

TÍTULO

COMPUESTOS DE AZOL PARA EL CONTROL DE PLAGAS DE INVERTEBRADOS

REFERENCIA CRUZADA A SOLICITUDES RELACIONADAS

La presente solicitud reivindica el beneficio de la Solicitud Provisional de los EE. UU. n.º 63/214420 presentada el 24 de junio de 2021.

CAMPO

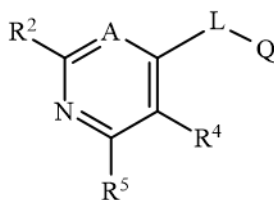
Esta divulgación se refiere a ciertos compuestos de azol, a sus *N*-óxidos, a sales y composiciones adecuadas para usos agronómicos y no agronómicos, y a métodos para su uso para el control de plagas de invertebrados tales como artrópodos tanto en entornos agronómicos como no agronómicos.

ANTECEDENTES

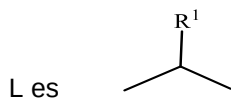
El control de las plagas de invertebrados es extremadamente importante para conseguir una alta eficiencia de los cultivos. Los daños causados por las plagas de invertebrados en los cultivos agronómicos en crecimiento y almacenados pueden provocar una reducción significativa de la productividad y, por lo tanto, pueden dar como resultado un aumento de los costes para el consumidor. También es importante el control de las plagas de invertebrados en la silvicultura, los cultivos de invernadero, las plantas ornamentales, los cultivos de vivero, los productos alimentarios y de fibra almacenados, el ganado, el hogar, el césped, los productos madereros, y la sanidad pública y animal. Se dispone de muchos productos comercializados para estos fines, pero se siguen necesitando nuevos compuestos que sean más eficaces, menos costosos, menos tóxicos, más seguros para el medio ambiente o que tengan sitios de acción diferentes.

COMPENDIO

Esta divulgación se refiere a compuestos de Fórmula 1 (incluyendo todos los isómeros geométricos y estereoisómeros), a *N*-óxidos y sales de los mismos, a composiciones que los contienen y a su uso para el control de plagas de invertebrados:



en donde



en donde el enlace que se proyecta hacia la izquierda está unido al anillo aromático que contiene A y el enlace que se proyecta hacia la derecha está unido a Q;

R¹ es H, CN, OCOR⁶, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilalquilo C₃-C₅ o halocicloalquilalquilo C₃-C₅;

A es N o CR³;

R² es H, halógeno, CN, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, halocicloalquilo C₃-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄;

R³ es H, halógeno, CN, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, halocicloalquilo C₃-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄;

R⁴ es un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros, conteniendo cada anillo elementos del anillo seleccionados entre átomos de carbono y 1 a 4 heteroátomos seleccionados independientemente entre hasta 2 átomos de O, hasta 2 de átomos de S y hasta 4 átomos de N, en donde hasta 2 miembros de anillo se seleccionan independientemente entre C(=O), C(=S), S(=O) y S(=O)₂, estando cada anillo opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R^v, y r es el número de los sustituyentes.

cada R^v es independientemente H, ciano, halógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cianoalquilo C₂-C₆, hidroxialquilo C₁-C₆, alquilocicloalquilo C₄-C₁₀, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, cicloalqueno C₃-C₆, halocicloalqueno C₃-C₆, alcoxialquilo C₂-C₆, cicloalcoxialquilo C₄-C₁₀, alcoxialcoxialquilo C₃-C₁₀, alquiltioalquilo C₂-C₆, alquilsulfinilalquilo C₂-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halocicloalcoxi C₃-C₆, cicloalquilalcoxi C₄-C₁₀, alquenoiloxi C₂-C₆, haloalquenoiloxi C₂-C₆, alcoxialcoxi C₂-C₆, alquilcarboniloxi C₂-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, cicloalquiltio C₃-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, haloalquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, cicloalquilsulfonilo C₃-C₆, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₂-C₆, haloalquilamino C₁-C₆, halodialquilamino C₂-C₆ o cicloalquilamino C₃-C₆;

r es 1, 2, 3, 4 o 5;

R⁵ es H, halógeno, CN, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, halocicloalquilo C₃-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄;

R⁶ es alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄ o halocicloalquilo C₃-C₄;

Q es un anillo aromático de cinco o seis miembros que contiene elementos de anillo seleccionados entre átomos de carbono y hasta 1 átomo de oxígeno, 1 átomo de azufre, 2 átomos de nitrógeno, estando cada anillo opcionalmente sustituido en los elementos del anillo de átomos de carbono con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R^w; y s es el número de los sustituyentes; dos R^w en átomos de carbono adyacentes juntos puede formar un anillo de 5 miembros o de 6 miembros, tal como -OCF₂O-, -OCH₂O-, -OCF₂S-, -OCH₂CH₂-, OCF₂CF₂O-, -OCR⁵=N-, -SCR⁵=N-, -CH=CR⁵-CH=CH- o -CH=N-CR⁵=CH-;

R^w es independientemente H, ciano, halógeno, SF₅, SCl, SO₂Cl, SO₂F, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cianoalquilo C₂-C₆, hidroxialquilo C₁-C₆, alquilocicloalquilo C₄-C₁₀, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, cicloalqueno C₃-C₆, halocicloalqueno C₃-C₆, alcoxialquilo C₂-C₆, cicloalcoxialquilo C₄-C₁₀, alcoxialcoxialquilo C₃-

C₁₀, alquiltioalquilo C₂-C₆, alquilsulfinilalquilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halocicloalcoxi C₃-C₆, cicloalquilalcoxi C₄-C₁₀, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alcoxialcoxi C₂-C₆, alquilcarbonilo C₂-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, cicloalquiltio C₃-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, haloalquilsulfinilo C₁-C₆, cicloalquilsulfinilo C₃-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, cicloalquilsulfonilo C₃-C₆, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₂-C₆, haloalquilamino C₁-C₆, halodialquilamino C₂-C₆ o cicloalquilamino C₃-C₆;

s es 1, 2, 3, 4 o 5;

n es 0, 1 o 2.

Esta divulgación también proporciona una composición que comprende un compuesto de Fórmula **1**, un *N*-óxido o una sal del mismo, y al menos un componente adicional seleccionado entre el grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos. En una realización, esta divulgación también proporciona una composición para controlar una plaga de invertebrados que comprende un compuesto de Fórmula **1**, un *N*-óxido o una sal del mismo, y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, comprendiendo dicha composición opcionalmente además al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional.

Esta divulgación también proporciona un método para controlar una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su entorno con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula **1**, un *N*-óxido o una sal del mismo, (p. ej., como una composición descrita en el presente documento). Esta divulgación también se refiere a dicho método en donde la plaga de invertebrados o su entorno se pone en contacto con una composición que comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula **1**, un *N*-óxido o una sal del mismo y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, comprendiendo opcionalmente dicha composición además una cantidad biológicamente eficaz de al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional.

Esta divulgación también proporciona un método para controlar una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su entorno con una cantidad biológicamente eficaz de cualquiera de las composiciones mencionadas anteriormente en donde el entorno es una planta.

Esta divulgación también proporciona un método para controlar una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su entorno con una cantidad biológicamente eficaz de cualquiera de las composiciones mencionadas anteriormente en donde el entorno es un animal.

Esta divulgación también proporciona un método para controlar una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su entorno con una cantidad biológicamente eficaz de cualquiera de las composiciones mencionadas anteriormente en donde el entorno es una semilla.

Esta divulgación también proporciona un método para proteger una semilla de una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la semilla con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula **1**, un *N*-óxido o una sal del mismo, (p. ej., como una composición descrita en el

presente documento). Esta divulgación también se refiere a la semilla tratada (es decir, la semilla en contacto con un compuesto de Fórmula 1).

Esta divulgación también proporciona un método para aumentar el vigor de una planta de cultivo que comprende poner en contacto la planta de cultivo, la semilla a partir de la que se cultiva la planta de cultivo o el emplazamiento (p. ej., medio de crecimiento) de la planta de cultivo con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1 (p. ej., como una composición descrita en el presente documento).

Esta divulgación también proporciona un método para proteger a un animal de una plaga parasitaria de invertebrados que comprende administrar al animal una cantidad parasiticidamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo, (p. ej., como una composición descrita en el presente documento). Esta divulgación también proporciona el uso de un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo, (p. ej., como una composición descrita en el presente documento) en la protección de un animal de una plaga de invertebrados.

DESCRIPCIÓN DETALLADA

Se pretende que las expresiones "comprende", "que comprende", "incluye", "que incluye", "tiene", "que tiene", "contiene", "que contiene", "caracterizado por" o cualquier otra variación de las mismas, tal como se utilizan en el presente documento, abarquen una inclusión no exclusiva, sujeta a cualquier limitación indicada de manera explícita. Por ejemplo, una composición, mezcla, proceso o método que comprenda una lista de elementos, no se limita necesariamente solo a esos elementos, sino que puede incluir otros elementos no enumerados expresamente o inherentes a tal composición, mezcla, proceso o método.

La expresión de transición "que consiste en" excluye cualquier elemento, etapa o ingrediente no especificado. Si estuviera en la reivindicación, esta cerraría la reivindicación a la inclusión de materiales distintos de los citados, salvo impurezas asociadas habitualmente con los mismos. Cuando la expresión "que consiste en" aparece en una cláusula del cuerpo de una reivindicación, en lugar de hacerlo justo después del preámbulo, solo limita el elemento expuesto en esa cláusula; no se excluyen otros elementos del conjunto de la reivindicación.

La expresión de transición "que consiste esencialmente en", se utiliza para definir una composición o un método que incluye materiales, etapas, características, componentes o elementos, además de los divulgados literalmente, a condición de que estos materiales, etapas, características, componentes o elementos adicionales no afecten materialmente a la característica o características básicas y novedosas de la divulgación reivindicada. La expresión "que consiste esencialmente en" ocupa un lugar intermedio entre "que comprende" y "que consiste en".

Cuando los solicitantes han definido una realización, o una parte de la misma, con una expresión abierta tal como "que comprende", debe entenderse fácilmente que (a menos que se indique otra cosa) debe interpretarse que la descripción también describe una realización de este tipo usando las expresiones "que consiste esencialmente en" o "que consiste en".

Además, a menos que se indique expresamente lo contrario, "o" se refiere a un "o" inclusivo y no a un "o" exclusivo. Por ejemplo, una condición A o B se satisface con una cualquiera de las siguientes: A es verdadera (o está presente) y B es falsa (o no está presente), A es falsa (o no está presente) y B es verdadera (o está presente), y tanto A como B son verdaderas (o están presentes).

5 Además, los artículos indefinidos "un" y "uno/a" que preceden a un elemento o componente de la divulgación no pretenden ser restrictivos en cuanto al número de ejemplos (es decir, apariciones) del elemento o componente. Por lo tanto, se debe interpretar que "un" o "uno/a" incluyen uno/a o al menos uno/a, y la forma de la palabra en singular del elemento o componente también incluye el plural, a menos que sea evidente que el número es singular.

10 Como se menciona en esta divulgación, la expresión "plaga de invertebrados" incluye artrópodos, gasterópodos, nematodos y helmintos de importancia económica como plagas. El término "artrópodo" incluye insectos, ácaros, arañas, escorpiones, ciempiés, milpiés, chinches y sínfilos. El término "gasterópodo" incluye caracoles, babosas y otros *Stylommatophora*. El término "nematodo" incluye miembros del filo *Nematoda*, tales como nematodos fitófagos y nematodos helmintos que parasitan a los
15 animales. El término "helminto" incluye a todos los gusanos parásitos, tales como gusanos redondos (filo *Nematoda*), gusanos del corazón (filo *Nematoda*, clase *Secernentea*), trematodos (filo *Platyhelminthes*, clase *Tematoda*), acantocéfalos (filo *Acanthocephala*) y cestodos (filo *Platyhelminthes*, clase *Cestoda*).

En el contexto de esta divulgación, "control de plagas de invertebrados" significa la inhibición del desarrollo de plagas de invertebrados (incluidas la mortalidad, la reducción de la alimentación y/o la
20 interrupción del apareamiento) y las expresiones relacionadas se definen de forma análoga.

El término "agronómico" se refiere a la producción de cultivos de campo, tales como los destinados a la alimentación y a la fibra, e incluye el crecimiento de maíz, soja y otras leguminosas, arroz, cereales (p. ej., trigo, avena, cebada, centeno y arroz), verduras de hoja (p. ej., lechuga, col y otros cultivos de coles),
25 verduras de fruto (p. ej., tomates, pimientos, berenjenas, crucíferas y cucurbitáceas), patatas, boniatos, uvas, algodón, frutos de árbol (p. ej., de pepita, de hueso y cítricos), frutos pequeños (p. ej., bayas y cerezas) y otros cultivos especiales (p. ej., colza, girasol y aceitunas).

La expresión "no agronómico" se refiere a otros cultivos distintos de los de campo, tales como cultivos hortícolas (p. ej., plantas de invernadero, vivero u ornamentales que no se cultivan en un campo),
30 estructuras residenciales, agrícolas, comerciales e industriales, césped (p. ej., cultivos de tepes, pastos, campos de golf, grama, campos deportivos, etc.), productos madereros, productos almacenados, gestión agroforestal y de la vegetación, aplicaciones de sanidad pública (es decir, humana) y sanidad animal (p. ej., animales domesticados tales como mascotas, ganado y aves de corral, animales no domesticados tales como la fauna silvestre).

La expresión "vigor del cultivo" se refiere a la tasa de crecimiento o acumulación de biomasa de
35 una planta de cultivo. Un "aumento del vigor" se refiere a un aumento del crecimiento o de la acumulación de biomasa en una planta de cultivo con respecto a una planta de cultivo de control no tratada. La expresión "rendimiento del cultivo" se refiere a la cantidad del material de cultivo, tanto en términos de cantidad como

de calidad, que se obtiene después de cosechar una planta de cultivo. Un "aumento del rendimiento del cultivo" se refiere a un aumento del rendimiento del cultivo con respecto a una planta de cultivo de control no tratada.

La expresión "cantidad biológicamente eficaz" se refiere a la cantidad de un compuesto biológicamente activo (p. ej., un compuesto de Fórmula 1) suficiente para producir el efecto biológico deseado cuando se aplica a (es decir, se pone en contacto con) una plaga de invertebrados que se ha de controlar o su entorno, o a una planta, la semilla a partir de la cual se cultiva la planta o el emplazamiento de la planta (p. ej., medio de crecimiento) para proteger la planta frente a los daños provocados por la plaga de invertebrados o para otro efecto deseado (p. ej., aumentar el vigor de la planta).

Las aplicaciones no agronómicas incluyen proteger a un animal de una plaga parasitaria de invertebrados mediante la administración de una cantidad parasiticidamente eficaz (es decir, biológicamente eficaz) de un compuesto de la divulgación, normalmente en forma de una composición formulada para uso veterinario, al animal que se va a proteger. Como se hace referencia en la presente divulgación y en las reivindicaciones, los términos "parasitícida" y "parasiticidamente" se refieren a efectos observables sobre una plaga parasitaria de invertebrados para proporcionar protección a un animal frente a la plaga. Los efectos parasitícidas normalmente se refieren a la disminución de la aparición o actividad de la plaga parasitaria de invertebrados diana. Dichos efectos sobre la plaga incluyen necrosis, muerte, crecimiento retardado, disminución de la movilidad o disminución de la capacidad de permanecer sobre o en el interior del animal hospedador, reducción de la alimentación e inhibición de la reproducción. Estos efectos sobre plagas parasitarias de invertebrados proporcionan control (incluyendo prevención, reducción o eliminación) de la infestación parasitaria o la infección del animal.

En las menciones anteriores, el término "alquilo", utilizado ya sea solo o en palabras compuestas tales como "alquiltio" o "haloalquilo" incluye alquilo de cadena lineal o ramificada, tal como metilo, etilo, *n*-propilo, *i*-propilo o los diferentes isómeros de butilo, pentilo o hexilo. "Alquenilo" incluye alquenos de cadena lineal o ramificada, tales como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, y los diferentes isómeros de butenilo, pentenilo y hexenilo. "Alquenilo" también incluye polienos tales como 1,2-propadienilo y 2,4-hexadienilo. "Alquinilo" incluye alquinos de cadena lineal o ramificada, tales como etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo, y los diferentes isómeros de butinilo, pentinilo y hexinilo. "Alquinilo" también puede incluir restos que comprenden múltiples triples enlaces tales como 2,5-hexadiinilo. "Alquileno" indica un alcanodiilo de cadena lineal o ramificada. Los ejemplos de "alquileno" incluyen CH_2 , CH_2CH_2 , $\text{CH}(\text{CH}_3)$, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)$ y los diferentes isómeros de butileno. "Alquenileno" indica un alquenodiilo de cadena lineal o ramificada que contiene un enlace olefínico. Los ejemplos de "alquenileno" incluyen $\text{CH}=\text{CH}$, $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}$, $\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)$ y los diferentes isómeros de butenileno. "Alquinileno" indica un alquinodiilo de cadena lineal o ramificada que contiene un triple enlace. Los ejemplos de "alquinileno" incluyen $\text{C}\equiv\text{C}$, $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{C}$, $\text{C}\equiv\text{CCH}_2$ y los diferentes isómeros de butinileno.

"Alcoxi" incluye, por ejemplo, metoxi, etoxi, *n*-propiloxi, isopropiloxi y los diferentes isómeros de butoxi, pentoxi y hexiloxi. "Alcoxialquilo" indica una sustitución con alcoxi en el alquilo. Los ejemplos de

"alcoxialquilo" incluyen CH_3OCH_2 , $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ y $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$. "Alcoxialcoxi" indica una sustitución alcoxi en alcoxi. "Alqueniloxi" incluye restos alqueniloxi de cadena lineal o ramificada. Los ejemplos de "alqueniloxi" incluyen $\text{H}_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}$, $(\text{CH}_3)_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}$, $(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{O}$, $(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{O}$ y $\text{CH}_2=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{O}$. "Alquiniloxi" incluye

5 restos alquiniloxi de cadena lineal o ramificada. Los ejemplos de "alquiniloxi" incluyen $\text{HC}\equiv\text{CCH}_2\text{O}$, $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{O}$ y $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{O}$. "Alquiltio" incluye restos alquiltio de cadena ramificada o lineal, tales como metiltio, etiltio y los diferentes isómeros de propiltio, butiltio, pentiltio y hexiltio. "Alquilsulfinilo" incluye ambos enantiómeros de un grupo alquilsulfinilo. Los ejemplos de "alquilsulfinilo" incluyen $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})-$ y los diferentes isómeros de butilsulfinilo, pentilsulfinilo y

10 hexilsulfinilo. Los ejemplos de "alquilsulfonilo" incluyen $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})_2-$ y los diferentes isómeros de butilsulfonilo, pentilsulfonilo y hexilsulfonilo. "Alquiltioalquilo" indica una sustitución con alquiltio en alquilo. Los ejemplos de "alquiltioalquilo" incluyen CH_3SCH_2 , $\text{CH}_3\text{SCH}_2\text{CH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2$ y $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2$. "Alquiltioalcoxi" indica una sustitución alquiltio en alcoxi. "Alquilditio" indica restos alquilditio de cadena lineal o ramificada. Los

15 ejemplos de "alquilditio" incluyen $\text{CH}_3\text{SS}-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SS}-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SS}-$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHSS}-$ y los diferentes isómeros de butilditio y pentilditio. "Cianoalquilo" indica un grupo alquilo sustituido con un grupo ciano. Los ejemplos de "cianoalquilo" incluyen NCCH_2 , NCCH_2CH_2 y $\text{CH}_3\text{CH}(\text{CN})\text{CH}_2$. "Alquilamino", "dialquilamino", "alqueniltio", "alquenilsulfinilo", "alquenilsulfonilo", "alquiniltio", "alquinilsulfinilo", "alquinilsulfonilo" y similares se definen de forma análoga a los ejemplos anteriores.

20 "Cicloalquilo" incluye, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo. El término "alquilocicloalquilo" indica una sustitución alquilo en un resto cicloalquilo e incluye, por ejemplo, etilciclopropilo, *i*-propilciclobutilo, 3-metilciclopentilo y 4-metilciclohexilo. El término "cicloalquilalquilo" indica una sustitución con cicloalquilo en un resto alquilo. Los ejemplos de "cicloalquilalquilo" incluyen ciclopropilmetilo, ciclopentiletilo y otros restos cicloalquilo unidos a grupos alquilo de cadena lineal o

25 ramificada. El término "cicloalcoxi" indica un cicloalquilo unido a través de un átomo de oxígeno tal como ciclopentiloxi y ciclohexiloxi. "Cicloalquilalcoxi" indica un cicloalquilalquilo unido a través de un átomo de oxígeno que se une a la cadena de alquilo. Los ejemplos de "cicloalquilalcoxi" incluyen ciclopropilmetoxi, ciclopentiletoxí y otros restos cicloalquilo unidos a grupos alcoxi de cadena lineal o ramificada. "Cianocicloalquilo" indica un grupo cicloalquilo sustituido con un grupo ciano. Los ejemplos de

30 "cianocicloalquilo" incluyen 4-cianociclohexilo y 3-cianociclopentilo. "Cicloalquenilo" incluye grupos tales como ciclopentenilo y ciclohexenilo, así como grupos con más de un doble enlace tales como 1,3- y 1,4-ciclohexadienilo.

El término "halógeno", ya sea solo o en palabras compuestas tales como "haloalquilo", o cuando se utiliza en descripciones tales como "alquilo sustituido con halógeno", incluye flúor, cloro, bromo o yodo.

35 Además, cuando se utiliza en palabras compuestas tales como "haloalquilo", o cuando se utiliza en descripciones tales como "alquilo sustituido con halógeno", dicho alquilo puede estar sustituido parcial o totalmente con átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes. Los ejemplos de "haloalquilo" o

"alquilo sustituido con halógeno" incluyen $\text{F}_3\text{C}-$, ClCH_2- , CF_3CH_2- y CF_3CCl_2- . Los términos "halocicloalquilo", "haloalcoxi", "haloalquiltio", "haloalquenilo", "haloalquinilo" y similares se definen de forma análoga al término "haloalquilo". Los ejemplos de "haloalcoxi" incluyen $\text{CF}_3\text{O}-$, $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}-$, $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ y $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}-$. Los ejemplos de "haloalquiltio" incluyen $\text{CCl}_3\text{S}-$, $\text{CF}_3\text{S}-$, $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{S}-$ y $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$. Los ejemplos de "haloalquilsulfonilo" incluyen $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})-$, $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})-$, $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$ y $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})-$. Los ejemplos de "haloalquilsulfonilo" incluyen $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})_2-$, $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})_2-$, $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$ y $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})_2-$. Los ejemplos de "haloalquenilo" incluyen $(\text{Cl})_2\text{C}=\text{CHCH}_2-$ y $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2-$. Los ejemplos de "haloalquinilo" incluyen $\text{HC}\equiv\text{CCHCl}-$, $\text{CF}_3\text{C}\equiv\text{C}-$, $\text{CCl}_3\text{C}\equiv\text{C}-$ y $\text{FCH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2-$. Los ejemplos de "haloalcoxialcoxi" incluyen $\text{CF}_3\text{OCH}_2\text{O}-$, $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$, $\text{Cl}_3\text{CCH}_2\text{OCH}_2\text{O}-$ así como derivados de alquilo ramificados.

"Alquilcarbonilo" indica un resto alquilo de cadena lineal o ramificada unido a un resto $\text{C}(=\text{O})$. Los ejemplos de "alquilcarbonilo" incluyen $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})-$ y $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(=\text{O})-$. Los ejemplos de "alcoxicarbonilo" incluyen $\text{CH}_3\text{OC}(=\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})-$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(=\text{O})-$ y los diferentes isómeros de butoxi- o pentoxycarbonilo.

Las abreviaturas químicas $\text{S}(\text{O})$ y $\text{S}(=\text{O})$ como se utilizan en el presente documento representan un resto sulfinilo. Las abreviaturas químicas SO_2 , $\text{S}(\text{O})_2$ y $\text{S}(=\text{O})_2$ como se utilizan en el presente documento representan un resto sulfonilo. Las abreviaturas químicas $\text{C}(\text{O})$ y $\text{C}(=\text{O})$ como se utilizan en el presente documento representan un resto carbonilo. Las abreviaturas químicas CO_2 , $\text{C}(\text{O})\text{O}$ y $\text{C}(=\text{O})\text{O}$ como se utilizan en el presente documento representan un resto oxycarbonilo. "CHO" significa formilo.

Cuando R^4 es un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R^v , los sustituyentes R^v pueden unirse al resto del compuesto de Fórmula 1 a través de cualquier elemento del anillo disponible del anillo heterocíclico.

Cuando Q es un anillo aromático de seis miembros sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R^w , los sustituyentes R^w pueden estar unidos al resto del compuesto de Fórmula 1 a través de cualquier elemento del anillo disponible del anillo aromático de seis miembros.

El número total de átomos de carbono en un grupo sustituyente está indicado por el sufijo " C_i-C_j " donde i y j son números de 1 a 10. Por ejemplo, alquilsulfonilo C_1-C_4 designa de metilsulfonilo a butilsulfonilo; alcoxialquilo C_2 designa CH_3OCH_2- ; alcoxialquilo C_3 designa, por ejemplo, $\text{CH}_3\text{CH}(\text{OCH}_3)-$, $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ o $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2-$; y alcoxialquilo C_4 designa los diversos isómeros de un grupo alquilo sustituido con un grupo alcoxi que contiene un total de cuatro átomos de carbono, incluidos los ejemplos $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ y $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$.

Cuando un compuesto está sustituido con un sustituyente que lleva un subíndice que indica que el número de dichos sustituyentes puede ser superior a 1, dichos sustituyentes (cuando son superiores a 1) se seleccionan independientemente entre el grupo de sustituyentes definidos, p. ej., $[(\text{R}^v)_r]$, r es 1, 2, 3, 4 o 5; y $[(\text{R}^w)_s]$, s es 1, 2, 3, 4 o 5. Cuando un grupo contiene un sustituyente que puede ser hidrógeno, por ejemplo R^v o R^w , entonces cuando este sustituyente se toma como hidrógeno, se reconoce que esto es

equivalente a que dicho grupo no está sustituido. Cuando se menciona que una o más posiciones en un grupo "no están sustituidas" o están "sin sustituir", entonces hay átomos de hidrógeno unidos hasta ocupar cualquier valencia libre.

A menos que se indique otra cosa, un "anillo" como componente de Fórmula 1 (p. ej., sustituyente R⁴) es carbocíclico o heterocíclico. La expresión "miembro de anillo" se refiere a un átomo u otro resto (p. ej., C(=O), C(=S), S(O) o S(O)₂) que forma la cadena principal de un anillo.

La expresión "anillo carbocíclico" o "carbociclo" indica un anillo en donde los átomos que forman la cadena principal del anillo se seleccionan únicamente entre carbono. La expresión "anillo heterocíclico" o "heterociclo" indica un anillo en donde al menos un átomo que forma la cadena principal del anillo no es carbono, p. ej., nitrógeno, oxígeno o azufre. Normalmente, un anillo heterocíclico contiene no más de 4 nitrógenos, no más de 2 oxígenos y no más de 2 azufres. A menos que se indique otra cosa, un anillo carbocíclico o anillo heterocíclico puede ser un anillo saturado o insaturado. "Saturado" se refiere a un anillo que tiene una cadena principal que consiste en átomos unidos entre sí por enlaces sencillos; a menos que se especifique otra cosa, las valencias atómicas restantes están ocupadas por átomos de hidrógeno. A menos que se indique otra cosa, un "anillo insaturado" puede estar parcialmente insaturado o totalmente insaturado. La expresión "anillo totalmente insaturado" significa un anillo de átomos en el que los enlaces entre átomos del anillo son enlaces sencillos o dobles según la teoría del enlace de valencia y, además, los enlaces entre átomos del anillo incluyen tantos dobles enlaces como sea posible sin que los dobles enlaces sean acumulativos (es decir, sin C=C=C o C=C=N). El término "anillo parcialmente insaturado" indica un anillo que comprende al menos un miembro de anillo unido a un miembro de anillo adyacente a través de un doble enlace y que conceptualmente acomoda potencialmente un número de dobles enlaces no acumulados entre miembros de anillo adyacentes (es decir, en su forma complementaria totalmente insaturada) mayor que el número de dobles enlaces presentes (es decir, en su forma parcialmente insaturada).

A menos que se indique otra cosa, los anillos heterocíclicos pueden estar unidos a través de cualquier carbono o nitrógeno disponible por reemplazo de un hidrógeno en dicho carbono o nitrógeno.

"Aromático" indica que cada uno de los átomos de anillo está esencialmente en el mismo plano y tiene un orbital *p* perpendicular al plano del anillo, y en el que $(4n + 2)$ electrones π , donde *n* es un número entero positivo, se asocian con el anillo para cumplir la regla de Hückel. Cuando un anillo carbocíclico totalmente insaturado cumple la regla de Hückel, entonces dicho anillo también se denomina "anillo aromático" o "anillo carbocíclico aromático". Cuando un anillo heterocíclico totalmente insaturado cumple la regla de Hückel, entonces dicho anillo también se denomina "anillo heteroaromático" o "anillo heterocíclico aromático".

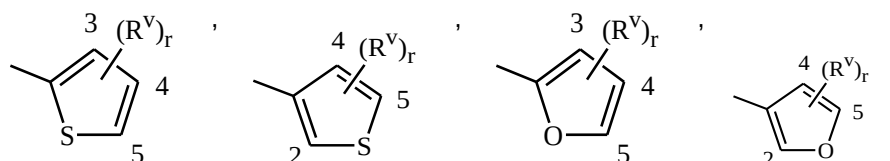
El término "opcionalmente sustituido" con respecto a los anillos heterocíclicos se refiere a grupos que no están sustituidos o que tienen al menos un sustituyente distinto de hidrógeno que no anula la actividad biológica que posee el análogo no sustituido. Como se utilizan en el presente documento se aplicarán las siguientes definiciones a menos que se indique otra cosa. El término "opcionalmente

sustituido" se utiliza indistintamente con la frase "sustituido o no sustituido" o con el término "(no) sustituido". A menos que se indique otra cosa, un grupo opcionalmente sustituido puede tener un sustituyente en cada posición sustituible del grupo y cada sustitución es independiente de las demás.

Cuando R^4 es un anillo heterocíclico de 5 o 6 miembros que contiene nitrógeno, puede unirse al resto de la Fórmula 1 a través de cualquier átomo de anillo de carbono o nitrógeno, a menos que se describa otra cosa.

Como se ha indicado anteriormente, R^4 puede ser un anillo heterocíclico de 5 o 6 miembros, que puede estar saturado o insaturado, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados entre un grupo de sustituyentes como se definen en el Compendio. Los ejemplos de un anillo heterocíclico aromático insaturado de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes incluyen los anillos U-2 a U-61 ilustrados en la Presentación 1, en donde R^v es cualquier sustituyente como se define en el Compendio y r es un número entero de 1 a 4, limitado por el número de posiciones disponibles en cada grupo U. Dado que U-29, U-30, U-36, U-37, U-38, U-39, U-40, U-41, U-42 y U-43 solo tienen una posición disponible, para estos grupos U r está limitado al número entero 1, y cuando R^v es H y r es 1 esto significa que el grupo U está sin sustituir y hay un hidrógeno en la posición indicada por $(R^v)_r$.

Presentación 1

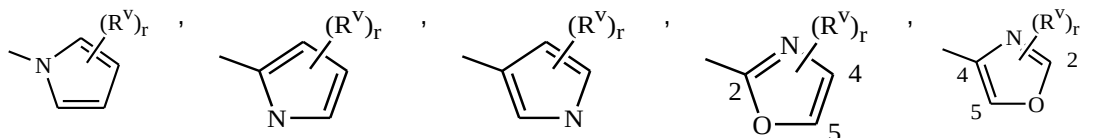


U-2

U-3

U-4

U-5



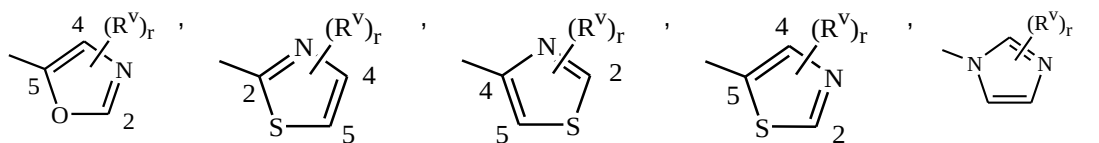
U-6

U-7

U-8

U-9

U-10



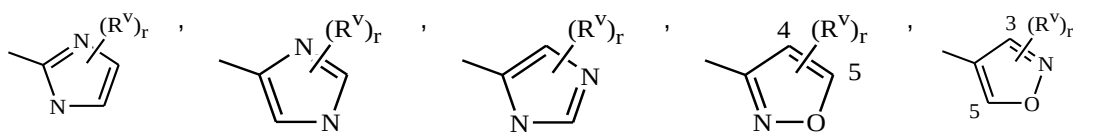
U-11

U-12

U-13

U-14

U-15



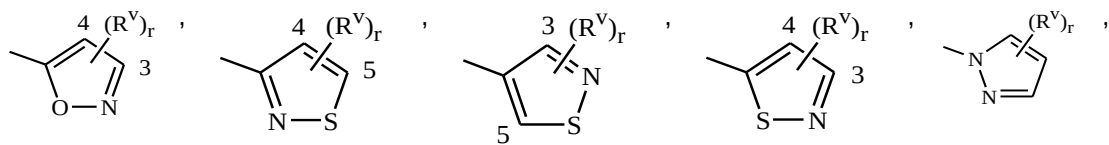
U-16

U-17

U-18

U-19

U-20



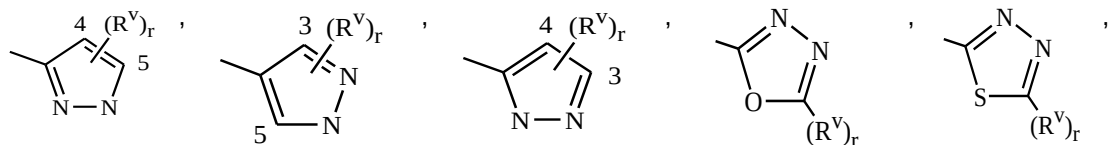
U-21

U-22

U-23

U-24

U-25



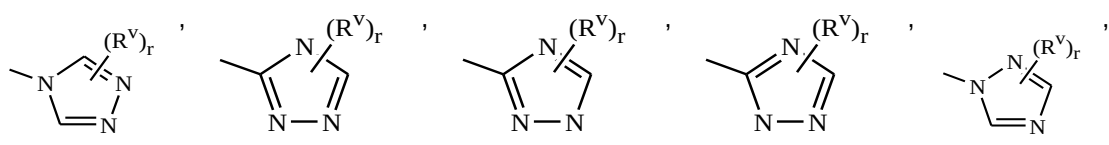
U-26

U-27

U-28

U-29

U-30



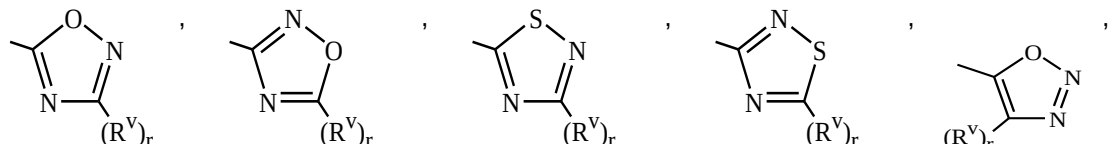
U-31

U-32

U-33

U-34

U-35



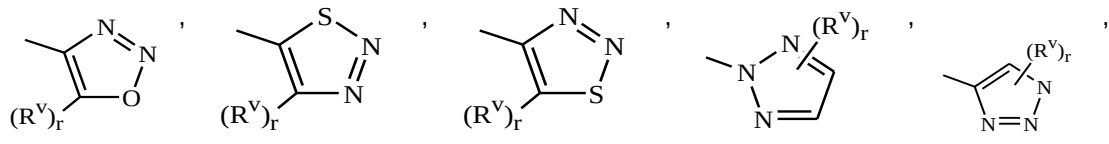
U-36

U-37

U-38

U-39

U-40



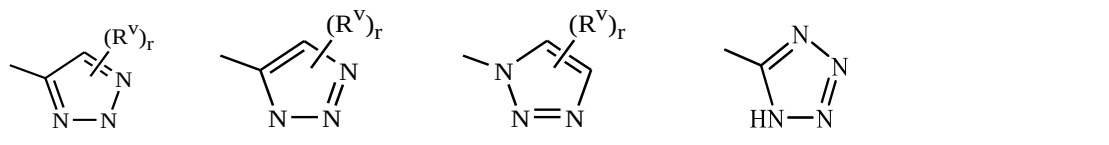
U-41

U-42

U-43

U-44

U-45

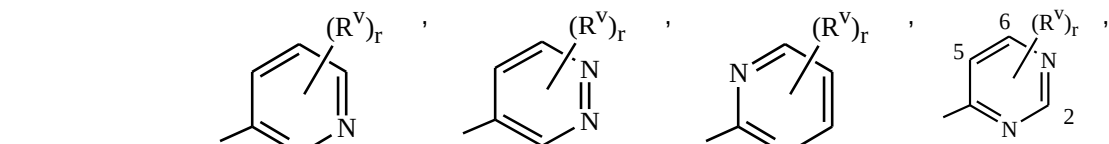


U-46

U-47

U-48

U-49

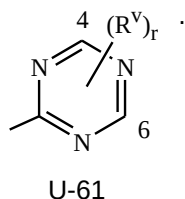
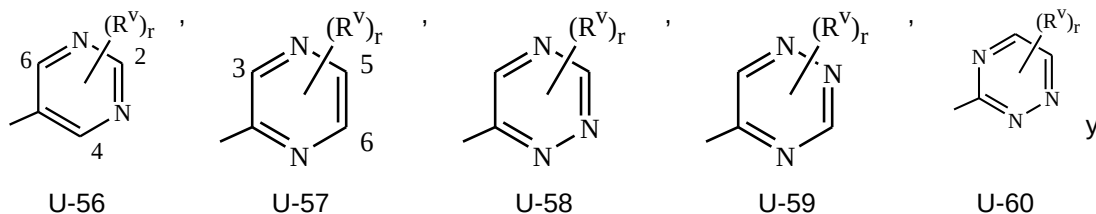


U-52

U-53

U-54

U-55

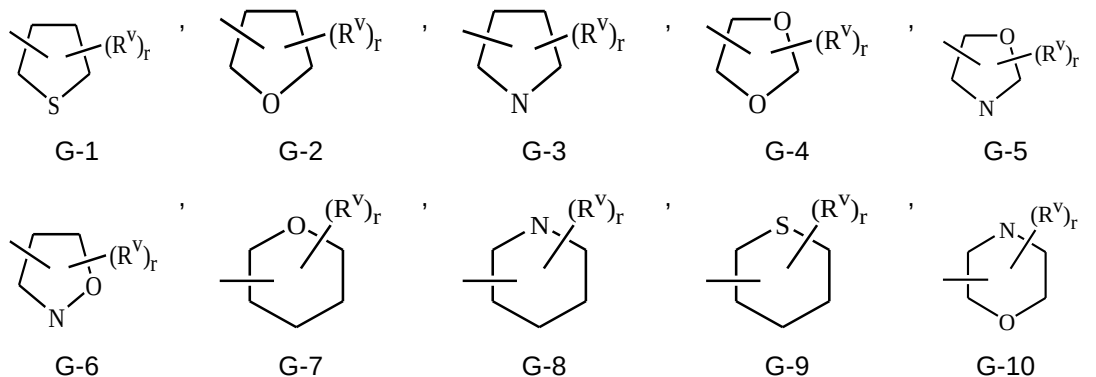


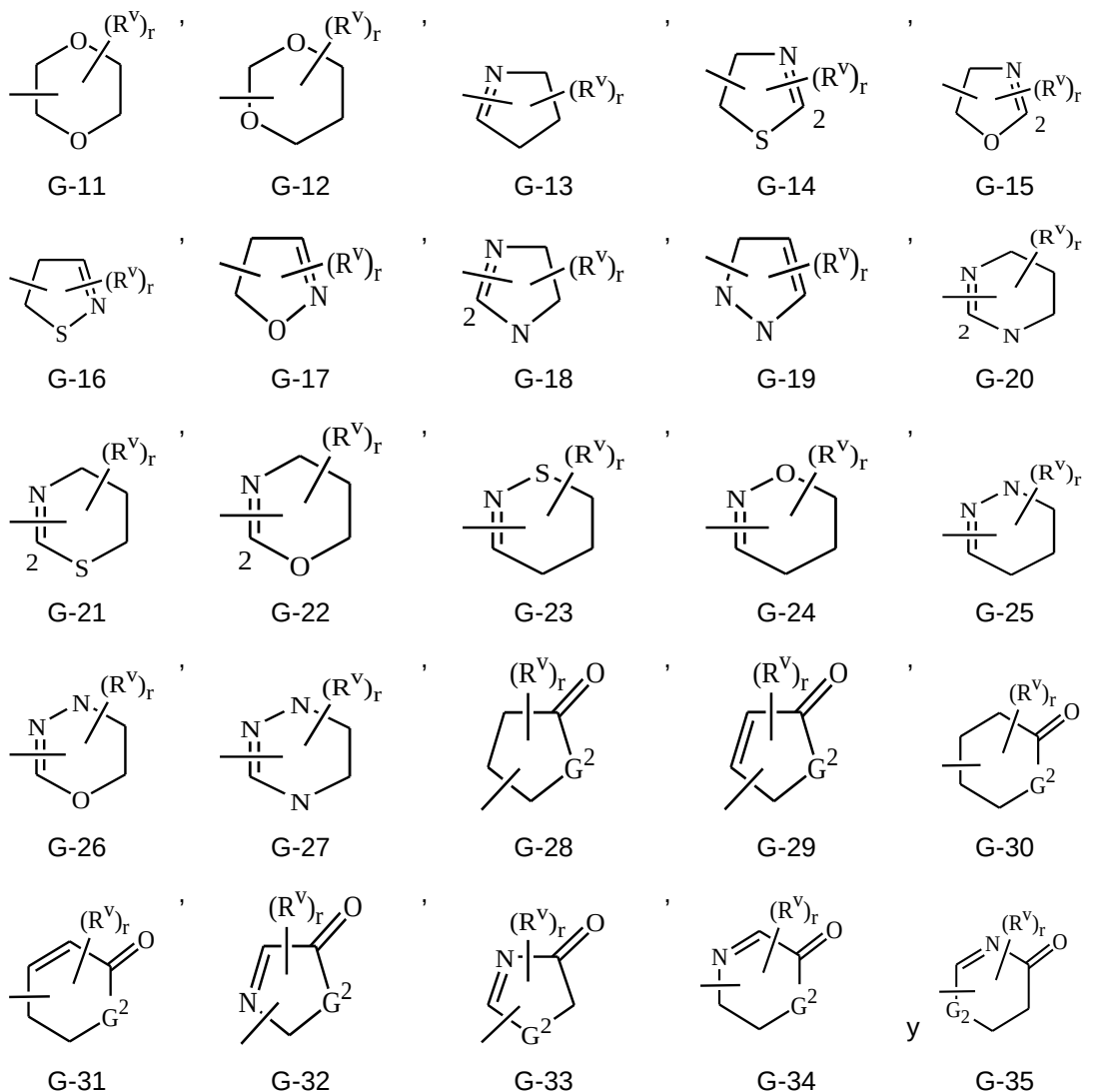
Obsérvese que cuando R^4 es un anillo heterocíclico no aromático saturado o insaturado de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados entre el grupo de sustituyentes como se definen en el Compendio, uno o dos miembros de anillo de carbono del heterociclo pueden estar opcionalmente en la forma oxidada de un resto carbonilo.

Los ejemplos de un anillo heterocíclico saturado o insaturado no aromático de 5 o 6 miembros incluyen los anillos G-1 a G-35, como se ilustra en la Presentación 2. Obsérvese que cuando el punto de unión en el grupo G se ilustra como flotante, el grupo G puede unirse al resto de la Fórmula 1 a través de cualquier carbono o nitrógeno disponible del grupo G reemplazando un átomo de hidrógeno. Los sustituyentes opcionales que corresponden a R^v se pueden unir a cualquier carbono o nitrógeno disponible reemplazando un átomo de hidrógeno. Para estos anillos G, s es normalmente un número entero de 1 a 5, limitado por el número de posiciones disponibles en cada grupo G.

