujo de 2,00 ml/min.

Los índices de tiempos de retención se determinaron en todos los casos a partir de una medición de calibración de una serie homóloga de alcan-2-onas de 3 a 16 carbonos de cadena lineal, donde el índice de la primera alcanona se fijó en 300, la última en 1600 y las alcanonas consecutivas se interpolaron linealmente entre dichos valores.

Las mediciones de los espectros de  $^1\text{H}$ -RMN se efectuaron con un espectrómetro Bruker Avance III 400 MHz, equipado con una sonda TCI de 1,7 mm, usando tetrametilsilano como estándar (0,00 ppm) de las soluciones en los solventes  $\text{CD}_3\text{CN}$ ,  $\text{CDCl}_3$  o  $d_6$ -DMSO. Como alternativa, para realizar las mediciones se usó un espectrómetro Bruker Avance III 600 MHz equipado con una sonda CPNMP de 5 mm o un espectrómetro Bruker Avance NEO 600 MHz equipado con una sonda TCI de 5 mm. Como regla general, las mediciones se realizaron a una temperatura de sonda de 298 K. Si se utilizaban otras temperaturas de medición, los resultados se anotaron por separado.

#### Métodos del listado de picos de RMN

Los datos de  $^1\text{H}$ -RMN de ejemplos seleccionados se muestran en la forma de listas de picos de  $^1\text{H}$ -RMN. Para cada pico de señal, primero se indica el valor  $\delta$  en ppm y luego la intensidad de la señal entre paréntesis. Los diferentes pares de valores  $\delta$  – intensidad de la señal se enumeran separados por punto y coma.

Por lo tanto, la lista de los picos de señal de un Ejemplo toma la siguiente forma:

$\delta_1$  (Intensidad<sub>1</sub>);  $\delta_2$  (Intensidad<sub>2</sub>);.....;  $\delta_i$  (Intensidad<sub>i</sub>);.....;  $\delta_n$  (Intensidad<sub>n</sub>)

La intensidad de las señales nítidas se correlaciona con la altura de las señales en una representación impresa de un espectro de  $^1\text{H}$ -RMN en cm y muestra las relaciones reales entre las intensidades de la señal. En el caso de señales amplias, se

observan y consideran varios picos o se considera el centro de las señales (señal central) y su intensidad relativa en comparación con la señal más intensa del espectro.

Para calibrar el desplazamiento químico de los espectros de  $^1\text{H}$ -RMN, se usa tetrametilsilano o el desplazamiento químico del solvente si la sonda no contiene tetrametilsilano. Por lo tanto, el listado de picos de  $^1\text{H}$ -RMN puede contener al pico de tetrametilsilano.

Los listados de picos de  $^1\text{H}$ -RMN son equivalentes a las representaciones clásicas de  $^1\text{H}$ -RMN y por lo tanto en general contienen todos los picos que se enumeran en una interpretación clásica de  $^1\text{H}$ -RMN.

Además, Además, pueden indicar, al igual que las representaciones clásicas de  $^1\text{H}$ -RMN, señales de solventes, señales de los estereoisómeros de los compuestos de interés, que también constituyen un objeto de la invención, y/o mostrar picos de impurezas.

Las señales de solvente de RMN, el pico de tetrametilsilano y la señal de agua en el solvente respectivo se excluyen de la calibración de intensidad relativa, porque los valores de intensidad indicados para ellos pueden ser muy altos.

Los picos de los (estéreo)isómeros de los compuestos de acuerdo con la invención y/o los picos de impurezas habitualmente tienen en promedio una intensidad más baja que los picos de los compuestos de acuerdo con la invención (por ejemplo, con una pureza > 90%).

Dichos estereoisómeros y/o impurezas pueden ser típicos del proceso de preparación particular. Por consiguiente, sus picos pueden ayudar a identificar la replicabilidad del proceso de preparación en cuestión por medio de “huellas dactilares de subproductos”.