Obsérvese que cuando R^4 comprende un anillo seleccionado de G-28 y G-35, G^2 se selecciona de O, S o N. Obsérvese que cuando G^2 es N, el átomo de nitrógeno puede completar su valencia por sustitución con los sustituyentes correspondientes a R^w como se definen en el Compendio.

Presentación 2





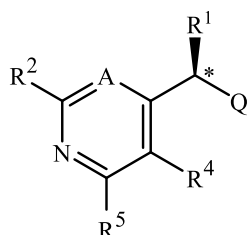
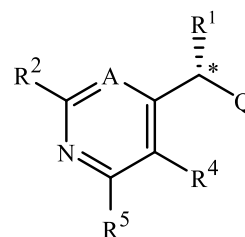
Aunque los grupos R^v se muestran en las estructuras de U-2 a U-61, cabe señalar que no es necesario que estén presentes puesto que son sustituyentes opcionales. Obsérvese que cuando R^v es H unido a un átomo, esto es lo mismo que si dicho átomo no estuviera sustituido. Los átomos de nitrógeno que requieren sustitución para llenar su valencia están sustituidos con H o R^v . Obsérvese que cuando el punto de unión entre $(R^v)_r$ y el anillo U se ilustra como flotante, $(R^v)_r$ puede estar unido a cualquier átomo de carbono o átomo de nitrógeno disponible del anillo U. Obsérvese que cuando el punto de unión en el anillo U se ilustra como flotante, el grupo U puede unirse al resto de la Fórmula 1 a través de cualquier carbono o nitrógeno disponible del grupo U reemplazando un átomo de hidrógeno. Obsérvese que algunos de los anillos U solo pueden estar sustituidos con menos de 4 grupos R^v (p. ej., de U-2 a U-5, de U-7 a U-49, y de U-52 a U-61).

En la técnica se conocen una gran diversidad de métodos de síntesis que permiten la preparación de anillos y sistemas anulares heterocíclicos aromáticos y no aromáticos; para consultar exámenes exhaustivos, véase el conjunto de ocho tomos de *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, redactores jefes

A. R. Katritzky y C. W. Rees, Pergamon Press, Oxford, 1984 y el conjunto de doce tomos de *Comprehensive Heterocyclic Chemistry II*, redactores jefes A. R. Katritzky, C. W. Rees y E. F. V. Scriven, Pergamon Press, Oxford, 1996.

Los compuestos de esta divulgación pueden existir como uno o más estereoisómeros. Los estereoisómeros son isómeros de constitución idéntica pero que difieren en la disposición de sus átomos en el espacio e incluyen enantiómeros, diastereómeros, isómeros *cis-trans* (también conocidos como isómeros geométricos) y atropisómeros. Los atropisómeros son el resultado de la rotación restringida alrededor de enlaces sencillos donde la barrera rotacional es lo suficientemente alta para permitir el aislamiento de las especies isoméricas. Un experto en la materia apreciará que un estereoisómero puede ser más activo y/o puede presentar efectos beneficiosos cuando está enriquecido con respecto al otro estereoisómero o estereoisómeros o cuando se separa del otro estereoisómero o estereoisómeros. Adicionalmente, el experto sabe cómo separar, enriquecer y/o preparar selectivamente dichos estereoisómeros. Para consultar un análisis exhaustivo de todos los aspectos de la estereoisomería, véase Ernest L. Eliel y Samuel H. Wilen, *Stereochemistry of Organic Compounds*, John Wiley & Sons, 1994.

Los compuestos de la divulgación pueden estar presentes como una mezcla de estereoisómeros o estereoisómeros individuales. Por ejemplo, dos posibles enantiómeros de Fórmula 1 se representan como la Fórmula 1a y la Fórmula 1a' que implican un centro de carbono quiral identificado con un asterisco (*). De forma análoga, son posibles otros centros quirales en, por ejemplo, R⁴.

**1a****1a'**

Las representaciones moleculares dibujadas en el presente documento siguen las convenciones clásicas para representar la estereoquímica. Para indicar la estereoconfiguración, los enlaces que sobresalen desde el plano del dibujo y hacia el observador se indican mediante cuñas continuas en donde el extremo ancho de la cuña se une al átomo que sobresale desde el plano del dibujo hacia el observador. Los enlaces que van por debajo del plano del dibujo y se alejan del observador se indican mediante cuñas discontinuas donde el extremo ancho de la cuña se une al átomo más alejado del observador.

Los compuestos de la divulgación pueden existir como estereoisómeros debido a los posibles átomos de carbono quirales presentes en la Fórmula 1. Por lo tanto, esta divulgación comprende los estereoisómeros individuales de los compuestos de Fórmula 1, así como mezclas de estereoisómeros de los compuestos de Fórmula 1.

Los compuestos de Fórmula **1** pueden comprender centros quirales adicionales. Por ejemplo, los sustituyentes y otros constituyentes moleculares, tales como R⁴ pueden contener a su vez centros quirales. Esta divulgación comprende mezclas racémicas, así como estereoconfiguraciones enriquecidas y esencialmente puras en estos centros quirales adicionales.

Los compuestos de la presente divulgación pueden existir como uno o más isómeros conformacionales debido a la rotación restringida alrededor de cualquiera de los enlaces en la Fórmula **1**. Esta divulgación comprende mezclas de isómeros conformacionales. Además, esta divulgación incluye compuestos que están enriquecidos en un conformero con respecto a otros.

Se cree que el enantiómero con mayor actividad biológica es la Fórmula **1a** (el enantiómero R de Fórmula **1**).

La presente divulgación comprende mezclas racémicas de cantidades iguales de los enantiómeros de las Fórmulas **1a** (el enantiómero R de Fórmula **1**) y **1a'** (el enantiómero S de Fórmula **1**). Además, la presente divulgación incluye mezclas que están enriquecidas en el enantiómero de Fórmula **1a** en comparación con la mezcla racémica de las Fórmulas **1a** y **1a'**. La presente divulgación también comprende el enantiómero esencialmente puro de Fórmula **1a**.

Una realización de la presente divulgación comprende mezclas de estereoisómeros de los compuestos de Fórmula **1a** y de Fórmula **1a'**, en donde la relación de **1a** a **1a'** es de al menos 75:25 (un exceso enantiomérico del 50 %).

Una realización de la presente divulgación comprende mezclas de estereoisómeros de los compuestos de Fórmula **1a** y de Fórmula **1a'**, en donde la relación de **1a** a **1a'** es de al menos 90:10 (un exceso enantiomérico del 80 % de **1a**).

Una realización de la presente divulgación comprende mezclas de estereoisómeros de los compuestos de Fórmula **1a** y de Fórmula **1a'**, en donde la relación de **1a** a **1a'** es de al menos 95:5 (un exceso enantiomérico del 90 % de **1a**).

Una realización de la presente divulgación comprende mezclas de estereoisómeros de los compuestos de Fórmula **1a** y de Fórmula **1a'**, en donde la relación de **1a** a **1a'** es de al menos 98:2 (un exceso enantiomérico del 96 % de **1a**).

Una realización de la presente divulgación comprende mezclas de estereoisómeros de los compuestos de Fórmula **1a** y de Fórmula **1a'**, en donde la relación de **1a** a **1a'** es de al menos 99:1 (un exceso enantiomérico del 98 % de **1a**).

Una realización de la presente divulgación comprende mezclas de estereoisómeros de los compuestos de Fórmula **1a** y de Fórmula **1a'**, en donde la relación de **1a** a **1a'** es esencialmente 100:0.

Una realización de la presente divulgación comprende los compuestos de Fórmula **1a**.

Un experto en la materia apreciará que no todos los heterociclos que contienen nitrógeno pueden formar *N*-óxidos, puesto que el nitrógeno requiere un par solitario disponible para la oxidación al óxido; un experto en la materia reconocerá los heterociclos que contienen nitrógeno que pueden formar *N*-óxidos. Un experto en la materia también reconocerá que las aminas terciarias pueden formar *N*-óxidos. Los

métodos de síntesis para la preparación de *N*-óxidos de heterociclos y aminas terciarias son muy conocidos por los expertos en la materia, incluyendo la oxidación de heterociclos y aminas terciarias con peroxiácidos tales como ácido peracético y 3-cloroperbenzoico (MCPBA), peróxido de hidrógeno, hidroperóxidos de alquilo tales como hidroperóxido de *t*-butilo, perborato de sodio y dioxiranos tales como dimetildioxirano.

- 5 Estos métodos para la preparación de *N*-óxidos se han descrito y examinado ampliamente en la bibliografía, véase, por ejemplo: T. L. Gilchrist en *Comprehensive Organic Synthesis*, tomo 7, págs. 748–750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler y B. Stanovnik en *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, tomo 3, págs. 18–20, A. J. Boulton y A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett y B. R. T. Keene en *Advances in Heterocyclic Chemistry*, tomo 43, págs. 149–161, A. R. Katritzki, Ed., Academic Press; M.
- 10 Tisler y B. Stanovnik en *Advances in Heterocyclic Chemistry*, tomo 9, págs. 285–291, A. R. Katritzky y A. J. Boulton, Eds., Academic Press; y G. W. H. Cheeseman y E. S. G. Werstiuk en *Advances in Heterocyclic Chemistry*, tomo 22, págs. 390–392, A. R. Katritzky y A. J. Boulton, Eds., Academic Press.

Un experto en la materia reconoce que, debido a que en el entorno y en condiciones fisiológicas las sales de los compuestos químicos están en equilibrio con sus correspondientes formas no salinas, las

15 sales comparten la utilidad biológica de las formas no salinas. Por tanto, una gran diversidad de sales de los compuestos de Fórmula 1 son útiles para el control de plagas de invertebrados. Las sales de los compuestos de Fórmula 1 incluyen sales de adición de ácido con ácidos inorgánicos u orgánicos tales como el ácido bromhídrico, clorhídrico, nítrico, fosfórico, sulfúrico, acético, butírico, fumárico, láctico, maleico, malónico, oxálico, propiónico, salicílico, tartárico, 4-toluenosulfónico o valérico. Cuando un

20 compuesto de Fórmula 1 contiene un resto ácido tal como un ácido carboxílico o fenol, las sales también incluyen las formadas con bases orgánicas o inorgánicas tales como piridina, trietilamina o amoníaco, o amidas, hidruros, hidróxidos o carbonatos de sodio, potasio, litio, calcio, magnesio o bario. Por consiguiente, la presente divulgación comprende compuestos seleccionados de Fórmula 1, *N*-óxidos y sales adecuadas de los mismos.

25 Los compuestos seleccionados de la Fórmula 1, estereoisómeros, tautómeros, *N*-óxidos y sales de estos, existen normalmente en más de una forma, y la Fórmula 1 incluye, por lo tanto, todas las formas cristalinas y no cristalinas de los compuestos que representa la Fórmula 1. Las formas no cristalinas incluyen realizaciones que son sólidas, tales como ceras y gomas, así como realizaciones que son líquidas, tales como soluciones y fundidos. Las formas cristalinas incluyen realizaciones que representan

30 esencialmente un único tipo de cristal y realizaciones que representan una mezcla de polimorfos (es decir, tipos cristalinos diferentes). El término "polimorfo" se refiere a una forma cristalina particular de un compuesto químico que puede cristalizar en diferentes formas cristalinas, teniendo estas formas diferentes disposiciones y/o conformaciones de las moléculas en la red cristalina. Aunque los polimorfos pueden tener la misma composición química, también pueden diferir en su composición debido a la presencia o ausencia

35 de agua cocrystalizada u otras moléculas, que pueden estar unidas a la red de manera débil o fuerte. Los polimorfos pueden diferir en propiedades químicas, físicas y biológicas como la forma cristalina, la densidad, la dureza, el color, la estabilidad química, el punto de fusión, la higroscopicidad, la

suspensibilidad, la velocidad de disolución y la disponibilidad biológica. Un experto en la materia apreciará que un polimorfo de un compuesto representado por la Fórmula 1 puede presentar efectos beneficiosos (por ejemplo, idoneidad para la preparación de formulaciones útiles, rendimiento biológico mejorado) con respecto a otro polimorfo o una mezcla de polimorfos del mismo compuesto representado por la Fórmula 1. La preparación y el aislamiento de un polimorfo particular de un compuesto representado por la Fórmula 1 se puede conseguir mediante métodos conocidos por los expertos en la técnica que incluyen, por ejemplo, la cristalización utilizando disolventes y temperaturas seleccionados. Los compuestos de esta divulgación pueden existir en forma de uno o más polimorfos cristalinos. Esta divulgación comprende tanto polimorfos individuales como mezclas de polimorfos, incluyendo mezclas enriquecidas en un polimorfo con respecto a otros. Para un análisis exhaustivo del polimorfismo, véase R. Hilfiker, Ed., *Polymorphism in the Pharmaceutical Industry*, Wiley-VCH, Weinheim, 2006.

Las realizaciones de la presente divulgación como se describen en el Compendio incluyen las que se describen a continuación. En las siguientes realizaciones, la Fórmula 1 incluye estereoisómeros, *N*-óxidos y sales de los mismos, y la referencia a "un compuesto de Fórmula 1" incluye las definiciones de sustituyentes especificadas en el Compendio, a menos que se definan adicionalmente en las realizaciones.

Realización 1. Un compuesto de Fórmula 1 en donde R^1 es H, CN, $OCOR^6$, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , haloalquinilo C_2-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 o cicloalquilalquilo C_3-C_5 .

Realización 1a. Un compuesto de Fórmula 1 en donde R^1 es H, CN, $OCOR^6$, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 o cicloalquilalquilo C_3-C_5 .

Realización 1b. Un compuesto de la Realización 1a, en donde R^1 es H, CN, $OCOR^6$, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 o halocicloalquilo C_3-C_6 .

Realización 1c. Un compuesto de la Realización 1b, en donde R^1 es H, CN, $OCOR^6$, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 o cicloalquilo C_3-C_6 .

Realización 1d. Un compuesto de la Realización 1c, en donde R^1 es H, CN, $OCOR^6$, alquilo C_1-C_6 o haloalquilo C_1-C_6 .

Realización 1e. Un compuesto de la Realización 1d, en donde R^1 es H, CN, $OCOR^6$ o alquilo C_1-C_6 .

Realización 1f. Un compuesto de la Realización 1e, en donde R^1 es H, CN o alquilo C_1-C_6 .

Realización 1g. Un compuesto de la Realización 1f, en donde R^1 es H o alquilo C_1-C_6 .

Realización 2. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Realizaciones anteriores en donde A es N o CR^3 .

Realización 2a. Un compuesto de la Realización 2 en donde A es CR^3 .

Realización 3. Un compuesto de Fórmula **1** o cualquiera de las Realizaciones anteriores en donde R^2 es H, halógeno, CN, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 .

Realización 3a. Un compuesto de la Realización 3 en donde R^2 es H, halógeno, CN, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_4 o alcoxi C_1-C_4 .

Realización 3b. Un compuesto de la Realización 3a, en donde R^2 es H, halógeno, CN, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_4 o halocicloalquilo C_3-C_4 .

Realización 3c. Un compuesto de la Realización 3b, en donde R^2 es H, halógeno, CN, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 o cicloalquilo C_3-C_4 .

Realización 3d. Un compuesto de la Realización 3c, en donde R^2 es H, halógeno, CN, alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 .

Realización 3e. Un compuesto de la Realización 3d, en donde R^2 es H, halógeno, CN o alquilo C_1-C_4 .

Realización 3f. Un compuesto de la Realización 3e, en donde R^2 es H, halógeno o alquilo C_1-C_4 .

Realización 3g. Un compuesto de la Realización 3f, en donde R^2 es H.

Realización 3h. Un compuesto de la Realización 3e, en donde R^2 es halógeno.

Realización 3i. Un compuesto de la Realización 3e, en donde R^2 es alquilo C_1-C_4 .

Realización 4. Un compuesto de Fórmula **1** o cualquiera de las Realizaciones anteriores en donde R^3 es H, halógeno, CN, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 .

Realización 4a. Un compuesto de la Realización 4 en donde R^3 es H, halógeno, CN, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_4 o alcoxi C_1-C_4 .

Realización 4b. Un compuesto de la Realización 4a, en donde R^3 es H, halógeno, CN, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_4 o halocicloalquilo C_3-C_4 .

Realización 4c. Un compuesto de la Realización 4b, en donde R^3 es H, halógeno, CN, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 o cicloalquilo C_3-C_4 .

Realización 4d. Un compuesto de la Realización 4c, en donde R^3 es H, halógeno, CN, alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 .

Realización 4e. Un compuesto de la Realización 4d, en donde R^3 es H, halógeno, CN o alquilo C_1-C_4 .

Realización 4f. Un compuesto de la Realización 4e, en donde R^3 es H, halógeno o alquilo C_1-C_4 .

Realización 4g. Un compuesto de la Realización 4f, en donde R^3 es H.

Realización 4h. Un compuesto de la Realización 4g, en donde R^3 es alquilo C_1-C_4 .

Realización 4i. Un compuesto de la Realización 4h, en donde R^3 es halógeno.

Realización 4j. Un compuesto de la Realización 4i, en donde R^3 es F, Br o Cl.

Realización 4k. Un compuesto de la Realización 4j, en donde R^3 es F o Cl.

Realización 4l. Un compuesto de la Realización 4k, en donde R^3 es F.

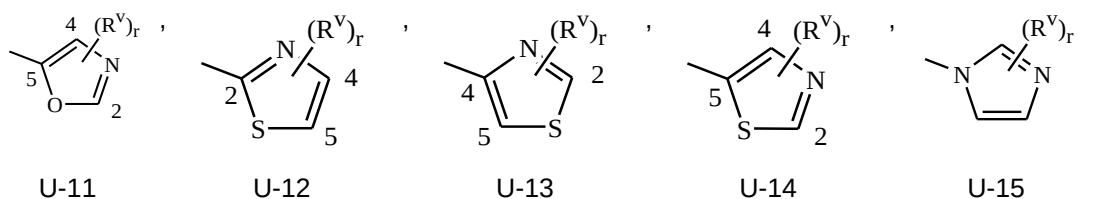
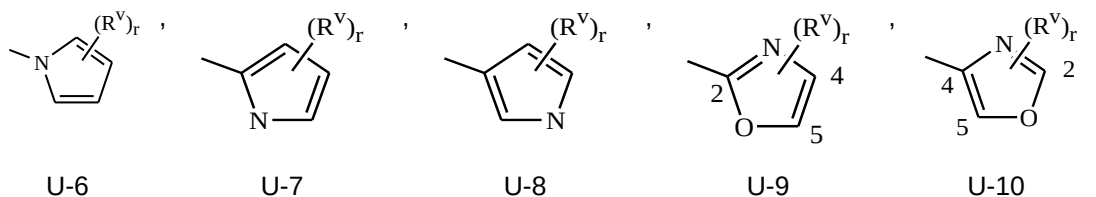
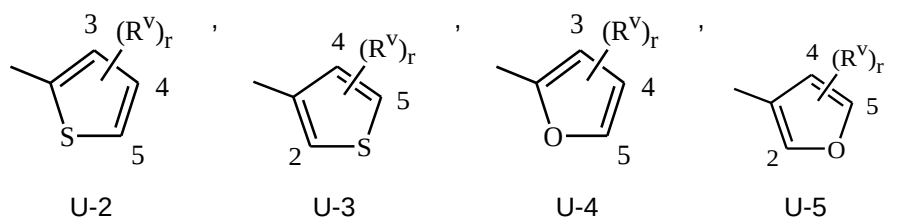
Realización 4m. Un compuesto de la Realización 4k, en donde R^3 es Cl.

Realización 4n. Un compuesto de la Realización 4j, en donde R^3 es Br.

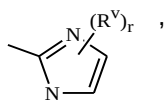
Realización 5. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones anteriores en donde R^4 es un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros, conteniendo cada anillo elementos del anillo seleccionados entre átomos de carbono y 1 a 4 heteroátomos seleccionados independientemente entre hasta 2 átomos de O, hasta 2 de átomos de S y hasta 4 átomos de N, en donde hasta 2 miembros de anillo se seleccionan independientemente entre $C(=O)$, $C(=S)$, $S(=O)$ y $S(=O)_2$, estando cada anillo opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R^v , y r es el número de los sustituyentes.

Realización 5a. Un compuesto de la Realización 5 en donde R^4 se selecciona entre U-2 a U-49 o entre U52 a U61 como se muestra en la Presentación 1.

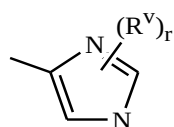
Presentación 1



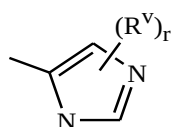
5



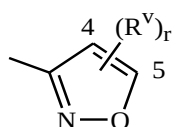
U-16



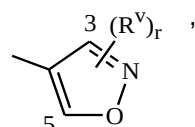
U-17



U-18

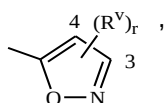


U-19

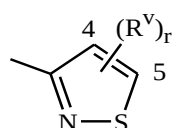


U-20

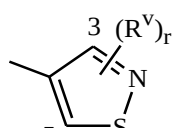
10



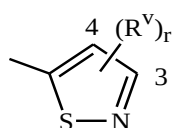
U-21



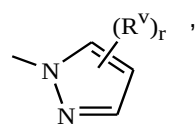
U-22



U-23

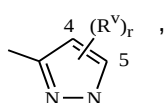


U-24

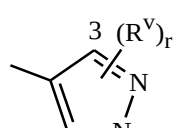


U-25

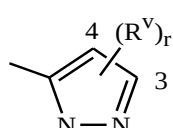
15



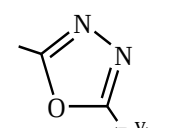
U-26



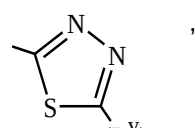
U-27



U-28

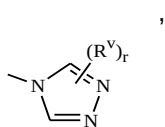


U-29

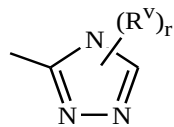


U-30

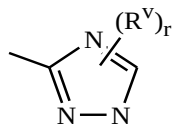
20



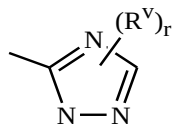
U-31



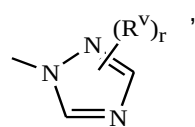
U-32



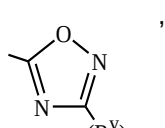
U-33



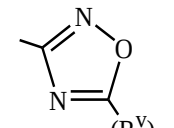
U-34



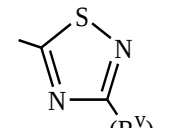
U-35



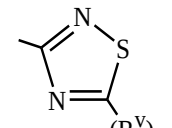
U-36



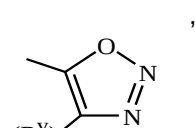
U-37



U-38

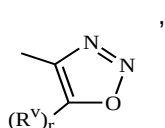


U-39

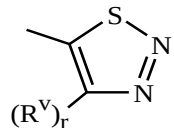


U-40

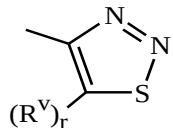
25



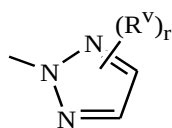
U-41



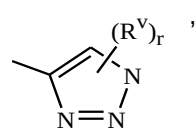
U-42



U-43

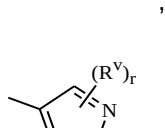


U-44

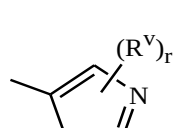


U-45

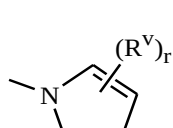
30



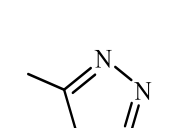
U-46



U-47

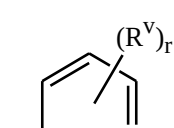


U-48

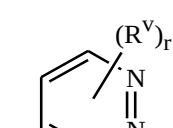


U-49

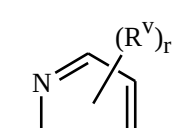
35



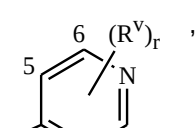
U-52



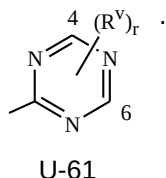
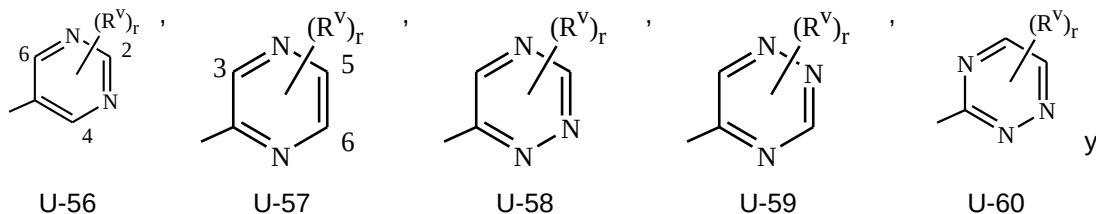
U-53



U-54



U-55



Realización 5b. Un compuesto de la Realización 5a, en donde R^4 se selecciona entre U-2 a U-49.

Realización 5c. Un compuesto de la Realización 5b, en donde R^4 se selecciona entre U-2, U-3, U-4, U-5, U-7, U-9, U-11, U-12, U-13, U-16, U-21, U-25, U-26, U-27, U-28, U-29, U-31, U-32, U-35, U-36, U-37, U-44, U-48 y U-49.

Realización 5d. Un compuesto de la Realización 5c, en donde R^4 se selecciona entre U-9, U-11, U-32, U-36, U-44, U-48 y U-49.

Realización 5e. Un compuesto de la Realización 5d, en donde R^4 se selecciona entre U-9, U-11, U-32, U-36, U-48 y U-44.

Realización 5f. Un compuesto de la Realización 5e, en donde R^4 se selecciona entre U-9, U-32, U-44 y U-48.

Realización 5g. Un compuesto de la Realización 5f, en donde R^4 es U-9.

Realización 5h. Un compuesto de la Realización 5g, en donde R^4 es U-11.

Realización 5i. Un compuesto de la Realización 5h, en donde R^4 es U-32.

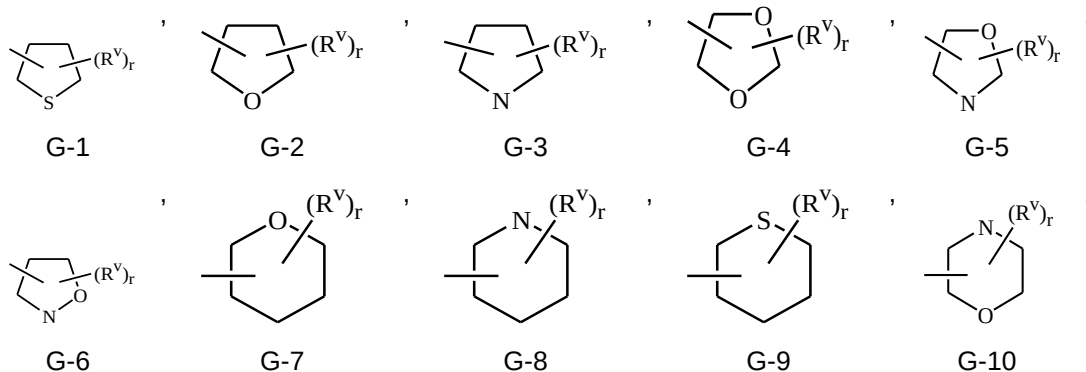
Realización 5j. Un compuesto de la Realización 5i, en donde R^4 es U-36.

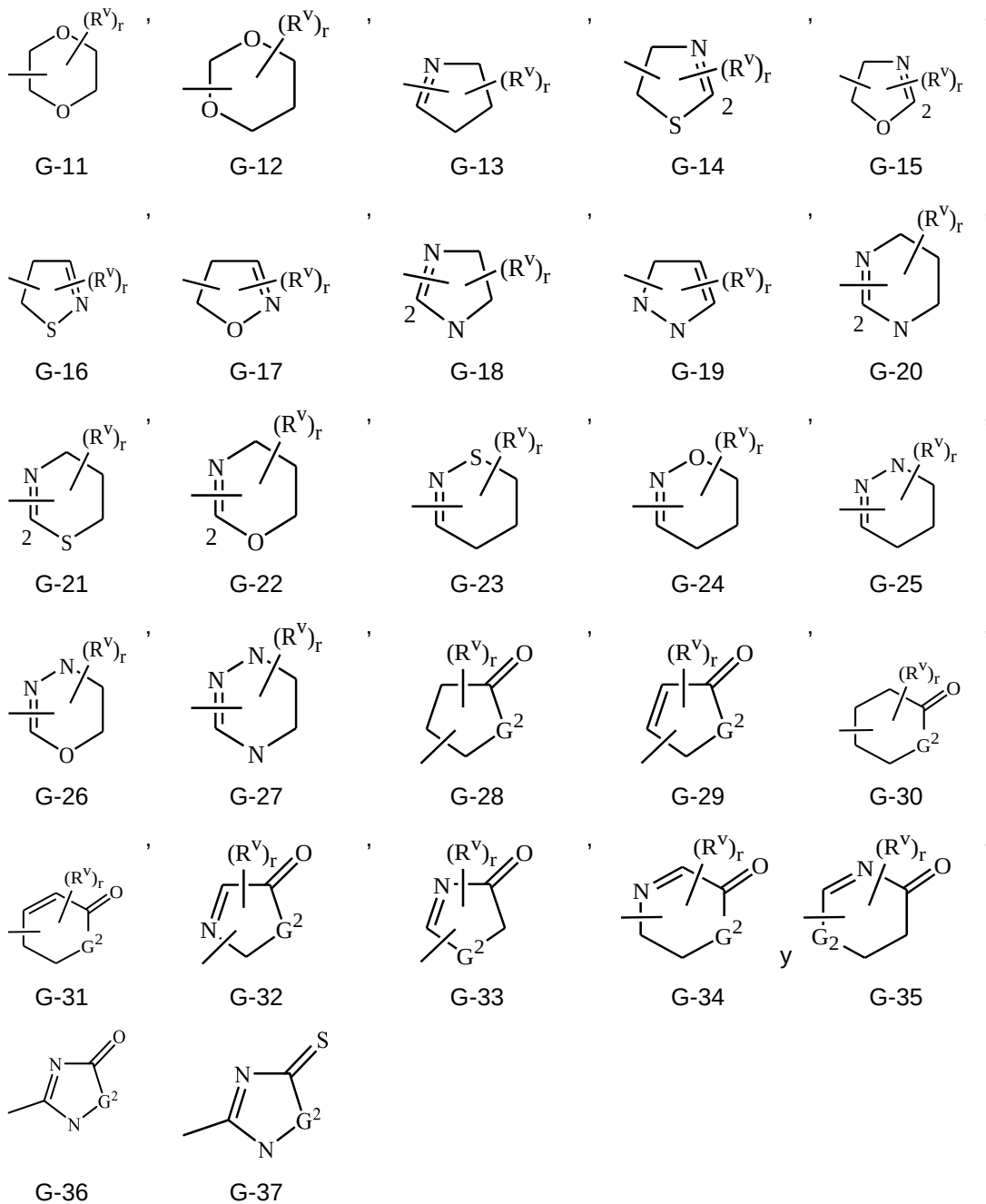
Realización 5k. Un compuesto de la Realización 5j, en donde R^4 es U-44.

Realización 5l. Un compuesto de la Realización 5k, en donde R^4 es U-48.

Realización 5l. Un compuesto de la Realización 5 en donde R^4 se selecciona entre G-1 a G-37 como se muestra en la Presentación 2.

Presentación 2





Realización 5l. Un compuesto de la Realización 5k, en donde G-2 es O, S o N.

Realización 5m. Un compuesto de la Realización 5l, en donde G-2 es O.

Realización 5n. Un compuesto de la Realización 5l, en donde G-2 es S.

Realización 5o. Un compuesto de la Realización 5l, en donde G-2 es N.

Realización 6. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Realizaciones anteriores en

donde R^v es independientemente H, halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o haloalcoxi C_1-C_6 .

Realización 6a. Un compuesto de la Realización 6 en donde R^v es H.

Realización 6b. Un compuesto de la Realización 6 en donde R^V es halógeno.

Realización 6c. Un compuesto de la Realización 6 en donde R^V es alquilo C_1-C_6 .

Realización 6d. Un compuesto de la Realización 6c, en donde R^V es Me.

Realización 7. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Realizaciones 5 a 6d en donde r es 1, 2, 3, 4 o 5.

Realización 7a. Un compuesto de la Realización 7 en donde r es 1 o 2.

Realización 7b. Un compuesto de la Realización 7 en donde r es 1.

Realización 7c. Un compuesto de la Realización 7 en donde r es 2.

Realización 7d. Un compuesto de la Realización 7 en donde r es 3.

Realización 7e. Un compuesto de la Realización 7 en donde r es 4.

Realización 7f. Un compuesto de la Realización 7 en donde r es 5.

Realización 8. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Realizaciones anteriores en donde R^5 es H, halógeno, CN, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 .

Realización 8a. Un compuesto de la Realización 8 en donde R^5 es H, halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 .

Realización 8b. Un compuesto de la Realización 8a, en donde R^5 es H o halógeno.

Realización 8c. Un compuesto de la Realización 8b, en donde R^5 es H.

Realización 8d. Un compuesto de la Realización 8b, en donde R^5 es halógeno.

Realización 8e. Un compuesto de la Realización 8d, en donde R^5 es F.

Realización 8e. Un compuesto de la Realización 8d, en donde R^5 es Cl.

Realización 8e. Un compuesto de la Realización 8d, en donde R^5 es Br.

Realización 8e. Un compuesto de la Realización 8a, en donde R^5 es alquilo C_1-C_4 .

Realización 9. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Realizaciones anteriores en donde R^6 es alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_4 o halocicloalquilo C_3-C_4 .

Realización 9a. Un compuesto de la Realización 9 en donde R^6 es alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 .

Realización 9b. Un compuesto de la Realización 9a, en donde R^6 es alquilo C_1-C_4 .

Realización 9c. Un compuesto de la Realización 9b, en donde R^6 es Me.

Realización 9d. Un compuesto de la Realización 9a, en donde R^6 es haloalquilo C_1-C_4 .

Realización 9e. Un compuesto de la Realización 9b, en donde R^6 es CF_3 .

Realización 10. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Realizaciones anteriores en donde Q es un anillo aromático de seis miembros con 0 a 2 N en el anillo, estando cada anillo opcionalmente sustituido en los elementos del anillo de átomos de carbono con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R^w .

Realización 10a. Un compuesto de la Realización 10 en donde Q es un anillo de fenilo, piridinilo, pirimidinilo o pirazinilo, estando cada anillo opcionalmente sustituido en los elementos del anillo de átomos de carbono con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R^w .

Realización 10b. Un compuesto de la Realización 10a, en donde Q es un anillo de fenilo opcionalmente sustituido en los elementos del anillo de átomos de carbono con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R^w .

Realización 10c. Un compuesto de la Realización 10a, en donde Q es un anillo de piridinilo opcionalmente sustituido en los elementos del anillo de átomos de carbono con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R^w .

Realización 10d. Un compuesto de la Realización 10a, en donde Q es un anillo de pirimidinilo opcionalmente sustituido en los elementos del anillo de átomos de carbono con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R^w .

Realización 10e. Un compuesto de la Realización 10a, en donde Q es un anillo de pirazinilo opcionalmente sustituido en los elementos del anillo de átomos de carbono con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R^w .

Realización 11. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Realizaciones 10 a 10e en donde R^w es independientemente H, ciano, halógeno, SF_5 , SCl , SO_2Cl , SO_2F , alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , haloalquinilo C_2-C_6 , alcoxialcoxi C_2-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , cicloalquiltio C_3-C_6 , alquilsulfinilo C_1-C_6 , haloalquilsulfinilo C_1-C_6 , alquilsulfonilo C_1-C_6 , haloalquilsulfonilo C_1-C_6 o cicloalquilsulfonilo C_3-C_6 ;

Realización 11a. Un compuesto de la Realización 11 en donde R^w es ciano, halógeno, alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , haloalquinilo C_2-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , alquilsulfinilo C_1-C_6 , haloalquilsulfinilo C_1-C_6 , alquilsulfonilo C_1-C_6 o haloalquilsulfonilo C_1-C_6 .

Realización 11b. Un compuesto de la Realización 11a, en donde R^w es haloalcoxi C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , haloalquinilo C_2-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , alquilsulfinilo C_1-C_6 , haloalquilsulfinilo C_1-C_6 , alquilsulfonilo C_1-C_6 , haloalquilsulfonilo C_1-C_6 .

Realización 11c. Un compuesto de la Realización 11b, en donde R^w es haloalcoxi C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , haloalquinilo C_2-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , haloalquilsulfinilo C_1-C_6 , haloalquilsulfonilo C_1-C_6 .

5 Realización 11d. Un compuesto de la Realización 11c, en donde R^w es OCF_3 , SCF_3 , OCF_2CFCF_3 , CF_3 , $SOCF_3$ o SO_2CF_3 .

Realización 11e. Un compuesto de la Realización 11d, en donde R^w es OCF_3 .

Realización 11f. Un compuesto de la Realización 11d, en donde R^w es SCF_3 .

10 Realización 11g. Un compuesto de la Realización 11d, en donde R^w es CF_3 .

Realización 11h. Un compuesto de la Realización 11d, en donde R^w es $SOCF_3$ o SO_2CF_3 .

Realización 11i. Un compuesto de la Realización 11h, en donde R^w es OCF_2CFCF_3 .

15 Realización 12. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Realizaciones anteriores en donde s es 1, 2, 3, 4 o 5.

Realización 12a. Un compuesto de la Realización 12 en donde r es 1 o 2.

Realización 12b. Un compuesto de la Realización 12 en donde r es 1.

Realización 12c. Un compuesto de la Realización 12 en donde r es 2.

Realización 12d. Un compuesto de la Realización 12 en donde r es 3.

20 Realización 12e. Un compuesto de la Realización 12 en donde r es 4.

Realización 12f. Un compuesto de la Realización 12 en donde r es 5.

Realización 13. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Realizaciones anteriores en donde n es 0, 1 o 2.

Realización 13a. Un compuesto de la Realización 13 en donde n es 0.

25 Realización 13b. Un compuesto de la Realización 13 en donde n es 1.

Realización 13c. Un compuesto de la Realización 13 en donde n es 2.

Realización A1. Un compuesto de una cualquiera de las Realizaciones 1-13c, en donde el compuesto de Fórmula 1 es un compuesto de Fórmula 1a.

30 Realización A2. Un compuesto de una cualquiera de las Realizaciones 1-13c, en donde el compuesto de Fórmula 1 es un compuesto de Fórmula 1a'.

Realización A3. Una composición que comprende un compuesto de Fórmula 1a y un compuesto de Fórmula 1a'.

Realización A3a. Una composición de la Realización A3 en donde la relación del compuesto de Fórmula 1a al compuesto de Fórmula 1a' es mayor de 60:40.

35 Realización A3b. Una composición de la Realización A3a en donde la relación del compuesto de Fórmula 1a al compuesto de Fórmula 1a' es mayor de 80:20.

Realización A3c. Una composición de la Realización A3a en donde la relación del compuesto de Fórmula 1a al compuesto de Fórmula 1a' es mayor de 90:10.

Realización A3d. Una composición de la Realización A3a en donde la relación del compuesto de Fórmula 1a al compuesto de Fórmula 1a' es mayor de 99:1.

5 Realización A4. Una composición que comprende un compuesto de Fórmula 1a' y un compuesto de Fórmula 1a.

Realización A4a. Una composición de la Realización A4 en donde la relación del compuesto de Fórmula 1a' al compuesto de Fórmula 1a es mayor de 60:40.

10 Realización A4b. Una composición de la Realización A4 en donde la relación del compuesto de Fórmula 1a' al compuesto de Fórmula 1a es mayor de 80:20.

Realización A4c. Una composición de la Realización A4 en donde la relación del compuesto de Fórmula 1a' al compuesto de Fórmula 1a es mayor de 90:10.

Realización A4d. Una composición de la Realización A4 en donde la relación del compuesto de Fórmula 1a' al compuesto de Fórmula 1a es mayor de 99:1.

15 Realización X. Un método para controlar una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su ambiente con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1.

Realización X1. Un método de la Realización X en donde la plaga de invertebrados es un miembro de los *Hemiptera*.

20 Realización X2. Un método de la Realización X1 en donde el miembro de los *Hemiptera* es un miembro del suborden *Homoptera*.

Realización X2a. Un método de la Realización X2 en donde el suborden *Homoptera* comprende saltapuntas de las familias *Cicadellidae* y *Delphacidae*.

25 Realización X2b. Un método de la Realización X2 en donde el suborden *Homoptera* comprende áfidos de la familia *Aphididae*.

Realización X2c. Un método de la Realización X2 en donde el suborden *Homoptera* comprende moscas blandas de la familia *Aleyrodidae*.

Realización X3. Un método de la Realización X2 en donde el suborden *Homoptera* comprende CPH, CMA, GPA y WF.

30 Realización X4. Un método de la Realización X2 en donde el suborden *Homoptera* comprende *Aphis fabae* Scopoli (pulgón de la judía negra), *Aphis gossypii* Glover (pulgón del algodón o pulgón del melón), *Bemisia tabaci* Gennadius (mosca blanca del tabaco, mosca blanca de la batata), *Bemisia argentifolii* Bellows & Perring (mosca blanca de hoja plateada), *Dialeurodes citri* Ashmead (mosca blanca de los cítricos) y *Trialeurodes vaporariorum* Westwood (mosca blanca de invernadero); *Empoasca fabae* Harris (saltahojas de la patata), *Laodelphax striatellus* Fallen (saltapuntas marrón pequeño), *Macrostelus quadrilineatus* Forbes (chicharrita), *Myzus persicae* (Sulzer), *Nephotettix cincticeps* Uhler (saltahojas verde del arroz), *Nephotettix nigropictus* Stål (saltahojas del arroz), *Nilaparvata lugens* Stål (saltapuntas pardo),

Peregrinus maidis Ashmead (saltapuntas del maíz), *Sogatella furcifera* Horvath (saltapuntas de dorso blanco), *Tagosodes orizicolus* Muir (delfácido del arroz), *Typhlocyba pomaria* McAtee (saltahojas blanco del manzano) o *Erythroneura* spp. (saltahojas de la vid).

Realización X5. Un método de la Realización X1 en donde el *Hemiptera* es un miembro del suborden *Heteroptera*.

Realización X5a. Un método de la Realización X5, en donde el suborden *Heteroptera* comprende *Acrosternum hilare* Say (chinche verde), *Anasa tristis* De Geer (chinche del calabacín), *Blissus leucopterus leucopterus* Say (chinche), *Cimex lectularius* Linnaeus (chinche) *Corythucha gossypii* Fabricius (chinche de encaje), *Cyrtopeltis modesta* Distant (chinche del tomate), *Dichelops melacanthus* Dallas (chinche de vientre verde), *Dysdercus suturellus* Herrich-Schäffer (tinte del algodón), *Euschistus heros* Fabricius (chinche parda neotropical), *Euschistus servus* Say (chinche hedionda parda), *Euschistus variolarius* Palisot de Beauvois (chinche hedionda de una mancha), *Graptostethus* spp. (complejo de chinches de semillas), *Halyomorpha halys* Stål (chinche hedionda parda marmorada), *Leptoglossus corculus* Say (chinche de semillas de pino con patas de hoja), *Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois (chinche lygus), *Nezara viridula* Linnaeus (chinche verde del sur), *Oebalus pugnax* Fabricius (chinche de arroz), *Oncopeltus fasciatus* Dallas (chinche grande de algodoncillo), *Pseudatomoscelis seriatus* Reuter (saltapulgas del algodón).

Realización X6. Un método de la Realización X5 en donde el suborden *Heteroptera* comprende chinches hediondas de la familia *Pentatomidae*.

Realización X7. Un método de la Realización X6 en donde el suborden *Heteroptera* comprende *Acrosternum hilare* Say (chinche hedionda verde), *Dichelops melacanthus* Dallas (chinche de vientre verde), *Euschistus heros* Fabricius (chinche parda neotropical), *Euschistus servus* Say (chinche hedionda parda), *Euschistus variolarius* Palisot de Beauvois (chinche hedionda de una mancha), *Halyomorpha halys* Stål (chinche hedionda marmolada parda), *Nezara viridula* Linnaeus (chinche hedionda verde del sur), *Oebalus pugnax* Fabricius (chinche hedionda del arroz).

Realización X8. Un método de la Realización X5 en donde el suborden *Heteroptera* comprende *Anasa tristis* De Geer (chinche del calabacín), *Blissus leucopterus* Say (chinche), *Cimex lectularius* Linnaeus (chinche), *Corythucha gossypii* Fabricius (chinche de encaje), *Cyrtopeltis modesta* Distant (chinche del tomate), *Dysdercus suturellus* Herrich-Schaffer (tinte del algodón), *Graptosthetus* spp. (complejo de chinches de semillas), *Leptoglossus corculus* Say (chinche de semillas de pino con patas de hoja), *Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois (chinche lygus), *Oncopeltus fasciatus* Dallas (chinche grande de algodoncillo) o *Pseudatomoscelis seriatus* Reuter (saltapulgas del algodón).

Las realizaciones de esta divulgación, incluyendo las Realizaciones 1–X8 anteriores, así como cualquier otra realización descrita en el presente documento, pueden combinarse de cualquier manera, y las descripciones de variables en las realizaciones no solo se refieren a los compuestos de Fórmula 1 sino también a los compuestos de partida y compuestos intermedios útiles para preparar los compuestos de Fórmula 1. Además, las realizaciones de esta divulgación, incluyendo las Realizaciones 1-X8 anteriores,

así como cualquier otra realización descrita en el presente documento y cualquier combinación de las mismas, se refieren a las composiciones y métodos de la presente divulgación.

Se ilustran combinaciones de las Realizaciones 1–X8 mediante:

Realización A1. Un compuesto de Fórmula 1 en donde

R^1 es H;

A es CR^3 ;

R^2 es H, halógeno, CN, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 ;

R^3 es H, halógeno, CN, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 ;

R^4 es un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros, conteniendo cada anillo elementos del anillo seleccionados entre átomos de carbono y 1 a 4 heteroátomos seleccionados independientemente entre hasta 2 átomos de O, hasta 2 de átomos de S y hasta 4 átomos de N, en donde hasta 2 miembros de anillo se seleccionan independientemente entre $C(=O)$, $C(=S)$, $S(=O)$ y $S(=O)_2$, estando cada anillo o sistema de anillo opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R^v , y r es el número de los sustituyentes.

cada R^v es independientemente H, halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o haloalcoxi C_1-C_6 ;

r es 1, 2, 3, 4 o 5;

R^5 es H, halógeno, CN, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 ;

Q es un anillo aromático de seis miembros con 0 a 2 N en el anillo, estando cada anillo opcionalmente sustituido en los elementos del anillo de átomos de carbono con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R^w ;

R^w es independientemente ciano, halógeno, alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , haloalqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , haloalquino C_2-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , alquilsulfinilo C_1-C_6 , haloalquilsulfinilo C_1-C_6 , alquilsulfonilo C_1-C_6 o haloalquilsulfonilo C_1-C_6 ;

s es 1, 2, 3, 4 o 5;

n es 0, 1 o 2.

Realización B1. Un compuesto de la Realización A1 en donde

R^2 es H, halógeno o alquilo C_1-C_4 ;

R^3 es H, halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 ;

R^4 se selecciona entre U-2 a U-49 o entre U52 a U61 como se muestra en la Presentación 1;
r es 1 o 2;

R^5 es H, halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 ;

R^w es haloalcoxi C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , haloalquinilo C_2-C_6 , haloalquiltio
5 C_1-C_6 , haloalquilsulfinilo C_1-C_6 , haloalquilsulfonilo C_1-C_6 .

s es 1 o 2.

Realización C1. Un compuesto de la Realización B1 en donde

R^2 es H;

R^3 es H o halógeno;

R^4 se selecciona entre U-2 a U-49;

R^v es H;

R^5 es H o halógeno;

10 Q es un anillo de fenilo, piridinilo, pirimidinilo o pirazinilo, estando cada anillo opcionalmente
sustituido en los elementos del anillo de átomos de carbono con hasta 5 sustituyentes seleccionados
independientemente entre R^w ;

R^w es OCF_3 , SCF_3 , OCF_2CF_3 , CF_3 , $SOCF_3$ o SO_2CF_3 .

Realización D1. Un compuesto de la Realización B1 en donde

R^2 es H;

R^3 es H o halógeno;

R^4 se selecciona entre U-2 a U-49;

R^v es alquilo C_1-C_6 ;

25 R^5 es H;

Q es un anillo de fenilo, piridinilo, pirimidinilo o pirazinilo, estando cada anillo opcionalmente
sustituido en los elementos del anillo de átomos de carbono con hasta 5 sustituyentes seleccionados
independientemente entre R^w ;

Realización E1. Un compuesto de la Realización C1 en donde

R^3 es halógeno;

R^4 se selecciona entre U-2, U-3, U-4, U-5, U-7, U-9, U-11, U-12, U-13, U-16, U-21, U-25, U-26, U-
27, U-28, U-29, U-31, U-32, U-35, U-36, U-37, U-44, U-48 y U-49;

R^5 es H;

35 Q es un anillo de fenilo, piridinilo, pirimidinilo o pirazinilo, estando cada anillo opcionalmente
sustituido en los elementos del anillo de átomos de carbono con hasta 5 sustituyentes seleccionados
independientemente entre R^w .

Realización F1. Un compuesto de la Realización E1 en donde

R^3 es F;

R^4 se selecciona entre U-9, U-11, U-32, U-36, U-44 y U-48;

Q es un anillo de fenilo opcionalmente sustituido en los elementos del anillo de átomos de carbono con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R^w .

Realización G1. Un compuesto de la Realización F1 en donde

R^4 se selecciona entre U-44 y U-48.

Realización H1. Un compuesto de la Realización G1 en donde

R^4 se selecciona entre el grupo de U-44.

Realización I1. Un compuesto de la Realización G1 en donde

R^4 se selecciona entre el grupo de U-48.

Realización J1. Un compuesto de la Realización B1 en donde

R^2 es alquilo C_1-C_4 ;

R^3 es H o halógeno;

R^4 se selecciona entre U-2 a U-49;

R^v es H;

r es 2;

R^5 es H;

Q es un anillo de fenilo, piridinilo, pirimidinilo o pirazinilo, estando cada anillo opcionalmente sustituido en los elementos del anillo de átomos de carbono con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R^w ;

R^w es OCF_3 , SCF_3 , OCF_2CFCF_3 , CF_3 , $SOCF_3$ o SO_2CF_3 .

Realización A2. Un compuesto de Fórmula 1 en donde

R^1 es CN;

A es CR^3 ;

R^2 es H, halógeno, CN, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 ;

R^3 es H, halógeno, CN, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 ;

R^4 es un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros, conteniendo cada anillo elementos del anillo seleccionados entre átomos de carbono y 1 a 4 heteroátomos seleccionados independientemente entre hasta 2 átomos de O, hasta 2 de átomos de S y hasta 4 átomos de N, en donde hasta 2 miembros de anillo se seleccionan independientemente entre $C(=O)$, $C(=S)$, $S(=O)$ y $S(=O)_2$, estando cada anillo o sistema de

anillo opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R^v , y r es el número de los sustituyentes.

cada R^v es independientemente H, halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o haloalcoxi C_1-C_6 ;

r es 1, 2, 3, 4 o 5;

R^5 es H, halógeno, CN, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 ;

Q es un anillo aromático de seis miembros con 0 a 2 N en el anillo, estando cada anillo opcionalmente sustituido en los elementos del anillo de átomos de carbono con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R^w ;

R^w es independientemente ciano, halógeno, alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , haloalqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , haloalquino C_2-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , alquilsulfinilo C_1-C_6 , haloalquilsulfinilo C_1-C_6 , alquilsulfonilo C_1-C_6 o haloalquilsulfonilo C_1-C_6 ;

s es 1, 2, 3, 4 o 5;

n es 0, 1 o 2.

Realización B2. Un compuesto de la Realización A2 en donde

R^2 es H, halógeno o alquilo C_1-C_4 ;

R^3 es H, halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 ;

R^4 se selecciona entre U-2 a U-49 o entre U52 a U61 como se muestra en la Presentación 1;

r es 1 o 2;

R^5 es H, halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 ;

R_w es haloalcoxi C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalqueno C_2-C_6 , haloalquino C_2-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , haloalquilsulfinilo C_1-C_6 , haloalquilsulfonilo C_1-C_6 .

s es 1 o 2.

Realización C2. Un compuesto de la Realización B2 en donde

R^2 es H;

R^3 es H o halógeno;

R^4 se selecciona entre U-2 a U-49;

R^v es H;

r es 2;

R^5 es H o halógeno;

Q es un anillo de fenilo, piridinilo, pirimidinilo o pirazinilo, estando cada anillo opcionalmente sustituido en los elementos del anillo de átomos de carbono con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R^w ;

R^w es OCF_3 , SCF_3 , OCF_2CFCF_3 , CF_3 , $SOCF_3$ o SO_2CF_3 .

Realización D2. Un compuesto de la Realización B2 en donde

R^2 es H;

R^3 es H o halógeno;

R^4 se selecciona entre U-2 a U-49;

R^v es alquilo C_1 - C_6 ;

R^5 es H;

Q es un anillo de fenilo, piridinilo, pirimidinilo o pirazinilo, estando cada anillo opcionalmente sustituido en los elementos del anillo de átomos de carbono con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R^w .

Realización E2. Un compuesto de la Realización C2 en donde

R^3 es halógeno;

R^4 se selecciona entre U-2, U-3, U-4, U-5, U-7, U-9, U-11, U-12, U-13, U-16, U-21, U-25, U-26, U-27, U-28, U-29, U-31, U-32, U-35, U-36, U-37, U-44, U-48 y U-49;

R^5 es H;

Q es un anillo de fenilo, piridinilo, pirimidinilo o pirazinilo, estando cada anillo opcionalmente sustituido en los elementos del anillo de átomos de carbono con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R^w .

Realización F2. Un compuesto de la Realización E2 en donde

R^3 es F;

R^4 se selecciona entre U-9 y U-44;

Q es un anillo de fenilo opcionalmente sustituido en los elementos del anillo de átomos de carbono con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R^w .

Realización G2. Un compuesto de la Realización F2 en donde

R^4 es U-44.

Realización H2. Un compuesto de la Realización F2 en donde

R^4 es U-48.

Realización A3. Un compuesto de Fórmula 1 en donde

R^1 es $OCOR^6$;

A es CR^3 ;

R^2 es H, halógeno, CN, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 ;

R^3 es H, halógeno, CN, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 ;

R^4 es un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros, conteniendo cada anillo elementos del anillo seleccionados entre átomos de carbono y 1 a 4 heteroátomos seleccionados independientemente entre hasta 2 átomos de O, hasta 2 de átomos de S y hasta 4 átomos de N, en donde hasta 2 miembros de anillo se seleccionan independientemente entre $C(=O)$, $C(=S)$, $S(=O)$ y $S(=O)_2$, estando cada anillo o sistema de anillo opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R^v , y r es el número de los sustituyentes.

cada R^v es independientemente H, halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o haloalcoxi C_1-C_6 ;

r es 1, 2, 3, 4 o 5;

R^5 es H, halógeno, CN, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 ;

R^6 es alquilo C_1-C_4 ;

Q es un anillo aromático de seis miembros con 0 a 2 N en el anillo, estando cada anillo opcionalmente sustituido en los elementos del anillo de átomos de carbono con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R^w ;

R^w es independientemente ciano, halógeno, alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , haloalqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , haloalquino C_2-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , alquilsulfinilo C_1-C_6 , haloalquilsulfinilo C_1-C_6 , alquilsulfonilo C_1-C_6 o haloalquilsulfonilo C_1-C_6 ;

s es 1, 2, 3, 4 o 5;

n es 0, 1 o 2.

Realización B3. Un compuesto de la Realización A3 en donde

R^2 es H, halógeno o alquilo C_1-C_4 ;

R^3 es H, halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 ;

R^4 se selecciona entre U-2 a U-49 o entre U52 a U61 como se muestra en la Presentación 1;

r es 1 o 2;

R^5 es H, halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 ;

R^6 es Me;

R^w es haloalcoxi C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalquenilo C_1-C_6 , haloalquinilo C_2-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , haloalquilsulfinilo C_1-C_6 , haloalquilsulfonilo C_1-C_6 .

s es 1 o 2.

Realización C3. Un compuesto de la Realización B3 en donde

R^2 es H;

R^3 es H o halógeno;

R^4 se selecciona entre U-2 a U-49;

R^v es H;

r es 2;

R^5 es H;

Q es un anillo de fenilo, piridinilo, pirimidinilo o pirazinilo, estando cada anillo opcionalmente sustituido en los elementos del anillo de átomos de carbono con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R^w ;

R^w es OCF_3 , SCF_3 , OCF_2CFCF_3 , CF_3 , $SOCF_3$ o SO_2CF_3 .

Realización D3. Un compuesto de la Realización B3 en donde

R^2 es H;

R^3 es H o halógeno;

R^4 se selecciona entre U-2 a U-49;

R^v es alquilo C_1-C_6 ;

R^5 es H;

Q es un anillo de fenilo, piridinilo, pirimidinilo o pirazinilo, estando cada anillo opcionalmente sustituido en los elementos del anillo de átomos de carbono con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R^w ;

Realización E3. Un compuesto de la Realización C3 en donde

R^3 es halógeno;

R^4 se selecciona entre U-2, U-3, U-4, U-5, U-7, U-9, U-11, U-12, U-13, U-16, U-21, U-25, U-26, U-27, U-28, U-29, U-31, U-32, U-35, U-36, U-37, U-44, U-48 y U-49;

R^5 es H;

Q es un anillo de fenilo, piridinilo, pirimidinilo o pirazinilo, estando cada anillo opcionalmente sustituido en los elementos del anillo de átomos de carbono con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R^w .

Realización F3. Un compuesto de la Realización E3 en donde

R^3 es F;

R^4 es U-44 o U-48;

Q es un anillo de fenilo opcionalmente sustituido en los elementos del anillo de átomos de carbono con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R^w .

Realización G3. Un compuesto de la Realización F3 en donde

R^4 se selecciona entre el grupo de U-44.

Realización H3. Un compuesto de la Realización F3 en donde

R^4 se selecciona entre el grupo de U-48.

Realización A4. Un compuesto de Fórmula 1 en donde

R^1 es alquilo C_1-C_6 ;

A es CR^3 ;

R^2 es H, halógeno, CN, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 ;

R^3 es H, halógeno, CN, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 ;

R^4 es un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros, conteniendo cada anillo elementos del anillo seleccionados entre átomos de carbono y 1 a 4 heteroátomos seleccionados independientemente entre hasta 2 átomos de O, hasta 2 de átomos de S y hasta 4 átomos de N, en donde hasta 2 miembros de anillo se seleccionan independientemente entre $C(=O)$, $C(=S)$, $S(=O)$ y $S(=O)_2$, estando cada anillo o sistema de anillo opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R^v , y r es el número de los sustituyentes.

cada R^v es independientemente H, halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o haloalcoxi C_1-C_6 ;

r es 1, 2, 3, 4 o 5;

R^5 es H, halógeno, CN, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 ;

Q es un anillo aromático de seis miembros con 0 a 2 N en el anillo, estando cada anillo opcionalmente sustituido en los elementos del anillo de átomos de carbono con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R^w ;

R^w es independientemente ciano, halógeno, alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , haloalquinilo C_2-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , alquilsulfinilo C_1-C_6 , haloalquilsulfinilo C_1-C_6 , alquilsulfonilo C_1-C_6 o haloalquilsulfonilo C_1-C_6 ;

s es 1, 2, 3, 4 o 5;

n es 0, 1 o 2.

Realización B4. Un compuesto de la Realización A4 en donde

R^2 es H, halógeno o alquilo C_1-C_4 ;

R^3 es H, halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 ;

R^4 se selecciona entre U-2 a U-49 o entre U52 a U61 como se muestra en la Presentación 1;
r es 1 o 2;

R^5 es H, halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 ;

R^w es haloalcoxi C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , haloalquinilo C_2-C_6 , haloalquiltio
 C_1-C_6 , haloalquilsulfinilo C_1-C_6 , haloalquilsulfonilo C_1-C_6 .

s es 1 o 2.

Realización C4. Un compuesto de la Realización B4 en donde

R^2 es H;

R^3 es H o halógeno;

R^4 se selecciona entre U-2 a U-49;

R^v es H;

R^5 es H o halógeno;

Q es un anillo de fenilo, piridinilo, pirimidinilo o pirazinilo, estando cada anillo opcionalmente
sustituido en los elementos del anillo de átomos de carbono con hasta 5 sustituyentes seleccionados
independientemente entre R^w ;

R^w es OCF_3 , SCF_3 , OCF_2CFCF_3 , CF_3 , $SOCF_3$ o SO_2CF_3 .

Realización D4. Un compuesto de la Realización B4 en donde

R^2 es H;

R^3 es H o halógeno;

R^4 se selecciona entre U-2 a U-49;

R^v es alquilo C_1-C_6 ;

R^5 es H;

Q es un anillo de fenilo, piridinilo, pirimidinilo o pirazinilo, estando cada anillo opcionalmente
sustituido en los elementos del anillo de átomos de carbono con hasta 5 sustituyentes seleccionados
independientemente entre R^w ;

Realización E4. Un compuesto de la Realización C4 en donde

R^3 es halógeno;

R^4 se selecciona entre U-2, U-3, U-4, U-5, U-7, U-9, U-11, U-12, U-13, U-16, U-21, U-25, U-26, U-
27, U-28, U-29, U-31, U-32, U-35, U-36, U-37, U-44, U-48 y U-49;

R^5 es H;

Q es un anillo de fenilo, piridinilo, pirimidinilo o pirazinilo, estando cada anillo opcionalmente sustituido en los elementos del anillo de átomos de carbono con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R^w .

5 Realización D4. Un compuesto de la Realización E4 en donde

R^3 es F;

R^4 se selecciona entre U-9, U-11, U-32, U-36, U-44 y U-48;

10 Q es un anillo de fenilo opcionalmente sustituido en los elementos del anillo de átomos de carbono con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R^w .

Realización E4. Un compuesto de la Realización D4 en donde

R^4 se selecciona entre U-44 y U-48.

Realización F4. Un compuesto de la Realización E4 en donde

R^4 se selecciona entre el grupo de U-44.

15 Realización G4. Un compuesto de la Realización F4 en donde

R^4 se selecciona entre el grupo de U-48.

Realización H4. Un compuesto de la Realización B4 en donde

R^2 es alquilo C_1-C_4 ;

20 R^3 es H o halógeno;

R^4 se selecciona entre U-2 a U-49;

R^v es H;

r es 2;

R^5 es H;

25 Q es un anillo de fenilo, piridinilo, pirimidinilo o pirazinilo, estando cada anillo opcionalmente sustituido en los elementos del anillo de átomos de carbono con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R^w ;

R^w es OCF_3 , SCF_3 , OCF_2CFCF_3 , CF_3 , $SOCF_3$ o SO_2CF_3 .

30 Realización I4. Un compuesto de una cualquiera de las Realizaciones A4 a H4 en donde R^1 es Me.

Realización A5. Un compuesto de Fórmula 1 en donde

R^1 es alquenilo C_2-C_6 ;

A es CR^3 ;

35 R^2 es H, halógeno, CN, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 ;

R^3 es H, halógeno, CN, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 ;

R^4 es un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros, conteniendo cada anillo elementos del anillo seleccionados entre átomos de carbono y 1 a 4 heteroátomos seleccionados independientemente entre hasta 2 átomos de O, hasta 2 de átomos de S y hasta 4 átomos de N, en donde hasta 2 miembros de anillo se seleccionan independientemente entre $C(=O)$, $C(=S)$, $S(=O)$ y $S(=O)_2$, estando cada anillo o sistema de anillo opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R^v , y r es el número de los sustituyentes.

cada R^v es independientemente H, halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o haloalcoxi C_1-C_6 ;

r es 1, 2, 3, 4 o 5;

R^5 es H, halógeno, CN, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 ;

Q es un anillo aromático de seis miembros con 0 a 2 N en el anillo, estando cada anillo opcionalmente sustituido en los elementos del anillo de átomos de carbono con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R^w ;

R^w es independientemente ciano, halógeno, alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , haloalqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , haloalquino C_2-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , alquilsulfinilo C_1-C_6 , haloalquilsulfinilo C_1-C_6 , alquilsulfonilo C_1-C_6 o haloalquilsulfonilo C_1-C_6 ;

s es 1, 2, 3, 4 o 5;

n es 0, 1 o 2.

Realización B5. Un compuesto de la Realización A5 en donde

R^2 es H, halógeno o alquilo C_1-C_4 ;

R^3 es H, halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 ;

R^4 se selecciona entre U-2 a U-49 o entre U52 a U61 como se muestra en la Presentación 1;

r es 1 o 2;

R^5 es H, halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 ;

R^w es haloalcoxi C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalqueno C_2-C_6 , haloalquino C_2-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , haloalquilsulfinilo C_1-C_6 , haloalquilsulfonilo C_1-C_6 .

s es 1 o 2.

Realización C5. Un compuesto de la Realización B5 en donde

R^2 es H;

R^3 es H o halógeno;

R^4 se selecciona entre U-2 a U-49;

R^v es H;

R^5 es H o halógeno;

Q es un anillo de fenilo, piridinilo, pirimidinilo o pirazinilo, estando cada anillo opcionalmente sustituido en los elementos del anillo de átomos de carbono con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R^w ;

R^w es OCF_3 , SCF_3 , OCF_2CFCF_3 , CF_3 , $SOCF_3$ o SO_2CF_3 .

Realización D5. Un compuesto de la Realización B5 en donde

R^2 es H;

R^3 es H o halógeno;

R^4 se selecciona entre U-2 a U-49;

R^v es alquilo C_1-C_6 ;

R^5 es H;

Q es un anillo de fenilo, piridinilo, pirimidinilo o pirazinilo, estando cada anillo opcionalmente sustituido en los elementos del anillo de átomos de carbono con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente entre R^w ;

Las realizaciones específicas incluyen uno o más compuestos de Fórmula 1 seleccionados entre el grupo que consiste en:

3-fluoro-5-(2H-1,2,3-triazol-2-il)-4-[[4-(trifluorometoxi)fenil]metil]piridina;

3-fluoro-5-(2H-1,2,3-triazol-2-il)-4-[[4-[(trifluorometil)tio]fenil]metil]piridina;

3-fluoro-5-(2H-1,2,3-triazol-2-il)-4-[1-[4-(trifluorometoxi)fenil]etil]piridina;

3-fluoro-5-(2H-1,2,3-triazol-2-il)-4-[1-[4-[(trifluorometil)tio]fenil]etil]piridina;

3-cloro-5-(2H-1,2,3-triazol-2-il)-4-[[4-(trifluorometoxi)fenil]metil]piridina;

3-cloro-5-(2H-1,2,3-triazol-2-il)-4-[[4-[(trifluorometil)tio]fenil]metil]piridina;

3-cloro-5-(2H-1,2,3-triazol-2-il)-4-[1-[4-(trifluorometoxi)fenil]etil]piridina;

3-cloro-5-(2H-1,2,3-triazol-2-il)-4-[1-[4-[(trifluorometil)tio]fenil]etil]piridina;

3-bromo-5-(2H-1,2,3-triazol-2-il)-4-[[4-(trifluorometil)tio]fenil]metil]piridina;

3-bromo-5-(2H-1,2,3-triazol-2-il)-4-[[4-(trifluorometoxi)fenil]metil]piridina;

3-fluoro-5-(1H-1-pirazol-1-il)-4-[[4-(trifluorometoxi)fenil]metil]piridina;

3-cloro-5-(1H-1-pirazol-1-il)-4-[[4-(trifluorometoxi)fenil]metil]piridina;

3-bromo-5-(1H-pirazol-1-il)-4-[[4-(trifluorometoxi)fenil]metil]piridina;

3-fluoro-5-(1H-pirazol-1-il)-4-[[4-[(trifluorometil)tio]fenil]metil]piridina;

3-cloro-5-(1H-pirazol-1-il)-4-[[4-[(trifluorometil)tio]fenil]metil]piridina;

3-bromo-5-(1H-pirazol-1-il)-4-[[4-[(trifluorometil)tio]fenil]metil]piridina;

- 3-fluoro-5-(2H-1,2,3-triazol-2-il)-4-[[4-(trifluorometil)fenil]metil]piridina;
 3-cloro-5-(2H-1,2,3-triazol-2-il)-4-[[4-(trifluorometil)fenil]metil]piridina;
 3-bromo-5-(2H-1,2,3-triazol-2-il)-4-[[4-(trifluorometil)fenil]metil]piridina;
 3-fluoro-4-[[4-(1,1,2,2,2-pentafluoroetil)fenil]metil]-5-(2H-1,2,3-triazol-2-il)piridina;
 5 3-cloro-4-[[4-(1,1,2,2,2-pentafluoroetil)fenil]metil]-5-(2H-1,2,3-triazol-2-il)piridina;
 3-bromo-4-[[4-(1,1,2,2,2-pentafluoroetil)fenil]metil]-5-(2H-1,2,3-triazol-2-il)piridina;
 4-[[4-(difluorometoxi)fenil]metil]-3-fluoro-5-(2H-1,2,3-triazol-2-il)piridina;
 3-cloro-4-[[4-(difluorometoxi)fenil]metil]-5-(2H-1,2,3-triazol-2-il)piridina;
 3-bromo-4-[[4-(difluorometoxi)fenil]metil]-5-(2H-1,2,3-triazol-2-il)piridina;
 10 3-fluoro-5-(1H-pirazol-1-il)-4-[[4-(trifluorometil)fenil]metil]piridina;
 3-cloro-5-(1H-pirazol-1-il)-4-[[4-(trifluorometil)fenil]metil]piridina;
 3-bromo-5-(1H-pirazol-1-il)-4-[[4-(trifluorometil)fenil]metil]piridina;
 3-fluoro-4-[[4-(1,1,2,2,2-pentafluoroetil)fenil]metil]-5-(1H-pirazol-1-il)piridina;
 3-cloro-4-[[4-(1,1,2,2,2-pentafluoroetil)fenil]metil]-5-(1H-pirazol-1-il)piridina;
 15 3-bromo-4-[[4-(1,1,2,2,2-pentafluoroetil)fenil]metil]-5-(1H-pirazol-1-il)piridina;
 4-[[4-(difluorometoxi)fenil]metil]-3-fluoro-5-(1H-pirazol-1-il)piridina;
 3-cloro-4-[[4-(difluorometoxi)fenil]metil]-5-(1H-pirazol-1-il)piridina; y
 3-bromo-4-[[4-(difluorometoxi)fenil]metil]-5-(1H-pirazol-1-il)piridina.

Realización Y1. Una composición que comprende un compuesto de Fórmula 1 o de una cualquiera
 20 de las realizaciones anteriores y al menos un componente adicional seleccionado entre el grupo que
 consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, comprendiendo dicha composición
 opcionalmente además al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional.

Realización Y2. La composición de la realización Y1 en donde el al menos un compuesto o agente
 biológicamente activo adicional se selecciona entre el grupo que consiste en abamectina, acefato,
 25 acequinocil, acetamiprid, acrinatrina, afidopiropeno, amidoflomet, amitraz, avermectina, azadiractina,
 azinfós-metilo, benfuracarb, bensultap, bifentrina, bifenazato, bistriflurón, borato, bromantraniliprol,
 buprofezina, carbarilo, carbofurano, cartap, carzol, clorantraniliprol, clorfenapir, clorfluazurón, clorpirifós,
 clorpirifós-metilo, cromafenozid, clofentezina, clotianidina, ciantraniliprol, ciclaniliprol, cicloprotrina,
 cicloxaprid, ciflumetofeno, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalodiamida, cihalotrina, gamma-cihalotrina, lambda-
 30 cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, zeta-cipermetrina, ciromazina, deltametrina, diafentiurón,
 diazinón, diclorantraniliprol, dieldrina, diflubenzurón, dimeflutrina, dimehipo, dimetolato, dinotefurano,
 diofenolán, emamectina, endosulfán, esfenvalerato, etiprol, etofenprox, etoxazol, óxido de fenbutatina,
 fenitrotión, fenotiocarb, fenoxicarb, fenpropatrina, fenvalerato, fipronil, flometoquina, flonicamid,
 flubendiamida, flucitrinato, flufenerim, flufenoxurón, flufenoxistrobina, fluensulfona, fluopiram,
 35 flupiradifurona, fluvalinato, tau-fluvalinato, fonofós, formetanato, fostiazato, halofenozid, heptaflutrina,
 hexaflumurón, hexitiazox, hidrametilnón, imidacloprid, indoxacarb, jabones insecticidas, isofenfós,
 lufenurón, malatión, meperflutrina, metaflumizona, metaldehído, methamidofós, methidatión, metiocarb,

metomilo, metopreno, metoxiclor, metoxifeno, metoflutrina, monocrotofos, monofluorotrina, nicotina, N-[1,1-dimetil-2-(metiltio)etil]-7-fluoro-2-(3-piridinil)-2H-indazol-4-carboxamida, N-[1,1-dimetil-2-(metilsulfinil)etil]-7-fluoro-2-(3-piridinil)-2H-indazol-4-carboxamida, N-[1,1-dimetil-2-(metilsulfonil)etil]-7-fluoro-2-(3-piridinil)-2H-indazol-4-carboxamida, N-(1-metilciclopropil)-2-(3-piridinil)-2H-indazol-4-carboxamida, N-[1-(difluorometil)ciclopropil]-2-(3-piridinil)-2H-indazol-4-carboxamida, nitenpiram, nitiazina, novalurón, noviflumurón, oxamilo, paratión, paratión-metilo, permetrina, forato, fosalón, fosmet, fosfamidón, pirimicarb, profenofós, proflutrina, propargita, protrifenbuto, piflubumida, pimetrozina, pirafloprol, piretrina, piridabeno, piridalo, pirifluquinazón, piriminostrobina, piriprol, piriproxifen, rotenona, rianodina, silafluofeno, spinetoram, spinosad, espiroclorfen, espiromesifeno, espirotetramat, sulprofós, sulfoxaflor, tebufenozid, tebufenpirad, teflubenzurón, teflutrina, tetraclorantraniliprol, tetraclorvinfos, tetrametrina, tetrametilflutrina, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodio, tioazafen, tolfenpirad, tralometrina, triazamato, triclorfon, triflumezopirim, triflumurón, delta-endotoxinas de *Bacillus thuringiensis*, bacterias entomopatógenas, virus entomopatógenos y hongos entomopatógenos.

Realización Y3. La composición de la realización Y2 en donde el al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional se selecciona entre el grupo que consiste en abamectina, acetamiprid, acrinatrina, afidopiropeno, amitraz, avermectina, azadiractina, benfuracarb, bensultap, bifentrina, buprofezina, carbarilo, cartap, clorantulaniliprol, clorfenapir, clorpirifós, clotianidina, ciantraniliprol, ciclaniliprol, cicloprotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, gamma-cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, zeta-cipermetrina, ciromazina, deltametrina, dieldrina, dinotefurano, diofenolán, emamectina, endosulfán, esfenvalerato, etiprol, etofenprox, etoxazol, fenitrotión, fenotiocarb, fenoxicarb, fenvalerato, fipronil, flometoquina, flonicamid, flubendiamida, flufenoxurón, flufenoxistrobina, fluensulfona, flupirrol, flupiradifurona, fluvalinato, formetanato, fostiazato, heptaflutrina, hexaflumurón, hidrametilnón, imidacloprid, indoxacarb, lufenurón, meperflutrina, metaflumizona, metiocarb, metomilo, metopreno, metoxifeno, metoflutrina, monofluorotrina, nitenpiram, nitiazina, novalurón, oxamilo, piflubumida, pimetrozina, piretrina, piridabeno, piridalo, piriminostrobina, piriproxifen, rianodina, spinetoram, spinosad, espiroclorfen, espiromesifeno, espirotetramat, sulfoxaflor, tebufenozid, tetrametrina, tetrametilflutrina, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodio, tralometrina, triazamato, triflumezopirim, triflumurón, delta-endotoxinas de *Bacillus thuringiensis*, todas las cepas de *Bacillus thuringiensis* y todas las cepas de nucleopoliedrovirus.

Realización Y4. La composición de una cualquiera de las realizaciones Y1-Y3 que comprende además un fertilizante líquido.

Realización Y5. La composición de la Realización Y4 en donde el fertilizante líquido es de base acuosa.

Realización Y6. Una formulación para empapar el suelo que comprende la composición de una cualquiera de las realizaciones Y1-Y3.

Realización Y7. Una composición de pulverización que comprende la composición de una cualquiera de las realizaciones Y1-Y3 y un propulsor.

Realización Y8. Una composición de cebo, que comprende la composición de una cualquiera de las realizaciones Y1-Y3, uno o más materiales alimentarios, opcionalmente un factor quimiotáctico y opcionalmente un humectante.

Realización Y9. Un dispositivo trampa para controlar una plaga de invertebrados, que comprende:
 5 la composición de cebo de la Realización Y8 y un alojamiento adaptado para recibir dicha composición de cebo, en donde el alojamiento tiene al menos una abertura dimensionada para permitir que la plaga de invertebrados pase a través de la abertura para que la plaga de invertebrados pueda acceder a dicha composición de cebo desde un emplazamiento exterior al alojamiento, y en donde el alojamiento está además adaptado para colocarse en o cerca de un emplazamiento de actividad potencial o conocida para
 10 la plaga de invertebrados.

Realización Y10. Una composición que comprende la composición de cualquiera de las Realizaciones Y1-Y3 en donde la composición es una composición sólida seleccionada entre polvos finos, polvos, granulado, microgránulos, gránulos, pastillas, comprimidos y películas rellenas.

Realización Y11. La composición de la Realización Y10 en donde la composición es dispersable
 15 en agua o hidrosoluble.

Realización Y12. Una formulación líquida o seca que comprende la composición de una cualquiera de las Realizaciones Y1-Y3 para su uso en un sistema de riego por goteo, surco durante la siembra, pulverizador manual, pulverizador de mochila, pulverizador de brazo, pulverizador terrestre, aplicación aérea, vehículo aéreo no tripulado o un tratamiento de semillas.

Realización Y13. La formulación líquida o seca de la Realización Y12 en donde dicha formulación se pulveriza a un volumen ultrabajo.

Cabe destacar que los compuestos de esta divulgación se caracterizan por patrones metabólicos y/o residuales del suelo favorables y que presentan actividad que controla un espectro de plagas de invertebrados agronómicas y no agronómicas.

Cabe destacar que, por razones del espectro de control de plagas de invertebrados y por su importancia económica, la protección de cultivos agronómicos de los daños provocados por las plagas de invertebrados mediante el control de plagas de invertebrados, constituye realizaciones de la divulgación. Los compuestos de esta divulgación, debido a sus propiedades de translocación favorables o a su sistemicidad en las plantas, también protegen las partes foliares u otras partes de la planta que no están
 30 en contacto directo con un compuesto de Fórmula 1 o una composición que comprende el compuesto.

También son dignas de mención como realizaciones de la presente divulgación las composiciones que comprenden un compuesto de cualquiera de las realizaciones anteriores, así como cualquier otra realización descrita en el presente documento, y cualquier combinación de las mismas, y al menos un componente adicional seleccionado entre el grupo que consiste en un tensioactivo, un diluyente sólido y
 35 un diluyente líquido, comprendiendo opcionalmente dichas composiciones además al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional.

También son dignas de mención como realizaciones de la presente divulgación las composiciones para controlar una plaga de invertebrados que comprenden un compuesto de cualquiera de las realizaciones anteriores, así como cualquier otra realización descrita en el presente documento, y cualquier combinación de las mismas, y al menos un componente adicional seleccionado entre el grupo que consiste en un tensioactivo, un diluyente sólido y un diluyente líquido, comprendiendo opcionalmente dichas composiciones además al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional. Las realizaciones de la divulgación incluyen además métodos para controlar una plaga de invertebrados que comprenden poner en contacto la plaga de invertebrados o su entorno con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de cualquiera de las realizaciones anteriores (p. ej., como una composición descrita en el presente documento).

Las realizaciones de la divulgación también incluyen una composición que comprende un compuesto de cualquiera de las realizaciones anteriores, en forma de una formulación líquida de empapado del suelo. Las realizaciones de la divulgación incluyen, además, métodos para controlar una plaga de invertebrados, que comprenden poner en contacto el suelo con una composición líquida como un empapado del suelo, que comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de cualquiera de las realizaciones anteriores.

Las realizaciones de la divulgación también incluyen una composición de pulverización para controlar una plaga de invertebrados que comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de cualquiera de las realizaciones anteriores y un propulsor. Las realizaciones de la divulgación incluyen además una composición de cebo para controlar una plaga de invertebrados que comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de cualquiera de las realizaciones anteriores, uno o más materiales alimentarios, opcionalmente, un factor quimiotáctico y, opcionalmente, un humectante. Las realizaciones de la divulgación también incluyen un dispositivo para controlar una plaga de invertebrados que comprende dicha composición de cebo y un alojamiento adaptado para recibir dicha composición de cebo, en donde el alojamiento tiene al menos una abertura dimensionada para permitir que la plaga de invertebrados pase a través de la abertura de modo que la plaga de invertebrados pueda acceder a dicha composición de cebo desde un lugar exterior al alojamiento, y en donde el alojamiento esté además adaptado para colocarse en o cerca de un emplazamiento de posible actividad o de actividad conocida para la plaga de invertebrados.

Las realizaciones de la divulgación también incluyen métodos para proteger una semilla de una plaga de invertebrados que comprenden poner en contacto la semilla con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de cualquiera de las realizaciones anteriores.

Las realizaciones de la divulgación también incluyen métodos para proteger a un animal de una plaga parasitaria de invertebrados que comprenden administrar al animal una cantidad parasiticidamente eficaz de un compuesto de cualquiera de las realizaciones anteriores.

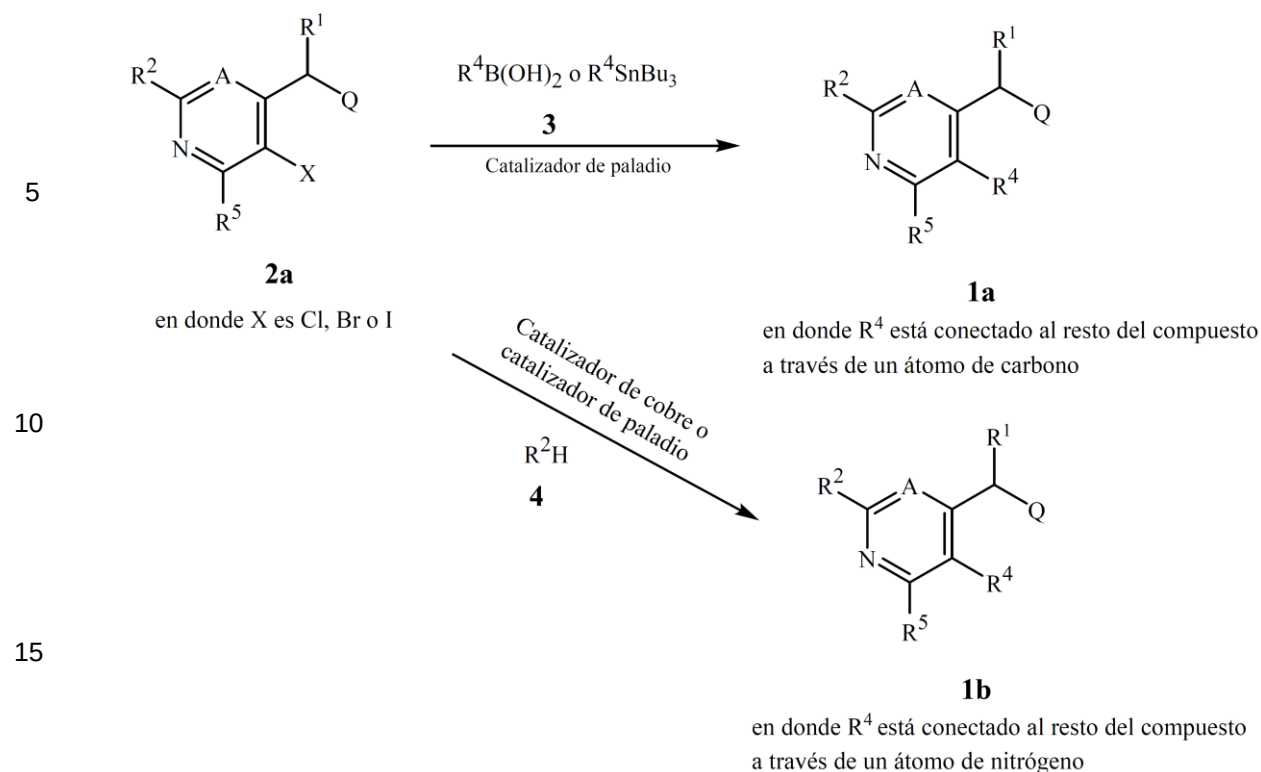
Las realizaciones de la divulgación también incluyen métodos para controlar una plaga de invertebrados que comprenden poner en contacto la plaga de invertebrados o su entorno con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo (p. ej., como una

composición descrita en el presente documento), siempre que los métodos no sean métodos de tratamiento médico de un cuerpo humano o animal mediante terapia.

Esta divulgación también se refiere a dichos métodos en donde la plaga de invertebrados o su entorno se pone en contacto con una composición que comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula **1**, un *N*-óxido o una sal del mismo, y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, comprendiendo opcionalmente dicha composición además una cantidad biológicamente eficaz de al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional, siempre que los métodos no sean métodos de tratamiento médico de un cuerpo humano o animal mediante terapia.

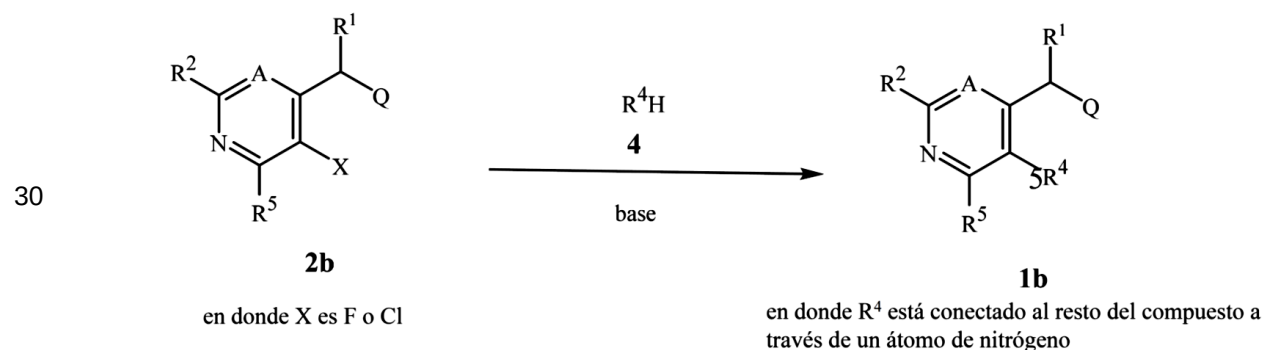
Para preparar los compuestos de Fórmula **1** se pueden utilizar uno o más de los siguientes métodos y variaciones como se describen en los Esquemas 1-11. Las definiciones de R¹, R², R³, R⁴, A y Q en los compuestos de las Fórmulas **1–18** a continuación son como se han definido anteriormente en el Sumario de la Divulgación, a menos que se indique otra cosa. Los compuestos de las Fórmulas **1a–1d** son diversos subconjuntos de los compuestos de Fórmula **1**, y todos los sustituyentes para las Fórmulas **1a–1d** son como se han definido anteriormente para la Fórmula **1**, a menos que se indique otra cosa. Temperatura ambiente se define como de aproximadamente 20–25 °C.