El especialista que calcula los picos de los compuestos de acuerdo con la invención utilizando métodos conocidos (MestreC, simulación ACD, pero también con valores esperados evaluados empíricamente) puede, según necesidad, identificar los picos de los compuestos de acuerdo con la invención, utilizando opcionalmente filtros de intensidad adicionales. Esta identificación es equivalente al listado de picos relevantes de la interpretación clásica de  $^1\text{H}$  NMR.

El solvente usado se puede ver en el archivo JCAMP en el parámetro "solvente", la frecuencia de medición del espectrómetro en la "frecuencia de observación" y el modelo del espectrómetro en "espectrómetro/sistema de datos".

Los datos de  $^{13}\text{C}$ -RMN se proveen como análogos de los datos de  $^1\text{H}$ -RMN en la forma de listados de picos de  $^{13}\text{C}$ -RMN de banda ancha desacoplados. Nuevamente, las señales de solvente y de tetrametilsilano de RMN se eliminan de la calibración de la intensidad relativa porque pueden tener señales de intensidad muy altas.

Se pueden consultar más detalles sobre los picos de  $^1\text{H}$ -RMN en: "Citation of NMR Peaklist Data within Patent Applications" en la base de datos *Research Disclosure Database* con el N° 564025.

#### Valores de logP

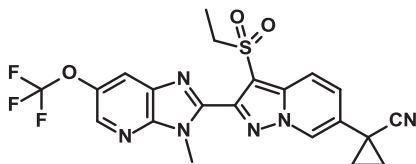
La determinación de los valores de logP se llevó a cabo de acuerdo a EEC Directive 79/831 Annex V.A8 mediante HPLC (cromatografía líquida de alto rendimiento) en una columna de fase reversa (C18) utilizando los siguientes métodos:

<sup>[a]</sup> El valor de logP se determina mediante medida por LC-UV en un rango ácido, con 0,9 ml/l de ácido fórmico en agua y 1,0 ml/l de ácido fórmico en acetonitrilo como eluyente (gradiente lineal entre 10% de acetonitrilo y 95% de acetonitrilo).

<sup>[b]</sup> El valor de logP se determina mediante medida por LC-UV en un rango neutro, con 79 mg/l de carbonato de amonio en agua y acetonitrilo como eluyente (gradiente lineal entre 10% acetonitrilo y 95% de acetonitrilo).

La calibración se llevó a cabo con una serie de homólogos de alcan-2-onas de cadena lineal (con entre 3 y 16 átomos de carbono) con valores conocidos de logP. Los valores entre alcanonas consecutivas se determinan mediante regresión lineal.

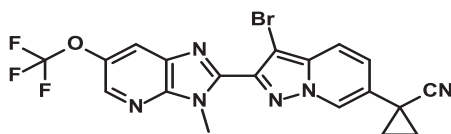
#### **1-[3-Etilsulfonil-2-[3-metil-6-(trifluorometoxi)imidazo[4,5-b]piridin-2-il]pirazolo[1,5-a]piridin-6-il]ciclopropanocarbonitrilo (I-1)**



Se disolvieron 350,0 mg (0,73 mmol) de 1-[3-bromo-2-[3-metil-6-(trifluorometoxi)imidazo[4,5-b]piridin-2-il]pirazolo[1,5-a]piridin-6-il]ciclopropanocarbonitrilo, 851,6 mg (7,33 mmol) de etanosulfonato de sodio y 21,0 mg (0,11 mmol) de ioduro de cobre (I) en 16 ml de N,N-dimetilformamida en un sintetizador de microondas (Anton Paar, Monowave 400) agitando durante 12 h a 120°C. Subsiguientemente la mezcla de reacción se mezcló con una solución de cloruro de sodio y se extrajo tres veces con acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato de sodio y subsiguientemente se extrajo el solvente por destilación al vacío. El residuo se purificó por medio de cromatografía en columna mediante HPLC preparativa con un gradiente de agua / acetonitrilo como eluyente.

logP (ácido): 3,18;  $MH^+$ : 491;  $^1H$ -RMN (400 MHz,  $D_6$ -dMSO)  $\delta$  ppm: 9,12 (s, 1H), 8,64 (s, 1H), 8,44 (s, 1 H), 8,18 (d, 1H), 7,86 (d, 1H), 4,00 (s, 3H), 3,81 (q, 2H), 1,81-1,85 (m, 2H), 1,72-1,75 (m, 2H), 1,23 (t, 3H).

**1-[3-Bromo-2-[3-metil-6-(trifluorometoxi)imidazo[4,5-b]piridin-2-il]pirazolo[1,5-a]piridin-6-il]ciclopropanocarbonitrilo**

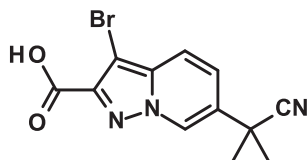


Se agregaron 200 mg (0,96 mmol) de N2-metil-5-(trifluorometoxi)piridin-2,3-diamina y 369 mg (1,20 mmol) de ácido 3-bromo-6-(1-cianociclopropil)pirazolo[1,5-a]piridin-2-carboxílico en piridina (5 mL). Se agregaron 185 mg (0,96 mmol) de EDCI y la mezcla se agitó durante 16 h a temperatura ambiente. Se extrajo el solvente por destilación, se diluyó el residuo con agua y se extrajo con acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato de sodio y se extrajo el solvente bajo presión reducida. El residuo se agitó en 5 ml de ácido acético durante 8 h a 100°C. Subsiguientemente se eliminó el solvente por destilación, se diluyó residuo con agua, se filtró y se lavó con agua.

logP (ácido): 3,90;  $MH^+$ : 477;  $^1H$ -RMN (400 MHz,  $D_6$ -dMSO)  $\delta$  ppm: 8,96 (s,

1H), 8,59 (s, 1H), 8,42 (s, 1 H), 7,80 (d, 1H), 7,56 (d, 1H), 4,16 (s, 3H), 1,78-1,82 (m, 2H), 1,69-1,72 (m, 2H).

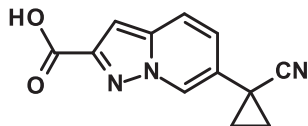
**Ácido 3-bromo-6-(1-cianociclopropil)pirazolo[1,5-a]piridin-2-carboxílico**



Se disolvieron 1,00 g (4,40 mmol) de ácido 6-(1-cianociclopropil)pirazolo[1,5-a]piridin-2-carboxílico y 0,862 g (4,84 mmol) de N-bromosuccinimida bajo argón a 0°C en 200 ml de cloroformo y se agitaron durante 1 h a 0°C. Subsiguientemente la mezcla de reacción se mezcló con agua, se separó la fase orgánica, se secó sobre sulfato de sodio, se filtró y se extrajo el solvente por destilación al vacío.

logP (ácido): 1,55;  $MH^+$ : 306;  $^1H$ -RMN (400 MHz, DMSO- $d_6$ ):  $\delta$  13,48 (s, 1H), 8,86 (s, 1H), 7,72 (d, 1H), 7,49 (d, 1H), 1,76-1,79 (m, 2H), 1,64-1,67 (m, 2H).

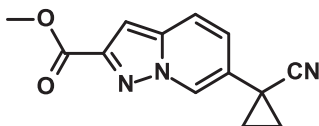
**Ácido 6-(1-cianociclopropil)pirazolo[1,5-a]piridin-2-carboxílico**



Se disolvieron 9,00 g (37,3 mmol) de 6-(1-cianociclopropil)pirazolo[1,5-a]piridin-2-carboxilato de metilo y 1,49 g (35,4 mmol) de hidróxido de litio monohidratado en una mezcla de tetrahidrofurano / agua (100 ml/150 ml) y se agitó durante 16 h a temperatura ambiente. Subsiguientemente se separó el solvente orgánico por destilación al vacío, se lavó la fase acuosa con 100 ml de acetato de etilo y con se llevó a pH = 4 con 1 N ácido clorhídrico. El sólido precipitado se separó por filtración y se secó al vacío.