Como se muestra en el Esquema 1, los compuestos de Fórmula **1a** (compuestos de Fórmula **1** en donde R⁴ está unido al resto de la molécula a través de un átomo de carbono) pueden prepararse poniendo en contacto compuestos de Fórmula **2a** en donde X es Cl, Br o I con ácidos borónicos o compuestos de organoestaño de Fórmula **3** en presencia de un catalizador de paladio. Para el presente método resulta útil una gran variedad de compuestos y complejos que contienen paladio como catalizadores. Algunos ejemplos de compuestos y complejos que contienen paladio útiles como catalizadores en el método del Esquema 1 incluyen Pd(OAc)₂ (acetato de paladio(II)), PdCl₂ (cloruro de paladio(II)), PdCl₂(PPh₃)₂ dicloruro de bis(trifenilfosfina)paladio(II), Pd(PPh₃)₄ (tetraquis(trifenilfosfina)paladio(0)), Pd(C₅H₇O₂)₂ (acetilacetionato de paladio(II)) y Pd₂(dba)₃ tris(dibencilidenacetona)dipaladio(0). Como también se muestra en el Esquema 1, los compuestos de Fórmula **1b** (compuestos de Fórmula **1** en donde R⁴ está unido al resto de la molécula a través de un átomo de nitrógeno) pueden prepararse poniendo en contacto compuestos de Fórmula **2a** (en donde X es Cl, Br o I) con compuestos de Fórmula **4** (un compuesto heterocíclico con un NH como un miembro del anillo en donde el H puede reemplazarse por otro grupo funcional durante una reacción química) en presencia de un catalizador de cobre o un catalizador de paladio. Para consultar artículos de revisión y libros recientes acerca de este tipo de transformación de grupos funcionales, véase, por ejemplo, F. Bellina et al., *Synthesis* **2004**, 15, 2419–2440; P. Espinet y A. M. Echavarren, *Angewandte Chemie, International Edition* **2004**, 43, 4704–4734; y J. J. Li, G. W. Gribble, editors, *Palladium in Heterocyclic Chemistry: A Guide for the Synthetic Chemist*. 2000. K. W. Anderson et al., *Angewandte Chemie, International Edition* **2006**, 45, 6523–6527.



Como se muestra en el Esquema 2, los compuestos de Fórmula **1b** también pueden prepararse poniendo en contacto compuestos de Fórmula **2b** (en donde X es F o Cl) con compuestos de Fórmula **4** en presencia de una base, tal como K₂CO₃ o Cs₂CO₃. Se considera razonablemente que una gran variedad de procedimientos generales conocidos pueden adaptarse fácilmente por un experto en la materia al método del Esquema 2, por ejemplo, véase, J. D. Culshaw et al., *Synlett* **2012**, 23, 1816–1820. El método del Esquema 2 se ilustra mediante el Ejemplo de síntesis 1, Etapa C y el Ejemplo de síntesis 2, Etapa B.

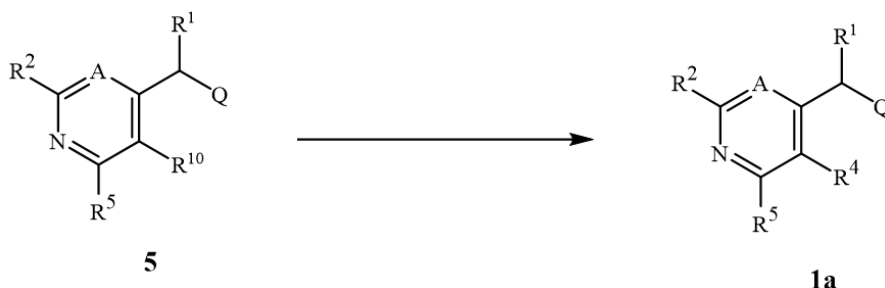
Esquema 2



Como alternativa, como se muestra en el Esquema 3, los compuestos de Fórmula **1a** pueden prepararse construyendo un anillo heterocíclico a partir de compuestos de Fórmula **5** en donde R¹⁰ es CN, COCH₃, NH₂NH₂ o CHO. Los métodos para formar un anillo heterocíclico a partir de estos grupos funcionales se conocen en la bibliografía. Se considera razonablemente que una gran variedad de

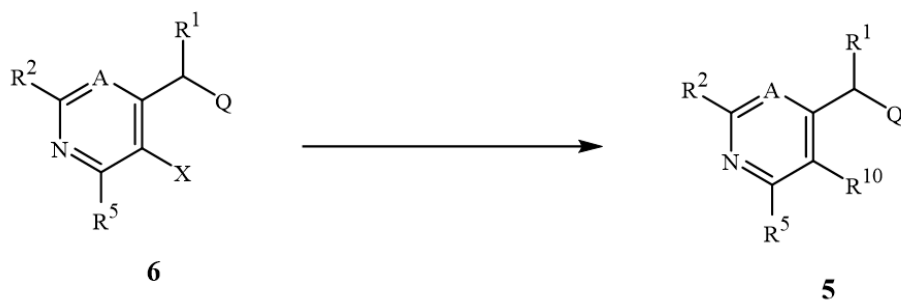
procedimientos generales conocidos pueden adaptarse fácilmente por un experto en la materia al método del Esquema 3, por ejemplo, véase la Publicación de Patente Mundial WO 2012/002577; la Publicación de Patente Mundial WO 2012/087938; la Publicación de Patente Mundial WO 2013/078468; M. H. Gezginci et al.; *J. Med. Chem.* **2001**, 44, 1560-1563; K. Gobbis, *J. Heterocyclic Chem.* **2009**, 46, 1271-1279. El método del Esquema 3 se ilustra mediante el Ejemplo de síntesis 3, Etapas B, C y D.

Esquema 3



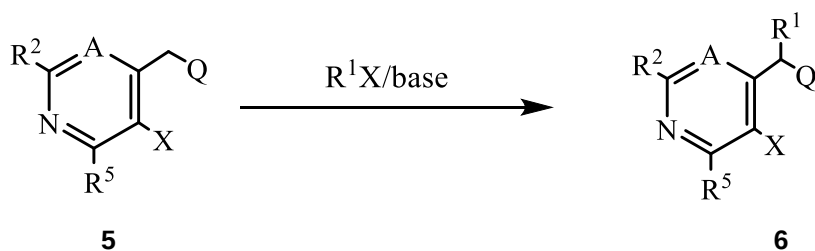
Como se muestra en el Esquema 4, un compuesto de Fórmula 5 puede prepararse convirtiendo el grupo X en un compuesto de Fórmula 6 en el grupo R¹⁰ en un compuesto de Fórmula 5 mediante reacciones de transformación del grupo funcional. Se conoce a partir de la bibliografía una variedad de procedimientos generales, por ejemplo, véase M. Hatsuda, M. Seki, *Tetrahedron*, **2005**, 61, 9908-9917; D. Xu et al., *Tetrahedron Letters*, **2008**, 6104-6107; A. Brennfuehrer, et al., *Tetrahedron*, **2007**, 63, 6252-6258, Publicación de Patente Mundial WO 2012/050159. El método del Esquema 4 se ilustra mediante el Ejemplo de síntesis 3, Etapa A.

Esquema 4



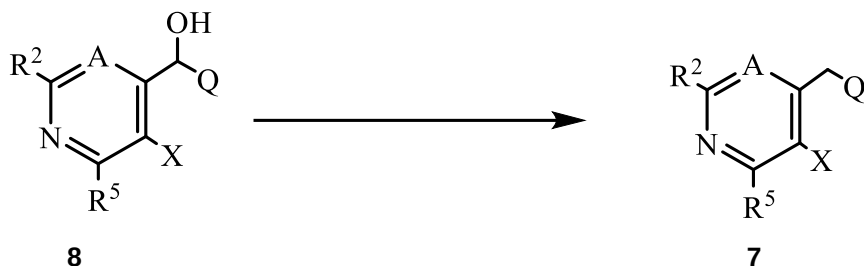
Como se muestra en el Esquema 5, un compuesto de Fórmula 6 puede prepararse tratando el compuesto de Fórmula 7 con R¹X en presencia de una base, tal como LHMDs, KHMDS, LDA, NaH, etc. Se conoce a partir de la bibliografía una gran variedad de procedimientos generales, por ejemplo, véase, Sheng-Chun Sha, et al., *J. Am. Chem. Soc.*, **2013**, 17602-17609; Publicación de Patente Mundial WO 2001/087839. El método del Esquema 4 se ilustra mediante el Ejemplo de síntesis 2, Etapa A.

Esquema 5



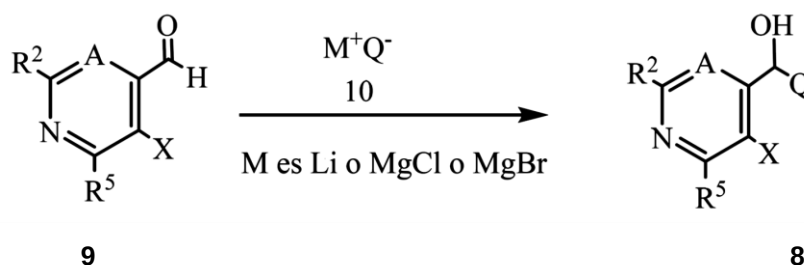
Como se muestra en el Esquema 6, un compuesto de Fórmula **7** puede obtenerse fácilmente tratando el compuesto de Fórmula **8** con agentes reducidos, tales como $HI/HOAc$, $Zn/HCOOH$, CF_3COOH/Et_3SiH , PBr_3 etc. Se conoce a partir de la bibliografía una variedad de procedimientos generales, por ejemplo, véase, Y. Nishigaya, et al., *Tetrahedron*, **2016**, 72, 1566-1572; S. Efange, et al. *J. Med. Chem.*, **1990**, 3133-3138; Publicación de Patente Mundial WO 2020/180624. El método del Esquema 6 se ilustra mediante el Ejemplo de síntesis 1, Etapa B.

Esquema 6



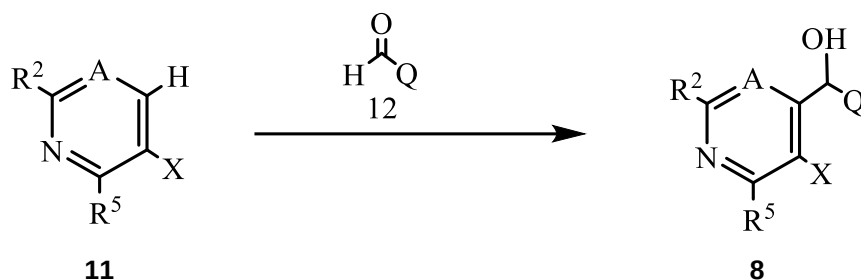
Como se muestra en el Esquema 7, los compuestos de Fórmula **8** se obtienen fácilmente mediante la adición nucleófila de los compuestos de Fórmula **10** con los aldehídos de Fórmula **9**. Los nucleófilos de Fórmula **10** pueden generarse mediante diversas estrategias químicas. Por ejemplo, la reacción de intercambio de metal-halógeno de un compuesto haloaromático QX' (en donde se prefiere que X' sea Br o I) con *n*-butillitio o bromuro de *i*-propilmagnesio, normalmente a una temperatura entre aproximadamente -100 y aproximadamente -20 °C, puede generar los nucleófilos de Fórmula **10** *in situ*. Se conoce en la técnica una gran variedad de procedimientos generales para llevar a cabo el intercambio de halógeno-metal, seguido de reacción con electrófilos y pueden adaptarse para el presente método. Para procedimientos generales relacionados véase, por ejemplo, M. Schlosser, *Angew. Chem. Int. Ed.* **2004**, 43, 2 y P. Knochel et al., *Synthesis*, **2002**, 565. Además, los nucleófilos de Fórmula **10** pueden prepararse mediante reacción de Grignard del bromuro o yoduro QBr o QI correspondiente con magnesio. Algunos de los nucleófilos de Fórmula **10** se encuentran disponibles comercialmente, por ejemplo, bromuro de 4-terc-butilfenilmagnesio o bromuro de 4-(trifluorometoxi)fenilmagnesio. La mayoría de los aldehídos de Fórmula **9** se encuentran disponibles comercialmente o son compuestos conocidos en la bibliografía química.

Esquema 7



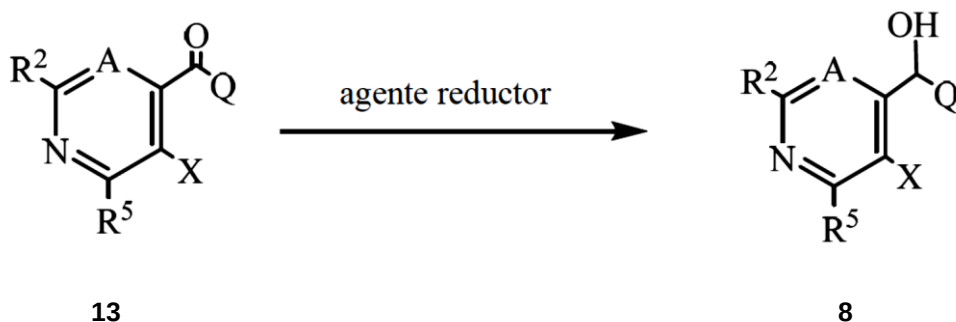
Como se muestra en el Esquema 8, el tratamiento de compuestos de Fórmula **11** (en donde X es F o Cl) con una base, tal como diisopropilamida de litio, complejo de cloruro de 2,2,6,6-tetrametilpiperidinil magnesio y cloruro de litio, etc. en disolventes de éter, tales como THF, éter dietílico o dioxanos a una temperatura entre -100 °C a -10 °C generará los aniones deseados *in situ*. Al inactivar los aniones anteriores con aldehídos de Fórmula **12**, pueden prepararse los compuestos de Fórmula **8**. Este método es de sobra conocido en la bibliografía, véase, por ejemplo, R. J. Mattson, et al. *J. Org. Chem.*, **1990**, 55, 3410. El método del Esquema 8 se ilustra mediante el Ejemplo de síntesis 1, Etapa A.

Esquema 8



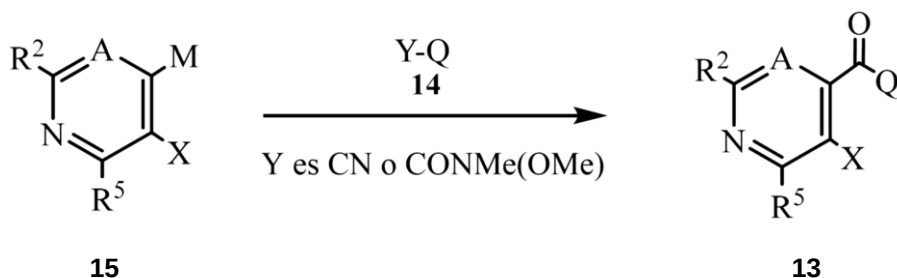
Como se muestra en el Esquema 9, los compuestos de Fórmula **8** también pueden prepararse mediante la reducción de los compuestos de carbonilo correspondientes de Fórmula **13**. Al tratar los compuestos de Fórmula **13** en disolventes, tales como metanol, etanol o éteres (tales como tetrahidrofurano) con diversos agentes reductores, tales como borohidruro de sodio, borano-dimetilsulfuro, pueden prepararse los compuestos de Fórmula **8**. Como alternativa, la reducción de los compuestos de carbonilo de Fórmula **13** puede lograrse mediante hidrogenación catalítica. Se conocen en la técnica varios procedimientos generales para estas transformaciones; véase, por ejemplo, D. Douglas, et al., *J. Med. Chem* **2009**, 52, 4694; M. Moriyasu, et al., *Synlett* **1997**, 3, 273.

Esquema 9



Como se muestra en el Esquema 10, los compuestos de Fórmula **13** pueden prepararse a partir de compuestos aromáticos de Fórmula **14** sustituidos con CN (en donde Y es CN) o amidas de Weinreb de Fórmula **14** (en donde Y es CONMeOMe). Las reacciones de los compuestos de Fórmula **15** con compuestos de Fórmula **14** pueden proporcionar compuestos de carbonilo de Fórmula **13**. Los compuestos de Fórmula **15** pueden prepararse utilizando una química general que genera los aniones correspondientes *in situ* como se describe en el Esquema 8. Para las referencias relacionadas véase, por ejemplo: la publicación de solicitud de patente de los Estados Unidos US 2008/280891 y Bela. et al. European J. Org. Chem. 2004 17, 3623-3632. Muchos de los compuestos de Fórmula **14** y **15** se encuentran disponibles comercialmente o fácilmente disponibles mediante métodos sintéticos de la bibliografía.

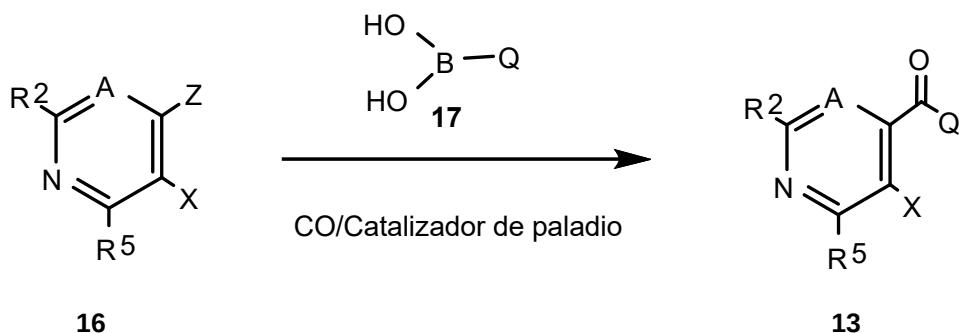
Esquema 10



en donde M es Li o MgX

Como alternativa, como se muestra en el Esquema 11, los compuestos de Fórmula **13** también pueden prepararse a partir de los compuestos de 4-halopiridina o pirimidina de Fórmula **16** (en donde Z es Br o I y X es distinto de Br o I). La reacción de acoplamiento cruzado catalizada con paladio de los compuestos de Fórmula **16**, monóxido de carbono y ácidos borónicos de Fórmula **17** puede proporcionar un modo alternativo para preparar compuestos de Fórmula **13**. El tratamiento de una mezcla de los compuestos de 4-halopiridina o pirimidina de Fórmula **16** y los ácidos borónicos de Fórmula **17** en presencia de un catalizador de paladio (tal como dicloruro de bis(trifenilfosfina)paladio(II) o tetraquis(trifenilfosfina)-paladio(0)) con una base (tal como carbonato de potasio, carbonato de sodio o carbonato de cesio) a una temperatura de aproximadamente 80 a 150 °C en disolventes de éter (tales como tetrahidrofurano o dioxano) en atmósfera presurizada de monóxido de carbono de 1 a 50 bar proporcionará los compuestos de carbonilo deseados de Fórmula **13**. Se proporciona un procedimientos experimental detallado en Couve-Bonnair et. al., *Tetrahedron Lett.* **2001**, 42, 3689-3691. La mayoría de los compuestos de Fórmula **16** y los ácidos borónicos de Fórmula **17** se encuentran disponibles comercialmente o fácilmente disponibles en la bibliografía química.

Esquema 11



en donde Z es Br o I; y X es distinto de Br o I

Se reconoce que algunos reactivos y condiciones de reacción descritos anteriormente para la preparación de compuestos de Fórmula **1** pueden no ser compatibles con ciertas funcionalidades presentes en los intermedios. En estos casos, la incorporación de secuencias de protección/desprotección o interconversiones de grupos funcionales en la síntesis ayudará a obtener los productos deseados. El uso y la elección de los grupos protectores serán evidentes para un experto en la síntesis química (véase, por ejemplo, Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2.^a ed.; Wiley: Nueva York, 1991). Un experto en la materia reconocerá que, en algunos casos, después de la introducción de un reactivo dado como se representa en cualquier esquema individual, puede ser necesario realizar pasos de síntesis habituales adicionales no descritos en detalle para completar la síntesis de compuestos de Fórmula **1**. Un experto en la materia también reconocerá que puede ser necesario realizar una combinación de los pasos ilustrados en los esquemas anteriores en un orden distinto al sugerido en la secuencia particular presentada para preparar los compuestos de Fórmula **1**.

Un experto en la materia también reconocerá que los compuestos de Fórmula **1** y los intermedios descritos en el presente documento pueden someterse a diversas reacciones electrófilas, nucleófilas, radicalarias, organometálicas, de oxidación y de reducción para añadir sustituyentes o modificar sustituyentes existentes.

Sin mayor elaboración, se cree que un experto en la materia que utilice la descripción anterior puede utilizar la presente divulgación en su máxima extensión. Por lo tanto, los siguientes Ejemplos de síntesis han de interpretarse como meramente ilustrativos y no limitantes de la divulgación en modo alguno. Los pasos de los siguientes Ejemplos de síntesis ilustran un procedimiento para cada paso en una transformación de síntesis global, y puede que el material de partida para cada paso no se haya preparado necesariamente mediante una serie preparativa particular cuyo procedimiento se describa en otros Ejemplos o Pasos. La temperatura ambiente se define como de aproximadamente 20–25 °C. Los porcentajes son en peso, excepto para las mezclas de disolventes cromatográficos o cuando se indique otra cosa. Las partes y los porcentajes para las mezclas de disolventes cromatográficos son en volumen, a menos que se indique otra cosa. MPLC se refiere a cromatografía líquida a media presión sobre gel de sílice. Los espectros de ¹H RMN se indican en ppm a partir del tetrametilsilano; "s" significa singlete, "d" significa doblete, "dd" significa doblete de dobletes, "ddd" significa doblete de doblete de dobletes, "t"

significa triplete, "m" significa multiplete y "br s" significa singlete ancho. Para los datos espectrales de masas, el valor numérico indicado es el peso molecular del ion molecular original (M) formado por la adición de H^+ (peso molecular de 1) a la molécula para dar un pico M+1 observado por espectrometría de masas usando ionización química a presión atmosférica (AP^+).

Los Esquemas 1 a 11 ilustran métodos para preparar compuestos de Fórmula 1 que tienen una diversidad de sustituyentes. Pueden prepararse compuestos de Fórmula 1 que tienen sustituyentes distintos de los indicados particularmente para los Esquemas 1 a 11 mediante métodos generales conocidos en la técnica de la química de síntesis orgánica, incluyendo métodos análogos a los descritos para los Esquemas 1 a 11.

EJEMPLO DE SÍNTESIS 1

Preparación de 3-fluoro-5-(triazol-2-il)-4-[[4-(trifluorometoxi)fenil]metil]piridina

(Compuesto 1)

Etapa A: Preparación de (3,5-difluoro-4-piridil)-[4-(trifluorometoxi)fenil]metanol

5 A una solución en agitación de 3,5-difluoropiridina (5 g, 0.043 mol, 1.0 eq.) en THF (50 ml) se le añadió LDA 2.0 M en THF (26.0 ml, 0.052 mol, 1.2 eq.), lentamente a -78°C en atmósfera de N₂. Después se agitó la mezcla de reacción durante 30 min y se le añadió 4-(trifluorometoxi)benzaldehído (8.25 g, 0.043 mol, 1.0 eq) (disuelto en 30 ml de THF) a -78 °C y se agitó durante 90 min a la misma temperatura. La reacción se supervisó mediante TLC. La mezcla de reacción se inactivó con solución acuosa saturada de NH₄Cl y se extrajo con EtOAc (3 × 500 ml), después se secó sobre Na₂SO₄ anhidro y se concentró a presión reducida, obteniéndose el producto en bruto. El producto en bruto obtenido se purificó mediante cromatografía combi flash utilizando gel de sílice 100-200, eluyendo con acetato de etilo al 0-30 % en éter de petróleo, obteniéndose el producto del título en forma de un sólido de color blanquecino (9.0 g, rendimiento del 69 %).

15 ¹H RMN (CDCl₃) δ 8.38 (s, 2H), 7.43 (d, 2H), 7.22 (d, 2H), 6.26 (d, 1H), 2.75 (d, 1H).

Etapa B: Preparación de 3,5-difluoro-4-[[4-(trifluorometoxi)fenil]metil]piridina

A una solución en agitación de (3,5-difluoro-4-piridil)-[4-(trifluorometoxi)fenil]metanol (2.0 g, 0.0065 mol, 1.0 eq) en AcOH (20 ml) se le añadió HI al 50 % en H₂O (2 × 8.3 g (100 %), 0.065 mol, 10.0 eq) a ta, en atmósfera de N₂ y después se agitó durante 16 h con un baño de aceite a 140 °C. La reacción se supervisó mediante TLC, y la mezcla de reacción se diluyó con agua (20 ml) y se extrajo con EtOAc (3 × 100 ml), después se lavó la capa orgánica con solución acuosa saturada de NaHCO₃ (2 × 100 ml) y agua (1 × 100 ml). Después se secó sobre Na₂SO₄ anhidro y se concentró a presión reducida, obteniéndose un producto en bruto. El producto en bruto obtenido se purificó mediante cromatografía combi flash utilizando gel de sílice 100-200, eluyendo con acetato de etilo al 0-10 % en éter de petróleo, obteniéndose el producto del título en forma de un líquido de color amarillo claro (1.8 g, rendimiento del 94 %).

25 ¹H RMN (CDCl₃) δ 8.33 (s, 2H), 7.28 (d, 2H), 7.14 (d, 2H), 4.05 (s, 2H).

Etapa C: Preparación de 3-fluoro-5-(triazol-2-il)-4-[[4-(trifluorometoxi)fenil]metil]piridina y 3-fluoro-5-(triazol-1-il)-4-[[4-(trifluorometoxi)fenil]metil]piridina

30 A una solución en agitación de 3,5-difluoro-4-[[4-(trifluorometoxi)fenil]metil]piridina (1.5 g, 0.0051 mol, 1.0 eq) en DMF (15 ml) se le añadió K₂CO₃ (1.8 g, 0.0129 mol, 2.5 eq) y 1,2,3-triazol (0.45 ml, 0.0077 mol, 1.5 eq) en un tubo sellado a ta en atmósfera de N₂. La mezcla de reacción se agitó durante 16 h a 80 °C y se supervisó mediante TLC. La mezcla de reacción se enfrió a ta y se vertió en agua enfriada en hielo (150 ml) y se extrajo con EtOAc (2 × 100 ml). Después se lavó la capa orgánica con salmuera (2 × 100 ml) y agua helada (100 ml), se secó sobre Na₂SO₄ anhidro y se concentró a presión reducida, obteniéndose un producto en bruto. El producto en bruto obtenido se purificó mediante cromatografía combi flash utilizando gel de sílice 100-200, se eluyó con acetato de etilo al 0-10 % en éter de petróleo,

obteniéndose los productos del título de 3-fluoro-5-(triazol-2-il)-4-[[4-(trifluorometoxi)fenil]etil]piridina (0.2 g, rendimiento del 11 %) en forma de un sólido de color blanquecino y 3-fluoro-5-(triazol-1-il)-4-[[4-(trifluorometoxi)fenil]etil]piridina

(0.05 g, rendimiento del 3 %).

¹H RMN (d6-DMSO) δ 8.79 (s, 1H), 8.77 (s, 1H), 8.22 (s, 2H), 7.22 (d, 2H), 7.14 (d, 2H), 4.27 (s, 2H); y 8.85 (s, 1H), 8.65 (s, 1H), 8.58 (d, 1H), 8.01 (d, 1H), 4.04 (s, 2H). (Compuesto 1)

EJEMPLO DE SÍNTESIS 2

Preparación de 3-fluoro-5-(triazol-2-il)-4-[1-[4-(trifluorometoxi)fenil]etil]piridina y 3-fluoro-5-(triazol-1-il)-4-[1-[4-(trifluorometoxi)fenil]etil]piridina (Compuesto 9)

EtapA A: Preparación de 3,5-difluoro-4-[1-[4-(trifluorometoxi)fenil]etil]piridina

A una solución en agitación de 3,5-difluoro-4-[1-[4-(trifluorometoxi)fenil]etil]piridina (1.5 g, 0.0051 mol, 1.0 eq., producto de la Etapa B del Ejemplo de síntesis 1) en THF (15 ml) se le añadió LiHMDS 1.0 M en THF (10.3 ml, 0.0103 mol, 2.0 eq) a una temperatura de 0 °C y se dejó en agitación durante 15 min. Después se añadió Mel (0.48 ml, 0.0077 mol, 1.5 eq) a la mezcla de reacción a 0 °C en atmósfera de N₂ y se dejó en agitación a ta durante 2 h. La reacción se supervisó mediante TLC. Tras finalizar, la mezcla de reacción se inactivó con agua enfriada en hielo y se extrajo con acetato de etilo (2 × 200 ml). La capa orgánica se secó sobre Na₂SO₄ anhidro y se concentró a presión reducida, obteniéndose un producto en bruto. El producto en bruto obtenido se purificó mediante cromatografía combi flash utilizando gel de sílice 100-200, se eluyó con acetato de etilo al 0-10 % en éter de petróleo, obteniéndose el producto del título (1.2 g, rendimiento del 80 %) en forma de un líquido incoloro.

¹H RMN (d6-DMSO) δ 8.49 (s, 2H), 7.41 (d, 2H), 7.32 (d, 2H), 7.64 (c, 1H), 1.70 (d, 3H).

EtapA B: Preparación de 3-fluoro-5-(triazol-2-il)-4-[1-[4-(trifluorometoxi)fenil]etil]piridina y 3-fluoro-5-(triazol-1-il)-4-[1-[4-(trifluorometoxi)fenil]etil]piridina

A una solución en agitación de 3,5-difluoro-4-[1-[4-(trifluorometoxi)fenil]etil]piridina (1.1 g, 0.0036 mol, 1.0 eq.) en DMF (15 ml) se le añadió K₂CO₃ (1.0 g, 0.0072 mol, 2.0 eq.) y 1,2,3-triazol (0.31 ml, 0.0054 mol, 1.5 eq.) en un tubo sellado a ta en atmósfera de N₂. La mezcla de reacción se agitó durante 16 h a 80 °C y la reacción se supervisó mediante TLC. La mezcla de reacción se enfrió a ta y se vertió en agua enfriada en hielo (150 ml) y se extrajo con EtOAc (2 × 100 ml). Después se lavó la capa orgánica con salmuera (2 × 100 ml) y agua enfriada en hielo (100 ml) y después se secó sobre Na₂SO₄ anhidro y se concentró a presión reducida, obteniéndose un producto en bruto. El producto en bruto obtenido se purificó mediante cromatografía combi flash utilizando gel de sílice 100-200, se eluyó con acetato de etilo al 0-10 % en éter de petróleo, obteniéndose los productos del título de 3-fluoro-5-(triazol-2-il)-4-[1-[4-(trifluorometoxi)fenil]etil]piridina (0.18 g, rendimiento del 15 %) en forma de un sólido de color blanquecino y 3-fluoro-5-(triazol-1-il)-4-[1-[4-(trifluorometoxi)fenil]etil]piridina

(36 mg, rendimiento del 3 %).

¹H RMN (d6-DMSO) δ 8.71 (s, 1H), 8.69 (s, 1H), 8.25 (s, 2H), 7.32 (d, 2H), 7.28 (d, 2H), 4.39 (c, 1H), 1.66 (d, 3H); y 8.58 (s, 1H), 8.39 (s, 1H), 7.84 (d, 1H), 7.58 (d, 1H), 7.16 (d, 2H), 7.09 (d, 2H), 4.19 (c, 1H), 1.74 (d, 3H). (Compuesto 9)

EJEMPLO DE SÍNTESIS 3

Preparación de 3-fluoro-5-(4-metiltriazol-2-il)-4-[[4-(trifluorometoxi)fenil]metil]piridina (Compuesto 3)

Etapas A: Preparación de [5-fluoro-4-[[4-(trifluorometoxi)fenil]metil]-3-piridil]hidrazina

A una solución en agitación de 3,5-difluoro-4-[[4-(trifluorometoxi)fenil]metil]piridina (1.5 g, 0.0051 mol, 1.0 eq., producto de la Etapa B del Ejemplo de síntesis 1) en DMF (15 ml) se le añadió K₂CO₃ (1.8 g, 0.0129 mol, 2.5 eq.) y N₂H₄.H₂O (2.5 g, 0.051 mol, 10 eq.) en un tubo sellado a ta en atmósfera de N₂ y después se calentó a 140 °C. La mezcla de reacción se agitó durante 9 h a 140 °C. La reacción se supervisó mediante TLC. La mezcla de reacción se enfrió a ta y se vertió en agua enfriada en hielo (150 ml) y se extrajo con EtOAc (3 × 100 ml). Después se lavó la capa orgánica con salmuera (2 × 50 ml) y agua enfriada en hielo (50 ml) y después se secó sobre Na₂SO₄ anhidro y se concentró a presión reducida, obteniéndose un producto en bruto. El producto del título en bruto obtenido (1.3 g en bruto) se confirmó mediante LCMS (56.6 %) y se usó para la etapa siguiente sin purificación.

Etapas B: Preparación de 2-[[5-fluoro-4-[[4-(trifluorometoxi)fenil]metil]-3-piridil]hidrazono]propanal oxima

A una solución en agitación del producto en bruto anterior de la Etapa A (1.3 g, 0.0043 mol, 1.0 eq.) en EtOH (13 ml) se le añadió 2-oxopropanal oxima (0.45 g, 0.0051 mol, 1.2 eq.) a ta en atmósfera de N₂ y se calentó hasta la temperatura de reflujo durante 3 h, la reacción se supervisó mediante TLC. Después se enfrió a ta y se concentró a presión reducida, obteniéndose el producto en bruto. El producto en bruto obtenido se trituró con MTBE (1 ml) y después éter de petróleo (2 × 2ml) obteniéndose el compuesto 7 sólido (0.8 g, rendimiento del 50 % en dos etapas)

¹H RMN (d6-DMSO) δ 11.36 (s, 1H), 8.71 (s, 1H), 8.50 (s, 1H), 8.12 (s, 1H), 7.29 (s, 4H), 4.25 (s, 2H), 1.99 (s, 3H).

Etapas C: Preparación de 1-óxido de 2-[5-fluoro-4-[[4-(trifluorometoxi)fenil]metil]-3-piridil]-4-metil-1lambda5,2,3-triazaciclopenta-3,5-dieno

Una solución en agitación de 2-[[5-fluoro-4-[[4-(trifluorometoxi)fenil]metil]-3-piridil]hidrazono]propanal oxima (250 mg, 0.675 mmol, 1.0 eq.) en solución acuosa al 15 % de piridina (10 ml) a ta se calentó a 100 °C, después se añadió CuSO₄ (253 mg, 1.013 mmol, 1.5 eq, disuelto en 2.5 ml de agua) y se agitó durante 1 h a 100 °C. La reacción se supervisó mediante TLC. La mezcla de reacción se enfrió a ta y se acidificó con solución de HCl 1 N hasta pH = 2, y después se extrajo con acetato de etilo (2 × 50 ml). La capa orgánica se secó sobre Na₂SO₄ anhidro y se concentró a presión reducida, obteniéndose el compuesto en bruto. El producto en bruto obtenido se purificó mediante cromatografía combiflash utilizando gel de sílice 100-200, se eluyó con acetato de etilo al 50 %/ éter de petróleo, obteniéndose el producto del título (180 mg, rendimiento del 72 %).

^1H RMN (d6-DMSO) δ 8.85 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.22 (d, 2H), 7.12 (d, 2H), 4.03 (s, 2H), 2.21 (s, 3H).

Etapa D: Preparación de 3-fluoro-5-(4-metiltriazol-2-il)-4-[[4-(trifluorometoxi)fenil]metil]piridina

A una solución en agitación de 1-óxido de 2-[5-fluoro-4-[[4-(trifluorometoxi)fenil]metil]-3-piridil]-4-metil-1lambda5,2,3-triazaciclopenta-3,5-dieno

(180 mg, 0.489 mmol, 1.0 eq.) en cloroformo se le añadió PCl_3 (201.4 mg, 1.467 mmol, 3.0 eq.) a ta en atmósfera de N_2 , después se calentó hasta temperatura de reflujo y se agitó durante 15 h. La reacción se supervisó mediante TLC. La mezcla de reacción se enfrió a 0 °C, después se inactivó con solución acuosa saturada de NaHCO_3 y se extrajo con acetato de etilo (2 $\times$ 50 ml). Después se secó la capa orgánica sobre Na_2SO_4 anhidro y se concentró a presión reducida, obteniéndose el compuesto en bruto. El producto en bruto obtenido se purificó mediante cromatografía combiflash gel de sílice 100-200, se eluyó con acetato de etilo al 30 %/éter de petróleo, obteniéndose el producto del título en forma de un líquido de color pardo (78 mg, rendimiento del 45 %).

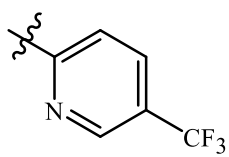
^1H RMN (d6-DMSO) δ 8.75 (s, 1H), 8.73 (s, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.23 (d, 2H), 7.15 (d, 2H), 4.30 (s, 2H), 2.35 (s, 3H).

Mediante los procedimientos descritos en el presente documento, junto con métodos conocidos en la técnica, pueden prepararse los siguientes compuestos de las tablas 1 a 42N. En las tablas que se muestran a continuación se utilizan las siguientes abreviaturas: *t* significa terciario, *s* significa secundario, *n* significa normal, *i* significa iso, *c* significa ciclo, Me significa metilo, Et significa etilo, Pr significa propilo, *i*-Pr significa isopropilo, Bu significa butilo, Ph significa fenilo, OMe significa metoxi, OEt significa etoxi, SMe significa metiltío, SEt significa etiltío, -CN significa ciano, Ph significa fenilo, Py significa piridinilo, -NO₂ significa nitro, TMS significa trimetilsililo, S(O)Me significa metilsulfinilo y S(O)₂Me significa metilsulfonilo.

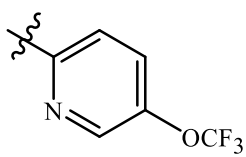
Los Fragmentos Q-1 a Q-19 mostrados a continuación se citan en las tablas 1A a 98I. Las estructuras de los Fragmentos Q-1 a Q-19 se ilustran en la Presentación 3. La línea ondulada indica el punto de unión del fragmento al resto de la molécula.

Presentación 3

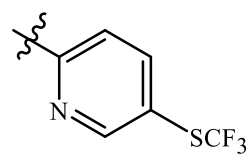
5



Q-1

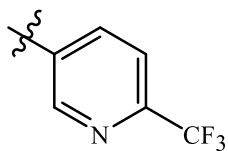


Q-2

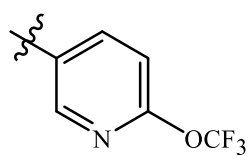


Q-3

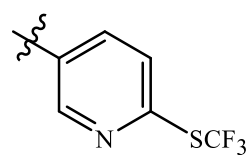
10



Q-4

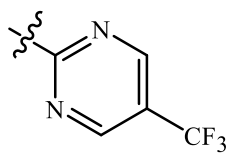


Q-5

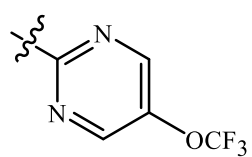


Q-6

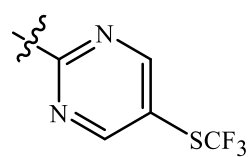
15



Q-7

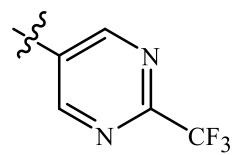


Q-8

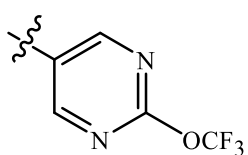


Q-9

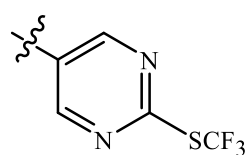
20



Q-10

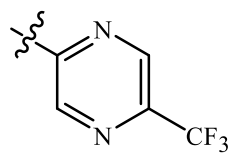


Q-11

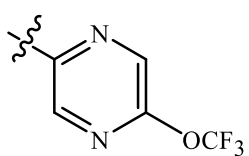


Q-12

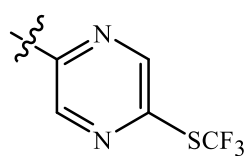
25



Q-13



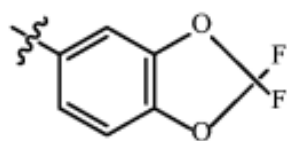
Q-14



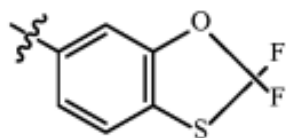
Q-15

30

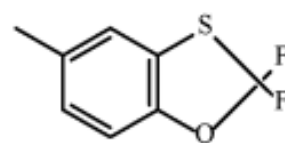
35



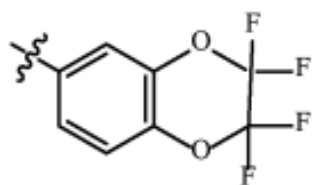
Q-16



Q-17



Q-18



Q-19

Tablas 1A–70. A se refiere a la estructura mostrada a continuación.

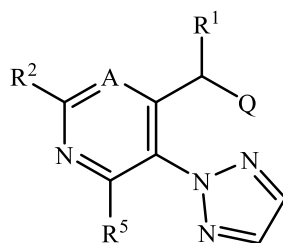


TABLA 1A

R^1 es H, A es CH, R^2 es H y R^5 es H.

10	Q	Q	Q
	4-clorofenilo	3-(CF ₃)fenilo	3-Cl, 4-(CF ₃)fenilo
	4-bromofenilo	3-(OCF ₃)fenilo	3-Br, 4-(CF ₃)fenilo
	4-yodofenilo	3-(s-Bu)fenilo	3-Me, 4-(CF ₃)fenilo
	4-nitrofenilo	3-(t-Bu)fenilo	2,6-diF, 4-(CF ₃)fenilo
15	4-cianofenilo	3-(CMe ₂ CH ₂ CH ₃)fenilo	2,6-diCl, 4-(CF ₃)fenilo
	4-(CF ₃)fenilo	3-(S- <i>i</i> -Pr)fenilo	2-F, 4-(OCF ₃)fenilo
	4-(OCF ₃)fenilo	3-(SCH ₂ CF ₃)fenilo	2-Cl, 4-(OCF ₃)fenilo
	4-(s-Bu)fenilo	3-(CF(CF ₃) ₂)fenilo	2-Me, 4-(OCF ₃)fenilo
	4-(t-Bu)fenilo	2-F, 4-(t-Bu)fenilo	3-F, 4-(OCF ₃)fenilo
20	4-(CMe ₂ CH ₂ CH ₃)fenilo	2-Cl, 4-(t-Bu)fenilo	3-Cl, 4-(OCF ₃)fenilo
	4-(S- <i>i</i> -Pr)fenilo	2-Me, 4-(t-Bu)fenilo	3-Br, 4-(OCF ₃)fenilo
	4-(SCH ₂ CF ₃)fenilo	3-F, 4-(t-Bu)fenilo	3-Me, 4-(OCF ₃)fenilo
	4-(SCHF ₂)fenilo	3-Cl, 4-(t-Bu)fenilo	2,6-diF, 4-(OCF ₃)fenilo
	4-(S(O)CHF ₂)fenilo	3-Br, 4-(t-Bu)fenilo	2,6-diCl, 4-(OCF ₃)fenilo
25	4-(SO ₂ CHF ₂)fenilo	3-Me, 4-(t-Bu)fenilo	2-F, 4-(CF ₂ CF ₃)fenilo
	4-(CF(CF ₃) ₂)fenilo	2,6-diF, 4-(t-Bu)fenilo	2-Cl, 4-(CF ₂ CF ₃)fenilo
	3-clorofenilo	2,6-diCl, 4-(t-Bu)fenilo	2-Me, 4-(CF ₂ CF ₃)fenilo
	3-bromofenilo	2-F, 4-(CF ₃)fenilo	3-F, 4-(CF ₂ CF ₃)fenilo
	3-yodofenilo	2-Cl, 4-(CF ₃)fenilo	3-Cl, 4-(CF ₂ CF ₃)fenilo
30	3-nitrofenilo	2-Me, 4-(CF ₃)fenilo	3-Br, 4-(CF ₂ CF ₃)fenilo
	3-cianofenilo	3-(SCF ₃)fenilo	3-Me, 4-(CF ₂ CF ₃)fenilo
	4-(SCF ₃)fenilo	3-(S(O)CF ₃)fenilo	Q-1
	4-(S(O)CF ₃)fenilo	3-(SO ₂ CF ₃)fenilo	Q-2
	4-(SO ₂ CF ₃)fenilo	3-(CF ₂ CF ₃)fenilo	Q-3
35	4-(CF ₂ CF ₃)fenilo	3-(CF ₂ CF ₂ CF ₃)fenilo	Q-4
	4-(CF ₂ CF ₂ CF ₃)fenilo	3-(OCF ₂ CF ₃)fenilo	Q-5
	4-(OCF ₂ CF ₃)fenilo	2-F, 4-(OCF ₂ CF ₃)fenilo	Q-6

	Q	Q	Q
	2-F, 4-(SCF ₃)fenilo	2-Cl, 4-(OCF ₂ CF ₃)fenilo	Q-7
	2-Cl, 4-(SCF ₃)fenilo	2-Me, 4-(OCF ₂ CF ₃)fenilo	Q-8
	2-Me, 4-(SCF ₃)fenilo	3-F, 4-(OCF ₂ CF ₃)fenilo	Q-9
5	3-F, 4-(SCF ₃)fenilo	3-Cl, 4-(OCF ₂ CF ₃)fenilo	Q-10
	3-Cl, 4-(SCF ₃)fenilo	3-Br, 4-(OCF ₂ CF ₃)fenilo	Q-11
	3-Br, 4-(SCF ₃)fenilo	3-Me, 4-(OCF ₂ CF ₃)fenilo	Q-12
	3-Me, 4-(SCF ₃)fenilo	2,6-diF, 4-(OCF ₂ CF ₃)fenilo	Q-13
	2,6-diF, 4-(SCF ₃)fenilo	2,6-diCl, 4-(OCF ₂ CF ₃)fenilo	Q-14
10	2,6-diCl, 4-(SCF ₃)fenilo	3-F, 4-(CF ₃)fenilo	Q-15
			Q-16
			Q-17
			Q-18
			Q-19

15 La presente divulgación también incluye las tablas 2A a 70A, cada una de las cuales está construida como la tabla 1A anterior, salvo por que la fila de encabezado en la tabla 1A (es decir, "A es CH, R⁴ es H y R⁵ es H") por debajo de la estructura de Markush se reemplaza por la fila de encabezado respectiva mostrada a continuación. Por ejemplo, en la tabla 2A la fila de encabezado es "R¹ es H, A es CF, R⁴ es H y R⁵ es H, y Q es como se ha definido en la tabla 1A anterior. Por tanto, la primera entrada en la tabla 2A

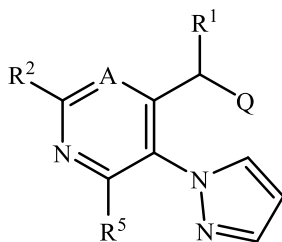
20 divulga específicamente la 4-[(4-clorofenil)metil]-3-fluoro-5-(triazol-2-il) piridina.

	Tabla	Encabezados de tabla	Tabla	Encabezados de tabla
	2A	R ¹ es H, A es CF	23A	R ¹ es CH ₃ , A es C- <i>i</i> -Pr
	3A	R ¹ es H, A es CCl	24A	R ¹ es CH ₃ , A es C- <i>c</i> -Pr
25	4A	R ¹ es H, A es CBr	25A	R ¹ es CH ₃ , A es C-CF ₃
	5A	R ¹ es H, A es Cl	26A	R ¹ es CH ₃ , A es C-OMe
	6A	R ¹ es H, A es CMe	27A	R ¹ es CH ₃ , A es C-OEt
	7A	R ¹ es H, A es CEt	28A	R ¹ es CH ₃ , A es N
30	8A	R ¹ es H, A es C- <i>n</i> -Pr	29A	R1 es CH ₂ CH ₃ , A es CH
	9A	R ¹ es H, A es C- <i>i</i> -Pr	30A	R1 es CH ₂ CH ₃ , A es CF
	10A	R ¹ es H, A es C- <i>c</i> -Pr	31A	R1 es CH ₂ CH ₃ , A es CCl
	11A	R1 es H, A es CCF ₃	32A	R1 es CH ₂ CH ₃ , A es CBr
	12A	R1 es H, A es COMe	33A	R1 es CH ₂ CH ₃ , A es Cl
35	13A	R1 es H, A es C-OEt	34A	R1 es CH ₂ CH ₃ , A es CMe
	14A	R1 es H, A es N	35A	R1 es CH ₂ CH ₃ , A es CEt
	15A	R1 es CH ₃ , A es CH	36A	R1 es CH ₂ CH ₃ , A es C- <i>n</i> -Pr

Tabla	Encabezados de tabla	Tabla	Encabezados de tabla
16A	R1 es CH ₃ , A es CF	37A	R1 es CH ₂ CH ₃ , A es C- <i>i</i> -Pr
17A	R1 es CH ₃ , A es CCl	38A	R1 es CH ₂ CH ₃ , A es C- <i>c</i> -Pr
18A	R1 es CH ₃ , A es CBr	39A	R1 es CH ₂ CH ₃ , A es C-CF ₃
5 19A	R1 es CH ₃ , A es Cl	40A	R1 es CH ₂ CH ₃ , A es C-OMe
20A	R1 es CH ₃ , A es CMe	41A	R1 es CH ₂ CH ₃ , A es C-OEt
21A	R1 es CH ₃ , A es CEt	42A	R1 es CH ₂ CH ₃ , A es N
22A	R1 es CH ₃ , A es C- <i>n</i> -Pr		
10 43A	R1 es CF ₃ , A es CH	57A	R1 es CN, A es CH
44A	R1 es CF ₃ , A es CF	58A	R1 es CN, A es CF
45A	R1 es CF ₃ , A es CCl	59A	R1 es CN, A es CCl
46A	R1 es CF ₃ , A es CBr	60A	R1 es CN, A es CBr
47A	R1 es CF ₃ , A es Cl	61A	R1 es CN ₃ , A es Cl
15 48A	R1 es CF ₃ , A es CMe	62A	R1 es CN, A es CMe
49A	R1 es CF ₃ , A es CEt	63A	R1 es CN, A es CEt
50A	R1 es CF ₃ , A es C- <i>n</i> -Pr	64A	R1 es CN, A es C- <i>n</i> -Pr
51A	R1 es CF ₃ , A es C- <i>i</i> -Pr	65A	R1 es CN, A es C- <i>i</i> -Pr
52A	R1 es CF ₃ , A es C- <i>c</i> -Pr	66A	R1 es CN, A es C- <i>c</i> -Pr
20 53A	R1 es CF ₃ , A es C-CF ₃	67A	R1 es CN, A es C-CF ₃
54A	R1 es CF ₃ , A es C-OMe	68A	R1 es CN, A es C-OMe
55A	R1 es CF ₃ , A es C-OEt	69A	R1 es CN, A es C-OEt
56A	R1 es CF ₃ , A es N	70A	R1 es CN, A es N
25			

TABLA 1B

La tabla 1B es idéntica a la tabla 1A, salvo por que la estructura química en el encabezado de la tabla 1B se sustituye por la siguiente estructura:



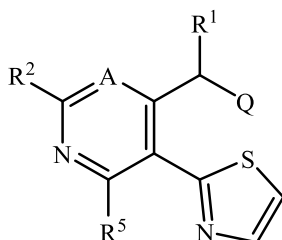
Por ejemplo, el primer compuesto en la tabla 1B es la estructura mostrada inmediatamente antes, en donde R¹ es H, A es CH, R² es H, R⁵ es H, y Q es 4-clorofenilo.

TABLAS 2B-70B

Las tablas 2B a 70B se construyen de un modo similar a las tablas 2A a 70A.

TABLA 1C

La tabla 1C es idéntica a la tabla 1A, salvo por que la estructura química en el encabezado de la tabla 1B se sustituye por la siguiente estructura:



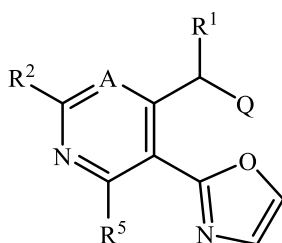
Por ejemplo, el primer compuesto en la tabla 1C es la estructura mostrada inmediatamente antes, en donde R¹ es H, A es CH, R² es H, R⁵ es H, y Q es 4-clorofenilo.

TABLAS 2C-70C

Las tablas 2C a 70C se construyen de un modo similar a las tablas 2A a 70A.

TABLA 1D

La tabla 1D es idéntica a la tabla 1A, salvo por que la estructura química en el encabezado de la tabla 1D se sustituye por la siguiente estructura:



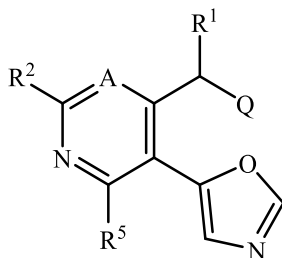
Por ejemplo, el primer compuesto en la tabla 1D es la estructura mostrada inmediatamente antes, en donde R¹ es H, A es CH, R² es H, R⁵ es H, y Q es 4-clorofenilo.

TABLAS 2D-70D

Las tablas 2D a 70D se construyen de un modo similar a las tablas 2A a 70A.

TABLA 1E

La tabla 1E es idéntica a la tabla 1A, salvo por que la estructura química en el encabezado de la tabla 1E se sustituye por la siguiente estructura:



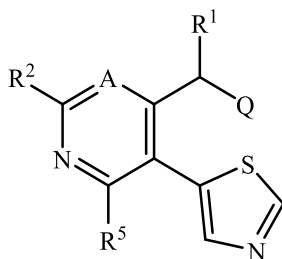
Por ejemplo, el primer compuesto en la tabla 1D es la estructura mostrada inmediatamente antes, en donde R¹ es H, A es CH, R² es H, R⁵ es H, y Q es 4-clorofenilo.

TABLAS 2E-70E

Las tablas 2E a 70E se construyen de un modo similar a las tablas 2A a 70A.

TABLA 1F

La tabla 1F es idéntica a la tabla 1A, salvo por que la estructura química en el encabezado de la
5 tabla 1F se sustituye por la siguiente estructura:



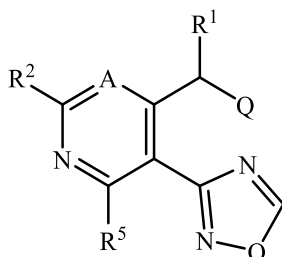
Por ejemplo, el primer compuesto en la tabla 1F es la estructura mostrada inmediatamente antes,
en donde R¹ es H, A es CH, R² es H, R⁵ es H, y Q es 4-clorofenilo.

TABLAS 2F-70F

Las tablas 2F a 70F se construyen de un modo similar a las tablas 2A a 70A.

TABLA 1G

La tabla 1G es idéntica a la tabla 1A, salvo por que la estructura química en el encabezado de la
tabla 1G se sustituye por la siguiente estructura:



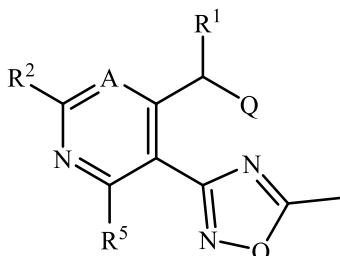
Por ejemplo, el primer compuesto en la tabla 1G es la estructura mostrada inmediatamente antes,
en donde R¹ es H, A es CH, R² es H, R⁵ es H, y Q es 4-clorofenilo.

TABLAS 2G-70G

Las tablas 2G a 70G se construyen de un modo similar a las tablas 2A a 70A.

TABLA 1H

La tabla 1H es idéntica a la tabla 1A, salvo por que la estructura química en el encabezado de la
tabla 1H se sustituye por la siguiente estructura:



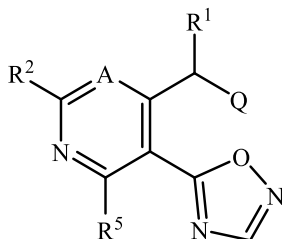
Por ejemplo, el primer compuesto en la tabla 1H es la estructura mostrada inmediatamente antes, en donde R^1 es H, A es CH, R^2 es H, R^5 es H, y Q es 4-clorofenilo.

TABLAS 2H-70H

Las tablas 2H a 70H se construyen de un modo similar a las tablas 2A a 70A.

TABLA 1I

La tabla 1I es idéntica a la tabla 1A, salvo por que la estructura química en el encabezado de la tabla 1H se sustituye por la siguiente estructura:



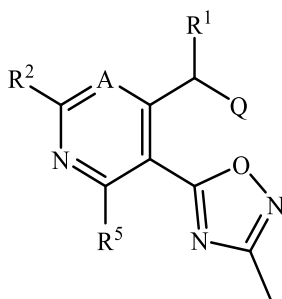
Por ejemplo, el primer compuesto en la tabla 1I es la estructura mostrada inmediatamente antes, en donde R^1 es H, A es CH, R^2 es H, R^5 es H, y Q es 4-clorofenilo.

TABLAS 2I-70I

Las tablas 2I a 70I se construyen de un modo similar a las tablas 2A a 70A.

TABLA 1J

La tabla 1J es idéntica a la tabla 1A, salvo por que la estructura química en el encabezado de la tabla 1J se sustituye por la siguiente estructura:



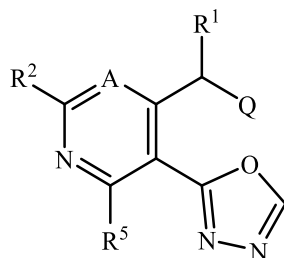
Por ejemplo, el primer compuesto en la tabla 1J es la estructura mostrada inmediatamente antes, en donde R^1 es H, A es CH, R^2 es H, R^5 es H, y Q es 4-clorofenilo.

TABLAS 2J-70J

Las tablas 2J a 70J se construyen de un modo similar a las tablas 2A a 70A.

TABLA 1K

La tabla 1K es idéntica a la tabla 1A, salvo por que la estructura química en el encabezado de la tabla 1K se sustituye por la siguiente estructura:



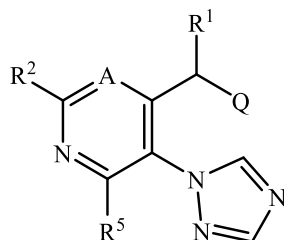
Por ejemplo, el primer compuesto en la tabla 1K es la estructura mostrada inmediatamente antes, en donde R^1 es H, A es CH, R^2 es H, R^5 es H, y Q es 4-clorofenilo.

TABLAS 2K-70K

Las tablas 2K a 70K se construyen de un modo similar a las tablas 2A a 70A.

TABLA 1L

La tabla 1L es idéntica a la tabla 1A, salvo por que la estructura química en el encabezado de la tabla 1L se sustituye por la siguiente estructura:



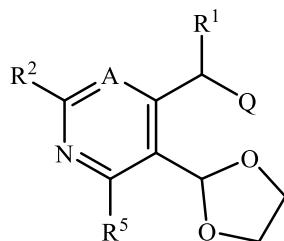
Por ejemplo, el primer compuesto en la tabla 1L es la estructura mostrada inmediatamente antes, en donde R^1 es H, A es CH, R^2 es H, R^5 es H, y Q es 4-clorofenilo.

TABLAS 2L-70L

Las tablas 2L a 70L se construyen de un modo similar a las tablas 2A a 70A.

TABLA 1M

La tabla 1M es idéntica a la tabla 1A, salvo por que la estructura química en el encabezado de la tabla 1M se sustituye por la siguiente estructura:



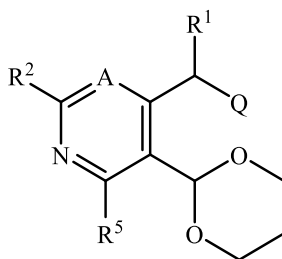
Por ejemplo, el primer compuesto en la tabla 1M es la estructura mostrada inmediatamente antes, en donde R^1 es H, A es CH, R^2 es H, R^5 es H, y Q es 4-clorofenilo.

TABLAS 2M-70M

Las tablas 2M a 70M se construyen de un modo similar a las tablas 2A a 70A.

TABLA 1N

La tabla 1N es idéntica a la tabla 1A, salvo por que la estructura química en el encabezado de la tabla 1N se sustituye por la siguiente estructura:



Por ejemplo, el primer compuesto en la tabla 1N es la estructura mostrada inmediatamente antes, en donde R¹ es H, A es CH, R² es H, R⁵ es H, y Q es 4-clorofenilo.

TABLAS 2N-70N

Las tablas 2N a 70N se construyen de un modo similar a las tablas 2A a 70A.

Un compuesto de esta divulgación se usará generalmente como ingrediente activo para el control de plagas de invertebrados en una composición, es decir, una formulación, con al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, que sirve como vehículo. Los ingredientes de la formulación o composición se seleccionan para que sean coherentes con las propiedades físicas del principio activo, el modo de aplicación y los factores ambientales, tales como el tipo de suelo, la humedad y la temperatura.

Las formulaciones útiles incluyen composiciones tanto líquidas como sólidas. Las composiciones líquidas incluyen soluciones (que incluyen concentrados emulsionables), suspensiones, emulsiones (que incluyen microemulsiones, emulsiones de aceite en agua, concentrados fluidos y/o suspoemulsiones) y similares, que opcionalmente se pueden espesar para dar geles. Los tipos generales de composiciones líquidas acuosas son el concentrado soluble, el concentrado en suspensión, la suspensión en cápsula, la emulsión concentrada, la microemulsión, la emulsión de aceite en agua, el concentrado fluido y la suspoemulsión. Los tipos generales de composiciones líquidas no acuosas son el concentrado emulsionable, el concentrado microemulsionable, el concentrado dispersable y la dispersión en aceite.

Los tipos generales de composiciones sólidas son polvos finos, polvos, gránulos, microgránulos, perlas, pastillas, comprimidos, películas rellenas (que incluyen recubrimientos de semillas) y similares, que pueden ser dispersables en agua ("humectables") o hidrosolubles. Las películas y los recubrimientos formados a partir de soluciones que forman películas o suspensiones fluidas son particularmente útiles para el tratamiento de semillas. El principio activo puede estar (micro)encapsulado y además conformado en una suspensión o formulación sólida; como alternativa, toda la formulación del principio activo puede estar encapsulada (o "sobrerrecubierta"). La encapsulación puede controlar o retrasar la liberación del principio activo. Un gránulo emulsionable combina las ventajas de tanto una formulación de concentrado emulsionable como una formulación granular seca. Las composiciones de concentración elevada se utilizan principalmente como intermedios para su formulación adicional.

Las formulaciones pulverizables normalmente se extienden en un medio adecuado antes de la pulverización. Dichas formulaciones líquidas y sólidas se formulan para que se diluyan fácilmente en el medio de pulverización, por lo general agua, pero ocasionalmente otro medio adecuado como un hidrocarburo aromático o parafínico o aceite vegetal. Los volúmenes de pulverización pueden variar de aproximadamente uno a varios miles de litros por hectárea, pero más normalmente están en el intervalo de aproximadamente diez a varios cientos de litros por hectárea. Las formulaciones pulverizables se pueden mezclar en tanque con agua u otro medio adecuado para el tratamiento foliar mediante aplicación aérea o terrestre, o para su aplicación en el medio de crecimiento de la planta. Las formulaciones líquidas y secas se pueden administrar directamente a los sistemas de riego por goteo o administrar al surco durante la plantación. Las formulaciones líquidas y sólidas se pueden aplicar a las semillas de cultivos y a otra vegetación deseable como tratamientos de semillas antes de la plantación para proteger las raíces en desarrollo y otras partes subterráneas de la planta y/o el follaje a través de la absorción sistémica.

Las formulaciones contendrán normalmente cantidades eficaces de principio activo, diluyente y surfactante dentro de los siguientes intervalos aproximados que suman hasta un 100 por ciento en peso.

	Porcentaje en peso		
	<u>Principio</u>		
	<u>activo</u>	<u>Diluyente</u>	<u>Tensioactivo</u>
Gránulos, comprimidos y polvos dispersables en agua e hidrosolubles	0.001–90	0–99.999	0–15
Dispersiones, suspensiones, emulsiones y soluciones en aceite (incluidos concentrados emulsionables)	1–50	40–99	0–50
Polvos	1–25	70–99	0–5
Gránulos y microgránulos	0.001–99	5–99.999	0–15
Composiciones de concentración elevada	90–99	0–10	0–2

Los diluyentes sólidos incluyen, por ejemplo, arcillas tales como bentonita, montmorillonita, atapulgita y caolín, yeso, celulosa, dióxido de titanio, óxido de cinc, almidón, dextrina, azúcares (por ejemplo, lactosa, sacarosa), sílice, talco, mica, tierra de diatomeas, urea, carbonato de calcio, carbonato y bicarbonato de sodio, y sulfato de sodio. Se describen diluyentes sólidos típicos en Watkins *et al.*, Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers, 2.^a Ed., Dorland Books, Caldwell, Nueva Jersey.

Los diluyentes líquidos incluyen, por ejemplo, agua, *N,N*-dimetilalcanamidas (p. ej., *N,N*-dimetilformamida), limoneno, sulfóxido de dimetilo, *N*-alquilpirrolidonas (p. ej., *N*-metilpirrolidinona), alquilfosfatos (p. ej., trietilfosfato), etilenglicol, trietilenglicol, propilenglicol, dipropilenglicol, polipropilenglicol, carbonato de propileno, carbonato de butileno, parafinas (p. ej., aceites minerales

blancos, parafinas normales, isoparafinas), alquilbencenos, alquilnaftalenos, glicerina, triacetato de glicerol, sorbitol, hidrocarburos aromáticos, alifáticos desaromatizados, alquilbencenos, alquilnaftalenos, cetonas tales como ciclohexanona, 2-heptanona, isoforona y 4-hidroxi-4-metil-2-pentanona, acetatos tales como acetato de isoamilo, acetato de hexilo, acetato de heptilo, acetato de octilo, acetato de nonilo, acetato de tridecilo y acetato de isobornilo, otros ésteres tales como ésteres alquilados de lactato, ésteres dibásicos benzoatos de alquilo y arilo, γ -butirolactona y alcoholes, que pueden ser lineales, ramificados, saturados o insaturados, tales como metanol, etanol, *n*-propanol, alcohol isopropílico, *n*-butanol, alcohol isobutílico, *n*-hexanol, 2-etilhexanol, *n*-octanol, decanol, alcohol isodecílico, isooctadecanol, alcohol cetílico, alcohol laurílico, alcohol tridecílico, alcohol oleílico, ciclohexanol, alcohol tetrahydrofurfurílico, alcohol diacetónico, cresol y alcohol bencílico. Los diluyentes líquidos también incluyen ésteres de ácidos grasos saturados e insaturados (normalmente

C₆–C₂₂) con glicerol, tales como aceites de semillas y frutos vegetales (p. ej., aceites de oliva, ricino, linaza, ajonjolí, maíz, cacahuate, girasol, semilla de uva, cártamo, semilla de algodón, soya, colza, coco y palmiste), grasas de origen animal (p. ej., sebo de vacuno, sebo de cerdo, manteca de cerdo, aceite de hígado de bacalao, aceite de pescado) y mezclas de estos. Los diluyentes líquidos también incluyen ácidos grasos alquilados (por ejemplo, metilados, etilados, butilados) donde los ácidos grasos se pueden obtener por hidrólisis de ésteres de glicerol procedentes de fuentes vegetales y animales, y se pueden purificar por destilación. Se describen diluyentes líquidos típicos en Marsden, *Solvents Guide*, 2.^a Ed., Interscience, Nueva York, 1950.

Las composiciones sólidas y líquidas de la presente divulgación con frecuencia incluyen uno o más tensioactivos. Cuando se añaden a un líquido, los tensioactivos (también conocidos como "agentes tensioactivos") generalmente modifican y, con mucha más frecuencia, reducen la tensión superficial del líquido. Dependiendo de la naturaleza de los grupos hidrófilos y lipófilos en una molécula de tensioactivo, los tensioactivos pueden ser útiles como agentes humectantes, dispersantes, emulsionantes o agentes antiespumantes.

Los tensioactivos se pueden clasificar como no iónicos, aniónicos o catiónicos. Los tensioactivos no iónicos útiles para las composiciones de la presente incluyen, pero no se limitan a: alcoxilatos de alcohol tales como alcoxilatos de alcohol a base de alcoholes naturales y sintéticos (que pueden ser ramificados o lineales) y preparados a partir de los alcoholes y óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de estos; etoxilatos de amina, alcanolamidas y alcanolamidas etoxiladas; triglicéridos alcoxilados tales como aceites de soya, ricino y colza etoxilados; alcoxilatos de alquilfenol tales como etoxilatos de octilfenol, etoxilatos de nonilfenol, etoxilatos de dinonilfenol y etoxilatos de dodecilfenol (preparados a partir de los fenoles y óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de estos); polímeros de bloques preparados a partir de óxido de etileno u óxido de propileno y polímeros de bloques inversos en los que los bloques terminales se preparan a partir de óxido de propileno; ácidos grasos etoxilados; aceites y ésteres grasos etoxilados; ésteres metílicos etoxilados; triestirilfenol etoxilado (que incluye los preparados a partir de óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de estos); ésteres de ácidos

grasos, ésteres de glicerol, derivados a base de lanolina, ésteres polietoxilados tales como ésteres de ácidos grasos con sorbitán polietoxilados, ésteres de ácidos grasos con sorbitol polietoxilados y ésteres de ácidos grasos con glicerol polietoxilados; otros derivados de sorbitán tales como ésteres de sorbitán; tensioactivos poliméricos tales como copolímeros aleatorios, copolímeros de bloques, resinas alquídicas de PEG (polietilenglicol), polímeros de injerto o peine y polímeros en estrella; polietilenglicoles (PEG); ésteres de ácidos grasos con polietilenglicol; tensioactivos a base de silicona; y derivados de azúcares tales como ésteres de sacarosa, poliglucósidos de alquilo y polisacáridos de alquilo.

Los tensioactivos aniónicos útiles incluyen, pero no se limitan a: ácidos alquilarylsulfónicos y sus sales; etoxilatos de alquilfenol o alcohol carboxilado; derivados de difenilsulfonato; lignina y derivados de lignina tales como lignosulfonatos; ácidos maleico o succínico, o sus anhídridos; sulfonatos de olefina; ésteres de fosfato tales como ésteres de fosfato de alcoxilatos de alcoholes, ésteres de fosfato de alcoxilatos de alquilfenol y ésteres de fosfato de etoxilatos de estirilfenol; tensioactivos de base proteica; derivados de sarcosina; étersulfato de estirilfenol; sulfatos y sulfonatos de aceites y ácidos grasos; sulfatos y sulfonatos de alquilfenoles etoxilados; sulfatos de alcoholes; sulfatos de alcoholes etoxilados; sulfonatos de aminas y amidas tales como *N,N*-alquilauratos; sulfonatos de benceno, cumeno, tolueno, xileno, y dodecil- y tridecilbencenos; sulfonatos de naftalenos condensados; sulfonatos de naftaleno y alquilnaftaleno; sulfonatos de petróleo fraccionado; sulfosuccinamatos; y sulfosuccinatos y sus derivados tales como sales de sulfosuccinato de dialquilo.

Los tensioactivos catiónicos útiles incluyen, pero no se limitan a: amidas y amidas etoxiladas; aminas tales como *N*-alquilpropanodiaminas, tripropilenotriaminas y dipropilenotetraminas, y aminas etoxiladas, diaminas etoxiladas y aminas propoxiladas (preparadas a partir de las aminas y óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de estos); sales de amina tales como acetatos de amina y sales de diamina; sales de amonio cuaternario tales como sales cuaternarias, sales cuaternarias etoxiladas y sales dicuaternarias; y óxidos de amina tales como óxidos de alquildimetilamina y óxidos de bis-(2-hidroxietil)alquilamina.

También son útiles para las presentes composiciones las mezclas de tensioactivos no iónicos y aniónicos o las mezclas de tensioactivos no iónicos y catiónicos. Los tensioactivos no iónicos, aniónicos y catiónicos y sus usos recomendados se divulgan en diversas referencias publicadas que incluyen *McCutcheon's Emulsifiers and Detergents*, ediciones anuales estadounidense e internacional publicadas por McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely y Wood, *Encyclopedia of Surface Active Agents*, Chemical Publ. Co., Inc., Nueva York, 1964; y A. S. Davidson y B. Milwidsky, *Synthetic Detergents*, séptima edición, John Wiley and Sons, Nueva York, 1987.

Las composiciones de esta divulgación también pueden contener adyuvantes y aditivos de formulación, conocidos por los expertos en la materia como adyuvantes de formulación (algunos de los cuales pueden considerarse que también actúan como diluyentes sólidos, diluyentes líquidos o tensioactivos). Tales adyuvantes y aditivos de formulación pueden controlar: el pH (tampones), la formación de espuma durante el procesamiento (antiespumantes tales como poliorganosiloxanos), la sedimentación

de los principios activos (agentes de suspensión), la viscosidad (espesantes tixotrópicos), el crecimiento microbiano en recipiente (agentes antimicrobianos), la congelación del producto (anticongelantes), el color (colorantes/dispersión de pigmentos), la separación por lavado (formadores de película o adhesivos), la evaporación (retardantes de la evaporación) y otros atributos de la formulación. Los formadores de películas incluyen, por ejemplo, acetatos de polivinilo, copolímeros de acetato de polivinilo, copolímero de polivinilpirrolidona-acetato de vinilo, alcoholes polivinílicos, copolímeros de alcohol polivinílico y ceras. Los ejemplos de auxiliares y aditivos de formulación incluyen los enumerados en *McCutcheon's Volume 2: Functional Materials*, ediciones anuales internacional y norteamericana publicadas por McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; y la Publicación PCT WO 03/024222.

El compuesto de Fórmula 1 y cualesquiera otros principios activos se incorporan normalmente a las presentes composiciones disolviendo el principio activo en un disolvente o moliendo en un diluyente líquido o seco. Las soluciones, incluidos los concentrados emulsionables, se pueden preparar simplemente mezclando los ingredientes. Si el disolvente de una composición líquida destinada al uso como concentrado emulsionable es inmiscible en agua, normalmente se añade un emulsionante para emulsionar el disolvente que contiene el principio activo al diluirlo con agua. Las suspensiones espesas de principios activos, con diámetros de partícula de hasta 2000 μm , se pueden moler en húmedo utilizando molinos de medios para obtener partículas con diámetros promedio inferiores a 3 μm . Las suspensiones espesas acuosas se pueden convertir en concentrados de suspensión acabados (véase, por ejemplo, el documento U.S. 3,060,084) o procesar adicionalmente mediante secado por pulverización para formar gránulos dispersables en agua. Las formulaciones secas por lo general requieren procesos de molienda en seco, que producen diámetros de partícula promedio en el intervalo de 2 a 10 μm . Los polvos finos y polvos se pueden preparar mezclando y, normalmente, moliendo (tal como con un molino de martillos o un molino por energía de un fluido). Los gránulos y los microgránulos se pueden preparar pulverizando el material activo sobre portadores granulares preformados o mediante técnicas de aglomeración. Véanse Browning, "Agglomeration", *Chemical Engineering*, 4 de diciembre de 1967, págs. 147–48, *Perry's Chemical Engineer's Handbook*, 4.^a ed., McGraw-Hill, Nueva York, 1963, págs. 8–57 y posteriores, y el documento WO 91/13546. Los microgránulos se pueden preparar como se describe en el documento U.S. 4,172,714. Los gránulos dispersables en agua e hidrosolubles se pueden preparar como se muestra en los documentos U.S. 4,144,050, U.S. 3,920,442 y DE 3,246,493. Los comprimidos pueden prepararse como se enseña en los documentos U.S. 5,180,587, U.S. 5,232,701 y U.S. 5,208,030. Las películas pueden prepararse como se enseña en los documentos GB 2,095,558 y U.S. 3,299,566.

Para consultar más información sobre la técnica de la formulación, véase T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox-Product Forms for Modern Agriculture" en *Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food–Environment Challenge*, T. Brooks y T. R. Roberts, Ed., actas del 9.º congreso internacional sobre la química de plaguicidas, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, págs. 120–133. Véanse también el documento U.S. 3,235,361, de la Col. 6, línea 16 a la Col. 7, línea 19 y los Ejemplos 10–41; el documento U.S. 3,309,192, de la Col. 5, línea 43 a la Col. 7, línea 62 y los Ejemplos 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132,

138–140, 162–164, 166, 167 y 169–182; el documento U.S. 2,891,855, de la Col. 3, línea 66 a la Col. 5, línea 17 y los Ejemplos 1–4; Klingman, *Weed Control as a Science*, John Wiley and Sons, Inc, Nueva York, 1961, págs. 81–96; Hance *et al.*, *Weed Control Handbook*, 8.^a Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; y *Developments in formulation technology*, PJB Publications, Richmond, Reino Unido, 2000.

5 En los siguientes Ejemplos, todas las formulaciones se preparan de formas convencionales. Los números de los compuestos se refieren a compuestos de las Tablas de índices A–B. Sin mayor elaboración, se cree que un experto en la materia, empleando la descripción anterior, puede utilizar la presente divulgación en toda su extensión. Por lo tanto, los siguientes ejemplos se han de interpretar como meramente ilustrativos y no limitantes de la divulgación en modo alguno. Los porcentajes son en peso, a
10 menos que se indique otra cosa.

Ejemplo A

Concentrado de concentración elevada

	compuesto 8	98.5%
	aerogel de sílice	0.5%
15	sílice fina amorfa sintética	1.0%

Ejemplo B

Polvo humectable

	compuesto 9	65.0%
	éter dodecilfenólico de polietilenglicol	2.0%
20	ligninsulfonato de sodio	4.0%
	silicoaluminato de sodio	6.0%
	montmorillonita (calcinada)	23.0%

Ejemplo C

Gránulo

25	compuesto 2	10.0%
	gránulos de atapulgita (materia poco volátil, 0.71/0.30 mm; tamices U.S.S. N.º 25–50)	90.0%

Ejemplo D

Microgránulo extruido

30	compuesto 4	25.0%
	sulfato de sodio anhidro	10.0%
	ligninsulfonato de calcio en bruto	5.0%
	alquilnaftalenosulfonato de sodio	1.0%
	bentonita de calcio/magnesio	59.0%

35

Ejemplo EConcentrado emulsionable

	compuesto 6	10.0%
	hexoleato de polioxietilensorbitol	20.0%
5	éster metílico de ácido graso C ₆ –C ₁₀	70.0%

Ejemplo FMicroemulsión

	compuesto 11	5.0%
10	copolímero de polivinilpirrolidona-acetato de vinilo	30.0%
	alquilpoliglicósido	30.0%
	monooleato de glicerilo	15.0%
	agua	20.0%

Ejemplo G15 Tratamiento de semillas

	compuesto 1	20.00%
	copolímero de polivinilpirrolidona-acetato de vinilo	5.00%
	cera de ácido montánico	5.00%
	ligninsulfonato de calcio	1.00%
20	copolímeros de bloques de polioxietileno/polioxipropileno	1.00%
	alcohol estearílico (POE 20)	2.00%
	poliorganosilano	0.20%
	tinte rojo colorante	0.05%
	agua	65.75%

25 Ejemplo HBarra fertilizante

	compuesto 5	2.5%
	copolímero de pirrolidona-estireno	4.8%
	16-etoxilato de triestirilfenilo	2.3%
30	talco	0.8%
	almidón de maíz	5.0%
	fertilizante de liberación lenta	36.0%
	caolín	38.0%
	agua	10.6%

35 Ejemplo IConcentrado en suspensión

	compuesto 7	35%
--	--------------------	-----

	copolímero de bloques de butilpolioxietileno/polipropileno	4.0%
	copolímero de ácido esteárico/polietilenglicol	1.0%
	polímero acrílico de estireno	1.0%
	goma de xantano	0.1%
5	propilenglicol	5.0%
	antiespumante a base de silicona	0.1%
	1,2-benzisotiazolin-3-ona	0.1%
	agua	53.7%

Ejemplo J

10	<u>Emulsión en agua</u>	
	compuesto 3	10.0%
	copolímero de bloques de butilpolioxietileno/polipropileno	4.0%
	copolímero de ácido esteárico/polietilenglicol	1.0%
	polímero acrílico de estireno	1.0%
15	goma de xantano	0.1%
	propilenglicol	5.0%
	antiespumante a base de silicona	0.1%
	1,2-benzisotiazolin-3-ona	0.1%
	hidrocarburo aromático a base de petróleo	20.0
20	agua	58.7%

Ejemplo KDispersión en aceite

	compuesto 1	25%
	hexaoleato de polioxietilen-sorbitol	15%
25	arcilla bentonita modificada orgánicamente	2.5%
	éster metílico de ácido graso	57.5%

Ejemplo LSuspoemulsión

	compuesto 9	10.0%
30	imidacloprid	5.0%
	copolímero de bloques de butilpolioxietileno/polipropileno	4.0%
	copolímero de ácido esteárico/polietilenglicol	1.0%
	polímero acrílico de estireno	1.0%
	goma de xantano	0.1%
35	propilenglicol	5.0%
	antiespumante a base de silicona	0.1%
	1,2-benzisotiazolin-3-ona	0.1%

hidrocarburo aromático a base de petróleo

20.0%

agua

53.7 %

Los compuestos de esta divulgación presentan actividad contra un amplio espectro de plagas de invertebrados. Estas plagas incluyen invertebrados que habitan en diversidad de entornos tales como, por ejemplo, follaje de plantas, raíces, suelo, cultivos cosechados u otros alimentos, estructuras de edificios o tegumentos de animales. Estas plagas incluyen, por ejemplo, invertebrados que se alimentan de follaje (que incluye hojas, tallos, flores y frutos), semillas, madera, fibras textiles, o sangre o tejidos de animales y de este modo provocan lesión o daño en, por ejemplo, cultivos agronómicos en crecimiento o almacenados, bosques, cultivos de invernadero, plantas ornamentales, cultivos de vivero, alimentos almacenados o productos de fibra, o viviendas u otras estructuras o su contenido, o que son nocivos para la sanidad pública o sanidad animal. Los expertos en la materia apreciarán que no todos los compuestos son igual de eficaces contra todas las etapas de crecimiento de todas las plagas.

Por tanto, estos compuestos y composiciones de la presente tienen utilidad agronómica para proteger cultivos de campo frente a plagas de invertebrados fitófagos, y también utilidad no agronómica para proteger otros cultivos y plantas hortícolas frente a plagas de invertebrados fitófagos. Esta utilidad incluye proteger cultivos y otras plantas (es decir, tanto agronómicos como no agronómicos) que contienen material genético introducido por ingeniería genética (es decir, transgénicos) o modificados por mutagénesis para proporcionar rasgos ventajosos. Los ejemplos de dichos rasgos incluyen tolerancia a herbicidas, resistencia a plagas fitófagas (por ejemplo, insectos, ácaros, pulgones, arañas, nematodos, caracoles, hongos fitopatógenos, bacterias y virus), mejor crecimiento de las plantas, mayor tolerancia a condiciones de crecimiento adversas tales como temperaturas altas o bajas, humedad del suelo baja o alta y alta salinidad, mayor floración o fructificación, mayores rendimientos de la cosecha, maduración más rápida, mayor calidad y/o valor nutricional del producto cosechado, o mejores propiedades de almacenamiento o proceso de los productos cosechados. Las plantas transgénicas se pueden modificar para expresar varios rasgos. Los ejemplos de plantas que contienen rasgos proporcionados por ingeniería genética o mutagénesis incluyen variedades de maíz, algodón, soja y patata que expresan una toxina insecticida de *Bacillus thuringiensis*, tal como YIELD GARD®, KNOCKOUT®, STARLINK®, BOLLGARD®, NuCOTN® y NEWLEAF®, INVICTA RR2 PRO™ y variedades de maíz, algodón, soja y colza tolerantes a herbicidas tales como ROUNDUP READY®, LIBERTY LINK®, IMI®, STS® y CLEARFIELD®, así como cultivos que expresan *N*-acetiltransferasa (GAT) para proporcionar resistencia al herbicida glifosato, o cultivos que contienen el gen HRA que proporciona resistencia a herbicidas que inhiben la acetolactato-sintasa (ALS). Los presentes compuestos y composiciones pueden presentar efectos potenciados con rasgos introducidos por ingeniería genética o modificados por mutagénesis, potenciando así la expresión fenotípica o la eficacia de los rasgos o aumentando la eficacia del control de plagas de invertebrados de los presentes compuestos y composiciones. En particular, los presentes compuestos y composiciones pueden presentar efectos potenciados con la expresión fenotípica de proteínas u otros

productos naturales tóxicos para plagas de invertebrados a fin de proporcionar un control mayor que el aditivo de estas plagas.

Las composiciones de esta divulgación también pueden comprender opcionalmente nutrientes vegetales, p. ej., una composición fertilizante que comprende al menos un nutriente vegetal seleccionado de nitrógeno, fósforo, potasio, azufre, calcio, magnesio, hierro, cobre, boro, manganeso, cinc y molibdeno. Cabe destacar las composiciones que comprenden al menos una composición fertilizante que comprende al menos un nutriente vegetal seleccionado de nitrógeno, fósforo, potasio, azufre, calcio y magnesio. Las composiciones de la presente divulgación que comprenden además al menos un nutriente vegetal pueden estar en forma de líquidos o sólidos. Cabe destacar las formulaciones sólidas en forma de gránulos, pequeñas barritas o comprimidos. Las formulaciones sólidas que comprenden una composición fertilizante se pueden preparar mezclando el compuesto o la composición de la presente divulgación con la composición fertilizante junto con los ingredientes de la formulación y, a continuación, preparando la formulación mediante métodos tales como granulación o extrusión. Como alternativa, se pueden preparar formulaciones sólidas pulverizando una solución o suspensión de un compuesto o una composición de la presente divulgación en un disolvente volátil sobre una composición fertilizante preparada previamente en forma de mezclas dimensionalmente estables, p. ej., granulado, pequeñas barritas o comprimidos, y a continuación evaporando el disolvente.

Los usos no agronómicos se refieren al control de plagas de invertebrados en zonas distintas a los campos de plantas de cultivo. Los usos no agronómicos de los compuestos y las composiciones de la presente incluyen el control de plagas de invertebrados en granos, semillas y otros alimentos almacenados, y en productos textiles tales como ropa y alfombras. Los usos no agronómicos de los compuestos y las composiciones de la presente también incluyen el control de plagas de invertebrados en plantas ornamentales, bosques, en patios, a lo largo de las cunetas de las carreteras y vías públicas de paso de los ferrocarriles, y en césped tal como gramas, campos de golf y pastos. Los usos no agronómicos de los compuestos y las composiciones de la presente también incluyen el control de plagas de invertebrados en viviendas y otros edificios que pueden estar ocupados por seres humanos y/o animales de compañía, de granja, rancho, zoológico u otros animales. Los usos no agronómicos de los compuestos y las composiciones de la presente también incluyen el control de plagas tales como termitas que pueden dañar la madera u otros materiales estructurales utilizados en edificios.

Los usos no agronómicos de los compuestos y las composiciones de la presente también incluyen la protección de la sanidad humana y animal mediante el control de plagas de invertebrados que son parásitos o transmiten enfermedades infecciosas. El control de los parásitos de animales incluye el control de los parásitos externos que parasitan la superficie del cuerpo del animal hospedador (por ejemplo, hombros, axilas, abdomen, parte interna de los muslos) y parásitos internos que parasitan el interior del cuerpo del animal hospedador (por ejemplo, estómago, intestino, pulmón, venas, debajo de la piel, tejido linfático). Las plagas parasitarias externas o transmisoras de enfermedades incluyen, por ejemplo, niguas, garrapatas, piojos, mosquitos, moscas, ácaros y pulgas. Los parásitos internos incluyen gusanos del

corazón, anquilostomas y helmintos. Los compuestos y composiciones de la presente divulgación son adecuados para el control sistémico y/o no sistémico de infestación o infección por parásitos en animales. Los compuestos y composiciones de la presente divulgación son particularmente adecuados para combatir plagas externas parasitarias o transmisoras de enfermedades. Los compuestos y composiciones de la presente divulgación son adecuados para combatir los parásitos que infestan a los animales de trabajo agrícola, tales como vacas, ovejas, cabras, caballos, cerdos, burros, camellos, búfalos, conejos, gallinas, pavos, patos, gansos y abejas; animales de compañía y animales domésticos tales como perros, gatos, pájaros de compañía y peces de acuario; así como los denominados animales de experimentación, tales como hámsteres, cobayas, ratas y ratones. Al combatir estos parásitos, se reducen las muertes y la reducción del rendimiento (en términos de carne, leche, lana, pieles, huevos, miel, etc.), de modo que la aplicación de una composición que comprende un compuesto de la presente divulgación permite una cría de animales más económica y sencilla.