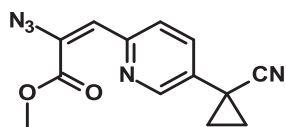
$^1H$ -RMN (400 MHz, DMSO- $d_6$ ):  $\delta$  13,00 (br. s, 1H), 8,78 (s, 1H), 7,79 (d, 1H), 7,32 (d, 1H), 7,07 (s, 1H), 1,74 (m, 2H), 1,62 (m, 2H).

**6-(1-Cianociclopropil)pirazolo[1,5-a]piridin-2-carboxilato de metilo**



Se calentaron 30 g (111 mmol) de una solución 0,4 molar de (E)-2-azido-3-[5-(1-cianociclopropil)-2-piridil]prop-2-enoato de metilo en mesitileno durante 1 h a reflujo, se dejaron enfriar y subsiguientemente se trataron durante 1 h a 0°C. El producto cristalino precipitado se separó por filtración, se agitó durante una noche en una mezcla de acetato de etilo / hexano (1:20), se separó por filtración y se secó al vacío. El producto se usó en el paso siguiente sin purificación adicional.

**(E)-2-azido-3-[5-(1-cianociclopropil)-2-piridil]prop-2-enoato de metilo**

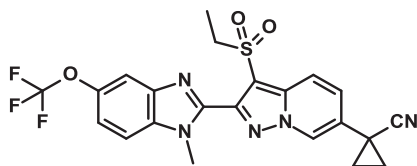


A una solución enfriada a entre -10 y -15°C de 50,0 g (290 mmol) de 6-formil-3-piridil)ciclopropanocarbonitrilo y 36,8 g (320 mmol) de azido-acetato de metilo en 350 ml de metanol se agregó una solución de 17,6 g (326 mmol) de metilato de sodio en 200 ml de metanol lentamente por goteo durante 30 min, en donde la temperatura de reacción se mantuvo a -10°C. Después del agregado se dejó elevar lentamente la temperatura hasta 0°C y se mantuvo la mezcla a esta temperatura durante otras 2 h. Durante este tiempo, el producto comenzó a precipitar como un precipitado fino. Se colocó una cortadora de burbujas en el recipiente de reacción y se agitó la reacción durante una noche en un baño de hielo. Subsiguientemente se agregó la suspensión resultante a una mezcla de 2 kg de hielo y 400 g de cloruro de amonio sólido, se agitó hasta que se fundió el hielo y se separó por filtración.

Se lavó la torta de filtración con agua fría, se secó al vacío y se disolvió en 600 ml de diclorometano. La fase orgánica se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró a través de gel de sílice y se lavó el residuo con 200 ml de diclorometano. Las fases orgánicas combinadas se concentraron y el residuo se usó en el siguiente paso sin purificación adicional.

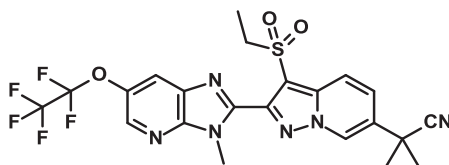
En forma análoga al ejemplo (I-1) y de acuerdo con los métodos de preparación que se describieron anteriormente, se pueden preparar los siguientes compuestos de fórmula (I):

**1-[3-Etilsulfonil-2-[1-metil-5-(trifluorometoxi)benzimidazol-2-il]pirazolo[1,5-a]piridin-6-il]ciclopropanocarbonitrilo (I-2)**



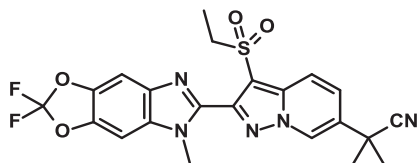
logP (ácido): 3,29;  $MH^+$ : 490;  $^1H$ -RMN (400 MHz,  $D_6$ -dMSO)  $\delta$  ppm: 9,10 (s, 1H), 8,17 (d, 1H), 7,79 (s, 1H), 7,82-7,86 (m, 2H), 7,42 (d, 1H), 3,97 (s, 3H), 3,81 (q, 2H), 1,81-1,84 (m, 2H), 1,71-1,75 (m, 2H), 1,22 (t, 3H).

**1-[3-Etilsulfonil-2-[3-metil-6-(1,1,2,2,2-pentafluoroetoxi)imidazo[4,5-b]piridin-2-il]pirazolo[1,5-a]piridin-6-il]ciclopropanocarbonitrilo (I-5)**



logP (ácido): 3,76;  $MH^+$ : 541;  $^1H$ -RMN (400 MHz,  $D_6$ -dMSO)  $\delta$  ppm: 9,10 (s, 1H), 8,62 (s, 1H), 8,44 (s, 1H), 8,20 (d, 1H), 7,85 (d, 1H), 4,00 (s, 3H), 3,81 (q, 2H), 1,82-1,85 (m, 2H), 1,72-1,75 (m, 2H), 1,23 (t, 3H).

**1-[2-(2,2-Difluoro-7-metil-[1,3]dioxolo[4,5-f]benzimidazol-6-il)-3-etilsulfonil-pirazolo[1,5-a]piridin-6-il]ciclopropanocarbonitrilo (I-3)**

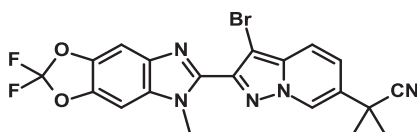


Se agitaron 117,7 mg (0,10 mmol) de 1-[3-bromo-2-(2,2-difluoro-7-metil-[1,3]dioxolo[4,5-f]benzimidazol-6-il)pirazolo[1,5-a]piridin-6-il]ciclopropanocarbonitrilo, 119,5 mg (1,02 mmol) de etanosulfonato de sodio y 2,9 mg (0,01 mmol) de ioduro de cobre (I) en 6 ml de N,N-dimetilformamida en un sintetizador de microondas (Anton Paar, Monowave 400) durante 4 h a 140°C. La mezcla de reacción se filtró a través de gel de sílice, se lavó con acetonitrilo y el residuo se purificó por medio de

cromatografía en columna mediante HPLC preparativa con un gradiente de agua / acetonitrilo como eluyente.

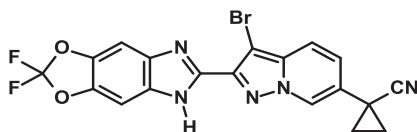
logP (ácido): 3,18;  $MH^+$ : 486;  $^1H$ -RMN (400 MHz,  $D_6$ -dMSO)  $\delta$  ppm: 9,07 (s, 1H), 8,17 (d, 1H), 7,89 (s, 1 H), 7,81-7,84 (m, 2H), 3,95 (s, 3H), 3,80 (q, 2H), 1,81-1,85 (m, 2H), 1,71-1,75 (m, 2H), 1,21 (t, 3H).

**1-[3-Bromo-2-(2,2-difluoro-7-metil-[1,3]dioxolo[4,5-f]benzimidazol-6-il)pirazolo[1,5-a]piridin-6-il]ciclopropanocarbonitrilo.**



Se agitaron 35,0 mg (0,02 mmol) de 1-[3-bromo-2-(2,2-difluoro-5H-[1,3]dioxolo[4,5-f]benzimidazol-6-il)pirazolo[1,5-a]piridin-6-il]ciclopropanocarbonitrilo, 3,3 mg (0,02 mmol) de yodometano y 5,7 mg (0,04 mmol) de carbonato de potasio en 5 ml de acetona durante 6 h a reflujo. Se extrajo el solvente por destilación, se tomó el residuo en diclorometano y con se lavó con una solución saturada de cloruro de sodio. Se separó la fase orgánica, se secó sobre sulfato de sodio y se separó el solvente orgánico por filtración al vacío. El residuo se usó en el paso siguiente sin purificación adicional.