Algunos ejemplos de plagas de invertebrados agronómicas o no agronómicas incluyen huevos, larvas y adultos del orden *Lepidoptera* tales como gusanos soldados, gusanos cortadores, orugas y heliotinos de la familia *Noctuidae* (por ejemplo, barrenador rosado del tallo (*Sesamia inferens* Walker), barrenador del tallo del maíz (*Sesamia nonagrioides* Lefebvre), oruga militar del sur (*Spodoptera eridania* Cramer), oruga militar tardía (*Spodoptera frugiperda* J. E. Smith), oruga militar de la remolacha (*Spodoptera exigua* Hübner), rosquilla negra (*Spodoptera littoralis* Boisduval), oruga militar rayada amarilla (*Spodoptera ornithogalli* Guenée), gusano cortador negro (*Agrotis ipsilon* Hufnagel), gusano de las leguminosas (*Anticarsia gemmatilis* Hübner), gusano de los frutos verdes (*Lithophane antennata* Walker), nóctua de la col (*Barathra brassicae* Linnaeus), falsa oruga medidora (*Pseudoplusia includens* Walker), oruga de la col (*Trichoplusia ni* Hübner), gusano de la yema del tabaco (*Heliothis virescens* Fabricius); barrenadores, portadores de caja, gusanos telarañeros, gusanos de conos, gusanos de la col y esqueletizadores de la familia *Pyrilidae* (por ejemplo, barrenador europeo del maíz (*Ostrinia nubilalis* Hübner), gusano de la naranja navel (*Amyelois transitella* Walker), gusano telarañero de la raíz del maíz (*Crambus caliginosellus* Clemens), gusanos telarañeros del césped (*Pyrilidae*: *Crambinae*) tal como el gusano del césped (*Herpetogramma licarsialis* Walker), barrenador del tallo de la caña de azúcar (*Chilo infuscatellus* Snellen), pequeño barrenador del tomate (*Neoleucinodes elegantalis* Guenée), enrollador de hojas verde (*Cnaphalocrocis medinalis* Guenée), enrollador de hojas de parra (*Desmia funeralis* Hübner), gusano del pepino (*Diaphania nitidalis* Stoll), larva del centro de la col (*Hellula hydralis* Guenée), barrenador amarillo del tallo (*Scirpophaga incertulas* Walker), barrenador blanco del tallo (*Scirpophaga innotata* Walker), barrenador del tallo superior (*Scirpophaga nivella* Fabricius), barrenador del arroz de cabeza oscura (*Chilo polychrysus* Meyrick), barrenador del arroz rayado (*Chilo suppressalis* Walker), oruga de racimo de la col (*Crociodomia binotalis* Zeller)); enrolladores de hojas, gusanos de las yemas, gusanos de semillas y gusanos de la fruta de la familia *Tortricidae* (p. ej., polilla del manzano (*Cydia pomonella* Linnaeus), polilla de la uva (*Paralobesia viteana* Clemens), polilla oriental de la fruta (*Grapholita molesta* Busck), falso gusano de la fruta (*Cryptophlebia leucotreta* Meyrick), barrenador de los cítricos (*Gymnandrosoma aurantianum*

Lima), enrollador de bandas rojas (*Argyrotaenia velutinana* Walker), enrollador de bandas oblicuas (*Choristoneura rosaceana* Harris), polilla del manzano parda clara (*Epiphyas postvittana* Walker), polilla de la uva europea (*Eupoecilia ambiguella* Hübner), polilla pandemis del manzano (*Pandemis pyrusana* Kearfott), enrollador omnívoro (*Platynota stultana* Walsingham), tortrix de árboles frutales barrados (*Pandemis cerasana* Hübner), tortrix parda del manzano (*Pandemis heparana* Denis y Schiffermüller)); y muchos otros lepidópteros económicamente importantes (p. ej., polilla dorso de diamante (*Plutella xylostella* Linnaeus), gusano rosado (*Pectinophora gossypiella* Saunders), polilla gitana (*Lymantria dispar* Linnaeus), barrenador del melocotón (*Carposina niponensis* Walsingham), barrenador de la ramita del melocotonero (*Anarsia lineatella* Zeller), gusano del tubérculo de la patata (*Phthorimaea operculella* Zeller), minador teniforme manchado (*Phyllonorycter blancardella* Fabricius), minador asiático del manzano (*Lithocolletis ringoniella* Matsumura), saltarina blanca nublada (*Lerodea eufala* Edwards), minador del manzano (*Leucoptera scitella* Zeller)); huevos, ninfas y adultos del orden *Blattodea*, incluidas las cucarachas de las familias *Blattellidae* y *Blattidae* (p. ej., cucaracha oriental (*Blatta orientalis* Linnaeus), cucaracha asiática (*Blattella asahinai* Mizukubo), cucaracha alemana (*Blattella germanica* Linnaeus), cucaracha de banda parda (*Supella longipalpa* Fabricius), cucaracha americana (*Periplaneta americana* Linnaeus), cucaracha parda (*Periplaneta brunnea* Burmeister), cucaracha de Madeira (*Leucophaea maderae* Fabricius)), cucaracha parda ahumada (*Periplaneta fuliginosa* Serville), cucaracha australiana (*Periplaneta australasiae* Fabr.), cucaracha langosta (*Nauphoeta cinerea* Olivier) y cucaracha lisa (*Symploce pallens* Stephens)); huevos, larvas con alimentación foliar, alimentación de frutas, alimentación de raíces, alimentación de semillas y alimentación de tejido vesicular y adultos del orden *Coleoptera*, incluyendo los gorgojos de las familias *Anthribidae*, *Bruchidae* y *Curculionidae* (p. ej., gorgojo de la cápsula (*Anthonomus grandis* Boheman), gorgojo del agua del arroz (*Lissorhoptrus oryzophilus* Kuschel), gorgojo del granero (*Sitophilus granarius* Linnaeus), gorgojo del arroz (*Sitophilus oryzae* Linnaeus)), gorgojo del pasto azul anual (*Listronotus maculicollis* Dietz), picudo del pasto azul (*Sphenophorus parvulus* Gyllenhal), chinche de caza (*Sphenophorus venatus vestitus* Chittenden), picudo de las Montañas Rocosas (picudo de Denver) (*Sphenophorus cicatristriatus* Fahraeus)); escarabajos pulgas, escarabajos del pepino, gusanos de la raíz, escarabajos de las hojas, escarabajos de la patata y minadores de hojas de la familia *Chrysomelidae* (p. ej., escarabajo de la patata de Colorado (*Leptinotarsa decemlineata* Say), gusano de la raíz del maíz occidental (*Diabrotica virgifera* LeConte)); parpallas y otros escarabajos de la familia *Scarabaeidae* (p. ej., escarabajo japonés (*Popillia japonica* Newman), escarabajo oriental (*Anomala orientalis* Waterhouse), parpalla enmascarada del norte (*Cyclocephala borealis* Arrow), parpalla enmascarada del sur (*Cyclocephala immaculata* Olivier o *C. lurida* Bland), escarabajo pelotero y gusano blanco (*Aphodius* spp.), ataenius del césped negro (*Ataenius spretulus* Haldeman), escarabajo verde de junio (*Cotinis nitida* Linnaeus), escarabajo asiático de jardín (*Maladera castanea* Arrow), escarabajos de mayo/junio (*Phyllophaga* spp.) y parpalla europea (*Rhizotrogus majalis* Razoumowsky)); escarabajos de las alfombras de la familia *Dermestidae*; gusanos alambre de la familia *Elateridae*; escarabajos de la corteza de la familia *Scolytidae* y escarabajos de la harina de la familia *Tenebrionidae*.

Además, las plagas agronómicas y no agronómicas incluyen: huevos, adultos y larvas del orden *Dermaptera*, incluyendo tijeretas de la familia *Forficulidae* (p. ej., tijereta europea (*Forficula auricularia* Linnaeus), tijereta negra (*Chelisoches morio* Fabricius)); huevos, individuos inmaduros, adultos y ninfas de los órdenes *Hemiptera* tales como, insectos de plantas de la familia *Miridae*, cigarras de la familia *Cicadidae*, saltahojas (p. ej. *Empoasca* spp.) de la familia *Cicadellidae*, chinches (p. ej., *Cimex lectularius* Linnaeus) de la familia *Cimicidae*, chicharritas de las familias *Fulgoridae* y *Delphacidae*, membranácidos de la familia *Membracidae*, psílicos de las familias *Liviidae*, *Psyllidae* y *Triozidae*, moscas blancas de la familia *Aleyrodidae*, pulgones de la familia *Aphididae*, filoxera de la familia *Phylloxeridae*, cochinillas de la familia *Pseudococcidae*, insectos escama de las familias *Coccidae*, *Diaspididae* y *Margarodidae*, tígidos de la familia *Tingidae*, chinches hediondas de la familia *Pentatomidae*, chinches (p. ej., chinches con vello) (*Blissus leucopterus hirtus* Montandon) y chinche sureña (*Blissus insularis* Barber)) y otros insectos de las semillas de la familia *Lygaeidae*, chinches del xilema de la familia *Cercopidae*, chinches del calabacín de la familia *Coreidae* y chinches rojas y teñidoras de algodón de la familia *Pyrrhocoridae*.

Las plagas agronómicas y no agronómicas también incluyen: huevos, larvas, ninfas y adultos del orden *Acari* (ácaros) tales como los ácaros araña y los ácaros rojos de la familia *Tetranychidae* (p. ej., ácaro rojo europeo (*Panonychus ulmi* Koch), ácaro de dos puntos (*Tetranychus urticae* Koch), ácaro McDaniel (*Tetranychus mcdanieli* McGregor)); ácaros planos de la familia *Tenuipalpidae* (p. ej., ácaros planos de los cítricos (*Brevipalpus lewisi* McGregor)); ácaros de la roya y de los cogollos de la familia *Eriophyidae* y otros ácaros de alimentación foliar y ácaros importantes para la salud humana y animal, es decir, ácaros del polvo de la familia *Epidermoptidae*, ácaros de los folículos de la familia *Demodicidae*, ácaros de los granos de la familia *Glycyphagidae*; garrapatas de la familia *Ixodidae*, comúnmente conocidas como garrapatas duras (p. ej., garrapata del venado (*Ixodes scapularis* Say), garrapata de parálisis australiana (*Ixodes holocyclus* Neumann), garrapata de perro americano (*Dermacentor variabilis* Say), garrapata de estrella solitaria (*Amblyomma americanum* Linnaeus)) y garrapatas de la familia *Argasidae*, comúnmente conocidas como garrapatas blandas (p. ej., garrapata de fiebre recurrente (*Ornithodoros turicata* Duges), garrapata común de las aves (*Argas radiatus* Raillet)); ácaros de la sarna y del prurito de las familias *Psoroptidae*, *Pyemotidae* y *Sarcoptidae*; huevos, adultos e individuos inmaduros del orden *Orthoptera*, incluyendo saltamontes, langostas y grillos (p. ej., saltamontes migratorios (p. ej., *Melanoplus sanguinipes* Fabricius, *M. differentialis* Thomas), saltamontes americanos (p. ej., *Schistocerca americana* Drury), langosta del desierto (*Schistocerca gregaria* Forsskål), langosta migratoria (*Locusta migratoria* Linnaeus), langosta arbustiva (*Zonocerus* spp.), grillo doméstico (*Acheta domesticus* Linnaeus), grillos topo (p. ej., grillo topo leonado (*Scapteriscus vicinus* Scudder) y grillo topo sureño (*Scapteriscus borellii* Giglio-Tos)); huevos, adultos e individuos inmaduros del orden *Diptera*, incluyendo los minadores de hojas (p. ej., *Liriomyza* spp., tales como el minador de hojas vegetales serpentina (*Liriomyza sativae* Blanchard)), mosquitos, moscas de la fruta (*Tephritidae*), moscas de la frita (p. ej., *Oscinella frit* Linnaeus), gusanos del suelo, moscas domésticas (p. ej., *Musca domestica* Linnaeus), moscas domésticas menores (p. ej., *Fannia canicularis* Linnaeus, *F. femoralis* Stein), moscas de los establos (p. ej., *Stomoxys calcitrans* Linnaeus), moscas de la

cara, moscas de los cuernos, moscardones (p. ej., *Chrysomya* spp., *Phormia* spp.), y otras plagas de moscas muscoides, tábanos (p. ej., *Tabanus* spp.), moscas Bot (p. ej., *Gasterophilus* spp., *Oestrus* spp.), larvas de ganado (p. ej., *Hypoderma* spp.), moscas de los ciervos (p. ej., *Chrysops* spp.), moscas piojos (p. ej., *Melophagus ovinus* Linnaeus) y otros braquíceros, mosquitos (p. ej., *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp.), moscas negras (p. ej., *Prosimulium* spp., *Simulium* spp.), mosquitos picadores, flebotomos, escáridos y otras nematóceros; huevos, adultos e inmaduros del orden *Thysanoptera*, incluyendo los trips de la cebolla (*Thrips tabaci* Lindeman), los trips de las flores (*Frankliniella* spp.) y otros trips de la alimentación foliar; plagas de insectos del orden *Hymenoptera*, incluyendo las hormigas de la familia *Formicidae*, incluyendo la hormiga carpintera de Florida (*Camponotus floridanus* Buckley), la hormiga carpintera roja (*Camponotus ferrugineus* Fabricius), la hormiga carpintera negra (*Camponotus pennsylvanicus* De Geer), la hormiga de patas blancas (*Technomyrmex albipes* F. Smith), hormigas cabezonas (*Pheidole* sp.), hormiga fantasma (*Tapinoma melanocephalum* Fabricius); hormiga faraón (*Monomorium pharaonis* Linnaeus), pequeña hormiga de fuego (*Wasmannia auropunctata* Roger), hormiga de fuego (*Solenopsis geminata* Fabricius), hormiga roja de fuego importada (*Solenopsis invicta* Buren), hormiga argentina (*Iridomyrmex humilis* Mayr), hormiga loca (*Paratrechina longicornis* Latreille), hormiga del pavimento (*Tetramorium caespitum* Linnaeus), hormiga del campo de maíz (*Lasius alienus* Förster) y hormiga doméstica olorosa (*Tapinoma sessile* Say). Otros himenópteros, incluyendo las abejas (incluyendo las abejas carpinteras), avispones, avispas chaqueta amarilla, avispas y moscas sierra (*Neodiprion* spp.; *Cephus* spp.); plagas de insectos del orden *Isoptera*, incluyendo las termitas de las familias *Termitidae* (p. ej., *Macrotermes* sp., *Odontotermes obesus* Rambur), *Kalotermitidae* (p. ej., *Cryptotermes* sp.) y *Rhinotermitidae* (p. ej., *Reticulitermes* sp., *Coptotermes* sp., *Heterotermes tenuis* Hagen), termitas subterráneas del este (*Reticulitermes flavipes* Kollar), termitas subterráneas occidentales (*Reticulitermes hesperus* Banks), termitas subterráneas de Formosa (*Coptotermes formosanus* Shiraki), termitas de la India Occidental (*Incisitermes immigrans* Snyder), termitas de madera seca de la India Occidental (*Cryptotermes brevis* Walker), termitas de madera seca (*Incisitermes snyderi* Light), termitas subterráneas del sureste (*Reticulitermes virginicus* Banks), termitas occidentales de madera seca (*Incisitermes minor* Hagen), termitas arbóreas tales como *Nasutitermes* sp. y otras termitas de importancia económica; plagas de insectos del orden *Thysanura* tales como lepismas (*Lepisma saccharina* Linnaeus) e insecto de fuego (*Thermobia domestica* Packard); plagas de insectos de los órdenes *Mallophaga* y *Phthiraptera*, e incluyendo el piojo de la cabeza (*Pediculus humanus capitis* De Geer), piojo del cuerpo (*Pediculus humanus* Linnaeus), piojo del cuerpo de pollo (*Menacanthus stramineus* Nitzsch), piojo masticador canino (*Trichodectes canis* De Geer), piojo de la pelusa (*Goniocotes gallinae* De Geer), piojo del cuerpo de oveja (*Bovicola ovis* Schrank), piojo bovino de nariz corta (*Haematopinus eurytenuis* Nitzsch), piojo bovino de nariz larga (*Linognathus vituli* Linnaeus) y otros piojos parásitos chupadores y masticadores que atacan al ser humano y a los animales; plagas de insectos del orden *Siphonoptera*, incluyendo la pulga de rata oriental (*Xenopsylla cheopis* Rothschild), pulga felina (*Ctenocephalides felis* Bouché), pulga canina (*Ctenocephalides canis* Curtis), pulga de gallina (*Ceratophyllus gallinae* Schrank), pulga pegajosa

(*Echidnophaga gallinacea* Westwood), pulga humana (*Pulex irritans* Linnaeus) y otras pulgas que afectan a mamíferos y aves. Otras plagas de artrópodos cubiertas incluyen: arañas del orden *Araneae*, tales como la araña reclusa parda (*Loxosceles reclusa* Gertsch y Mulaik) y la araña viuda negra (*Latrodectus mactans* Fabricius), y ciempiés del orden *Scutigleromorpha* tal como el ciempiés doméstico (*Scutigera coleoptrata* Linnaeus).

Algunos ejemplos de plagas de invertebrados del grano almacenado incluyen el barrenador mayor de los granos (*Prostephanus truncatus* Horn), barrenador menor de los granos (*Rhyzopertha dominica* Fabricius), gorgojo del arroz (*Sitophilus oryzae* Linnaeus), gorgojo del maíz (*Sitophilus zeamais* Motschulsky), gorgojo del caupí (*Callosobruchus maculatus* Fabricius), escarabajo rojo de la harina (*Tribolium castaneum* Herbst), gorgojo del granero (*Sitophilus granarius* Linnaeus), polilla india de la harina (*Plodia interpunctella* Hübner), escarabajo mediterráneo de la harina (*Ephestia kuhniella* Zeller) y escarabajo plano u oxidado de los granos (*Cryptolestis ferrugineus* Stephens).

Los compuestos de la presente divulgación pueden tener actividad en miembros de las clases *Nematoda*, *Cestoda*, *Trematoda* y *Acanthocephala*, incluyendo miembros económicamente importantes de los órdenes *Strongylida*, *Ascaridida*, *Oxyurida*, *Rhabditida*, *Spirurida* y *Enoplida*, tales como, sin carácter limitante, plagas agrícolas de importancia económica (es decir, nematodos agalladores del género *Meloidogyne*, nematodos de las lesiones del género *Pratylenchus*, nematodos de las raíces rechonchas del género *Trichodorus*, etc.) y plagas para la salud humana y animal (es decir, todos los trematodos, tenias y gusanos redondos de importancia económica, tales como *Strongylus vulgaris* en caballos, *Toxocara canis* en perros, *Haemonchus contortus* en ovejas, *Dirofilaria immitis* Leidy en perros, *Anoplocephala perfoliata* en caballos, *Fasciola hepatica* Linnaeus en rumiantes, etc.).

Los compuestos de la divulgación pueden tener actividad contra plagas del orden *Lepidoptera* (p. ej., *Alabama argillacea* Hübner (gusano de la hoja del algodón), *Archips argyrospila* Walker (enrollador de hojas de árboles frutales), *A. rosana* Linnaeus (enrollador de hojas europeo) y otras especies de *Archips*, *Chilo suppressalis* Walker (barrenador del tallo del arroz), *Cnaphalocrocis medinalis* Guenée (enrollador de hojas del arroz), *Crambus caliginosellus* Clemens (gusano de la raíz del maíz), *Crambus teterrellus* Zincken (gusano de la hierba azul), *Cydia pomonella* Linnaeus (polilla del manzano), *Earias insulana* Boisduval (gusano espinoso), *Earias vittella* Fabricius (gusano manchado del cogollo), *Helicoverpa armigera* Hübner (oruga del viejo mundo), *Helicoverpa zea* Boddie (gusano del maíz), *Heliothis virescens* Fabricius (gusano del cogollo del tabaco), *Herpetogramma licarsisalis* Walker (gusano del césped), *Lobesia botrana* Denis y Schiffermüller (polilla de la uva), *Pectinophora gossypiella* Saunders (gusano rosado de la cápsula), *Phyllocnistis citrella* Stainton (minador de hojas de los cítricos), *Pieris brassicae* Linnaeus (mariposa blanca grande), *Pieris rapae* Linnaeus (mariposa pequeña blanca), *Plutella xylostella* Linnaeus (polilla dorso de diamante), *Spodoptera exigua* Hübner (oruga militar de la remolacha), *Spodoptera litura* Fabricius (gusano cortador del tabaco, oruga de racimo), *Spodoptera frugiperda* J. E. Smith (oruga militar tardía), *Trichoplusia ni* Hübner (oruga de la col) y *Tuta absoluta* Meyrick (minador de la hoja del tomate)).

Los compuestos de la divulgación tienen una actividad significativa en los miembros del orden *Hemiptera*, que incluyen: *Acyrtosiphon pisum* Harris (pulgón del guisante), *Aphis craccivora* Koch (pulgón del caupí), *Aphis fabae* Scopoli (pulgón negro de la judía), *Aphis gossypii* Glover (pulgón del algodón, pulgón del melón), *Aphis pomi* De Geer (pulgón del manzano), *Aphis spiraecola* Patch (pulgón verde de los cítricos), *Aulacorthum solani* Kaltenbach (pulgón dedalera), *Chaetosiphon fragaefolii* Cockerell (pulgón de la fresa), *Diuraphis noxia* Kurdjumov/Mordvilko (pulgón ruso del trigo), *Dysaphis plantaginea* Passerini (pulgón rosado del manzano), *Eriosoma lanigerum* Hausmann (pulgón del manzano lanudo), *Hyalopterus pruni* Geoffroy (pulgón harinoso del ciruelo), *Lipaphis pseudobrassicae* Davis (pulgón del nabo), *Metopolophium dirrhodum* Walker (pulgón del cereal), *Macrosiphum euphorbiae* Thomas (pulgón de la patata), *Myzus persicae* Sulzer (pulgón del melocotenero y la patata, pulgón verde del melocotonero), *Nasonovia ribisnigri* Mosley (pulgón de la lechuga), *Pemphigus* spp. (pulgones de la raíz y pulgones de las agallas), *Rhopalosiphum maidis* Fitch (pulgón de la hoja del maíz), *Rhopalosiphum padi* Linnaeus (pulgón de la avena y cereza), *Schizaphis graminum* Rondani (pulgón verde), *Sitobion avenae* Fabricius (pulgón del grano inglés), *Therioaphis maculata* Buckton (pulgón manchado de la alfalfa), *Toxoptera aurantii* Boyer de Fonscolombe (pulgón negro de los cítricos) y *Toxoptera citricidus* Kirkaldy (pulgón pardo de los cítricos); *Adelges* spp. (áfidos de los pinos); *Phylloxera devastatrix* Pergande (filoxera de la pecana); *Bemisia tabaci* Gennadius (mosca blanca del tabaco, mosca blanca del camote), *Bemisia argentifolii* Bellows y Perring (mosca blanca de la hoja plateada), *Dialeurodes citri* Ashmead (mosca blanca de los cítricos) y *Trialeurodes vaporariorum* Westwood (mosca blanca de invernadero); *Empoasca fabae* Harris (saltahojas de la patata), *Laodelphax striatellus* Fallén (chicharrita parda menor), *Macrosteles quadrilineatus* Forbes (saltahojas del áster), *Nephotettix cincticeps* Uhler (saltahojas verde), *Nephotettix nigropictus* Stål (saltahojas del arroz), *Nilaparvata lugens* Stål (chicharrita parda), *Peregrinus maidis* Ashmead (chicharrita del maíz), *Sogatella furcifera* Horváth (chicharrita de dorso blanco), *Tagosodes orizicolus* Muir (delfácido del arroz), *Typhlocyba pomaria* McAtee (saltahojas blanco del manzano), *Erythroneura* spp. (saltahojas de la vid); *Magicidada septendecim* Linnaeus (chicharra periódica); *Icerya purchasi* Maskell (cochinilla acanalada), *Quadraspidotus perniciosus* Comstock (cochinilla de San José); *Planococcus citri* Risso (pulgón harinoso de los cítricos); *Pseudococcus* spp. (otros del complejo de pulgones harinosos); *Cacopsylla pyricola* Foerster (mieleta del peral), *Trioza diospyri* Ashmead (mieleta del caqui).

Los compuestos de esta divulgación también tienen actividad sobre los miembros del orden *Hemiptera*, que incluyen: *Acrosternum hilare* Say (chinche verde), *Anasa tristis* De Geer (chinche del calabacín), *Blissus leucopterus leucopterus* Say (chinche), *Cimex lectularius* Linnaeus (chinche), *Corythucha gossypii* Fabricius (chinche de encaje), *Cyrtopeltis modesta* Distant (chinche del tomate), *Dysdercus suturellus* Herrich-Schäffer (tinte del algodón), *Euschistus servus* Say (chinche hedionda parda), *Euschistus variolarius* Palisot de Beauvois (chinche hedionda de una mancha), *Graptostethus* spp. (complejo de chinches de semillas), *Halyomorpha halys* Stål (chinche hedionda parda marmorada), *Leptoglossus corculus* Say (chinche de semillas de pino con patas de hoja), *Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois (chinche lygus), *Nezara viridula* Linnaeus (chinche verde del sur), *Oebalus pugnax* Fabricius

(chinche de arroz), *Oncopeltus fasciatus* Dallas (chinche grande de algodoncillo), *Pseudatomoscelis seriatus* Reuter (saltapulgas del algodón). Otros órdenes de insectos controlados por los compuestos de la divulgación incluyen *Thysanoptera* (p. ej., *Frankliniella occidentalis* Pergande (trips occidental de las flores), *Scirtothrips citri* Moulton (trips de los cítricos), *Scirtothrips variabilis* Beach (trips de la soja) y *Thrips tabaci* Lindeman (trips de la cebolla); y el orden *Coleoptera* (p. ej., *Leptinotarsa decemlineata* Say (escarabajo de la patata de Colorado), *Epilachna varivestis* Mulsant (escarabajo mexicano de la judía) y gusanos alambre de los géneros *Agriotes*, *Athous* o *Limonius*).

Cabe destacar el uso de compuestos de esta divulgación para controlar los trips occidentales de las flores (*Frankliniella occidentalis*). Cabe destacar el uso de compuestos de esta divulgación para controlar el saltahoja de la patata (*Empoasca fabae*). Cabe destacar el uso de compuestos de esta divulgación para controlar el pulgón del melón y del algodón (*Aphis gossypii*). Cabe destacar el uso de compuestos de esta divulgación para controlar el pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*). Cabe destacar el uso de compuestos de esta divulgación para controlar la mosca blanca del camote (*Bemisia tabaci*).

Los compuestos de la presente divulgación también pueden ser útiles para aumentar el vigor de una planta de cultivo. Este método comprende poner en contacto la planta de cultivo (por ejemplo, el follaje, las flores, los frutos o las raíces) o la semilla a partir de la cual se cultiva la planta de cultivo con un compuesto de Fórmula 1 en cantidad suficiente para conseguir el efecto deseado de vigor de la planta (es decir, una cantidad biológicamente eficaz). Normalmente, el compuesto de Fórmula 1 se aplica en una composición formulada. Aunque el compuesto de Fórmula 1 con frecuencia se aplica directamente a la planta de cultivo o su semilla, también se puede aplicar al emplazamiento de la planta de cultivo, es decir, el entorno de la planta de cultivo, en particular a la porción del entorno lo suficientemente próxima para permitir que el compuesto de Fórmula 1 migre a la planta de cultivo. El emplazamiento relevante para este método comprende más habitualmente el medio de crecimiento (es decir, el medio que proporciona nutrientes a la planta), normalmente el suelo en el que se cultiva la planta. El tratamiento de una planta de cultivo para aumentar el vigor de la planta de cultivo comprende, por lo tanto, poner en contacto la planta de cultivo, la semilla a partir de la cual se cultiva la planta de cultivo o el emplazamiento de la planta de cultivo con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1.

El aumento del vigor del cultivo puede dar lugar a uno o más de los siguientes efectos observados:

(a) establecimiento óptimo del cultivo, como se demuestra por la excelente germinación de las semillas, la emergencia del cultivo y la densidad de plántulas del cultivo; (b) crecimiento del cultivo potenciado, como se demuestra por el crecimiento rápido y robusto de las hojas (por ejemplo, medido por el índice de superficie foliar), la altura de la planta, el número de cañas (por ejemplo, para el arroz), la masa radicular y el peso seco total de la masa vegetativa del cultivo; (c) mejores rendimientos del cultivo, como se demuestra por el tiempo hasta la floración, la duración de la floración, el número de flores, la acumulación total de biomasa (es decir, la cantidad del rendimiento) y/o la comerciabilidad del grado del fruto o grano del producto (es decir, la calidad del rendimiento); (d) capacidad potenciada del cultivo para resistir o prevenir

las infecciones por enfermedades de las plantas y las infestaciones de plagas de artrópodos, nematodos o moluscos; y (e) mayor capacidad del cultivo para resistir las agresiones ambientales tales como la exposición a temperaturas extremas, la humedad subóptima o los compuestos químicos fitotóxicos.

Los compuestos de la presente divulgación pueden aumentar el vigor de las plantas tratadas en comparación con las plantas no tratadas al destruir o prevenir de otro modo la alimentación de plagas de invertebrados fitófagos en el medio ambiente de las plantas. En ausencia de tal control de plagas de invertebrados fitófagos, las plagas reducen el vigor de las plantas al consumir tejidos vegetales o savia, o al transmitir fitopatógenos tales como virus. Incluso en ausencia de plagas de invertebrados fitófagos, los compuestos de la divulgación pueden aumentar el vigor de la planta modificando el metabolismo de las plantas. Generalmente, el vigor de una planta de cultivo aumentará más significativamente tratando la planta con un compuesto de la divulgación si la planta se cultiva en un entorno no ideal, es decir, un entorno que comprenda uno o más aspectos adversos para que la planta alcance el pleno potencial genético que presentaría en un entorno ideal.

Cabe destacar un método para aumentar el vigor de una planta de cultivo en donde la planta de cultivo se cultiva en un entorno que comprende plagas de invertebrados fitófagos. También cabe destacar un método para aumentar el vigor de una planta de cultivo en donde la planta de cultivo se cultiva en un entorno que no comprende plagas de invertebrados fitófagos. También cabe destacar un método para aumentar el vigor de una planta de cultivo donde la planta de cultivo se cultiva en un entorno que comprende una cantidad de humedad inferior a la ideal para fomentar el crecimiento de la planta de cultivo. Cabe destacar un método para aumentar el vigor de una planta de cultivo en donde el cultivo es arroz. También cabe destacar un método para aumentar el vigor de una planta de cultivo en donde el cultivo es maíz. También cabe destacar un método para aumentar el vigor de una planta de cultivo en donde el cultivo es soya.

Los compuestos de esta divulgación también se pueden mezclar con uno o más de otros compuestos o agentes biológicamente activos que incluyen insecticidas, fungicidas, nematicidas, bactericidas, acaricidas, herbicidas, protectores de herbicidas, reguladores del crecimiento tales como inhibidores de la muda de insectos y estimulantes del enraizamiento, quimioesterilantes, compuestos semioquímicos, repelentes, factores quimiotácticos, feromonas, estimulantes de la alimentación, otros compuestos biológicamente activos o bacterias entomopatógenas, virus u hongos para formar un plaguicida multicomponente que da un espectro aún más amplio de utilidad agronómica y no agronómica. Por tanto, la presente divulgación también se refiere a una composición que comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1, al menos un componente adicional seleccionado entre el grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, y al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional. Para las mezclas de la presente divulgación, los otros compuestos o agentes biológicamente activos se pueden formular junto con los presentes compuestos, incluyendo los compuestos de Fórmula 1, para formar una premezcla, o los compuestos o agentes biológicamente activos pueden formularse por separado de los presentes compuestos, incluyendo los

compuestos de Fórmula 1 y las dos formulaciones combinadas antes de la aplicación (p. ej., en un tanque de pulverización) o, como alternativa, aplicadas sucesivamente.

Algunos ejemplos de dichos compuestos o agentes biológicamente activos con los que pueden formularse compuestos de esta divulgación son insecticidas tales como abamectina, acefato, acequinocilo, acetamiprid, acrinatrina, afidopiropeno (ciclopropanocarboxilato de [(3*S*,4*R*,4*aR*,6*S*,6*aS*,12*R*,12*aS*,12*bS*)-3-[(ciclopropilcarbonil)oxi]-1,3,4,4*a*,5,6,6*a*,12,12*a*,12*b*-decahidro-6,12-dihidroxi-4,6*a*,12*b*-trimetil-11-oxo-9-(3-piridinil)-2*H*,11*H*-nafto[2,1-*b*]pirano[3,4-*e*]piran-4-il]metilo), amidoflumet, amitraz, avermectina, azadiractina, azinfós-metilo, benfuracarb, bensultap, bifentrina, bifenazato, bistriflurón, borato, buprofezina, cadusafós, carbarilo, carbofurano, cartap, carzol, clorantraniliprol, clorfenapir, clorfluazurón, clorpirifós, clorpirifós-metilo, cromafenozida, clofentezina, clotianidina, ciantraniliprol (3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-*N*-[4-ciano-2-metil-6-[(metilamino)carbonil]fenil]-1*H*-pirazol-5-carboxamida), ciclaniliprol (3-bromo-*N*-[2-bromo-4-cloro-6-[[[(1-ciclopropiletil)amino]carbonil]fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1*H*-pirazol-5-carboxamida], cicloprotrina, cicloxaprid ((5*S*,8*R*)-1-[(6-cloro-3-piridinil)metil]-2,3,5,6,7,8-hexahidro-9-nitro-5,8-Epoxi-1*H*-imidazo[1,2-*a*]azepina), ciflumetofeno, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, gamma-cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, zeta-cipermetrina, ciromazina, deltametrina, diafentiurón, diazinón, dieldrina, diflubenzurón, dimeflutrina, dimehipo, dimetoato, dinotefurano, diofenolano, emamectina, endosulfán, esfenvalerato, etiprol, etofenprox, etoxazol, óxido de fenbutatina, fenitrotión, fenotiocarb, fenoxicarb, fenpropatrina, fenvalerata, fipronilo, flometoquin (metil carbonato de 2-etil-3,7-dimetil-6-[4-(trifluorometoxi)fenoxi]-4-quinolinilo), flonicamid, flubendiamida, flucitrinato, flufenerim, flufenoxurón, flufenoxistrobina ((α *E*)-2-[[2-cloro-4-(trifluorometil)fenoxi]metil]- α -(metoximetileno)bencenoacetato de metilo), flufensulfona (5-cloro-2-[[3,4,4-trifluoro-3-buten-1-il)sulfonil]tiazol), fluhexafón, fluopiram, flupiprol (1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-5-[(2-metil-2-propen-1-il)amino]-4-[(trifluorometil)sulfinil]-1*H*-pirazol-3-carbonitrilo), flupiradifurona (4-[[[(6-cloro-3-piridinil)metil](2,2-difluoroetil)amino]-2(5*H*)-furanona], fluvalinato, tau-fluvalinato, fonofós, formetanato, fostiazato, halofenozida, heptaflutrina (2,2-dimetil-3-[(1*Z*)-3,3,3-trifluoro-1-propen-1-il]ciclopropanocarboxilato de [2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)fenil]metilo), hexaflumurón, hexitiazox, hidrametilnón, imidacloprid, indoxacarb, jabones insecticidas, isofenfós, lufenurón, malatión, meperflutrina ((1*R*,3*S*)-3-(2,2-dicloroetenil)-2,2-dimetilciclopropanocarboxilato de [2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)fenil]metilo), metaflumizona, metaldehído, metamidofós, metidatión, metiodicarb, metomilo, metopreno, metoxiclor, metoflutrina, metoxifenzida, metoflutrina, monocrotofós, monofluorotrina (3-(2-ciano-1-propen-1-il)-2,2-dimetilciclopropanocarboxilato de [2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)fenil]metilo), nicotina, nitenpiram, nitiazina, novalurón, noviflumurón, oxamilo, paratión, paratión-metilo, permetrina, forato, fosalona, fosmet, fosfamidón, pirimicarb, profenofós, proflutrina, propargita, protrifenbuta, piflubumida (1,3,5-trimetil-*N*-(2-metil-1-oxopropil)-*N*-[3-(2-metilpropil)-4-[2,2,2-trifluoro-1-metoxi-1-(trifluorometil)etil]fenil]-1*H*-pirazol-4-carboxamida), pimetozina, pirafluprol, piretrina, piridabeno, piridalilo, pirifluquinazón, piriminostrobina ((α *E*)-2-[[[2-[(2,4-diclorofenil)amino]-6-(trifluorometil)-4-pirimidinil]oxi]metil]- α -(metoximetileno)bencenoacetato de metilo), piriprol, piriproxifeno, rotenona, rianodina,

silafuofeno, espinetoram, spinosad, espiroclorfen, espiromesifeno, espirotetramat, sulprofós, sulfoxaflor (*N*-[metiloxido[1-[6-(trifluorometil)-3-piridinil]etil]- λ^4 -sulfaniliden]cianamida), tebufenozida, tebufenpirad, teflubenzurón, teflutrina, terbufós, tetraclorvinfós, tetrametrina, tetrametilflutrina (2,2,3,3-tetrametilciclopropanocarboxilato de [2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)fenil]metilo), tetraniliprol, tiacloprid, 5 tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodio, tioxazafeno (3-fenil-5-(2-tienil)-1,2,4-oxadiazol), tolfenpirad, tralometrina, triazamato, triclorfón, triflumezopirim (sal interna de 2,4-dioxo-1-(5-pirimidinilmetil)-3-[3-(trifluorometil)fenil]-2*H*-pirido[1,2-*a*]pirimidinio), triflumurón, delta-endotoxinas de *Bacillus thuringiensis*, bacterias entomopatógenas, virus entomopatógenos y hongos entomopatógenos.

Cabe destacar insecticidas tales como abamectina, acetamiprid, acrinatrina, afidopiropeno, 10 amitraz, avermectina, azadiractina, benfuracarb, bensultap, bifentrina, buprofezina, cadusafós, carbarilo, cartap, clorantraniliprol, clorfenapir, clorpirifós, clotianidina, ciantraniliprol, ciclaniliprol, cicloprotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, gamma-cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, zeta-cipermetrina, ciromazina, deltametrina, dieldrina, dinotefurano, diofenolano, emamectina, endosulfán, esfenvalerato, etiprol, etofenprox, etoxazol, fenitrotión, fenotiocarb, fenoxicarb, fenvalerato, fipronilo, 15 flometoquina, flonicamida, flubendiamida, flufenoxurón, flufenoxistrobina, flufensulfona, flupiprol, flupiradifurona, fluvalinato, formetanato, fostiazato, heptaflutrina, hexaflumurón, hidrametilnona, imidacloprid, indoxacarb, lufenurón, meperflutrina, metaflumizona, metiodicarb, metomilo, metopreno, metoxifenozida, metoflutrina, monofluorotrina, nitenpiram, nitiazina, novalurón, oxamilo, piflubumida, pimetrozina, piretrina, piridabeno, piridalilo, piriminostrobina, piriproxifeno, rianodina, espinetoram, 20 spinosad, espiroclorfen, espiromesifeno, espirotetramat, sulfoxaflor, tebufenozida, tetrametrina, tetrametilflutrina, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodio, tralometrina, triazamato, triflumezopirim, triflumurón, delta-endotoxinas de *Bacillus thuringiensis*, todas las cepas de *Bacillus thuringiensis* y todas las cepas de nucleopoliedrovirus.

Una realización de agentes biológicos para mezclar con los compuestos de la presente divulgación 25 incluyen bacterias entomopatógenas tales como *Bacillus thuringiensis* y las delta-endotoxinas encapsuladas de *Bacillus thuringiensis* tales como los bioinsecticidas MVP® y MVP-II® preparados mediante el proceso CellCap® (CellCap®, MVP® y MVP-II® son marcas comerciales de Mycogen Corporation, Indianápolis, Indiana, EE. UU.); hongos entomopatógenos tales como el hongo verde muscardina; y virus entomopatógenos (tanto naturales como modificados genéticamente), incluyendo baculovirus, 30 nucleopoliedrovirus (NPV) tales como el nucleopoliedrovirus *Helicoverpa zea* (HzNPV), el nucleopoliedrovirus *Anagrapha falcifera* (AfNPV); y el virus de la granulosis (GV) como el virus de la granulosis de *Cydia pomonella* (CpGV).

Una realización de agentes biológicos para mezclar con compuestos de esta divulgación incluye uno o una combinación de (i) una bacteria del género *Actinomycetes*, *Agrobacterium*, *Arthrobacter*, *Alcaligenes*, 35 *Aureobacterium*, *Azobacter*, *Bacillus*, *Beijerinckia*, *Bradyrhizobium*, *Brevibacillus*, *Burkholderia*, *Chromobacterium*, *Clostridium*, *Clavibacter*, *Comamonas*, *Corynebacterium*, *Curtobacterium*, *Enterobacter*, *Flavobacterium*, *Gluconobacter*, *Hydrogenophaga*, *Klebsiella*, *Methylobacterium*, *Paenibacillus*, *Pasteuria*,

Photorhabdus, *Phyllobacterium*, *Pseudomonas*, *Rhizobium*, *Serratia*, *Sphingobacterium*, *Stenotrophomonas*, *Streptomyces*, *Variovorax*, or *Xenorhabdus*, for example a bacterium of *Bacillus amyloliquefaciens*, *Bacillus cereus*, *Bacillus firmus*, *Bacillus licheniformis*, *Bacillus pumilus*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus subtilis*, *Bacillus thuringiensis*, *Bradyrhizobium japonicum*, *Chromobacterium subtsugae*, *Pasteuria nishizawae*, *Pasteuria penetrans*, *Pasteuria usage*, *Pseudomonas fluorescens*, y *Streptomyces lydicus*; (ii) un hongo tal como el hongo muscardina verde; (iii) un virus que incluye baculovirus, nucleopoliedrovirus tal como nucleopoliedrovirus de *Helicoverpa zea*, nucleopoliedrovirus de *Anagrapha falcifera*; virus de la granulosis tal como el virus de la granulosis *Cydia pomonella*.

Cabe destacar en particular una combinación de este tipo en la que el otro principio activo para el control de plagas de invertebrados pertenece a una clase química diferente o tiene un sitio de acción diferente al del compuesto de Fórmula 1. En ciertos casos, una combinación con al menos un principio activo diferente para el control de plagas de invertebrados que tenga un espectro de control similar pero un sitio de acción diferente será particularmente ventajosa para el manejo de la resistencia. Por lo tanto, una composición de la presente divulgación puede comprender además una cantidad biológicamente eficaz de al menos un principio activo adicional para el control de plagas de invertebrados que tenga un espectro de control similar, pero que pertenezca a una clase química diferente o que tenga un sitio de acción diferente. Estos compuestos o agentes biológicamente activos adicionales incluyen, sin carácter limitante, inhibidores de acetilcolinesterasa (AChE) tales como los carbamatos metomilo, oxamilo, tiodicarb, triazamato y los organofosforados clorpirifós; antagonistas de los canales de cloruro activados por GABA tales como ciclodienos dieldrina y endosulfán, y fenilpirazoles etiprol y fipronilo; moduladores de los canales de sodio tales como los piretroides bifentrina, ciflutrina, *beta*-ciflutrina, cihalotrina, *lambda*-cihalotrina, cipermetrina, deltametrina, dimeflutrina, esfenvalerato, metoflutrina y proflutrina; agonistas del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR) tales como los neonicotinoides acetamiprida, clotianidina, dinotefurano, imidacloprida, nitenpiram, nitiazina, tiacloprida y tiametoxam, la sulfoximina sulfoxaflor, la butenolida flupiradifurona y el mesoiónico triflumezopirim; activadores alostéricos del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR) tales como espinosinas espinetoram y espinosad; activadores de los canales de cloruro tales como las avermectinas abamectina y emamectina; imitadores de hormonas juveniles tales como diofenolano, metopreno, fenoxicarb y piriproxifeno; moduladores de órganos cordotonaes tales como pimetrozina, pirifluquinazona y flonicamida; inhibidores del crecimiento de ácaros tales como etoxazol; inhibidores de la ATP sintasa mitocondrial tales como la propargita; desacopladores de fosforilación oxidativa a través de la ruptura del gradiente de protones tales como clorfenapir; bloqueadores del canal del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR) tales como los análogos de nereistoxina cartap; inhibidores de la biosíntesis de quitina tales como benzoilureas flufenoxurón, hexaflumurón, lufenurón, novalurón, noviflumurón y triflumurón, y buprofezina; disruptores de la muda de dípteros tales como ciromazina; agonistas del receptor de ecdisona tales como diacilhidrazinas metoxifenoazida y tebufenozida; agonistas del receptor de octopamina tales como amitraz; inhibidores del transporte de electrones del complejo mitocondrial III tales como hidrametilnona y bifenazato; inhibidores del transporte de electrones del complejo mitocondrial I tales como

piridabeno; bloqueadores de los canales de sodio dependientes de la tensión tales como indoxacarb; inhibidores de acetil CoA carboxilasa tales como los ácidos tetrónico y tetrámico espiroclifeno, espiromesifeno y espirotetramat; inhibidores del transporte de electrones del complejo mitocondrial II tales como los β -cetonitrilos cienopirafeno y ciflumetofeno; moduladores del receptor de rianodina tales como las diamidas antranílicas clorantraniliprol y ciantraniliprol, diamidas tales como flubendiamida y ligandos del receptor de rianodina tales como rianodina; compuestos en donde el sitio diana responsable de la actividad biológica es desconocido o no está caracterizado, tales como azadiractina y piridalilo; disruptores microbianos de las membranas del intestino medio de los insectos tales como *Bacillus thuringiensis* y las delta-endotoxinas que producen y *Bacillus sphaericus*; y agentes biológicos que incluyen nucleopoliedrovirus (NPV) y otros virus insecticidas naturales o modificados genéticamente.

Otros ejemplos de compuestos o agentes biológicamente activos con los que se pueden formular compuestos de esta divulgación son: fungicidas tales como acibenzolar-S-metilo, aldimofo, ametoctradina, aminopirifeno, amisulbrom, anilazina, azaconazol, azoxistrobina, benalaxilo (incluyendo benalaxil-M), benodanilo, benomilo, bentiavalicarb (incluyendo bentiavalicarb-isopropilo), benzovindiflupir, betoxazina, binapacril, bifenilo, bitertanol, bixafén, blastidicid-S, boscalida, bromuconazol, bupirinato, butiobato, carboxina, carpropamida, captafol, captán, carbendazim, cloroneb, clorotalonilo, clozolinato, hidróxido de cobre, oxicloruro de cobre, sulfato de cobre, cumoxistrobina, ciazofamida, ciflufenamida, cimoxanilo, ciproconazol, ciprodinilo, diclobentiazox, diclofluanida, diclocimet, diclomezina, diclorán, dietofencarb, difenoconazol, diflumetorim, dimethirimol, dimetomorf, dimoxiestrobina, diniconazol (incluyendo diniconazol-M), dinocap, dipimetitrona, ditianona, ditiolanos, dodemorf, dodina, econazol, etaconazol, edifenfós, enoxastrobina (también conocida como enestroburina), epoxiconazol, etaboxam, etirimol, etridiazol, famoxadona, fenamidona, fenaminstrobina, fenarimol, fenbuconazol, fenfuram, fenhexamida, fenoxanilo, fenciclonilo, fencicoxamida, fenpropidina, fenpropimorf, fenpirazamina, acetato de fentina, hidróxido de fentina, ferbam, ferimzona, flometoquina, florilpicoxamida, fluopimomida, fluazinam, fludioxonilo, flufenoxistrobina, fluindapir, flumorf, fluopicolida, fluopiram, fluoxapirolina, fluoxastrobina, fluquinconazol, flusilazol, flusulfamida, flutianilo, flutolanilo, flutriafol, fluxapiroxad, folpet, ftalida, fuberidazol, furalaxilo, furametpir, hexaconazol, himexazol, guazatina, imazalilo, imibenconazol, albesilato de iminoctadina, triacetato de iminoctadina, inpirfluxam, yodicarb, ipconazol, ipfentrifluconazol, ipflufenquina, isofetamida, iprobenfós, iprodiona, iprovalicarb, isoflucipram, isoprotilano, isopirazam, isotianilo, casugamicina, cresoxim-metilo, lancotriona, mancozeb, mandipropamida, mandestrobina, maneb, mapanipirina, mefentrifluconazol, mepronilo, meptildinocap, metalaxilo (incluyendo metalaxil-M/mefenoxam), metconazol, metasulfocarb, metiram, metominostrobina, metiltetraprol, metrafenona, miclobutanilo, naftitina, neo-asozina (metanearsonato férrico), nuarimol, octilinona, ofurace, orisastrobina, oxadixilo, oxatiapiprolina, ácido oxolínico, oxpoconazol, oxicarboxina, oxitetraciclina, penconazol, pencicurón, penflufeno, pentiopirad, perfurazoato, ácido fosforoso (incluyendo sales del mismo, p. ej., fosetil-aluminio), picoxistrobina, piperalina, polioxina, probenazol, procloraz, procimidona, propamocarb, propiconazol, propineb, proquinazida, protiocarb, protioconazol, pidiflumetofeno (Adepidyn®),

piraclostrobina, pirametostrobina, pirapropoina, piraoxistrobina, piraziflumida, pirazofós, piribencarb, piributacarb, piridaclometilo, pirifenox, piriofenona, perisoxazol, pirimetanilo, pirifenox, pirrolnitrina, piroquilona, quinconazol, quinmetionato, quinofumelina, quinoxifén, quintoceno, siltiofam, sedaxano, simeconazol, espiroxamina, estreptomicina, sulfur, tebuconazol, tebufloquina, tecloftalam, tecnazeno, 5 terbinafina, tetraconazol, tiabendazol, tifluzamida, tiofanato, tiofanato-metilo, tiram, tiadinilo, tolclorfós-metilo, tolprocarb, tolifluanida, triadimefón, triadimenol, triarimol, triazóxido, sulfato de cobre tribásico, triclopircarb, tridemorf, trifloxistrobina, triflumizol, trimoframida triciclazol, trifloxistrobina, triforina, triticonazol, uniconazol, validamicina, valifenalato (también conocido como valifenal), vinclozolina, zineb, ziram, zoxamida y 1-[4-[4-[5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-10 (trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona; nematicidas tales como fluopiram, espirotetramat, tiodicarb, fostiazato, abamectina, iprodiona, fluensulfona, dimetildisulfuro, tioazafeno, 1,3-dicloropropeno (1,3-D), metam (sodio y potasio), dazomet, cloropicrina, fenamifós, etoprofós, cadusafós, terbufós, imiciafós, oxamilo, carbofurano, tioazafeno, *Bacillus firmus* y *Pasteuria nishizawae*; bactericidas tales como estreptomicina; acaricidas tales como amitraz, chinometionat, clorobenzilato, cihexatina, dicofol, dienoclor, 15 etoxazol, fenazaquina, óxido de fenbutatina, fenpropatrina, fenpiroximato, hexitiazox, propargita, piridabeno y tebufenpirad.

Las plagas de invertebrados se controlan en aplicaciones agronómicas y no agronómicas aplicando uno o más compuestos de esta divulgación, normalmente en forma de una composición, en una cantidad biológicamente eficaz, al entorno de las plagas, incluyendo el emplazamiento agronómico y/o no 20 agronómico de la infestación, la superficie que se va a proteger o directamente sobre las plagas que se van a controlar.

Por lo tanto, la presente divulgación comprende un método para controlar una plaga de invertebrados en aplicaciones agronómicas y/o no agronómicas, que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su entorno con una cantidad biológicamente eficaz de uno o más de los compuestos de la divulgación, o con una composición que comprende al menos uno de dichos compuestos o una 25 composición que comprende al menos uno de dichos compuestos y una cantidad biológicamente eficaz de al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional. Los ejemplos de composiciones adecuadas que comprenden un compuesto de la divulgación y una cantidad biológicamente eficaz de al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional incluyen composiciones granuladas en 30 donde el compuesto activo adicional está presente en el mismo granulado que el compuesto de la divulgación o en granulados distintos de los del compuesto de la divulgación.

Para lograr el contacto con un compuesto o una composición de la divulgación a fin de proteger un cultivo de campo de plagas de invertebrados, el compuesto o la composición normalmente se aplica a la semilla del cultivo antes de plantar, al follaje (p. ej., hojas, tallos, flores, frutos) de las plantas de cultivo, o 35 al suelo u otro medio de crecimiento antes o después de plantar el cultivo.

Una realización de un método de contacto es mediante pulverización. Como alternativa, se puede aplicar una composición granular que comprenda un compuesto de la divulgación al follaje de la planta o

al suelo. Los compuestos de esta divulgación también se pueden administrar eficazmente a través de la absorción de la planta al poner en contacto la planta con una composición que comprenda un compuesto de esta divulgación aplicado como un empapado del suelo con una formulación líquida, una formulación granular en el suelo, un tratamiento de caja de vivero o un baño de trasplantes. Cabe destacar una composición de la presente divulgación en forma de una formulación líquida de empapado del suelo. También cabe destacar un método para controlar una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su entorno con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de la presente divulgación o con una composición que comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de la presente divulgación. Cabe destacar además este método en donde el entorno es suelo y la composición se aplica en el suelo como una formulación de empapado del suelo. Cabe destacar además que los compuestos de esta divulgación también son eficaces mediante la aplicación localizada en el emplazamiento de la infestación. Otros métodos de contacto incluyen la aplicación de un compuesto o una composición de la divulgación mediante pulverizaciones directas y residuales, pulverizaciones aéreas, geles, recubrimientos de semillas, microencapsulaciones, absorción sistémica, cebos, marcajes de mazorcas, bolos, nebulizadores, fumigadores, aerosoles, polvos y muchos otros. Una realización de un método de contacto es un granulado, barra o comprimido de fertilizante dimensionalmente estable que comprende un compuesto o una composición de la divulgación. Los compuestos de esta divulgación también se pueden impregnar en materiales para fabricar dispositivos de control de invertebrados (p. ej., redes para insectos).

Los compuestos de la divulgación son útiles para tratar todas las plantas, partes de plantas y semillas. Se pueden obtener variedades y cultivares de semillas y plantas mediante métodos convencionales de propagación y fitomejoramiento o mediante métodos de ingeniería genética. Las plantas o semillas modificadas genéticamente (plantas o semillas transgénicas) son aquellas en las que se ha integrado un gen heterólogo (transgén) de forma estable en el genoma de la planta o semilla. Un transgén que se define por su ubicación particular en el genoma de la planta se denomina un evento de transformación o transgénico.

Las variedades de cultivo de semillas y plantas modificadas genéticamente que se pueden tratar de acuerdo con la divulgación incluyen las que son resistentes a una o más agresiones bióticas (plagas tales como nematodos, insectos, ácaros, hongos, etc.) o agresiones abióticas (sequía, temperatura fría, salinidad del suelo, etc.), o que contengan otras características deseables. Las plantas y semillas se pueden modificar genéticamente para presentar rasgos de, por ejemplo, tolerancia a herbicidas, resistencia a insectos, perfiles de aceite modificados o tolerancia a la sequía. Las plantas y semillas modificadas genéticamente útiles que contienen eventos de transformación de un solo gen o combinaciones de eventos de transformación se enumeran en la Tabla Z. En las siguientes bases de datos se puede obtener información adicional para las modificaciones genéticas enumeradas en la Tabla Z:

Base de datos de productos BioTrack de la OCDE [base de datos en línea]. Obtenido de la Organización para la Cooperación y el Desarrollo Económico (OCDE) usando Internet <<https://biotrackproductdatabase.oecd.org/byidentifier.aspx>>

5 Servicio de Inspección de Sanidad Animal y Vegetal del USDA [base de datos en línea]. Obtenido del Departamento de Agricultura de los EE. UU. usando Internet <<http://www.aphis.usda.gov>>

Liberación deliberada y comercialización de OMG en la UE - Registro de OMG [base de datos en línea]. Obtenido del Centro Común de Investigación de la Comisión Europea usando Internet <<http://gmoinfo.jrc.ec.europa.eu>>

10 En la Tabla Z que se muestra a continuación se utilizan las siguientes abreviaturas: tol. es tolerancia, res. es resistencia, SU es sulfonilurea, ALS es acetolactato sintasa, HPPD es 4-Hidroxifenilpiruvato Dioxigenasa, ND es No Disponible.

Tabla Z

	Cultivo	Nombre del evento	Código del evento	Rasgo(s)	Gen(es)
15	Alfalfa	J101	MON-00101-8	Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
	Alfalfa	J163	MON-ØØ163-7	Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
20	Colza*	23-18-17 (Evento 18)	CGN-89465-2	Aceite con alto contenido de ácido láurico	te
	Colza*	23-198 (Evento 23)	CGN-89465-2	Aceite con alto contenido de ácido láurico	te
	Colza*	61061	DP-Ø61Ø61-7	Tol. a glifosato	gat4621
25	Colza*	73496	DP-Ø73496-4	Tol. a glifosato	gat4621
	Colza*	GT200 (RT200)	MON-89249-2	Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
30	Colza*	GT73 (RT73)	MON-ØØØ73-7	Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
	Colza*	HCN10 (Topas 19/2)	ND	Tol. a glufosinato	bar
35	Colza*	HCN28 (T45)	ACS-BNØØ8-2	Tol. a glufosinato	pat (syn)

5	Colza*	HCN92 (Topas 19/2)	ACS-BNØØ7-1	Tol. a glufosinato	bar
	Colza*	MON88302	MON-883Ø2-9	Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
	Colza*	MPS961	ND	Degradación de fitato	phyA
	Colza*	MPS962	ND	Degradación de fitato	phyA
	Colza*	MPS963	ND	Degradación de fitato	phyA
10	Colza*	MPS964	ND	Degradación de fitato	phyA
	Colza*	MPS965	ND	Degradación de fitato	phyA
	Colza*	MS1 (B91-4)	ACS-BNØØ4-7	Tol. a glufosinato	bar
	Colza*	MS8	ACS-BNØØ5-8	Tol. a glufosinato	bar
	Colza*	OXY-235	ACS-BNØ11-5	Tol. a oxinilo	bxn
15	Colza*	PHY14	ND	Tol. a glufosinato	bar
	Colza*	PHY23	ND	Tol. a glufosinato	bar
	Colza*	PHY35	ND	Tol. a glufosinato	bar
	Colza*	PHY36	ND	Tol. a glufosinato	bar
	Colza*	RF1 (B93-101)	ACS-BNØØ1-4	Tol. a glufosinato	bar
20	Colza*	RF2 (B94-2)	ACS-BNØØ2-5	Tol. a glufosinato	bar
	Colza*	RF3	ACS-BNØØ3-6	Tol. a glufosinato	bar
	Frijol	EMBRAPA 5.1	EMB-PV051-1	Res. a enfermedades	ac1 (sentido y antisentido)
	Berenjena (Berenjena)	EE-1		Res. a insectos	cry1Ac
	Clavel	11 (7442)	FLO-07442-4	Tol. a SU; color de la flor modificado	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
35	Clavel	11363 (1363A)	FLO-11363-1	Tol. a SU; color de la flor modificado	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
	Clavel	1226A (11226)	FLO-11226-8	Tol. a SU; color de la flor modificado	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
	Clavel	123.2.2 (40619)	FLO-4Ø619-7	Tol. a SU; color de la flor modificado	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
	Clavel				

5	Clavel	123.2.38 (40644)	FLO-40644-4	Tol. a SU; color de la flor modificado	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
	Clavel	123.8.12	FLO-40689-6	Tol. a SU; color de la flor modificado	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
	Clavel	123.8.8 (40685)	FLO-40685-1	Tol. a SU; color de la flor modificado	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
	Clavel	1351A (11351)	FLO-11351-7	Tol. a SU; color de la flor modificado	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
	Clavel	1400A (11400)	FLO-11400-2	Tol. a SU; color de la flor modificado	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
10	Clavel	15	FLO-00015-2	Tol. a SU; color de la flor modificado	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
	Clavel	16	FLO-00016-3	Tol. a SU; color de la flor modificado	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
	Clavel	4	FLO-00004-9	Tol. a SU; color de la flor modificado	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
15	Clavel	66	FLO-00066-8	Tol. a SU; retraso de la senescencia	surB; acc
	Clavel	959A (11959)	FLO-11959-3	Tol. a SU; color de la flor modificado	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
	Clavel	988A (11988)	FLO-11988-7	Tol. a SU; color de la flor modificado	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
	Clavel	26407	IFD-26497-2	Tol. a SU; color de la flor modificado	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
25	Clavel	25958	IFD-25958-3	Tol. a SU; color de la flor modificado	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
	Achicoria	RM3-3	ND	Tol. a glufosinato	bar
30	Achicoria	RM3-4	ND	Tol. a glufosinato	bar
	Achicoria	RM3-6	ND	Tol. a glufosinato	bar
	Algodón	19-51a	DD-01951A-7	Tol. a herbicidas ALS	S4-HrA
35	Algodón	281-24-236	DAS-24236-5	Tol. a glufosinato; res. a insectos	pat (syn); cry1F
	Algodón	3006-210-23	DAS-21023-5	Tol. a glufosinato; res. a insectos	pat (syn); cry1Ac
	Algodón	31707	ND	Tol. a oxinilo; res. a insectos	bxn; cry1Ac
	Algodón	31803	ND	Tol. a oxinilo; res. a insectos	bxn; cry1Ac

5	Algodón	31807	ND	Tol. a oxinilo; res. a insectos	bxn; cry1Ac
	Algodón	31808	ND	Tol. a oxinilo; res. a insectos	bxn; cry1Ac
	Algodón	42317	ND	Tol. a oxinilo; res. a insectos	bxn; cry1Ac
	Algodón	BNLA-601	ND	Res. a insectos	cry1Ac
	Algodón	BXN10211	BXN10211-9	Tol. a oxinilo	bxn; cry1Ac
10	Algodón	BXN10215	BXN10215-4	Tol. a oxinilo	bxn; cry1Ac
	Algodón	BXN10222	BXN10222-2	Tol. a oxinilo	bxn; cry1Ac
	Algodón	BXN10224	BXN10224-4	Tol. a oxinilo	bxn; cry1Ac
	Algodón	COT102	SYN-IR102-7	Res. a insectos	vip3A(a)
15	Algodón	COT67B	SYN-IR67B-1	Res. a insectos	cry1Ab
	Algodón	COT202		Res. a insectos	vip3A
	Algodón	Evento 1	ND	Res. a insectos	cry1Ac
20	Algodón	GMF Cry1A	GTL-GMF311-7	Res. a insectos	cry1Ab-Ac
	Algodón	GHB119	BCS-GH005-8	Res. a insectos	cry2Ae
	Algodón	GHB614	BCS-GH002-5	Tol. a glifosato	2mepsps
	Algodón	GK12	ND	Res. a insectos	cry1Ab-Ac
25	Algodón	LLCotton25	ACS-GH001-3	Tol. a glufosinato	bar
	Algodón	MLS 9124	ND	Res. a insectos	cry1C
	Algodón	MON1076	MON-89924-2	Res. a insectos	cry1Ac
	Algodón	MON1445	MON-01445-2	Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
	Algodón	MON15985	MON-15985-7	Res. a insectos	cry1Ac; cry2Ab2
35	Algodón	MON1698	MON-89383-1	Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)

	Algodón	MON531	MON-00531-6	Res. a insectos	cry1Ac	
	Algodón	MON757	MON-00757-7	Res. a insectos	cry1Ac	
5	Algodón	MON88913	MON-88913-8	Tol. a glifosato	cp4	epsps
	Algodón	Nqwe Chi 6 Bt	ND	Res. a insectos	¿ND?	
	Algodón	SKG321	ND	Res. a insectos	cry1A; CpTI	
10	Algodón	T303-3	BCS-GH003-6	Res. a insectos; tol. a glufosinato	cry1Ab; bar	
	Algodón	T304-40	BCS-GH004-7	Res. a insectos; tol. a glufosinato	cry1Ab; bar	
	Algodón	CE43-67B		Res. a insectos	cry1Ab	
	Algodón	CE46-02A		Res. a insectos	cry1Ab	
15	Algodón	CE44-69D		Res. a insectos	cry1Ab	
	Algodón	1143-14A		Res. a insectos	cry1Ab	
	Algodón	1143-51B		Res. a insectos	cry1Ab	
	Algodón	T342-142		Res. a insectos	cry1Ab	
20	Algodón	PV-GHGT07 (1445)		Tol. a glifosato	cp4	epsps
	Algodón	EE-GH3		Tol. a glifosato	mepsps	
	Algodón	EE-GH5		Res. a insectos	cry1Ab	
	Algodón	MON88701	MON-88701-3	Tol. a dicamba y glufosinato	dmo modificado; bar	
25	Algodón	OsCr11		Antialérgico	Cry j modificado	
	Agrostis trepador	ASR368	SMG-368ØØ-2	Tol. a glifosato	cp4	epsps
	Eucalipto	20-C		Tol. a sal	codA	
	Eucalipto	12-5C		Tol. a sal	codA	
30	Eucalipto	12-5B		Tol. a sal	codA	
	Eucalipto	107-1		Tol. a sal	codA	
	Eucalipto		1/9/2001	Tol. a sal	codA	
	Eucalipto		2/1/2001	Tol. a sal	codA	
	Eucalipto			Tol. al frío	des9	
35	Lino	FP967	CDC-FL001-2	Tol. a herbicidas ALS	als	
	Lenteja	RH44		Tol. a imidazolinona	als	

5	Maíz	3272	SYN-E3272-5	Alfa-amilasa modificada	amy797E
	Maíz	5307	SYN-05307-1	Res. a insectos	ecry3.1Ab
	Maíz	59122	DAS-59122-7	Res. a insectos; tol. a glufosinato	cry34Ab1; cry35Ab1; pat
	Maíz	676	PH-000676-7	Tol. a glufosinato; control de polinización	pat; dam
	Maíz	678	PH-000678-9	Tol. a glufosinato; control de polinización	pat; dam
10	Maíz	680	PH-000680-2	Tol. a glufosinato; control de polinización	pat; dam
	Maíz	98140	DP-098140-6	Tol. a glifosato; tol. a herbicidas ALS	gat4621; zm-hra
	Maíz	Bt10	ND	Res. a insectos; tol. a glufosinato	cry1Ab; pat
15	Maíz	Bt176 (176)	SYN-EV176-9	Res. a insectos; tol. a glufosinato	cry1Ab; bar
	Maíz	BVLA430101	ND	Degradación de fitato	phyA2
	Maíz	CBH-351	ACS-ZM004-3	Res. a insectos; tol. a glufosinato	cry9C; bar
	Maíz	DAS40278-9	DAS40278-9	Tol. a 2,4-D	aad-1
	Maíz	DBT418	DKB-89614-9	Res. a insectos; tol. a glufosinato	cry1Ac; pinII; bar
25	Maíz	DLL25 (B16)	DKB-89790-5	Tol. a glufosinato	bar
	Maíz	GA21	MON-00021-9	Tol. a glifosato	mepsps
	Maíz	GG25		Tol. a glifosato	mepsps
30	Maíz	GJ11		Tol. a glifosato	mepsps
	Maíz	FI117		Tol. a glifosato	mepsps
	Maíz	GAT-ZM1		Tol. a glufosinato	pat
	Maíz	LY038	REN-00038-3	Lisina aumentada	cordapA
	Maíz	MIR162	SYN-IR162-4	Res. a insectos	vip3Aa20

5	Maíz	MIR604	SYN- IR604-5	Res. a insectos	mcry3A
	Maíz	MON801 (MON80100)	MON801	Res. a insectos; tol. a glifosato	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
	Maíz	MON802	MON- 80200-7	Res. a insectos; tol. a glifosato	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
	Maíz	MON809	PH-MON- 809-2	Res. a insectos; tol. a glifosato	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
	Maíz	MON810	MON- 00810-6	Res. a insectos; tol. a glifosato	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
15	Maíz	MON832	ND	Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
20	Maíz	MON863	MON- 00863-5	Res. a insectos	cry3Bb1
	Maíz	MON87427	MON- 87427-7	Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
	Maíz	MON87460	MON- 87460-4	Tol. a la sequía	cspB
	Maíz	MON88017	MON- 88017-3	Res. a insectos; tol. a glifosato	cry3Bb1; cp4 epsps (aroA:CP4)
25	Maíz	MON89034	MON- 89034-3	Res. a insectos	cry2Ab2; cry1A.105
30	Maíz	MS3	ACS- ZM001-9	Tol. a glufosinato; control de polinización	bar; barnasa
	Maíz	MS6	ACS- ZM005-4	Tol. a glufosinato; control de polinización	bar; barnasa
	Maíz	NK603	MON- 00603-6	Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
	Maíz	T14	ACS- ZM002-1	Tol. a glufosinato	pat (syn)
35	Maíz	T25	ACS- ZM003-2	Tol. a glufosinato	pat (syn)

5	Maíz	TC1507	DAS-01507-1	Res. a insectos; tol. a glufosinato	cry1Fa2; pat
	Maíz	TC6275	DAS-06275-8	Res. a insectos; tol. a glufosinato	mocry1F; bar
	Maíz	VIP1034		Res. a insectos; tol. a glufosinato	vip3A; pat
	Maíz	43A47	DP-043A47-3	Res. a insectos; tol. a glufosinato	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
	Maíz	40416	DP-040416-8	Res. a insectos; tol. a glufosinato	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
10	Maíz	32316	DP-032316-8	Res. a insectos; tol. a glufosinato	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
	Maíz	4114	DP-004114-3	Res. a insectos; tol. a glufosinato	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
	Melón	Melón A	ND	Maduración/senescencia retrasada	sam-k
15	Melón	Melón B	ND	Maduración/senescencia retrasada	sam-k
	Papaya	55-1	CUH-CP551-8	Res. a enfermedades	prsv cp
	Papaya	63-1	CUH-CP631-7	Res. a enfermedades	prsv cp
20	Papaya	Huanong N.º 1	ND	Res. a enfermedades	prsv rep
	Papaya	X17-2	UFL-X17CP-6	Res. a enfermedades	prsv cp
	Petunia	Petunia-CHS	ND	Calidad del producto modificada	Supresión de CHS
25	Ciruelo	C-5	ARS-PLMC5-6	Res. a enfermedades	ppv cp
	Colza**	ZSR500	ND	Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
	Colza**	ZSR502	ND	Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
30					
35					

	Colza**	ZSR503	ND	Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
5	Álamo	Álamo Bt	ND	Res. a insectos	cry1Ac; API
	Álamo	Clon híbrido de álamo 741	ND	Res. a insectos	cry1Ac; API
	Álamo	trg300-1		Celulosa alta	AaXEG2
	Álamo	trg300-2		Celulosa alta	AaXEG2
10	Patata	1210 amk	ND	Res. a insectos	cry3A
	Patata	2904/1 kgs	ND	Res. a insectos	cry3A
	Colza**	ZSR500	ND	Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
15	Colza**	ZSR502	ND	Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
	Patata	ATBT04-27	NMK- 89367-8	Res. a insectos	cry3A
20	Patata	ATBT04-30	NMK- 89613-2	Res. a insectos	cry3A
	Patata	ATBT04-31	NMK- 89170-9	Res. a insectos	cry3A
	Patata	ATBT04-36	NMK- 89279-1	Res. a insectos	cry3A
25	Patata	ATBT04-6	NMK- 89761-6	Res. a insectos	cry3A
	Patata	BT06	NMK- 89812-3	Res. a insectos	cry3A
30	Patata	BT10	NMK- 89175-5	Res. a insectos	cry3A
	Patata	BT12	NMK- 89601-8	Res. a insectos	cry3A
	Patata	BT16	NMK- 89167-6	Res. a insectos	cry3A
35	Patata	BT17	NMK- 89593-9	Res. a insectos	cry3A

5	Patata	BT18	NMK-89906-7	Res. a insectos		cry3A
	Patata	BT23	NMK-89675-1	Res. a insectos		cry3A
	Patata	EH92-527-1	BPS-25271-9	Almidón/carbohidrato modificado		gbss (antisentido)
	Patata	HLMT15-15	ND	Res. a insectos enfermedades	y	cry3A; pvy cp
	Patata	HLMT15-3	ND	Res. a insectos enfermedades	y	cry3A; pvy cp
10	Patata	HLMT15-46	ND	Res. a insectos enfermedades	y	cry3A; pvy cp
	Patata	RBMT15-101	NMK-89653-6	Res. a insectos enfermedades	y	cry3A; pvy cp
	Patata	RBMT21-129	NMK-89684-1	Res. a insectos enfermedades	y	cry3A; plrv orf1; plrv orf2
15	Patata	RBMT21-152	ND	Res. a insectos enfermedades	y	cry3A; plrv orf1; plrv orf2
	Patata	RBMT21-350	NMK-89185-6	Res. a insectos enfermedades	y	cry3A; plrv orf1; plrv orf2
	Patata	RBMT22-082	NMK-89896-6	Res. a insectos enfermedades; tol. glifosato	y a	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)
	Patata	RBMT22-186	ND	Res. a insectos enfermedades; tol. glifosato	y a	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)
25	Patata	RBMT22-238	ND	Res. a insectos enfermedades; tol. glifosato	y a	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)
	Patata	RBMT22-262	ND	Res. a insectos enfermedades; tol. glifosato	y a	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)
	Patata	SEMT15-02	NMK-89935-9	Res. a insectos enfermedades	y	cry3A; pvy cp
35	Patata	SEMT15-07	ND	Res. a insectos enfermedades	y	cry3A; pvy cp

5	Patata	SEMT15-15	NMK-89930-4	Res. a insectos y enfermedades	cry3A; pvy cp
	Patata	SPBT02-5	NMK-89576-1	Res. a insectos	cry3A
	Patata	SPBT02-7	NMK-89724-5	Res. a insectos	cry3A
	Arroz	7Crp#242-95-7		Antialérgico	7crp
	Arroz	7Crp#10	ND	Antialérgico	7crp
10	Arroz	GM Shanyou 63	ND	Res. a insectos	cry1Ab; cry1Ac
	Arroz	Huahui-1/TT51-1	ND	Res. a insectos	cry1Ab; cry1Ac
	Arroz	LLRICE06	ACS-OS001-4	Tol. a glufosinato	bar
	Arroz	LLRICE601	BCS-OS003-7	Tol. a glufosinato	bar
	Arroz	LLRICE62	ACS-OS002-5	Tol. a glufosinato	bar
15	Arroz	Tarom molaii + cry1Ab	ND	Res. a insectos	cry1Ab (truncada)
	Arroz	GAT-OS2		Tol. a glufosinato	bar
	Arroz	GAT-OS3		Tol. a glufosinato	bar
	Arroz	PE-7		Res. a insectos	Cry1Ac
	Arroz	7Crp#10	ND	Antialérgico	7crp
20	Arroz	KPD627-8		Triptófano alto	OASA1D
	Arroz	KPD722-4		Triptófano alto	OASA1D
	Arroz	KA317		Triptófano alto	OASA1D
	Arroz	HW5		Triptófano alto	OASA1D
	Arroz	HW1		Triptófano alto	OASA1D
25	Arroz	B-4-1-18		Hojas erectas semienanas	Δ OsBRI1
	Arroz	G-3-3-22		Semienana	OSGA2ox1
	Arroz	AD77		Res. a enfermedades	DEF
	Arroz	AD51		Res. a enfermedades	DEF
	Arroz	AD48		Res. a enfermedades	DEF
30	Arroz	AD41		Res. a enfermedades	DEF
	Arroz	13pNasNaatAprt1		Baja tol. al hierro	HvNAS1; HvNAAT-A; APRT
	Arroz	13pAprt1		Baja tol. al hierro	APRT
35					

5	Arroz	gHvNAS1- gHvNAAT-1		Baja tol. al hierro	HvNAS1; HvNAAT-A; HvNAAT-B
	Arroz	gHvIDS3-1		Baja tol. al hierro	HvIDS3
	Arroz	gHvNAAT1		Baja tol. al hierro	HvNAAT-A; HvNAAT-B
	Arroz	gHvNAS1-1		Baja tol. al hierro	HvNAS1
	Arroz	NIA-OS006-4		Res. a enfermedades	WRKY45
10	Arroz	NIA-OS005-3		Res. a enfermedades	WRKY45
	Arroz	NIA-OS004-2		Res. a enfermedades	WRKY45
	Arroz	NIA-OS003-1		Res. a enfermedades	WRKY45
	Arroz	NIA-OS002-9		Res. a enfermedades	WRKY45
	Arroz	NIA-OS001-8		Res. a enfermedades	WRKY45
15	Arroz	OsCr11		Antialérgico	Cry j modificado
	Arroz	17053		Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
	Arroz	17314		Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
	Rosa	WKS82 / 130-4-1	IFD-52401-4	Color de la flor modificado	5AT; bp40 (f3'5'h)
	Rosa	WKS92 / 130-9-1	IFD-52901-9	Color de la flor modificado	5AT; bp40 (f3'5'h)
25	Soja	260-05 (G94-1, G94-19, G168)	ND	Aceite/ácido graso modificado	gm-fad2-1 (locus de silenciamiento)
	Soja	A2704-12	ACS-GM005-3	Tol. a glufosinato	pat
	Soja	A2704-21	ACS-GM004-2	Tol. a glufosinato	pat
	Soja	A5547-127	ACS-GM006-4	Tol. a glufosinato	pat
	Soja	A5547-35	ACS-GM008-6	Tol. a glufosinato	pat
35	Soja	CV127	BPS-CV127-9	Tol. a imidazolinona	csr1-2
	Soja	DAS68416-4	DAS68416-4	Tol. a glufosinato	pat

5	Soja	DP305423	DP-305423-1	Aceite/ácido graso modificado; tol. a herbicidas ALS	gm-fad2-1 (locus de silenciamiento); gm-hra
	Soja	DP356043	DP-356043-5	Aceite/ácido graso modificado; tol. a glifosato	gm-fad2-1 (locus de silenciamiento); gat4601
	Soja	FG72	MST-FG072-3	Tol. a glifosato y HPPD	2mepsps; hppdPF W336
10	Soja	GTS 40-3-2 (40-3-2)	MON-04032-6	Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
	Soja	GU262	ACS-GM003-1	Tol. a glufosinato	pat
	Soja	MON87701	MON-87701-2	Res. a insectos	cry1Ac
15	Soja	MON87705	MON-87705-6	Aceite/ácido graso modificado; tol. a glifosato	fatb1-A (sentido y antisentido); fad2-1A (sentido y antisentido); cp4 epsps (aroA:CP4)
	Soja	MON87708	MON-87708-9	Tol. a dicamba y glifosato	dmo; cp4 epsps (aroA:CP4)
	Soja	MON87769	MON-87769-7	Aceite/ácido graso modificado; tol. a glifosato	Pj.D6D; Nc.Fad3; cp4 epsps (aroA:CP4)
25	Soja	MON89788	MON-89788-1	Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
	Soja	W62	ACS-GM002-9	Tol. a glufosinato	bar
	Soja	W98	ACS-GM001-8	Tol. a glufosinato	bar
30	Soja	MON87754	MON-87754-1	Aceite alto	dgat2A
	Soja	DAS21606	DAS-21606	Tol. a ariloxialcanoato y glufosinato	aad-12 modificado; pat
	Soja	DAS44406	DAS-44406-6	Tol. a ariloxialcanoato, glifosato y glufosinato	aad-12 modificado; 2mepsps; pat

	Soja	SYHT04R	SYN-0004R-8	Tol. a mesotriona	avhppd modificado
	Soja	9582.814.19.1		Res. a insectos y tol. a glufosinato	cry1Ac, cry1F, PAT
5	Calabaza	CZW3	SEM-ØCZW3-2	Res. a enfermedades	cmv cp, zymv cp, wmv cp
	Calabaza	ZW20	SEM-0ZW20-7	Res. a enfermedades	zymv cp, wmv cp
10	Remolacha azucarera	GTSB77 (T9100152)	SY-GTSB77-8	Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
	Remolacha azucarera	H7-1	KM-000H71-4	Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
15	Remolacha azucarera	T120-7	ACS-BV001-3	Tol. a glufosinato	pat
	Remolacha azucarera	T227-1		Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
20	Caña de azúcar	NXI-1T		Tol. a la sequía	EcbetA
	Girasol	X81359		Tol. a imidazolinona	als
	Pimiento dulce	PK-SP01	ND	Res. a enfermedades	cmv cp
	Tabaco	C/F/93/08-02	ND	Tol. a oxinilo	bxn
25	Tabaco	Vector 21-41	ND	Nicotina reducida	NtQPT1 (antisentido)
	Tomate	1345-4	ND	Maduración/senescencia retrasada	acc (truncado)
30	Tomate	35-1-N	ND	Maduración/senescencia retrasada	sam-k
	Tomate	5345	ND	Res. a insectos	cry1Ac
	Tomate	8338	CGN-89322-3	Maduración/senescencia retrasada	accd
35	Tomate	B	SYN-0000B-6	Maduración/senescencia retrasada	pg (sentido o antisentido)
	Tomate	Da	SYN-0000DA-9	Maduración/senescencia retrasada	pg (sentido o antisentido)

	Girasol	X81359		Tol. a imidazolinona	als
	Tomate	Da Dong N.º 9	ND	Producto modificado	ND
	Tomate	F (1401F, h38F, 11013F,7913F)	SYN-0000F-1	Maduración/senescencia retrasada	pg (sentido o antisentido)
5	Tomate	FLAVR SAVR™	CGN-89564-2	Maduración/senescencia retrasada	pg (sentido o antisentido)
	Tomate	Huafan N.º 1	ND	Maduración/senescencia retrasada	anti-eft
10	Tomate	PK-TM8805R (8805R)	ND	Res. a enfermedades	cmv cp
	Trigo	MON71800	MON-718ØØ-3	Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)

15 * Argentina, ** Polaco, # Berenjena

El tratamiento de plantas y semillas modificadas genéticamente con compuestos de la divulgación puede producir efectos potenciados. Por ejemplo, la reducción de las tasas de aplicación, la ampliación del espectro de actividad, el aumento de la tolerancia a las agresiones bióticas/abióticas o la potenciación de la estabilidad de almacenamiento pueden ser superiores a lo que se espera de los simples efectos aditivos de la aplicación de los compuestos de la divulgación sobre plantas y semillas modificadas genéticamente.

Los compuestos de esta divulgación también son útiles en el tratamiento de semillas para proteger las semillas de plagas de invertebrados. En el contexto de la presente divulgación y las reivindicaciones, tratar una semilla significa poner en contacto la semilla con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de esta divulgación, que normalmente se formula como una composición de la divulgación. Este tratamiento de semillas protege la semilla frente a las plagas de invertebrados del suelo y, en general, también puede proteger las raíces y otras partes de la planta en contacto con el suelo de la plántula que se desarrolla a partir de la semilla en germinación. El tratamiento de semillas también puede proporcionar protección del follaje mediante la translocación del compuesto de esta divulgación o un segundo principio activo dentro de la planta en desarrollo. Los tratamientos de semillas se pueden aplicar a todo tipo de semillas, incluidas aquellas a partir de las cuales germinarán plantas transformadas genéticamente para expresar rasgos especializados. Los ejemplos representativos incluyen las que expresan proteínas tóxicas para plagas de invertebrados, tales como la toxina de *Bacillus thuringiensis*, o las que expresan resistencia a herbicidas, tales como la glifosato-acetiltransferasa, que proporciona resistencia al glifosato. Los tratamientos de semillas con compuestos de esta divulgación también pueden aumentar el vigor de las plantas que crecen a partir de la semilla tratada.

Un método de tratamiento de semillas es pulverizar o espolvorear la semilla con un compuesto de la divulgación (es decir, como una composición formulada) antes de sembrar las semillas. Las

composiciones formuladas para el tratamiento de semillas generalmente comprenden un agente adhesivo o formador de películas. Por lo tanto, normalmente una composición de recubrimiento de semillas de la presente divulgación comprende una cantidad biológicamente eficaz de compuestos de Fórmula 1, un N-óxido o sal del mismo, y un formador de película o agente adhesivo. La semilla puede recubrirse pulverizando un concentrado en suspensión fluido directamente en un lecho de volteo de semillas y, a continuación, secando las semillas. Como alternativa, se pueden pulverizar sobre la semilla otros tipos de formulación tales como polvos húmedos, soluciones, suspoemulsiones, concentrados emulsionables y emulsiones en agua. Este proceso es particularmente útil para aplicar recubrimientos de tipo película sobre las semillas. Un experto en la materia dispone de diversas máquinas y procesos de recubrimiento. Los procesos adecuados incluyen los enumerados en P. Kusters *et al.*, *Seed Treatment: Progress and Prospects*, 1994 Monografía de BCPC N.º 57, y las referencias enumeradas en dicho documento.

Los compuestos de Fórmula 1 y sus composiciones, tanto solos como junto con otros insecticidas y fungicidas, son particularmente útiles en el tratamiento de semillas para cultivos que incluyen, pero sin limitación, maíz, soja, algodón, cereales (p. ej., trigo, avena, cebada, centeno y arroz), patatas, verduras y colza.

Otros insecticidas con los que se pueden formular compuestos de Fórmula 1 para proporcionar mezclas útiles en el tratamiento de semillas incluyen abamectina, acetamiprida, acrinatrina, amitraz, avermectina, azadiractina, bensultap, bifentrina, buprofezina, carbarilo, carbofurano, cartap, clorantianiliprol, clorfenapir, clorpirifós, clotianidina, ciantraniliprol, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, gamma-cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, zeta-cipermetrina, ciromazina, deltametrina, dieldrina, dinotefurano, diofenolano, emamectina, endosulfano, esfenvalerato, etiprol, etofenprox, etoxazol, fenotiocarb, fenoxicarb, fenvalerato, fipronilo, flonicamida, flubendiamida, flufenoxurón, fluvalinato, formetanato, fostiazato, hexaflumurón, hidrametilnón, imidacloprida, indoxacarb, lufenurón, metaflumizona, metiocarb, metomilo, metopreno, metoxifenoazida, nitenpiram, nitiazina, novalurón, oxamilo, pimetrozina, piretrina, piridabeno, piridalilo, piriproxifeno, rianodina, espinetoram, espinosad, espirodiclofeno, espiromesifeno, espirotetramat, sulfoxaflor, tebufenozida, tetrametrina, tiacloprida, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodio, tralometrina, triazamato, triflumurón, delta-endotoxinas de *Bacillus thuringiensis*, todas las cepas de *Bacillus thuringiensis* y todas las cepas de nucleopoliedrovirus.

Los fungicidas con los que se pueden formular compuestos de Fórmula 1 para proporcionar mezclas útiles en el tratamiento de semillas incluyen amisulbrom, azoxistrobina, boscalida, carbendazim, carboxina, cimoxanilo, ciproconazol, difenoconazol, dimetomorf, fluazinam, fludioxonilo, fluquinconazol, fluopicolida, fluoxastrobina, flutriafol, fluxapiroxad, ipconazol, iprodiona, metalaxilo, mefenoxam, metconazol, miclobutanilo, paclobutrazol, penflufeno, picoxistrobina, prothioconazol, piraclostrobina, sedaxano, siltiofam, tebuconazol, tiabendazol, tiofanato-metilo, tiram, trifloxistrobina y triticonazol.

Las composiciones que comprenden compuestos de Fórmula 1 útiles para el tratamiento de semillas también pueden comprender bacterias tales como *Bacillus pumilus* (p. ej., cepa GB34) y *Bacillus firmus* (p. ej., aislado 1582), inoculantes/extensores de rizobios, isoflavonoides y lipo-quitoligosacáridos.

La semilla tratada normalmente comprende un compuesto de la presente divulgación en una cantidad de aproximadamente 0.1 g a 1 kg por 100 kg de semilla (es decir, de aproximadamente el 0.0001 al 1 % en peso de la semilla antes del tratamiento). Una suspensión fluida formulada para el tratamiento de semillas comprende normalmente de aproximadamente un 0.5 a aproximadamente un 70 % del principio activo, de aproximadamente un 0.5 a aproximadamente un 30 % de un adhesivo que forma películas, de aproximadamente un 0.5 a aproximadamente un 20 % de un agente dispersante, de un 0 a aproximadamente un 5 % de un espesante, de un 0 a aproximadamente un 5 % de un pigmento y/o colorante, de un 0 a aproximadamente un 2 % de un agente antiespumante, de un 0 a aproximadamente un 1 % de un conservante y de un 0 a aproximadamente un 75 % de un diluyente líquido volátil.

Los compuestos de esta divulgación pueden incorporarse a una composición de cebo que sea consumida por una plaga de invertebrados o utilizarse dentro de un dispositivo tal como una trampa, una estación de cebo y similares. Una composición de cebo de este tipo puede estar en forma de gránulos que comprenden (a) principios activos, en concreto, una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal de este; (b) uno o más materiales alimentarios; opcionalmente, (c) un atractante y, opcionalmente, (d) uno o más humectantes. Cabe destacar los gránulos o las composiciones de cebo que comprenden entre aproximadamente el 0.001-5 % de principios activos, aproximadamente el 40-99 % de material alimentario y/o atractante; y, opcionalmente, aproximadamente el 0.05-10 % de humectantes, que son eficaces para controlar las plagas de invertebrados del suelo en tasas de aplicación muy bajas, particularmente en dosis de principio activo que son letales por ingestión en lugar de a través del contacto directo. Algunos materiales alimentarios pueden funcionar como fuente de alimento y como atractante. Los materiales alimentarios incluyen carbohidratos, proteínas y lípidos. Son ejemplos de materiales alimentarios la harina vegetal, azúcar, almidones, grasa animal, aceite vegetal, extractos de levadura y sólidos lácteos. Son ejemplos de atractantes los odorantes y aromatizantes, tales como extractos de frutas o plantas, perfumes u otros componentes animales o vegetales, feromonas u otros agentes que se sabe que atraen una plaga de invertebrados diana. Son ejemplos de humectantes, es decir, agentes que retienen la humedad, los glicoles y otros polioles, glicerina y sorbitol. Cabe destacar una composición de cebo (y un método que utiliza tal composición de cebo) utilizada para controlar al menos una plaga de invertebrados seleccionada del grupo que consiste en hormigas, termitas y cucarachas. Un dispositivo para controlar una plaga de invertebrados puede comprender la composición de cebo de la presente y una carcasa adaptada para recibir la composición de cebo, en donde la carcasa tiene al menos una abertura con un tamaño adecuado para permitir que la plaga de invertebrados pase a través de la abertura de modo que la plaga de invertebrados pueda acceder a la composición de cebo desde un lugar externo a la carcasa, y en donde la carcasa está además adaptada para colocarse en o cerca de un emplazamiento de actividad potencial o conocida para la plaga de invertebrados.