**1-[3-Bromo-2-(2,2-difluoro-5H-[1,3]dioxolo[4,5-f]benzimidazol-6-il)pirazolo[1,5-a]piridin-6-il]ciclopropanocarbonitrilo**

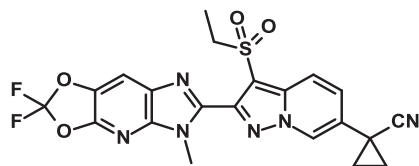


Se introdujeron 200 mg (1,06 mmol) de 2,2-difluoro-1,3-benzodioxol-5,6-diamina y 384 mg (1,19 mmol) de ácido 3-bromo-6-(1-cianociclopropil)pirazolo[1,5-a]piridin-2-carboxílico en piridina (25 mL). Se agregaron 315 mg (1,59 mmol) de EDCI

y la mezcla se agitó durante 8 h a 120°C. Se extrajo el solvente por destilación, se tomó el residuo en diclorometano y se lavó con una solución saturada de cloruro de sodio. La fase orgánica se secó sobre sulfato de sodio, se extrajo el solvente por destilación al vacío y el residuo se purificó mediante HPLC preparativa con un gradiente de agua / acetonitrilo como eluyente. El producto se usó en el paso siguiente sin purificación adicional.

En forma análoga al ejemplo (I-3) y de acuerdo con los métodos de preparación que se describieron anteriormente se puede preparar el siguiente compuesto de fórmula (I):

**1-[3-Etilsulfonil-2-[2,2-difluoro-7-metil-[1,3]dioxolo-imidazo[4,5-b]piridin-6-il]pirazolo[1,5-a]piridin-6-il]ciclopropanocarbonitrilo (I-4)**



logP (ácido): 3,22;  $MH^+$ : 487;  $^1H$ -RMN (400 MHz,  $D_6$ -dMSO)  $\delta$  ppm: 9,09 (s, 1H), 8,41 (s, 1H), 8,18 (d, 1 H), 7,84 (d, 1H), 3,95 (s, 3H), 3,81 (q, 2H), 1,81-1,85 (m, 2H), 1,71-1,75 (m, 2H), 1,22 (t, 3H).

### **Ejemplos de aplicación**

#### ***Boophilus microplus*: Prueba de inyección**

Solvente: dimetilsulfóxido

Para producir una preparación adecuada del compuesto activo, se disolvieron 10 mg del compuesto activo en 0,5 ml de solvente y el concentrado se diluye con solvente hasta alcanzar la concentración deseada.

Se inyecta 1  $\mu$ l de la solución de fármaco en el abdomen de 5 garrapatas bovinas hembras adultas y húmedas (*Boophilus microplus*). Los animales se transfieren a bandejas y se guardan en una cámara climatizada.

Luego de 7 días se monitorea la presencia de huevos, en especial de huevos fértiles. Los huevos cuya fertilidad no era visible desde el exterior se guardan en la

cámara climática durante aproximadamente 42 días hasta la eclosión de las larvas. Una eficacia del 100% significa que ninguna de las garrapatas ha puesto huevos fértiles, del 0% significa que todos los huevos son fértiles.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación tienen un efecto del 95% a una dosis de aplicación de 20 µg/animal: I-4

***Ctenocephalides felis*: Prueba oral**

Solvente: dimetilsulfóxido

Para la preparación de una preparación adecuada de compuesto activo, se mezclan 10 mg de compuesto activo con 0,5 ml de dimetilsulfóxido. La dilución con sangre bovina citrada permite obtener la concentración deseada.

Se introdujeron aproximadamente 20 pulgas de gato (*Ctenocephalides felis*) en una cámara sellada, con una gasa en la parte superior e inferior. Se coloca un cilindro de metal en la cámara, cuyo lado inferior está sellado con Parafilm. El cilindro contiene la preparación del compuesto activo con la sangre que puede ser absorbida por las pulgas a través de la membrana de Parafilm.

Después de 2 días se determina la mortalidad como un %. Un 100% significa que todas las pulgas murieron; un 0% significa que ninguna de las pulgas murió.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación mostraron buena actividad de 100 % a una dosis de aplicación de 100 ppm: I-1, I-4.

***Diabrotica balteata*: Prueba de rociado**

Solvente:                78     partes en peso de acetona  
                              1,5    partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante:        Alquil aril poliglicol éter

Para producir una preparación adecuada del compuesto activo, se disuelve 1 parte en peso del compuesto activo con las partes indicadas en peso de solvente y se completa con agua que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm hasta alcanzar la concentración deseada. Para preparar las concentraciones de prueba adicionales, se diluye con agua que contiene emulsionante.

Se incuban granos de trigo (*Triticum aestivum*) previamente hinchados en una

placa de múltiples pocillos con agar y un poco de agua durante un día (5 semillas por pocillo). Los granos de trigo germinados se rocían con una preparación del compuesto activo a la concentración deseada. Cada pocillo se infecta con 10-20 larvas de escarabajo de la especie *Diabrotica balteata*.

Después de 7 días, se determina el efecto como un %. Un 100% significa que todas las plantas de trigo han crecido como el control no infectado no tratado; 0% significa que ninguna planta de trigo ha crecido.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran un efecto de 100% a una tasa de aplicación de 500 g/ha (= 160µg/pocillo): I-2, I-3, I-5.

#### ***Spodoptera frugiperda*: Prueba de rociado**

Solvente: 78,0 partes en peso de acetona  
1,5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: Alquil aril poliglicol éter

Para preparar una preparación adecuada del compuesto activo, se disuelve 1 parte en peso del compuesto activo con las partes indicadas en peso de solvente y se completa con agua que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm hasta alcanzar la concentración deseada. Para preparar las concentraciones de prueba adicionales, se diluye con agua que contiene emulsionante.

Se rocían discos de hoja de maíz (*Zea mays*) con una preparación del compuesto activo a la concentración deseada y, después del secado, se infestan con orugas del gusano militar (*Spodoptera frugiperda*).

Después de 7 días, se determina el efecto como un %. Un 100% significa que todas las orugas han muerto; un 0% significa que no ha muerto ninguna oruga.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación tienen un efecto del 100% a una dosis de 100 g/ha: I-1, I-2, I-3, I-4, I-5.

#### ***Phaedon cochleariae*: Prueba de rociado**

Solvente: 78,0 partes en peso de acetona  
1,5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: Alquil aril poliglicol éter

Para preparar una preparación adecuada del compuesto activo, se disuelve 1 parte en peso del compuesto activo con las partes indicadas en peso de solvente y se completa con agua que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm hasta alcanzar la concentración deseada. Para preparar las concentraciones de prueba adicionales, se diluye con agua que contiene emulsionante.

Se rocían discos de hojas de col china (*Brassica pekinensis*) con una preparación del compuesto activo a la concentración deseada y, después del secado, se introducen larvas del escarabajo de la hoja de mostaza (*Phaedon cochleariae*).

Después de 7 días se determina el % de efecto. 100 % significa que todas las larvas de escarabajo han muerto; 0 % significa que no ha muerto ninguna larva de escarabajo.

En esta prueba, por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran un efecto de 100% a una tasa de aplicación de 100 g/ha: I-1, I-4.

#### **Myzus persicae – Prueba oral**

Solvente: 100 partes en peso de acetona

Para preparar una preparación de compuesto activo adecuada, se disuelve 1 parte en peso de agente activo con las partes en peso dadas de solvente y se completa con agua hasta conseguir la concentración deseada.

Se transfieren 50 µl de la preparación de agente activo a placas de microtitulación y se completa con 150 µl de medio para insectos IPL41 (33% + 15% de azúcar) hasta un volumen final de 200 µl. Posteriormente, las placas se sellan con Parafilm, que una población mixta de áfidos verdes del durazno (*Myzus persicae*), que se encuentra en una segunda placa de microtitulación, puede perforar y así absorber la solución.

Después de 5 días se determina el % de efecto. 100 % significa que todos los áfidos han muerto; 0 % significa que no ha muerto ningún áfido.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran un efecto del 100% a una tasa de aplicación de 4 ppm: I-1, I-2, I-3, I-4.