Los compuestos de esta divulgación se pueden aplicar sin otros adyuvantes, pero la aplicación más frecuente será de una formulación que comprenda uno o más principios activos con vehículos, diluyentes y tensioactivos adecuados y, posiblemente, en combinación con un alimento dependiendo del

uso final contemplado. Un método de aplicación implica pulverizar una dispersión de agua o una solución de aceite refinado de un compuesto de la presente divulgación. Las combinaciones con aceites en pulverización, concentraciones de aceite de pulverización, adhesivos esparcidores, adyuvantes, otros disolventes y butóxido de piperonilo suelen potenciar la eficacia del compuesto. Para usos no agronómicos, tales pulverizaciones se pueden aplicar desde recipientes de pulverización tales como una lata, un bote u otro recipiente, ya sea por medio de una bomba o liberándolas de un recipiente presurizado, p. ej., un 5 spray en lata de aerosol presurizada. Tales composiciones de pulverización pueden adoptar diversas formas, por ejemplo, pulverizaciones, nebulizaciones, espumas, humos o neblinas. Por tanto, tales composiciones de pulverización pueden comprender además propulsores, agentes espumantes, etc., según sea el caso. Cabe destacar una composición de pulverización que comprende una cantidad 10 biológicamente eficaz de un compuesto o una composición de la presente divulgación y un vehículo. Una realización de una composición de pulverización de este tipo comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto o una composición de la presente divulgación y un propulsor. Los propulsores representativos incluyen, sin carácter limitante, metano, etano, propano, butano, isobutano, buteno, 15 pentano, isopentano, neopentano, penteno, hidrofluorocarbonos, clorofluorocarbonos, éter dimetílico y mezclas de los anteriores. Cabe destacar una composición de pulverización (y un método que utiliza una composición de pulverización de este tipo dispensada desde un recipiente de pulverización) utilizada para controlar al menos una plaga de invertebrados seleccionada del grupo que consiste en mosquitos, moscas 20 negras, moscas de los establos, moscas de los ciervos, tábanos, avispas, avispas chaqueta amarilla, avispones, garrapatas, arañas, hormigas, jejenes y similares, incluso individualmente o en combinaciones.

Una realización de la presente divulgación se refiere a un método para el control de plagas de invertebrados, que comprende diluir la composición plaguicida de la presente divulgación (un compuesto de Fórmula 1 formulado con tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos o una mezcla formulada de un compuesto de Fórmula 1 y al menos otro plaguicida) con agua, y opcionalmente añadir un adyuvante 25 para formar una composición diluida, y poner en contacto la plaga de invertebrados o su entorno con una cantidad eficaz de dicha composición diluida.

Aunque una composición de pulverización formada diluyendo con agua una concentración suficiente de la presente composición plaguicida puede proporcionar suficiente eficacia para controlar plagas de invertebrados, también se pueden añadir productos adyuvantes formulados por separado a las 30 mezclas de tanques de pulverización. Estos adyuvantes adicionales se conocen habitualmente como "adyuvantes de pulverización" o "adyuvantes de mezcla en tanque", e incluyen cualquier sustancia mezclada en un tanque de pulverización para mejorar el rendimiento de un plaguicida o alterar las propiedades físicas de la mezcla de pulverización. Los adyuvantes pueden ser tensioactivos, agentes emulsionantes, aceites de cultivo derivados del petróleo, aceites de semillas derivados de cultivos, 35 acidificantes, tampones, espesantes o agentes antiespumantes. Los adyuvantes se utilizan para potenciar la eficacia (por ejemplo, la disponibilidad biológica, la adhesión, la penetración, la uniformidad de la cobertura y la durabilidad de la protección), o minimizar o eliminar los problemas de aplicación de la

pulverización asociados con la incompatibilidad, la espumación, el arrastre, la evaporación, la volatilización y la degradación. Para obtener un rendimiento óptimo, los adyuvantes se seleccionan teniendo en cuenta las propiedades del principio activo, la formulación y la diana (por ejemplo, cultivos, plagas de insectos).

Entre los adyuvantes de pulverización, los aceites que incluyen aceites de cultivo, concentrados de aceite de cultivo, concentrados de aceite vegetal y concentrados de aceite de semillas metilado se utilizan más comúnmente para mejorar la eficacia de los plaguicidas, posiblemente al fomentar depósitos de pulverización más homogéneos y uniformes. En situaciones en las que la fitotoxicidad provocada posiblemente por aceites u otros líquidos inmiscibles en agua son de interés, las composiciones de pulverización preparadas a partir de la composición de la presente divulgación generalmente no contendrán adyuvantes de pulverización a base de aceite. Sin embargo, en las situaciones en las que la fitotoxicidad provocada por adyuvantes de pulverización a base de aceite es irrelevante desde el punto de vista comercial, las composiciones de pulverización preparadas a partir de la composición de la presente composición también pueden contener adyuvantes de pulverización a base de aceite, que podrán aumentar aún más el control de plagas de invertebrados, así como la resistencia a la lluvia.

Los productos identificados como "aceite de cultivo" normalmente contienen del 95 al 98 % de aceite de petróleo a base de parafina o nafta y del 1 al 2 % de uno o más tensioactivos que actúan como emulsionantes. Los productos identificados como "concentrados de aceite de cultivo" normalmente consisten en del 80 al 85 % de aceite emulsionable derivado del petróleo y del 15 al 20 % de tensioactivos no iónicos. Los productos identificados correctamente como "concentrados de aceite vegetal" normalmente consisten en del 80 al 85 % de aceite vegetal (es decir, aceite de semillas o frutas, más comúnmente de algodón, linaza, soja o girasol) y del 15 al 20 % de tensioactivos no iónicos. El rendimiento de los adyuvantes se puede mejorar reemplazando el aceite vegetal por ésteres metílicos de ácidos grasos, que normalmente derivan de aceites vegetales. Los ejemplos de concentrados de aceite de semillas metilado incluyen el concentrado MSO® (UAP-Loveland Products, Inc.) y el aceite de pulverización metilado Premium MSO (Helena Chemical Company).

La cantidad de adyuvantes añadida a las mezclas de pulverización generalmente no supera aproximadamente el 2.5 % en volumen y, más normalmente, la cantidad es de aproximadamente el 0.1 a aproximadamente el 1 % en volumen. Las tasas de aplicación de adyuvantes que se añaden a las mezclas de pulverización normalmente son de entre aproximadamente 1 y 5 l por hectárea. Los ejemplos representativos de adyuvantes de pulverización incluyen: aceite de colza metilado al 47 % en hidrocarburos líquidos Adigor® (Syngenta), heptametiltrisiloxano modificado con óxido de polialquileño Silwet® (Helena Chemical Company) y combinación de tensioactivos al 17 % en aceite mineral de parafina al 83 % Assist® (BASF).

Las aplicaciones no agronómicas incluyen proteger a un animal, particularmente un vertebrado, más particularmente un vertebrado homeotérmico (p. ej., un mamífero o ave) y lo más particularmente un mamífero, de una plaga parasitaria de invertebrados mediante la administración de una cantidad parasiticidamente eficaz (es decir, biológicamente eficaz) de un compuesto de la divulgación, normalmente

en forma de una composición formulada para uso veterinario, al animal que se va a proteger. Por lo tanto, cabe destacar un método para proteger a un animal que comprende administrar al animal una cantidad parasiticidamente eficaz de un compuesto de divulgación. Como se hace referencia en la presente divulgación y en las reivindicaciones, los términos "parasitocida" y "parasiticidamente" se refieren a efectos observables sobre una plaga parasitaria de invertebrados para proporcionar protección a un animal frente a la plaga. Los efectos parasitocidas normalmente se refieren a la disminución de la aparición o actividad de la plaga parasitaria de invertebrados diana. Dichos efectos sobre la plaga incluyen necrosis, muerte, crecimiento retardado, disminución de la movilidad o disminución de la capacidad de permanecer sobre o en el interior del animal hospedador, reducción de la alimentación e inhibición de la reproducción. Estos efectos sobre plagas parasitarias de invertebrados proporcionan control (incluyendo prevención, reducción o eliminación) de la infestación parasitaria o la infección del animal. Los ejemplos de plagas parasitarias de invertebrados controladas mediante la administración de una cantidad parasiticidamente eficaz de un compuesto de la divulgación a un animal que se va a proteger incluyen ectoparásitos (artrópodos, ácaros, etc.) y endoparásitos (helminths, p. ej., nematodos, trematodos, cestodos, acantocéfalos, etc.). En particular, los compuestos de esta divulgación son eficaces contra ectoparásitos que incluyen: moscas tales como *Haematobia (Lyperosia) irritans* (mosca de los cuernos), *Stomoxys calcitrans* (mosca de los establos), *Simulium* spp. (mosca negra), *Glossina* spp. (moscas tse-tsé), *Hydrotaea irritans* (mosca de la cabeza), *Musca autumnalis* (mosca de la cara), *Musca domestica* (mosca doméstica), *Morellia simplex* (mosca del sudor), *Tabanus* spp. (mosca del caballo), *Hypoderma bovis*, *Hypoderma lineatum*, *Lucilia sericata*, *Lucilia cuprina* (mosca verde), *Calliphora* spp. (mosca azul), *Protophormia* spp., *Oestrus ovis* (mosca del carnero), *Culicoides* spp. (mosquitos), *Hippobosca equine*, *Gastrophilus intestinalis*, *Gastrophilus haemorrhoidalis* y *Gastrophilus nasalis*; piojos tales como *Bovicola (Damalinia) bovis*, *Bovicola equi*, *Haematopinus asini*, *Felicola subrostratus*, *Heterodoxus spiniger*, *Lignonathus setosus* y *Trichodectes canis*; falsas garrapatas tales como *Melophagus ovinus*; ácaros tales como *Psoroptes* spp., *Sarcoptes scabiei*, *Chorioptes bovis*, *Demodex equi*, *Cheyletiella* spp., *Notoedres cati*, *Trombicula* spp. y *Otodectes cyanotis* (ácaros del oído); garrapatas tales como *Ixodes* spp., *Boophilus* spp., *Rhipicephalus* spp., *Amblyomma* spp., *Dermacentor* spp., *Hyalomma* spp. y *Haemaphysalis* spp.; y pulgas tales como *Ctenocephalides felis* (pulga del gato) y *Ctenocephalides canis* (pulga del perro).

Las aplicaciones no agronómicas en el sector veterinario se realizan por medios convencionales tal como por administración enteral en forma de, por ejemplo, comprimidos, cápsulas, bebidas, preparaciones de empapado, granulados, pastas, bolos, procedimientos de alimentación o supositorios; o por administración parenteral, tal como por inyección (incluyendo intramuscular, subcutánea, intravenosa, intraperitoneal) o implantes; por administración nasal; por administración tópica, por ejemplo, en forma de inmersión o baño, pulverización, lavado, recubrimiento con polvo, o aplicación en un área pequeña del animal, y a través de artículos tales como collares, crotales, bandas para la cola, bandas para las extremidades o cabezadas que comprenden compuestos o composiciones de la presente divulgación.

Normalmente, una composición parasitocida de acuerdo con la presente divulgación comprende una mezcla de un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo, con uno o más vehículos farmacéutica o veterinariamente aceptables que comprenden excipientes y auxiliares seleccionados con respecto a la vía prevista de administración (p. ej., administración oral, tópica o parenteral, tal como por inyección) y de acuerdo con la práctica habitual. Además, un vehículo adecuado se selecciona basándose en la compatibilidad con el uno o más principios activos de la composición, incluyendo consideraciones tales como la estabilidad con respecto al pH y el contenido de humedad. Por lo tanto, cabe destacar una composición para proteger a un animal de una plaga parasitaria de invertebrados que comprende una cantidad parasiticidamente eficaz de un compuesto de la divulgación y al menos un vehículo.

Para la administración parenteral, incluida la inyección intravenosa, intramuscular y subcutánea, un compuesto de la presente divulgación puede formularse en suspensión, solución o emulsión en vehículos oleosos o acuosos, y puede contener agentes auxiliares tales como agentes de suspensión, de estabilización y/o de dispersión. Las composiciones farmacéuticas para inyección incluyen soluciones acuosas de formas hidrosolubles de principios activos (p. ej., una sal de un compuesto activo), preferentemente en tampones fisiológicamente compatibles que contienen otros excipientes o auxiliares que son bien conocidos en la técnica de la formulación farmacéutica.

Para la administración oral en forma de soluciones (la forma más fácilmente disponible para la absorción), emulsiones, suspensiones, pastas, geles, cápsulas, comprimidos, bolos, polvos, gránulos, retención del rumen y pienso/agua/bloques para lamer, un compuesto de la presente divulgación puede formularse con aglutinantes/cargas conocidas en la técnica por ser adecuadas para composiciones para administración oral, tales como azúcares (p. ej., lactosa, sacarosa, manitol, sorbitol), almidón (p. ej., almidón de maíz, almidón de trigo, almidón de arroz, almidón de patata), celulosa y derivados (p. ej., metilcelulosa, carboximetilcelulosa, etilhidroxixelulosa), derivados de proteínas (p. ej., zeína, gelatina) y polímeros sintéticos (p. ej., alcohol polivinílico, polivinilpirrolidona). Si se desea, pueden añadirse lubricantes (p. ej., estearato de magnesio), agentes disgregantes (p. ej., polivinilpirrolidinona reticulada, goma de agar, ácido algínico) y tintes o pigmentos. Las pastas y geles con frecuencia también contienen adhesivos (p. ej., goma arábiga, ácido algínico, bentonita, celulosa, goma xantana, silicato de magnesio y aluminio coloidal) para ayudar a mantener la composición en contacto con la cavidad oral y que no se pueda expulsar fácilmente.

Si las composiciones parasitocidas están en forma de concentrados para piensos, el vehículo se selecciona normalmente entre piensos de alto rendimiento, cereales para piensos o concentrados de proteínas. Dichas composiciones que contienen concentrados para piensos pueden comprender, además de los principios activos parasitocidas, aditivos que potencian la salud o el crecimiento de los animales, mejoran la calidad de la carne de los animales para matanza o son útiles de otro modo para la cría de animales. Estos aditivos pueden incluir, por ejemplo, vitaminas, antibióticos, agentes quimioterápicos, bacteriostáticos, fungistáticos, coccidostáticos y hormonas.

Se ha descubierto que los compuestos de la presente divulgación tienen propiedades farmacocinéticas y farmacodinámicas favorables que proporcionan disponibilidad sistémica a partir de la administración e ingestión oral. Por lo tanto, después de la ingestión por parte del animal que se va a proteger, las concentraciones parasiticidamente eficaces de los compuestos de la divulgación en el torrente sanguíneo protegen al animal tratado de plagas de chupadores de sangre tales como pulgas, garrapatas y piojos. Por lo tanto, cabe destacar una composición para proteger a un animal de una plaga parasitaria de invertebrados en una forma de administración oral (es decir, que comprende, además de una cantidad parasiticidamente eficaz de un compuesto de la divulgación, uno o más vehículos seleccionados de aglutinantes y cargas adecuadas para la administración oral y vehículos de concentrados para piensos).

Las formulaciones para administración tópica están normalmente en forma de un polvo, crema, suspensión, pulverización, emulsión, espuma, pasta, aerosol, pomada, ungüento o gel. Más normalmente, una formulación tópica es una solución hidrosoluble que puede estar en forma de un concentrado que se diluye antes del uso. Las composiciones parasitocidas adecuadas para la administración tópica normalmente comprenden un compuesto de la presente divulgación y uno o más vehículos tópicamente adecuados. En aplicaciones de una composición parasitocida por vía tópica en el exterior de un animal en forma de una línea o en un punto específico (es decir, tratamiento por unción dorsal puntual), el principio activo se desplaza por la superficie del animal para cubrir la mayor parte o toda su superficie externa. Como resultado, el animal tratado se protege particularmente de plagas de invertebrados que se alimentan de la epidermis del animal, tales como garrapatas, pulgas y piojos. Por lo tanto, las formulaciones para administración tópica localizada normalmente comprenden al menos un disolvente orgánico para facilitar el transporte del principio activo sobre la piel y/o su penetración en la epidermis del animal. Los disolventes empleados habitualmente como vehículos en dichas formulaciones incluyen propilenglicol, parafinas, agentes aromáticos, ésteres tales como miristato de isopropilo, éteres de glicol y alcoholes tales como etanol y *n*-propanol.

La tasa de aplicación requerida para un control eficaz (es decir, "la cantidad biológicamente eficaz") dependerá de factores tales como la especie de invertebrado que se controlará, el ciclo de vida de la plaga, la fase de vida, su tamaño, ubicación, época del año, cultivo o animal hospedador, comportamiento alimentario, comportamiento de apareamiento, humedad ambiental, temperatura y similares. En circunstancias normales, basta con tasas de aplicación de aproximadamente 0.01 a 2 kg de principios activos por hectárea para controlar plagas en ecosistemas agronómicos, pero puede bastar tan solo con 0.0001 kg/hectárea o pueden ser necesarios hasta 8 kg/hectárea. Para aplicaciones no agronómicas, las tasas de uso eficaces variarán de aproximadamente 1.0 y 50 mg/metro cuadrado, pero puede bastar tan solo con 0.1 mg/metro cuadrado o pueden ser necesarios hasta 150 mg/metro cuadrado. Un experto en la materia puede determinar la cantidad biológicamente eficaz necesaria para el nivel deseado de control de plagas de invertebrados.

En general, para uso veterinario, un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo, se administra en una cantidad parasiticidamente eficaz a un animal que se va a proteger de plagas parasitarias

de invertebrados. Una cantidad parasiticidamente eficaz es la cantidad de principio activo necesaria para conseguir un efecto observable de disminución de la aparición o actividad de la plaga parasitaria de invertebrados diana. Un experto en la materia apreciará que la dosis parasiticidamente eficaz puede variar para los diversos compuestos y composiciones de la presente divulgación, el efecto parasiticida deseado y su duración, la especie de plaga de invertebrados diana, el animal que se va a proteger, el modo de aplicación y similares, y la cantidad necesaria para conseguir un resultado particular puede determinarse a través de simple experimentación.

Para la administración oral a animales homeotérmicos, la dosis diaria de un compuesto de la presente divulgación normalmente varía de aproximadamente 0.01 mg/kg a aproximadamente 100 mg/kg, más normalmente de aproximadamente 0.5 mg/kg a aproximadamente 100 mg/kg, de peso corporal del animal. Para la administración tópica (p. ej., dérmica), los baños y pulverizaciones normalmente contienen de aproximadamente 0.5 ppm a aproximadamente 5000 ppm, más normalmente de aproximadamente 1 ppm a aproximadamente 3000 ppm, de un compuesto de la presente divulgación.

Los recientes avances en la capacidad de procesamiento de los ordenadores han dotado a los científicos de oportunidades sin precedentes para aprovechar las herramientas de simulación informática y así predecir e investigar los posibles resultados adversos asociados con las exposiciones xenobióticas, junto con las bases moleculares para estos eventos. Aunque los modelos informáticos actuales no pueden utilizarse como única herramienta para sustituir a las estrategias de experimentación *in vivo* o *in vitro*, siguen proporcionando herramientas valiosas para generar hipótesis, destacar los compuestos de interés y ayudar a priorizar y alinear los compuestos químicos a los estudios *in vitro* o *in vivo* adecuados.

La toxicología computacional/predictiva es una disciplina en rápida evolución que integra la información y los datos de diversas fuentes para desarrollar modelos matemáticos e informáticos para comprender y predecir mejor las interacciones de los agentes químicos y los organismos vivos a diversas escalas (por ejemplo, a escala poblacional, individual, celular y molecular) y pueden tenerse en cuenta para abarcar dos amplias áreas:

(1) El desarrollo y la aplicación de modelos en 2 dimensiones (2D) mediante los primeros principios (p. ej., motivos estructurales que impulsan una fácil reactividad química (Wijeyesakere, S.J. *et al.* Development of a Profiler for Facile Chemical Reactivity Using the Open-Source Konstanz Information Miner. *Appl. Vit. Toxicol.*, **4**, 202–213, 2018). Además, a fin de predecir la dosimetría para obtener un resultado biológico de interés, pueden llevarse a cabo técnicas cuantitativas de la relación estructura-actividad (QSAR, por sus siglas en inglés), tal como análisis de tendencias, si se dispone de datos experimentales de moléculas análogas (por ejemplo, la predicción de un potencial colinérgico de una serie de compuestos organofosforados relacionados (Makhaeva, G.F. *et al.* Esterase profiles of organophosphorus compounds in vitro predict their behavior in vivo. *Chem. Biol. Interact.*, **259**, 332–342, 2016). Makhaeva, G.F. *et al.* Kinetics and mechanism of inhibition of serine esterases by fluorinated carbethoxy 1-aminophosphonates. *Dokl. Biochem. Biophys.*, **451**, 203–206, 2013).

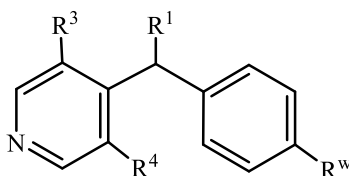
(2) Uso de estrategias de "big data" que puedan seleccionar toda la información disponible

sobre un resultado/modo de acción particular (p. ej., modelos predictivos para identificar inhibidores mitocondriales (Wijeyesakere, S.J. *et al.* Hybrid Machine-Learning/SMARTS Profiling Model for Mitochondrial Inhibition. *Appl. Vitro. Toxicol.*, **5**, 196–204, 2019) o aquellos que pueden interactuar con receptores neuronales definidos (Wijeyesakere, S.J. *et al.* Prediction of cholinergic compounds by machine-learning. *Comput. Toxicol.*, **13**, 100119, 2020)); y la extensión de estas evaluaciones en 2D para abarcar técnicas en 3D tales como simulaciones de acoplamiento y de dinámica molecular (DM) para investigar en más detalle las interacciones entre agentes intoxicantes y dianas biológicas supuestas/conocidas (Wang, Y. *et al.* Mixed inhibition of adenosine deaminase activity by 1,3-dinitrobenzene: A Model for understanding cell-selective neurotoxicity in chemically-induced energy deprivation syndromes in brain. *Toxicol. Sci.*, **125**, 509–521, 2012; Gonzalez, T.L. *et al.* Metabolites of n-Butylparaben and iso-Butylparaben Exhibit Estrogenic Properties in MCF-7 and T47D Human Breast Cancer Cell Lines. *Toxicol. Sci.*, **164**, 50–59018, 2018).

Los compuestos específicos de Fórmula 1 preparados por los métodos y variaciones que se han descrito en los Esquemas 1-11 y Ejemplos de Síntesis 1-2 anteriores se muestran en las Tablas de índices A y B a continuación. Véase la Tabla de índices C para los datos de ^1H RMN. Para los datos espectrales de masas (MS), el valor numérico indicado es el peso molecular del ion original con la mayor abundancia isotópica (M+1) formado por la adición de H^+ (peso molecular de 1) a la molécula, observado por espectrometría de masas usando ionización química a presión atmosférica (AP^+). Los datos del punto de fusión (PF) se notifican como un intervalo de temperatura. Los picos de iones moleculares alternos (p. ej., M+2 o M+4) que se producen en los compuestos que contienen múltiples halógenos no se notifican.

En las tablas de índices que se muestran a continuación se utilizan las siguientes abreviaturas: Comp. significa Compuesto, *t* es terciario, *c* es ciclo, Me es metilo, Et es etilo, Pr es propilo, *i*-Pr es isopropilo, Bu es butilo, *c*-Pr es ciclopropilo, *c*-Pn es ciclopentilo, *c*-Hx es ciclohexilo, *t*-Bu es butilo terciario, Ph es fenilo, OMe es metoxi, SMe es metiltio y SO_2Me significa metilsulfonilo. Una línea ondulada en un fragmento de la estructura representa el punto de unión del fragmento con el resto de la molécula. La abreviatura "Ej." significa "Ejemplo" y va seguida de un número que indica en qué Ejemplo de Síntesis se prepara el compuesto.

TABLA DE ÍNDICES A

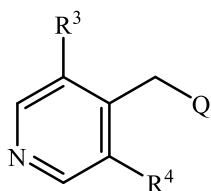


Comp. N.º	R1	R 3	R4	Rw	p.f. (°C)	Datos de MS
1	H	F	2 <i>H</i> -1,2,3-triazol-2-ilo	OCF ₃	57-60	339.3
2	H	F	2 <i>H</i> -1,2,3-triazol-2-ilo	SCF ₃	88-91	355.3
3	H	F	4-metil-2 <i>H</i> -1,2,3-triazol-2-ilo	OCF ₃		353.4

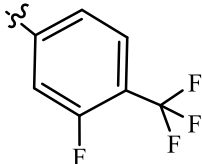
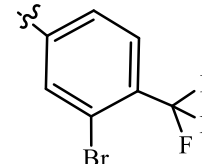
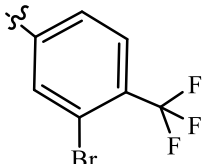
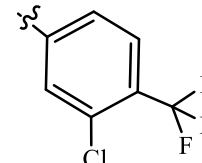
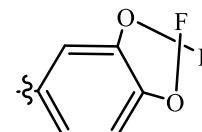
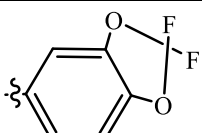
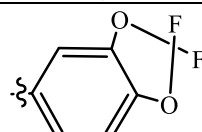
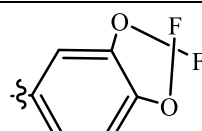
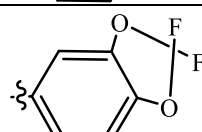
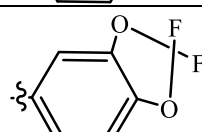
5	4	H	F	2 <i>H</i> -1,2,3-triazol-2-ilo	OCF ₂ CHF ₂ CF ₃		421.4
	5	H	Cl	2 <i>H</i> -1,2,3-triazol-2-ilo	SCF ₃		371.2
	6	H	Cl	1 <i>H</i> -1,2,3-triazol-1-ilo	SCF ₃		371.2
	7	CH ₂ CH=CH ₂	F	2 <i>H</i> -1,2,3-triazol-2-ilo	SCF ₃		395.4
	8	Me	F	2 <i>H</i> -1,2,3-triazol-2-ilo	SCF ₃		369.3
10	9	Me	F	2 <i>H</i> -1,2,3-triazol-2-ilo	OCF ₃		353.3
	10	CH ₂ CH=CH ₂	F	2 <i>H</i> -1,2,3-triazol-2-ilo	OCF ₃		379.4
	11	Me	F	1 <i>H</i> -1,2,3-triazol-1-ilo	SCF ₃		369.3
	12	H	Cl	2 <i>H</i> -1,2,3-triazol-2-ilo	OCF ₃	53-56	
	13	Me	Cl	1 <i>H</i> -pirazol-1-ilo	OCF ₃		384.2
15	14	Me	Cl	2 <i>H</i> -1,2,3-triazol-2-ilo	SCF ₃	92-95	
	15	H	Br	2 <i>H</i> -1,2,3-triazol-2-ilo	OCF ₃	63-66	
	16	H	H	2 <i>H</i> -1,2,3-triazol-2-ilo	OCF ₃		321.2
	17	H	I	2 <i>H</i> -1,2,3-triazol-2-ilo	OCF ₃	66-69	
	18	H	F	2 <i>H</i> -1,2,3-triazol-2-ilo	SOCF ₃		371.3
20	19	H	F	1 <i>H</i> -pirazol-1-ilo	SCF ₃		354.2
	20	H	Cl	1 <i>H</i> -pirazol-1-ilo	SCF ₃		370.2
	21	H	Cl	1,2,4-triazol-1-ilo	SCF ₃		371.3
	22	H	Cl	2 <i>H</i> -1,2,3-triazol-2-ilo	SOCF ₃	86-89	
	23	H	H	2 <i>H</i> -1,2,3-triazol-2-ilo	SCF ₃	75-78	
25	24	H	F	1,2,4-triazol-1-ilo	SCF ₃		355.3
	25	H	F	3-(trifluorometil)pirazol-1-ilo	SCF ₃		422.2
	26	H	Br	2 <i>H</i> -1,2,3-triazol-2-ilo	SCF ₃	82-85	
	27	H	F	2 <i>H</i> -1,2,3-triazol-2-ilo	OCF ₂ CF ₂ H		371.3
	28	H	H	2 <i>H</i> -1,2,3-triazol-2-ilo	SOCF ₃	81-84	
30	29	H	F	1 <i>H</i> -pirazol-1-ilo	OCF ₂ CF ₂ H		370.2
	30	H	F	1,3-oxazol-2-ilo	SCF ₃	114-117	
	31	H	F	2 <i>H</i> -1,2,3-triazol-2-ilo	Br	80-83	
	32	H	Cl	1 <i>H</i> -pirazol-1-ilo	OCF ₂ CF ₂ H		386.4
	33	H	Cl	2 <i>H</i> -1,2,3-triazol-2-ilo	OCF ₂ CF ₂ H		387.4
35	34	H	F	3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-ilo	SCF ₃	111-114	
	35	H	Cl	1,3-tiazol-2-ilo	SCF ₃	56-59	

5	36	H	Cl	3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-ilo	SCF3	105-108	
	37	H	Cl	1,3-oxazol-2-ilo	SCF3		371.3
	38	H	F	2H-1,2,3-triazol-2-ilo	OCF2CF3		355.3
	39	H	F	3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-ilo	OCF3	86-89	
	40	H	F	1,3-tiazol-2-ilo	OCF3		355.2
10	41	H	F	1,3-oxazol-2-ilo	OCF3	63-66	
	42	H	Cl	1,3-tiazol-2-ilo	OCF3		371.1
	43	H	Cl	1,3-oxazol-2-ilo	OCF3		355.1
	44	H	Cl	2H-1,2,3-triazol-2-ilo	OCF2CF3		405.0
	45	H	Cl	1H-pirazol-1-ilo	OCF2H		336.1
15	46	H	Cl	2H-1,2,3-triazol-2-ilo	OCF2H		337.2
	47	H	Cl	1H-1,2,3-triazol-1-ilo	OCF2H		337.2
	48	H	Cl	3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-ilo	OCF3	89-92	
	49	H	F	2H-1,2,3-triazol-2-ilo	CF2CF3		373.2
	50	Me	F	1H-pirazol-1-ilo	SCF3		368.3
20	51	Me	Cl	1,2,4-triazol-1-ilo	SCF3		385.3
	52	Me	F	1,2,4-triazol-1-ilo	SCF3		369.2
	53	Me	F	3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-ilo	SCF3		384.3
	54	Me	F	1,3-tiazol-2-ilo	SCF3		385.3
	55	Me	Cl	1,3-tiazol-2-ilo	SCF3		401.2
25	56	Me	Cl	3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-ilo	SCF3		400.3
	57	CH2CH3	F	2H-1,2,3-triazol-2-ilo	SCF3		383
	58	CH2CH3	F	2H-1,2,3-triazol-2-ilo	SCF3		383
	59	CH(CH3)2	F	2H-1,2,3-triazol-2-ilo	SCF3		397
	60	CH2CH3	F	2H-1,2,3-triazol-2-ilo	OCF3		367
30	61	CH(CH3)2	F	2H-1,2,3-triazol-2-ilo	OCF3		381
	62	Me	F	3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-ilo	OCF3		368.3
	63	Me	F	1,3-tiazol-2-ilo	OCF3		369.3
	64	Me	Cl	1,3-tiazol-2-ilo	OCF3		385.1

TABLA DE ÍNDICES B



Comp. N.º	R3	R4	Q	p.f. (°C)	Datos de MS
65	2H-1,2,3-triazol-2-ilo	F			371.3
66	2H-1,2,3-triazol-2-ilo	F			357.3
67	2H-1,2,3-triazol-2-ilo	F			387.3
68	2H-1,2,3-triazol-2-ilo	Cl			433.2
69	2H-1,2,3-triazol-2-ilo	F			417.2
70	2H-1,2,3-triazol-2-ilo	Cl		53-56	
71	2H-1,2,3-triazol-2-ilo	Cl			389.3
72	2H-1,2,3-triazol-2-ilo	Cl		86-89	

5	73	2H-1,2,3-triazol-2-ilo	F		52-55	
	74	2H-1,2,3-triazol-2-ilo	Cl			416.9
	75	2H-1,2,3-triazol-2-ilo	F			401.1
	76	2H-1,2,3-triazol-2-ilo	F			357.2
10	77	1H-pirazol-1-ilo	F			334.3
	78	2H-1,2,3-triazol-2-ilo	Cl		97-100	351.3
	79	1H-pirazol-1-ilo	Cl			350.3
	80	2H-1,2,3-triazol-2-ilo	F			335.3
15	81	1H-1,2,3-triazol-1-ilo	Cl			351.3
	82	1H-1,2,3-triazol-1-ilo	F			335.3

Los siguientes ensayos demuestran la eficacia de control de los compuestos de esta divulgación sobre plagas específicas. "Eficacia de control" representa la inhibición del desarrollo (que incluye la mortalidad) de plagas de invertebrados que provoca una reducción significativa de la alimentación. Sin

embargo, la protección de control de plagas proporcionada por los compuestos no se limita a estas especies. Véanse las Tablas de índices A y B para consultar descripciones de compuestos.

EJEMPLOS BIOLÓGICOS

Metodología de formulación y pulverización para los Ensayos A-G

Se formularon los compuestos de prueba utilizando una solución que contenía un 10 % de acetona, un 90 % de agua y 300 ppm de tensioactivo no iónico Activator 90® (Loveland Products, Loveland, Colorado, EE. UU.). Los compuestos formulados se aplicaron en 1 ml de líquido a través de una boquilla atomizadora colocada 1.27 cm (0.5 pulgadas) por encima de la parte superior de cada unidad de prueba. Los compuestos de prueba se pulverizaron en las tasas indicadas, y cada prueba se replicó tres veces.

Prueba A

Para evaluar el control del saltahoja del maíz (*Peregrinus maidis* (Ashmead)) a través del contacto y/o medios sistémicos, la unidad de prueba consistía en un pequeño recipiente abierto con una planta de maíz de 3-4 días en su interior. Se añadió arena blanca sobre el suelo antes de aplicar el compuesto de prueba.

Los compuestos de prueba se formularon y pulverizaron a 250 y/o 50 ppm y/o 10 ppm. Tras pulverizar el compuesto de prueba formulado, se dejaron secar las unidades de prueba durante 1 h antes de infestarlas posteriormente con ~15-20 ninfas (de 18 a 21 días de edad). Se colocó una tapa negra con malla encima de cada unidad de prueba y las unidades de prueba se mantuvieron durante 6 días en una cámara de crecimiento a 22–24 °C y 50-70 % de humedad relativa. A continuación, cada unidad de prueba se evaluó visualmente para determinar la mortalidad de los insectos.

De los compuestos de la Fórmula 1 sometidos a ensayo a 50 ppm, los siguientes dieron como resultado una mortalidad de al menos el 80 %: 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 11, 12, 13, 16, 18, 20, 23, 26, 27, 29, 30, 32, 33, 34, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 45, 46, 50, 51, 52, 53, 54, 56, 57, 60, 62, 63, 65, 66, 68, 69, 70, 71, 72, 73, 77.

De los compuestos de la Fórmula 1 sometidos a ensayo a 10 ppm, los siguientes dieron como resultado una mortalidad de al menos el 80 %: 1, 2, 3, 4, 5, 8, 9, 12, 19, 20, 23, 26, 27, 29, 30, 32, 33, 38, 39, 40, 41, 45, 46, 53, 54, 57, 62, 63, 66, 68, 69, 70, 71, 72, 73, 77.

Prueba B

Para evaluar el control del saltahoja de la papa (*Empoasca fabae* Harris) a través del contacto y/o medios sistémicos, la unidad de prueba consistía en un pequeño recipiente abierto con una planta de frijol Soleil de 5 a 6 días (con las hojas primarias emergidas) en su interior. Se añadió arena blanca sobre el suelo y se cortó una de las hojas primarias antes de la aplicación del compuesto de prueba.

Los compuestos de prueba se formularon y se pulverizaron en una concentración de 250 ppm. Después de pulverizar el compuesto de prueba formulado, las unidades de prueba se dejaron secar durante 1 hora antes de infestarlas posteriormente con 5 saltahoja de la papa (adultos de 18 a 21 días). Se colocó una tapa negra con malla encima de la unidad de prueba y las unidades de prueba se mantuvieron durante

6 días en una cámara de crecimiento a 20 °C y 70 % de humedad relativa. A continuación, cada unidad de prueba se evaluó visualmente para determinar la mortalidad de los insectos.

De los compuestos de la Fórmula 1 sometidos a ensayo a 50 ppm, los siguientes dieron como resultado una mortalidad de al menos el 80 %: 3

5

Prueba C

Para evaluar el control del pulgón verde del duraznero (*Myzus persicae* (Sulzer)) a través del contacto y/o medios sistémicos, la unidad de prueba consistía en un pequeño recipiente abierto con una planta de rábano de 12–15 días en su interior. Esta se infestó previamente colocando sobre una hoja de la planta de prueba 30–40 pulgones en un trozo de hoja extraído de una planta de cultivo (método de la hoja cortada). Los pulgones pasaron a la planta de prueba a medida que se desecaba el trozo de hoja. Tras la infestación previa, el suelo de la unidad de prueba se cubrió con una capa de arena.

10

Los compuestos de prueba se formularon y pulverizaron en una concentración de 250 y/o 50 ppm. Después de pulverizar el compuesto de prueba formulado, cada unidad de prueba se dejó secar durante 1 hora y después se colocó una tapa negra con malla encima. Las unidades de prueba se mantuvieron durante 6 días en una cámara de crecimiento a 19–21 °C y 50–70 % de humedad relativa. A continuación, cada unidad de prueba se evaluó visualmente para determinar la mortalidad de los insectos.

15

De los compuestos de la Fórmula 1 sometidos a ensayo a 50 ppm, los siguientes dieron como resultado una mortalidad de al menos el 80 %: 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 11, 12, 13, 16, 18, 20, 23, 26, 27, 29, 30, 32, 33, 34, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 45, 46, 50, 51, 52, 53, 54, 56, 57, 60, 62, 63, 65, 66, 68, 69, 70, 71, 72, 73, 77.

20

De los compuestos de la Fórmula 1 sometidos a ensayo a 10 ppm, los siguientes dieron como resultado una mortalidad de al menos el 80 %: 2, 5, 21, 24, 26, 70.

Prueba D

Para evaluar el control del pulgón del melón y del algodón (*Aphis gossypii* (Glover)) a través del contacto y/o medios sistémicos, la unidad de prueba consistía en un pequeño recipiente abierto con una planta de quingombó de 5 días en su interior. Esta se infestó previamente con 30–40 insectos en un trozo de hoja de acuerdo con el método de la hoja cortada, y el suelo de la unidad de prueba se cubrió con una capa de arena.

25

Los compuestos de prueba se formularon y pulverizaron en una concentración de 250 y/o 50 ppm. Después de la pulverización, las unidades de prueba se mantuvieron en una cámara de crecimiento durante 6 días a 19 °C y 70 % de humedad relativa. A continuación, cada unidad de prueba se evaluó visualmente para determinar la mortalidad de los insectos.

30

De los compuestos de la Fórmula 1 sometidos a ensayo a 50 ppm, los siguientes dieron como resultado una mortalidad de al menos el 80 %: 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 11, 12, 13, 16, 18, 20, 23, 26, 27, 29, 30, 32, 33, 34, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 45, 46, 50, 51, 52, 53, 54, 56, 57, 60, 62, 63, 65, 66, 68, 69, 70, 71, 72, 73, 77.

35

De los compuestos de la Fórmula 1 sometidos a ensayo a 10 ppm, los siguientes dieron como resultado una mortalidad de al menos el 80 %: 2, 8, 9, 16, 19, 20, 26, 27, 30, 40, 41, 63, 66, 70, 73.

Prueba E

Para evaluar el control de la mosca blanca del camote (*Bemisia tabaci* (Gennadius)) a través del contacto y/o medios sistémicos, la unidad de prueba consistía en un pequeño recipiente abierto con una planta de algodón de 12–14 días en su interior. Antes de aplicar la pulverización, se retiraron ambos cotiledones de la planta, dejando una hoja verdadera para el ensayo. Se dejó que las moscas blancas adultas pusieran huevos sobre la planta y después se retiraron de la unidad de prueba. Las plantas de algodón infestadas con al menos 15 huevos se sometieron a la prueba de pulverización.

Los compuestos de prueba se formularon y pulverizaron en una concentración de 250 y/o 50 ppm. Después de la pulverización, las unidades de prueba se dejaron secar durante 1 hora. A continuación, se retiraron los cilindros y las unidades se introdujeron en una cámara de crecimiento y se mantuvieron durante 13 días a 28 °C y 50–70 % de humedad relativa. A continuación, cada unidad de prueba se evaluó visualmente para determinar la mortalidad de los insectos.

De los compuestos de la Fórmula 1 sometidos a ensayo a 50 ppm, los siguientes dieron como resultado una mortalidad de al menos el 70 %: 1, 4, 5, 6, 9, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 26, 27, 33, 35, 38, 40, 45, 46, 51, 52, 54, 56, 57, 60, 63, 66, 68, 69, 71, 72, 77.

De los compuestos de la Fórmula 1 sometidos a ensayo a 10 ppm, los siguientes dieron como resultado una mortalidad de al menos el 70 %: 5, 19, 20, 21, 26, 27, 33, 40, 46, 57, 60, 68, 71.

PRUEBA F

Para evaluar el control del saltahoja pardo (*Nilaparvata lugens* (Stål)) a través del contacto y/o medios sistémicos, la unidad de ensayo consistía en un pequeño recipiente abierto con 6-10 tallos de arroz de 25 días en su interior. Se añadió arena blanca sobre el suelo antes de aplicar el compuesto de prueba.

Los compuestos de ensayo se formularon y pulverizaron a 50 ppm y/o 10 ppm. Después de pulverizar el compuesto de prueba formulado, las unidades de prueba se dejaron secar durante 1 h antes de infestarlas posteriormente con ~15-20 ninfas (que tenían de 15 a 17 días). Se colocó una tapa negra con malla encima de cada unidad de prueba y las unidades de prueba se mantuvieron durante 5 días en una cámara de crecimiento a 28 °C y 65 % de humedad relativa. A continuación, cada unidad de prueba se evaluó visualmente para determinar la mortalidad de los insectos.

De los compuestos de la Fórmula 1 sometidos a ensayo a 10 ppm, los siguientes dieron como resultado una mortalidad de al menos el 80 %: 1, 2, 5, 8, 19, 20, 26, 77.

Prueba G

Para evaluar el control de la palomilla dorso de diamante (*Plutella xylostella* (L.)), la unidad de prueba consistía en un pequeño recipiente abierto con una planta de mostaza de 12–14 días en su interior. Esta se infestó previamente con ~50 larvas neonatas que se dispensaron en la unidad de prueba a través de sémolas de mazorca de maíz utilizando un inoculador. Las larvas pasaron a la planta de prueba tras dispensarlas a la unidad de prueba.

Los compuestos de prueba se formularon y se pulverizaron en una concentración de 250 ppm. Después de pulverizar el compuesto de prueba formulado, cada unidad de prueba se dejó secar durante 1 hora y después se colocó una tapa negra con malla encima. Las unidades de prueba se mantuvieron durante 6 días en una cámara de crecimiento a 25 °C y 70 % de humedad relativa. A continuación, se evaluó visualmente el daño por alimentación en las plantas en función del follaje consumido, y se evaluó la mortalidad de las larvas.

De los compuestos de Fórmula 1 evaluados en una concentración de 50 ppm, los siguientes proporcionaron unos niveles de eficacia de control de muy buenos a excelentes (40 % o menos de daño por alimentación y/o 100 % de mortalidad): 11, 15, 25, 68, 70.