### ***Myzus persicae*: Prueba de rociado**

Solvente:                78     partes en peso de acetona  
                              1,5     partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante:        Alquil aril poliglicol éter

Para preparar una preparación adecuada del compuesto activo, se disuelve 1 parte en peso del compuesto activo con las partes indicadas en peso de solvente y se completa con agua que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm hasta alcanzar la concentración deseada. Para preparar las concentraciones de prueba adicionales, se diluye con agua que contiene emulsionante.

Se rocían discos de hojas de col china (*Brassica pekinensis*) infestados con todas las etapas del áfido verde del durazno (*Myzus persicae*) con una preparación del compuesto activo a la concentración deseada.

Después de 5 días, se determina el % de efecto. 100% significa que todos los áfidos han muerto; 0 % significa que no ha muerto ningún áfido.

En esta prueba, por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran un efecto de 90% a una tasa de aplicación de 100 g/ha: I-4.

En esta prueba, por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran un efecto de 100% a una tasa de aplicación de 100 g/ha: I-1.

### **Ejemplos comparativos**

#### ***Myzus persicae* - Prueba de pulverización (MYZUPE)**

Solvente:                14 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante:        alquil aril poliglicol éter

Para preparar una preparación adecuada de agente activo se disuelve 1 parte en peso de agente activo con las partes en peso dadas de solvente y se completa con agua que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm, hasta alcanzar la concentración deseada. Para preparar otras concentraciones de prueba, se diluye con agua que contiene emulsionante. Si se requiere el agregado de sales de amonio y/o promotores de la penetración, estos se agregan en cada caso en una concentración de 1000 ppm de la solución de la preparación.

Se tratan plantas de paprika (*Capsicum annuum*), las cuales están fuertemente infestadas con el pulgón verde del durazno (*Myzus persicae*), mediante pulverización con la preparación de agente activo en la concentración deseada.

Después del tiempo deseado, se determina el % de muerte. 100% significa que todos los animales han muerto; 0 % significa que no ha muerto ningún animal.

En esta prueba, por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una actividad superior en comparación con el estado del arte: véase la tabla

#### **Diabrotica balteata - Prueba de empapado (DIABBA)**

Solvente: 7 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: 2 partes en peso de alquil aril poliglicol éter

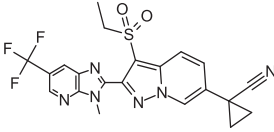
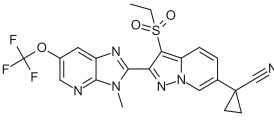
Para preparar una preparación adecuada de agente activo se mezcla 1 parte en peso de agente activo con las cantidades dadas de solvente y emulsionante, y se diluye el concentrado con agua a la concentración deseada, en donde se debe tener en cuenta el volumen de tierra que se va a empapar. Se debe asegurar que no se supere una concentración de 40 ppm de emulsionante en la tierra. Para preparar otras concentraciones de prueba, se diluye con agua.

En cada caso se siembran 5 granos de maíz (*Zea mays*) en macetas rellenas con tierra y al día siguiente se agrega la preparación de agente activo a la concentración deseada. Un día más tarde, se agregan aproximadamente 25 larvas L2 del gusano de la raíz del maíz (*Diabrotica balteata*).

Después de 8 días, se determina el % de efecto. 100% significa que han germinado y crecido las 5 plantas; 0 % significa que no ha crecido ninguna planta.

En esta prueba, por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una actividad superior en comparación con el estado del arte: véase la tabla

| Sustancia | Estructura | Objeto | Concentración | % de efecto |
|-----------|------------|--------|---------------|-------------|
|           |            |        |               |             |

|                                             |                                                                                   |                      |                    |                             |
|---------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------|----------------------|--------------------|-----------------------------|
| Arte previo de acuerdo con WO2017/155103    |  | MYZUP<br>E<br>DIABBA | 0,8 ppm<br>0,8 ppm | 40 6<br>dat<br>50 8<br>dat  |
| Ejemplo No. I-1 de acuerdo con la invención |  | MYZUP<br>E<br>DIABBA | 0,8 ppm<br>0,8 ppm | 100 6<br>dat<br>80 8<br>dat |

\*dat = días después del tratamiento